



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,  
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21), (22) Заявка: 2005120020/04, 26.11.2003

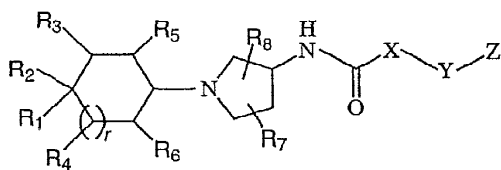
(30) Приоритет: 27.11.2002 US 60/429,605  
18.04.2003 US 60/463,976

(43) Дата публикации заявки: 20.01.2006 Бюл. № 02

(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную  
фазу: 27.06.2005(86) Заявка РСТ:  
US 03/37946 (26.11.2003)(87) Публикация РСТ:  
WO 2004/050024 (17.06.2004)Адрес для переписки:  
129010, Москва, ул. Б.Спасская, 25, стр.3,  
ООО "Юридическая фирма Городисский и  
Партнеры", пат.пов. Г.Б. Егоровой(71) Заявитель(и):  
ИНСАЙТ КОРПОРЕЙШН (US)(72) Автор(ы):  
СЮЭ Чу-Бяо (US),  
МЕТКАФ Брайан (US),  
ФЭН Хао (US),  
ЦАО Ганьфэн (US),  
ХУАН Тайшинг (US),  
ЧЖЭН Чаншэн (US),  
РОБИНСОН Дариус Дж. (US),  
ХАНЬ Эми Ци. (US)(74) Патентный поверенный:  
Егорова Галина Борисовна(54) **ПРОИЗВОДНЫЕ 3-АМИНОПИРРОЛИДИНА В КАЧЕСТВЕ МОДУЛЯТОРА РЕЦЕПТОРОВ ХЕМОКИНОВ**

Формула изобретения

1. Соединение формулы I



I

его энантиомеры, диастереоизомеры, энантиомерно обогащенные смеси, его рацемические смеси, его пролекарства, кристаллические формы, некристаллические формы, его аморфные формы, его сольваты, метаболиты и фармацевтически приемлемые соли, где

X выбирают из группы, состоящей из арила, моно- или полизамещенного арила, гетероцикла, гетероарила, моно- или полизамещенного гетероарила, карбоцикла, моно- или полизамещенного карбоцикла (CR<sub>9</sub>R<sub>10</sub>)<sub>n</sub>, где n=0-5;

Y представляет связь, или его выбирают из группы, состоящей из кислорода, серы, азота, амидной связи, тиамидной связи, сульфонида, кетона, -СНОН-, -СНО-алкила-, оксима или мочевины;

Z выбирают из группы, состоящей из карбоцикла, арила, гетероцикла или гетероарила, содержащих 0-3 заместителя R<sub>11</sub>, где R<sub>11</sub> независимо выбирают из группы, состоящей из

галогена, алкила, алкенила, алкинила, алкокси, алкоксиалкила, алкилтиоалкила, тиоалкила, моно-, ди- или тригалогеноалкила, моно-, ди- или тригалогеноалкокси, нитро, amino, моно- или дизамещенного amino, моно- или дизамещенного aminoалкила, карбоксила, этерифицированного карбоксила, карбоксамидо, моно- или дизамещенного карбоксамидо, карбамата, моно- или дизамещенного карбамата, сульфонамида, моно- или дизамещенного сульфонамида, алкилкарбонила, циклического алкилсульфонила, арилсульфонила, гетероарилсульфонила, алкилкарбонила, циклического алкилкарбонила, арилкарбонила, гетероарилкарбонила, тиокарбоксамидо, циано и  $R_{11a}$ -арила или  $R_{11a}$ -гетероарила, где  $R_{11a}$  представляет Н, галоген, ОН, amino, моно- или дизамещенный amino, моно-, ди- или тригалогеноалкил, алкокси, моно-, ди- или тригалогеноалкокси, карбоксамид, сульфонамид, карбамат, мочевино или циано;

$R_1$  независимо выбирают из группы, состоящей из карбоцикла, гетероцикла, арила, гетероарила, арилалкила, гетероарилалкила, арилалкенила, гетероарилалкенила, арилалкинила, гетероарилалкинила, ариламинокрбонила, гетероариламинокрбонила, арилкарбоксамидо, гетероарилкарбоксамидо, арилуреидо, гетероарилуреидо, арилокси, гетероарилокси, арилалкокси, гетероарилалкокси, ариламино или гетероариламино, и где указанные группы карбоцикла, гетероцикла, арила, арилалкила, гетероарила или гетероарилалкила могут быть замещены 0-3 заместителями  $R_{1a}$ , где  $R_{1a}$  независимо выбирают из группы, состоящей из галогена, алкила, алкенила, алкинила, алкокси, алкоксиалкила, алкилтиоалкила, гидроксиалкила, моно-, ди- или тригалогеноалкила, моно-, ди- или тригалогеноалкокси, нитро, amino, моно- или дизамещенного amino, моно- или дизамещенного aminoалкила, аминокрбонила, моно- или дизамещенного аминокрбонила, циклического аминокрбонила, аминосульфонила, моно- или дизамещенного аминосульфонила, алкилкарбонила, циклического алкилкарбонила, арилкарбонила, гетероарилкарбонила, алкилсульфонила, циклического алкилсульфонила, арилсульфонила, гетероарилсульфонила, карбоновой кислоты, этерифицированной карбоновой кислоты, алкилкарбониламино, циклического алкилкарбониламино, арилкарбониламино, гетероарилкарбониламино, циано, арилалкила, гетероарилалкила, арилоксиалкила, гетероарилоксиалкила, арилтиоалкила, гетероарилтиоалкила, карбамата, моно- или дизамещенного карбамата,  $R_{1b}$ -арила или  $R_{1b}$ -гетероарила, где  $R_{1b}$  представляет Н, галоген, ОН, amino, моно- или дизамещенный amino, моно-, ди- или тригалогеноалкил, алкокси, моно-, ди- или тригалогеноалкокси, гидроксиалкил, алкоксиалкил, aminoалкил, моно- или дизамещенный aminoалкил, карбоксамид, сульфонамид, карбамат, мочевино или циано;

$R_2$  независимо выбирают из группы, состоящей из Н, amino, моно- или дизамещенного amino, ОН, карбоксила, этерифицированного карбоксила, карбоксамида, N-монозамещенного карбоксамида и N,N-дизамещенного карбоксамида, циано, алкила, алкенила, алкинила, циклоалкила, циклоалкенила, алкокси, тиоалкила, моно-, ди- или тригалогеноалкила, галогена, арила или гетероарила;

необязательно  $R_1$  и  $R_2$  могут быть связаны друг с другом с образованием спироцикла;

$R_3$ ,  $R_4$ ,  $R_5$  и  $R_6$  независимо выбирают из группы, состоящей из Н, amino, ОН, алкила, галогеноалкила, дигалогеноалкила, тригалогеноалкила, алкенила, алкинила, арила, гетероарила, арилалкила, гетероарилалкила, алкокси и тиоалкила;

необязательно  $R_1$  и  $R_3$  могут быть циклизованы с образованием карбоцикла или гетероцикла, содержащего 0-3 заместителя  $R_a$ , где  $R_a$  выбирают из группы, состоящей из галогена, алкила, алкокси, тиоалкила, моно-, ди- или тригалогеноалкила, моно-, ди- или тригалогеноалкокси, нитро, amino, карбоксила, этерифицированного карбоксила, карбоксамидо, тиокарбоксамидо, циано, моно-, дизамещенного или полизамещенного арила и гетероцикла, необязательно содержащих 0-3  $R_b$ , где  $R_b$  выбирают из группы, состоящей из галогена, алкила, алкокси, тиоалкила, моно-, ди- или тригалогеноалкила, моно-, ди- или тригалогеноалкокси, нитро, amino, карбоксила, этерифицированного карбоксила, карбоксамидо, тиокарбоксамидо и циано;

необязательно  $R_3$  и  $R_4$  или  $R_5$  и  $R_6$  циклизованы с образованием мостиковой бициклической системы, содержащей этиленовый мостик;

необязательно  $R_3$  и  $R_6$  циклизованы с образованием мостиковой бициклической системы, содержащей метиленовую группу или этиленовую группу, или гетероатом, выбранный из группы, состоящей из N, O и S;

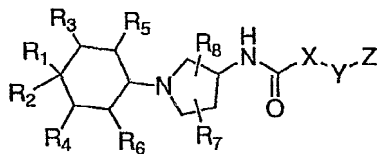
$R_7$  и  $R_8$  независимо выбирают из группы, состоящей из водорода,  $C_1$ - $C_8$ алкила, причем обязательно цепь  $C_1$ - $C_8$ алкила может прерываться кислородом или серой; алкокси, моно-, ди- или тригалогеноалкила, моно-, ди- или тригалогеноалкокси, алкоксиалкила, арилокси, гетероарилокси, арилалкокси, гетероарилалкокси, арилоксиалкила, гетероарилоксиалкила, арилалкоксиалкила или гетероарилалкоксиалкила;

необязательно  $R_7$  и  $R_8$  могут быть циклизованы с образованием спирокарбоцикла или спирогетероцикла;

$R_9$  и  $R_{10}$  независимо выбирают из группы, состоящей из H, OH, amino, алкокси, моно- или дизамещенного amino, алкила, алкенила, алкинила, арила, арилалкила, гетероарила, гетероарилалкила, карбоцикла или гетероцикла;

необязательно  $R_9$  и  $R_{10}$  могут быть циклизованы с образованием карбоцикла или гетероцикла; и  $r=0-3$ .

## 2. Соединение формулы II



### II

его энантиомеры, диастереоизомеры, энантиомерно обогащенные смеси, его рацемические смеси, пролекарства, кристаллические формы, некристаллические формы, его аморфные формы, его сольваты, его метаболиты и фармацевтически приемлемые соли, где

X выбирают из группы, состоящей из арила, моно- или полизамещенного арила, гетероцикла, гетероарила, моно- или полизамещенного гетероарила, карбоцикла, моно- или полизамещенного карбоцикла ( $CR_9R_{10}$ )<sub>n</sub>, где  $n=0-5$ ;

Y представляет связь, или его выбирают из группы, состоящей из кислорода, серы, азота, амидной связи, сульфонида, кетона, -CHON-, -CHO-алкила-, оксима или мочевины;

Z выбирают из группы, состоящей из карбоцикла, арила, гетероцикла или гетероарила с 0-3 заместителями  $R_{11}$ , где  $R_{11}$  независимо выбирают из группы, состоящей из галогена, алкила, алкенила, алкинила, алкокси, алкоксиалкила, алкилтиоалкила, тиоалкила, моно-, ди- или тригалогеноалкила, моно-, ди- или тригалогеноалкокси, нитро, amino, моно- или дизамещенного amino, моно- или дизамещенного aminoалкила, карбоксила, этерифицированного карбоксила, карбоксамида, моно- или дизамещенного карбоксамида, карбамата, моно- или дизамещенного карбамата, сульфонида, моно- или дизамещенного сульфонида, алкилкарбонила, циклического алкилсульфонила, арилсульфонила, гетероарилсульфонила, алкилкарбонила, циклического алкилкарбонила, арилкарбонила, гетероарилкарбонила, тиокарбоксамида, циано и  $R_{11a}$ -арила или  $R_{11a}$ -гетероарила, где  $R_{11a}$  представляет H, галоген, OH, amino, моно- или дизамещенный amino, моно-, ди- или тригалогеноалкил, алкокси, моно-, ди- или тригалогеноалкокси, карбоксамида, сульфонида, карбамата, мочевины или циано;

$R_1$  независимо выбирают из группы, состоящей из H, алкила, алкенила, алкинила, циклоалкила, циклоалкенила, алкокси, тиоалкила, тригалогеноалкила, галогена, карбоцикла, гетероцикла, арила, гетероарила, арилалкила, гетероарилалкила, арилалкенила, гетероарилалкенила, арилалкинила, гетероарилалкинила, ариламинокрбонила, гетероариламинокрбонила, арилкарбоксамида, гетероарилкарбоксамида, арилуридо, гетероарилуридо, арилокси, гетероарилокси, арилалкокси, гетероарилалкокси, ариламино или гетероариламино, и где указанные группы карбоцикла, гетероцикла, арила, арилалкила, гетероарила или гетероарилалкила, могут

быть замещены 0-3 заместителями  $R_{1a}$ , где  $R_{1a}$  независимо выбирают из группы, состоящей из галогена, алкила, алкенила, алкинила, алкокси, алкоксиалкила, алкилтиоалкила, гидроксиалкила, моно-, ди- или тригалогеноалкила, моно-, ди- или тригалогеноалкокси, нитро, amino, моно- или дизамещенного amino, моно- или дизамещенного aminoалкила, аминокарбонила, моно- или дизамещенного аминокарбонила, циклического аминокарбонила, аминосульфонил, моно- или дизамещенного аминосульфонил, алкилкарбонила, циклического алкилкарбонила, арилкарбонила, гетероарилкарбонила, алкилсульфонил, циклического алкилсульфонил, арилсульфонил, гетероарилсульфонил, карбоновой кислоты, этерифицированной карбоновой кислоты, алкилкарбониламино, циклического алкилкарбониламино, арилкарбониламино, гетероарилкарбониламино, циано, арилалкила, гетероарилалкила, арилоксиалкила, гетероарилоксиалкила, арилтиоалкила, гетероарилтиоалкила, карбамата, моно- или дизамещенного карбамата,  $R_{1b}$ -арила или  $R_{1b}$ -гетероарила, где  $R_{1b}$  представляет Н, галоген, ОН, amino, моно- или дизамещенный amino, моно-, ди- или тригалогеноалкил, алкокси, моно-, ди- или тригалогеноалкокси, гидроксиалкил, алкоксиалкил, aminoалкил, моно- или дизамещенный aminoалкил, карбоксамид, сульфонамид, карбамат, мочевины или циано;

$R_2$  независимо выбирают из группы, состоящей из Н, amino, моно- или дизамещенного amino, ОН, карбоксила, этерифицированного карбоксила, карбоксамида, N-монозамещенного карбоксамида и N,N-дизамещенного карбоксамида, циано, алкила, алкенила, алкинила, циклоалкила, циклоалкенила, алкокси, тиоалкила, моно-, ди- или тригалогеноалкила, галогена, арила или гетероарила;

необязательно  $R_1$  и  $R_2$  могут быть связаны друг с другом с образованием спироцикла;

$R_3$ ,  $R_4$ ,  $R_5$  и  $R_6$  независимо выбирают из группы, состоящей из Н, amino, ОН, алкила, галогеноалкила, дигалогеноалкила, тригалогеноалкила, алкенила, алкинила, арила, гетероарила, арилалкила, гетероарилалкила, алкокси и тиоалкила,

необязательно  $R_1$  и  $R_3$  могут быть циклизованы с образованием карбоцикла или гетероцикла, содержащего 0-3 заместителя  $R_a$ , где  $R_a$  выбирают из группы, состоящей из галогена, алкила, алкокси, тиоалкила, моно-, ди- или тригалогеноалкила, моно-, ди- или тригалогеноалкокси, нитро, amino, карбоксила, этерифицированного карбоксила, карбоксамидо, тиокарбоксамидо, циано, моно-, дизамещенного или полизамещенного арила и гетероцикла, необязательно содержащего 0-3  $R_b$ , где  $R_b$  выбирают из группы, состоящей из галогена, алкила, алкокси, тиоалкила, моно-, ди- или тригалогеноалкила, моно-, ди- или тригалогеноалкокси, нитро, amino, карбоксила, этерифицированного карбоксила, карбоксамидо, тиокарбоксамидо и циано;

необязательно  $R_3$  и  $R_4$  или  $R_5$  и  $R_6$  циклизованы с образованием мостиковой бициклической системы, содержащей этиленовый мостик;

необязательно  $R_3$  и  $R_6$  циклизованы с образованием мостиковой бициклической системы, содержащей метиленовую группу или этиленовую группу, или гетероатом, выбранный из группы, состоящей из N, O и S;

$R_7$  и  $R_8$  независимо выбирают из группы, состоящей из водорода,  $C_1$ - $C_8$ алкила, причем необязательно цепь  $C_1$ - $C_8$ алкила может быть прервана кислородом или серой; алкокси, моно-, ди- или тригалогеноалкила, моно-, ди- или тригалогеноалкокси, алкоксиалкила, арилокси, гетероарилокси, арилалкокси, гетероарилалкокси, арилоксиалкила, гетероарилоксиалкила, арилалкоксиалкила или гетероарилалкоксиалкила;

необязательно  $R_7$  и  $R_8$  могут быть циклизованы с образованием спирокарбоцикла или спирогетероцикла;

$R_9$  и  $R_{10}$  независимо выбирают из группы, состоящей из Н, ОН, amino, алкокси, моно- или дизамещенного amino, алкила, алкенила, алкинила, арила, арилалкила, гетероарила, гетероарилалкила, карбоцикла или гетероцикла; и

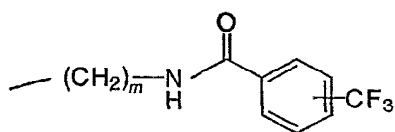
необязательно  $R_9$  и  $R_{10}$  могут быть циклизованы с образованием карбоцикла или гетероцикла.

3. Соединение по п.2, где  $R_2$  представляет ОН,  $R_3$ ,  $R_4$ ,  $R_5$ ,  $R_6$ ,  $R_7$  и  $R_8$  представляют водород,  $R_1$  выбирают из группы, состоящей из фенила, 4-метилфенила, 3-метилфенила,

2-метилфенила, 4-бромфенила, 3-бромфенила, 4-хлорфенила,  
3-хлорфенила, 4-трифторметилфенила, 3-трифторметилфенила,  
2-трифторметилфенила, 2-метоксифенила, 2-метокси-5-пиридила,  
2-этокси-5-пиридила, 3,4-метилendioксифенила, 4-фторфенила,  
3-трифторметил-1H-пиразол-1-ила, 3-фторфенила, 4-метоксифенила,  
3-метоксифенила, хинолин-4-ила, 3-метил-1H-пиразол-1-ила,  
3,5-диметил-1H-пиразол-1-ила, 4-трифторметилфенила,  
3-трифторметилфенила, 3,4-метилendioксифенила, 4-цианофенила,  
4-(метиламинокарбонил)фенила, пиридин-2-ила, пиридин-3-ила,  
пиридин-4-ила, 4-метилпиридин-2-ила, 5-метилпиридин-2-ила,  
6-метилпиридин-2-ила, 6-метоксипиридин-2-ила,  
6-метоксипиридин-3-ила, 6-метилпиридин-3-ила,  
6-этилпиридин-3-ила, 6-изопропилпиридин-3-ила,  
6-циклопропилпиридин-3-ила, 1-оксидопиридин-3-ила,  
1-оксидопиридин-2-ила, хинолин-4-ила, 3-цианофенила,  
3-(метиламинокарбонил)фенила, 1-оксидопиридин-4-ила,  
4-(морфолин-4-илкарбонил)фенила,  
5-(морфолин-4-илкарбонил)пиридин-2-ила,  
6-(морфолин-4-илкарбонил)пиридин-3-ила,  
4-(4-метилпиперазин-1-илкарбонил)фенила,  
6-(азетидин-1-ил)пиридин-3-ила, 5-цианопиридин-2-ила,  
6-цианопиридин-3-ила, 5-(метоксиметил)пиридин-2-ила,  
5-(1-гидрокси-1-метилэтил)пиридин-2-ила,  
4-(этиламинокарбонил)фенила, 4-(изопропиламинокарбонил)фенила,  
4-(трет-бутиламинокарбонил)фенила,  
4-(диметиламинокарбонил)фенила,  
4-[(азетидин-1-ил)карбонил]фенила,  
4-[(пирролидин-1-ил)карбонил]фенила,  
4-[(морфолин-4-ил)карбонил]фенила,  
4-(диметиламинокарбонил)-2-метилфенила,  
2-метил-4-(метиламинокарбонил)фенила,  
3-метил-4-(метиламинокарбонил)фенила,  
4-(диметиламинокарбонил)-3-метилфенила,  
3-метил-4-(пирролидин-1-илкарбонил)фенила,  
4-(диметиламинокарбонил)-3-фторфенила,  
4-[(2,2,2-трифторэтил)аминокарбонил]фенила,  
3-фтор-4-метиламинокарбонилфенила,  
4-этиламинокарбонил-3-фторфенила, 3-метиламинокарбонилфенила,  
3-диметиламинокарбонилфенила,  
5-диметиламинокарбонил-2-метоксифенила,  
2-метокси-5-метиламинокарбонилфенила,  
3-(метиламинокарбониламино)фенила,  
6-(морфолин-4-ил)пиридин-3-ила, 6-диметиламинопиридин-3-ила,  
6-изопропиламинопиридин-3-ила, 6-(пирролидин-1-ил)пиридин-3-ила,  
6-циклопропиламинопиридин-3-ила, 6-этоксипиридин-3-ила,  
6-(2-фторэтокси)пиридин-3-ила,  
6-(2,2-дифторэтокси)пиридин-3-ила,  
6-(2,2,2-трифторэтокси)пиридин-3-ила, 4-иодифенила,  
5-(пирролидин-1-илкарбонил)-2-пиридила,  
5-(морфолин-4-илкарбонил)-2-пиридила,  
5-диметиламинокарбонил-2-пиридила,  
4-метиламинокарбониламинофенила,  
6-(1-гидрокси-1-метилэтил)пиридин-3-ила,  
4-(1-гидрокси-1-метилэтил)фенила, 4-(метоксиметил)фенила,

3-фтор-4-(метоксиметил)фенила, 4-(диметиламино)фенила,  
4-(диметиламино)-3-фторфенила, 1H-индазол-5-ила,  
1-метил-1H-индазол-5-ила, 2-метил-1H-индазол-5-ила,  
1,3-тиазол-2-ила, 5-этил-1,3-тиазол-2-ила,  
5-(метиламинокарбонил)-1,3-тиазол-2-ила, 1,3-тиазол-5-ила,  
2-(метоксикарбониламино)-1,3-тиазол-5-ила,  
2-изопропил-1,3-тиазол-5-ила,  
5-(пиридин-3-ил)-1,3-тиазол-2-ила,  
5-(морфолин-4-илкарбонил)-1,3-тиазол-2-ила,  
5-аминокарбонил-1,3-тиазол-2-ила,  
5-диметиламинокарбонил-1,3-тиазол-2-ила,  
5-(пирролидин-1-илкарбонил)-1,3-тиазол-2-ила,  
5-аллил-1,3-тиазол-2-ила, 5-пропил-1,3-тиазол-2-ила,  
5-этиламинокарбонил-1,3-тиазол-2-ила, 5-фенил-1,3-тиазол-2-ила,  
5-метил-1,3-тиазол-2-ила, 5-гидроксиметил-1,3-тиазол-2-ила,  
5-(1-гидрокси-1-метилэтил)-1,3-тиазол-2-ила,  
5-метоксиметил-1,3-тиазол-2-ила,  
5-(2-пиридил)-1,3-тиазол-2-ила,  
2-(пирролидин-1-ил)-1,3-тиазол-4-ила,  
2-(морфолин-4-ил)-1,3-тиазол-4-ила, 2-метил-1,3-тиазол-5-ила,  
2-(1-гидрокси-1-метилэтил)-1,3-тиазол-5-ила,  
2-(пирролидин-1-ил)-1,3-тиазол-5-ила,  
2-этокси-1,3-тиазол-5-ила, 2-этил-1,3-тиазол-5-ила,  
2-(пирролидин-1-илметил)-1,3-тиазол-5-ила,  
2-(морфолин-4-ил)-1,3-тиазол-5-ила,  
2-метоксиметил-1,3-тиазол-5-ила, 2-изобутил-1,3-тиазол-5-ила,  
2-этиламинокарбонил-1,3-тиазол-5-ила,  
2-(пирролидин-1-илкарбонил)-1,3-тиазол-5-ила,  
2-(морфолин-4-илкарбонил)-1,3-тиазол-5-ила,  
2-(3-пиридил)-1,3-тиазол-5-ила, 2-(2-пиридил)-1,3-тиазол-5-ила,  
4-метил-1,3-тиазол-2-ила, 1,3-бензотиазол-2-ила,  
пиримидин-5-ила, пиримидин-4-ила, пиримидин-2-ила,  
пиридазин-3-ила, пиразин-2-ила, 2-метоксипиримидин-5-ила,  
2-этоксипиримидин-5-ила, 2-(2-фторэтокси)пиримидин-5-ила,  
2-метилпиримидин-5-ила, 2-этилпиримидин-5-ила,  
2-изопропилпиримидин-5-ила, 2-циклопропилпиримидин-5-ила,  
пиримидин-4-ила, 4-(пиримидин-5-ил)фенила,  
4-(1,3-оксазол-2-ил)фенила, 4-(1H-имидазол-1-ил)фенила,  
4-(морфолин-4-ил)фенила, 5-(пиразин-2-ил)пиридин-2-ила,  
4-(1-метил-1H-имидазол-5-ил)фенила,  
4-(4,6-диметилпиримидин-5-ил)фенила, 6-бромпиридин-3-ила,  
5-бромпиридин-2-ила, 4'-(метилсульфонил)бифенил-4-ила,  
3'-(метилсульфонил)бифенил-4-ила,  
3'-(метоксикарбонил)бифенил-4-ила,  
4-(2,3-дигидро-1,4-бензодиоксин-6-ил)фенила,  
4'-(диметиламино)бифенил-4-ила, 4-(пиридин-3-ил)фенила,  
4-(1H-пиразол-4-ил)фенила, 3,3'-бипиридин-6-ила,  
3,4'-бипиридин-6-ила, 5-(3-ацетилфенил)пиридин-2-ила,  
5-[3-(диметиламино)фенил]пиридин-2-ила,  
5-[3-(трифторметил)фенил]пиридин-2-ила,  
5-[4-(метилсульфонил)фенил]пиридин-2-ила,  
5-(4-метоксифенил)пиридин-2-ила,  
5-(3-метоксифенил)пиридин-2-ила,  
5-[3-(аминокарбонил)фенил]пиридин-2-ила,

5-(4-фторфенил)пиридин-2-ила, 5-(3,4-дифторфенил)пиридин-2-ила,  
 5-(3,5-диметилизоксазол-4-ил)пиридин-2-ила,  
 5-(1-метил-1Н-пиразол-4-ил)пиридин-2-ила,  
 5-(1Н-пиразол-4-ил)пиридин-2-ила,  
 5-(1-бензофуран-2-ил)пиридин-2-ила,  
 5-(1,3-бензодиоксол-5-ил)пиридин-2-ила,  
 5-(2-формилфенил)пиридин-2-ила, 4-(2'-формилбифенил)-4-ила,  
 5-(1,3-оксазол-2-ил)пиридин-2-ила,  
 6-(1,3-оксазол-2-ил)пиридин-3-ила, 4-(1,3-тиазол-2-ил)фенила,  
 5-(1,3-тиазол-2-ил)пиридин-2-ила,  
 6-(1,3-тиазол-2-ил)пиридин-3-ила,  
 6-(1Н-имидазол-1-ил)пиридин-3-ила,  
 5-(1Н-имидазол-1-ил)пиридин-2-ила, 6-фенилпиридин-3-ила,  
 5-(пиримидин-5-ил)пиридин-2-ила,  
 5-(пиримидин-2-ил)пиридин-2-ила,  
 5-(3-аминокарбонилфенил)пиридин-2-ила,  
 4-(1-метил-1Н-имидазол-4-ил)фенила, 4-(1Н-имидазол-4-ил)фенила,  
 5-[2-(гидроксиметил)фенил]пиридин-2-ила,  
 2'-(гидроксиметил)бифенил-4-ила,  
 5-{2-[(диметиламино)метил]фенил}пиридин-2-ила,  
 2'-[(диметиламино)метил]бифенил-4-ила,  
 5-фторметилпиразин-2-ила, 5-дифторметилпиразин-2-ила,  
 5-метилпиразин-2-ила, 2-метилпиримидин-5-ила,  
 2-фторметилпиримидин-5-ила, 2-дифторметилпиримидин-5-ила,  
 2-трифторметилпиримидин-5-ила, 2-циклопропилпиримидин-5-ила,  
 изотиазол-5-ила, 3-метилизотиазол-5-ила,  
 3-фторметилизотиазол-5-ила, 4-(диметиламинокарбонил)фенила,  
 4-(метиламинокарбонил)фенила, 4-(морфолин-4-илкарбонил)фенила,  
 4-(пиперидин-1-илкарбонил)фенила,  
 3-фтор-4-(пирролидин-1-илкарбонил)фенила,  
 5-(пирролидин-1-илкарбонил)пиридин-2-ила,  
 5-(диметиламинокарбонил)пиридин-2-ила,  
 5-(морфолин-4-илкарбонил)пиридин-2-ила, хинолин-4-ила,  
 6-метоксипиридин-3-ила, 6-(морфолин-4-ил)пиридин-3-ила,  
 4-(диметиламинометил)фенила,  
 5-(диметиламинометил)пиридин-2-ила,  
 5-(диметиламинокарбонил)пиридин-2-ила,  
 4-[гидрокси(пиридин-3-ил)метил]фенила,  
 6-[[гидрокси(пиридин-3-ил)метил]пиридин-3-ила,  
 6-(диметиламинокарбонил)пиридин-3-ила,  
 4-(4-гидроксипиперидин-1-илкарбонил)фенила,  
 4-(4-метоксипиперидин-1-илкарбонил)фенила,  
 5-(4-метоксипиперидин-1-илкарбонил)пиридин-2-ила,  
 6-(4-метоксипиперидин-1-илкарбонил)пиридин-3-ила,  
 фенокси, бензилокси, 2-тиенила, 2-изопропил-1,3-тиазол-5-ила,  
 4-(пиримидин-2-ил)фенила, 4-(пиримидин-4-ил)фенила и  
 5-(метоксиметил)пиридин-2-ила, и  
 X-Y-Z представляют



где  $m=1$ .

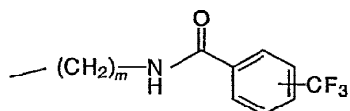
4. Соединение по п.2, где R<sub>2</sub> представляет H, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub>, R<sub>5</sub>, R<sub>6</sub>, R<sub>7</sub> и R<sub>8</sub> представляют водород, R<sub>1</sub> выбирают из группы, состоящей из фенила, пиридин-2-ила, 4-метилфенила, 3-метилфенила,

2-метилфенила, 4-бромфенила, 3-бромфенила, 4-хлорфенила,  
3-хлорфенила, 4-трифторметилфенила, 3-трифторметилфенила,  
2-трифторметилфенила, 2-метоксифенила, 3,4-метилендиоксифенила,  
4-фторфенила, 3-трифторметил-1H-пиразол-1-ила, 3-фторфенила,  
3-хлорфенила, 4-метоксифенила, 3-метоксифенила, пиридин-4-ила,  
пиридин-3-ила, 6-метилпиридин-2-ила, 6-метилпиридин-3-ила,  
6-этилпиридин-3-ила, 6-изопропилпиридин-3-ила, хинолин-4-ила,  
3-метил-1H-пиразол-1-ила, 3,5-диметил-1H-пиразол-1-ила,  
4-цианофенила, 4-(метиламинокарбонил)фенила,  
1-оксидопиридин-4-ила, пиридин-2-ила, 4-метилпиридин-2-ила,  
5-метилпиридин-2-ила, 6-метоксипиридин-2-ила,  
6-метоксипиридин-3-ила, 6-метилпиридин-3-ила,  
6-этилпиридин-3-ила, 6-изопропилпиридин-3-ила,  
6-циклопропилпиридин-3-ила, 1-оксидопиридин-3-ила,  
1-оксидопиридин-2-ила, 3-цианофенила,  
3-(метиламинокарбонил)фенила, 1-оксидопиридин-4-ила,  
4-(морфолин-4-илкарбонил)фенила,  
5-(морфолин-4-илкарбонил)пиридин-2-ила,  
6-(морфолин-4-илкарбонил)пиридин-3-ила,  
4-(4-метилпиперазин-1-илкарбонил)фенила,  
6-(азетидин-1-ил)пиридин-3-ила, 5-цианопиридин-2-ила,  
6-цианопиридин-3-ила, 5-(метоксиметил)пиридин-2-ила,  
5-(1-гидрокси-1-метилэтил)пиридин-2-ила, 5-диметиламинометила,  
4-этиламинокарбонилфенила, 4-изопропиламинокарбонилфенила,  
4-трет-бутиламинокарбонилфенила, 4-диметиламинокарбонилфенила,  
4-(азетидин-1-ил)карбонилфенила,  
4-(пирролидин-1-ил)карбонилфенила,  
4-(морфолин-4-ил)карбонилфенила,  
4-(диметиламинокарбонил)-2-метилфенила,  
2-метил-4-(метиламинокарбонил)фенила,  
3-метил-4-(метиламинокарбонил)фенила,  
4-(диметиламинокарбонил)-3-метилфенила,  
3-метил-4-(пирролидин-1-илкарбонил)фенила,  
4-(диметиламинокарбонил)-3-фторфенила,  
4-[(2,2,2-трифторэтил)аминокарбонил]фенила,  
3-фтор-4-метиламинокарбонилфенила,  
4-этиламинокарбонил-3-фторфенила, 3-метиламинокарбонилфенила,  
3-диметиламинокарбонилфенила,  
5-диметиламинокарбонил-2-метоксифенила,  
2-метокси-5-метиламинокарбонилфенила,  
3-(метиламинокарбониламино)фенила,  
6-(морфолин-4-ил)пиридин-3-ила, 6-диметиламинопиридин-3-ила,  
6-изопропиламинопиридин-3-ила, 6-(пирролидин-1-ил)пиридин-3-ила,  
6-циклопропиламинопиридин-3-ила, 6-этоксипиридин-3-ила,  
6-(2-фторэтокси)пиридин-3-ила,  
6-(2,2-дифторэтокси)пиридин-3-ила,  
6-(2,2,2-трифторэтокси)пиридин-3-ила, 4-иодифенила,  
5-(пирролидин-1-илкарбонил)-2-пиридила,  
5-(морфолин-4-илкарбонил)-2-пиридила,  
5-диметиламинокарбонил-2-пиридила,  
4-метиламинокарбониламинофенила,



6-(1-гидрокси-1-метилэтил)пиридин-3-ила,  
4-(1-гидрокси-1-метилэтил)фенила, 4-(метоксиметил)фенила,  
3-фтор-4-(метоксиметил)фенила, 4-(диметиламино)фенила,  
4-(диметиламино)-3-фторфенила, 1H-индазол-5-ила,  
1-метил-1H-индазол-5-ила, 2-метил-1H-индазол-5-ила,  
1,3-тиазол-2-ила, 5-этил-1,3-тиазол-2-ила,  
5-(метиламинокарбонил)-1,3-тиазол-2-ила, 1,3-тиазол-5-ила,  
2-(метоксикарбониламино)-1,3-тиазол-5-ила,  
2-изопропил-1,3-тиазол-5-ила,  
5-(пиридин-3-ил)-1,3-тиазол-2-ила,  
5-(морфолин-4-илкарбонил)-1,3-тиазол-2-ила,  
5-аминокарбонил-1,3-тиазол-2-ила,  
5-диметиламинокарбонил-1,3-тиазол-2-ила,  
5-(пирролидин-1-илкарбонил)-1,3-тиазол-2-ила,  
5-аллил-1,3-тиазол-2-ила, 5-пропил-1,3-тиазол-2-ила,  
5-этиламинокарбонил-1,3-тиазол-2-ила, 5-фенил-1,3-тиазол-2-ила,  
5-метил-1,3-тиазол-2-ила, 5-гидроксиметил-1,3-тиазол-2-ила,  
5-(1-гидрокси-1-метилэтил)-1,3-тиазол-2-ила,  
5-метоксиметил-1,3-тиазол-2-ила,  
5-(2-пиридил)-1,3-тиазол-2-ила,  
2-(пирролидин-1-ил)-1,3-тиазол-4-ила,  
2-(морфолин-4-ил)-1,3-тиазол-4-ила, 2-метил-1,3-тиазол-5-ила,  
2-(1-гидрокси-1-метилэтил)-1,3-тиазол-5-ила,  
2-(пирролидин-1-ил)-1,3-тиазол-5-ила,  
2-этокси-1,3-тиазол-5-ила, 2-этил-1,3-тиазол-5-ила,  
2-(пирролидин-1-илметил)-1,3-тиазол-5-ила,  
2-(морфолин-4-ил)-1,3-тиазол-5-ила,  
2-метоксиметил-1,3-тиазол-5-ила, 2-изобутил-1,3-тиазол-5-ила,  
2-этиламинокарбонил-1,3-тиазол-5-ила,  
2-(пирролидин-1-илкарбонил)-1,3-тиазол-5-ила,  
2-(морфолин-4-илкарбонил)-1,3-тиазол-5-ила,  
2-(3-пиридил)-1,3-тиазол-5-ила, 2-(2-пиридил)-1,3-тиазол-5-ила,  
4-метил-1,3-тиазол-2-ила, 1,3-бензотиазол-2-ила,  
пиримидин-5-ила, пиримидин-2-ила, пиридазин-4-ила,  
пиридазин-3-ила, пиразин-2-ила, 2-метилпиримидин-5-ила,  
2-этилпиридин-5-ила, 2-изопропилпиримидин-5-ила,  
2-циклопропилпиримидин-5-ила, 2-метоксипиримидин-5-ила,  
2-этоксипиримидин-5-ила, 2-(2-фторэтокси)пиримидин-5-ила,  
пиримидин-4-ила, 4-(пиримидин-5-ил)фенила,  
4-(1,3-оксазол-2-ил)фенила, 4-(1H-имидазол-1-ил)фенила,  
4-(морфолин-4-ил)фенила, 5-(пиразин-2-ил)пиридин-2-ила,  
4-(1-метил-1H-имидазол-5-ил)фенила,  
4-(4,6-диметилпиримидин-5-ил)фенила, 6-бромпиридин-3-ила,  
5-бромпиридин-2-ила, 4'-(метилсульфонил)бифенил-4-ила,  
3'-(метилсульфонил)бифенил-4-ила,  
3'-(метоксикарбонил)бифенил-4-ила,  
4-(2,3-дигидро-1,4-бензодиоксин-6-ил)фенила,  
4'-(диметиламино)бифенил-4-ила, 4-(пиридин-3-ил)фенила,  
4-(1H-пиразол-4-ил)фенила, 3,3'-бипиридин-6-ила,  
3,4'-бипиридин-6-ила, 5-(3-ацетилфенил)пиридин-2-ила,  
5-[3-(диметиламино)фенил]пиридин-2-ила,  
5-[3-(трифторметил)фенил]пиридин-2-ила,  
5-[4-(метилсульфонил)фенил]пиридин-2-ила,  
5-(4-метоксифенил)пиридин-2-ила,

5-(3-метоксифенил)пиридин-2-ила,  
 5-[3-(аминокарбонил)фенил]пиридин-2-ила,  
 5-(4-фторфенил)пиридин-2-ила, 5-(3,4-дифторфенил)пиридин-2-ила,  
 5-(3,5-диметилизоксазол-4-ил)пиридин-2-ила,  
 5-(1-метил-1Н-пиразол-4-ил)пиридин-2-ила,  
 5-(1Н-пиразол-4-ил)пиридин-2-ила,  
 5-(1-бензофуран-2-ил)пиридин-2-ила,  
 5-(1,3-бензодиоксол-5-ил)пиридин-2-ила,  
 5-(2-формилфенил)пиридин-2-ила, 4-(2'-формилбифенил)-4-ила,  
 5-(1,3-оксазол-2-ил)пиридин-2-ила,  
 6-(1,3-оксазол-2-ил)пиридин-3-ила, 4-(1,3-тиазол-2-ил)фенила,  
 5-(1,3-тиазол-2-ил)пиридин-2-ила,  
 6-(1,3-тиазол-2-ил)пиридин-3-ила,  
 6-(1Н-имидазол-1-ил)пиридин-3-ила,  
 5-(1Н-имидазол-1-ил)пиридин-2-ила, 6-фенилпиридин-3-ила,  
 5-(пиримидин-5-ил)пиридин-2-ила,  
 5-(пиримидин-2-ил)пиридин-2-ила,  
 5-(3-аминокарбонилфенил)пиридин-2-ила,  
 4-(1-метил-1Н-имидазол-4-ил)фенила, 4-(1Н-имидазол-4-ил)фенила,  
 5-[2-(гидроксиметил)фенил]пиридин-2-ила,  
 2'-(гидроксиметил)бифенил-4-ила,  
 5-{2-[(диметиламино)метил]фенил}пиридин-2-ила,  
 2'-[(диметиламино)метил]бифенил-4-ила,  
 5-фторметилпиразин-2-ила, 5-дифторметилпиразин-2-ила,  
 5-метилпиразин-2-ила, 2-метилпиримидин-5-ила,  
 2-фторметилпиримидин-5-ила, 2-дифторметилпиримидин-5-ила,  
 2-трифторметилпиримидин-5-ила, 2-циклопропилпиримидин-5-ила,  
 изотиазол-5-ила, 3-метилизотиазол-5-ила,  
 3-фторметилизотиазол-5-ила, 4-(диметиламинокарбонил)фенила,  
 4-(метиламинокарбонил)фенила, 4-(морфолин-4-илкарбонил)фенила,  
 4-(пиперидин-1-илкарбонил)фенила,  
 3-фтор-4-(пирролидин-1-илкарбонил)фенила,  
 5-(пирролидин-1-илкарбонил)пиридин-2-ила,  
 5-(диметиламинокарбонил)пиридин-2-ила,  
 5-(морфолин-4-илкарбонил)пиридин-2-ила, хинолин-4-ила,  
 6-метоксипиридин-3-ила, 6-(морфолин-4-ил)пиридин-3-ила,  
 4-(диметиламинометил)фенила,  
 5-(диметиламинометил)пиридин-2-ила,  
 5-(диметиламинокарбонил)пиридин-2-ила,  
 4-[гидрокси(пиридин-3-ил)метил]фенила,  
 6-[(гидрокси(пиридин-3-ил)метил)пиридин-3-ила,  
 6-(диметиламинокарбонил)пиридин-3-ила,  
 4-(4-гидроксипиперидин-1-илкарбонил)фенила, 4-(4-метоксипиперидин-1-илкарбонил)фенила,  
 5-(4-метоксипиперидин-1-илкарбонил)пиридин-2-ила,  
 6-(4-метоксипиперидин-1-илкарбонил)пиридин-3-ила, фенокси,  
 бензилокси, 2-тиенила, 2-изопропил-1,3-тиазол-5-ила,  
 4-(пиримидин-2-ил)фенила, 4-(пиримидин-4-ил)фенила и  
 5-(метоксиметил)пиридин-2-ила, и  
 X-Y-Z представляет



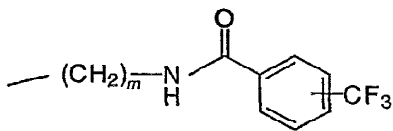
где  $m=1$ .

5. Соединение по п.2, где  $R_2$  представляет H,  $R_3, R_4, R_5, R_6$  представляют водород,  $R_7$  представляет гидроксигруппу и  $R_8$  представляет водород;  $R_1$  выбирают из группы, состоящей из фенила,

пиридин-2-ила, 4-метилфенила, 3-метилфенила, 2-метилфенила, 4-бромфенила, 3-бромфенила, 4-хлорфенила, 3-хлорфенила, 4-трифторметилфенила, 3-трифторметилфенила, 2-трифторметилфенила, 2-метоксифенила, 3,4-метилендиоксифенила, 4-фторфенила, 3-трифторметил-1H-пиразол-1-ила, 3-фторфенила, 4-метоксифенила, 3-метоксифенила, пиридин-4-ила, пиридин-3-ила, хинолин-4-ила, 3-метил-1H-пиразол-1-ила, 3,5-диметил-1H-пиразол-1-ила, 4-цианофенила, 4-(метиламинокарбонил)фенила, 1-оксидопиридин-4-ила, 4-метилфенила, 4-метоксифенила, 3-метоксифенила, 4-фторфенила, 3-фторфенила, пиридин-2-ила, пиридин-3-ила, пиридин-4-ила, 4-метилпиридин-2-ила, 5-метилпиридин-2-ила, 6-метилпиридин-2-ила, 6-метоксипиридин-2-ила, 6-метоксипиридин-3-ила, 6-метилпиридин-3-ила, 6-этилпиридин-3-ила, 6-изопропилпиридин-3-ила, 6-циклопропилпиридин-3-ила, 1-оксидопиридин-3-ила, 1-оксидопиридин-2-ила, 3-цианофенила, 3-(метиламинокарбонил)фенила, 1-оксидопиридин-4-ила, 4-(морфолин-4-илкарбонил)фенила, 5-(морфолин-4-илкарбонил)пиридин-2-ила, 6-(морфолин-4-илкарбонил)пиридин-3-ила, 4-(4-метилпиперазин-1-илкарбонил)фенила, 6-(азетидин-1-ил)пиридин-3-ила, 5-цианопиридин-2-ила, 6-цианопиридин-3-ила, 5-метоксиметилпиридин-2-ила, 5-(1-гидрокси-1-метилэтил)пиридин-2-ила, 5-диметиламинометила, 4-этиламинокарбонилфенила, 4-изопропиламинокарбонилфенила, 4-трет-бутиламинокарбонилфенила, 4-диметиламинокарбонилфенила, 4-(азетидин-1-ил)карбонилфенила, 4-(пирролидин-1-ил)карбонилфенила, 4-(морфолин-4-ил)карбонилфенила, 4-(диметиламинокарбонил)-2-метилфенила, 2-метил-4-(метиламинокарбонил)фенила, 3-метил-4-(метиламинокарбонил)фенила, 4-(диметиламинокарбонил)-3-метилфенила, 3-метил-4-(пирролидин-1-илкарбонил)фенила, 4-(диметиламинокарбонил)-3-фторфенила, 4-[(2,2,2-трифторэтил)аминокарбонил]фенила, 3-фтор-4-метиламинокарбонилфенила, 4-этиламинокарбонил-3-фторфенила, 3-метиламинокарбонилфенила, 3-диметиламинокарбонилфенила, 5-диметиламинокарбонил-2-метоксифенила, 2-метокси-5-метиламинокарбонилфенила, 3-(метиламинокарбониламино)фенила, 6-(морфолин-4-ил)пиридин-3-ила, 6-диметиламинопиридин-3-ила, 6-изопропиламинопиридин-3-ила, 6-(пирролидин-1-ил)пиридин-3-ила, 6-циклопропиламинопиридин-3-ила, 6-этоксипиридин-3-ила, 6-(2-фторэтокси)пиридин-3-ила, 6-(2,2-дифторэтокси)пиридин-3-ила, 6-(2,2,2-трифторэтокси)пиридин-3-ила, 4-иодифенила, 5-(пирролидин-1-илкарбонил)-2-пиридила,

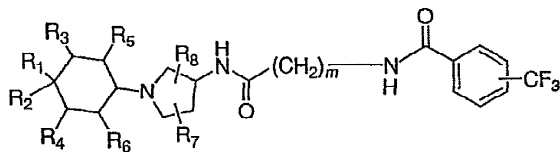
5-(морфолин-4-илкарбонил)-2-пиридила,  
5-диметиламинокарбонил-2-пиридила,  
4-метиламинокарбониламинофенила,  
6-(1-гидрокси-1-метилэтил)пиридин-3-ила,  
4-(1-гидрокси-1-метилэтил)фенила, 4-(метоксиметил)фенила,  
3-фтор-4-(метоксиметил)фенила, 4-(диметиламино)фенила,  
4-(диметиламино)-3-фторфенила, 1Н-индазол-5-ила,  
1-метил-1Н-индазол-5-ила, 2-метил-1Н-индазол-5-ила,  
1,3-тиазол-2-ила, 5-этил-1,3-тиазол-2-ила,  
5-(метиламинокарбонил)-1,3-тиазол-2-ила, 1,3-тиазол-5-ила,  
2-(метоксикарбониламино)-1,3-тиазол-5-ила,  
2-изопропил-1,3-тиазол-5-ила,  
5-(пиридин-3-ил)-1,3-тиазол-2-ила,  
5-(морфолин-4-илкарбонил)-1,3-тиазол-2-ила,  
5-аминокарбонил-1,3-тиазол-2-ила,  
5-диметиламинокарбонил-1,3-тиазол-2-ила,  
5-(пирролидин-1-илкарбонил)-1,3-тиазол-2-ила,  
5-аллил-1,3-тиазол-2-ила, 5-пропил-1,3-тиазол-2-ила,  
5-этиламинокарбонил-1,3-тиазол-2-ила, 5-фенил-1,3-тиазол-2-ила,  
5-метил-1,3-тиазол-2-ила, 5-гидроксиметил-1,3-тиазол-2-ила,  
5-(1-гидрокси-1-метилэтил)-1,3-тиазол-2-ила,  
5-метоксиметил-1,3-тиазол-2-ила,  
5-(2-пиридил)-1,3-тиазол-2-ила,  
2-(пирролидин-1-ил)-1,3-тиазол-4-ила,  
2-(морфолин-4-ил)-1,3-тиазол-4-ила,  
2-метил-1,3-тиазол-5-ила,  
2-(1-гидрокси-1-метилэтил)-1,3-тиазол-5-ила,  
2-(пирролидин-1-ил)-1,3-тиазол-5-ила,  
2-этокси-1,3-тиазол-5-ила, 2-этил-1,3-тиазол-5-ила,  
2-(пирролидин-1-илметил)-1,3-тиазол-5-ила,  
2-(морфолин-4-ил)-1,3-тиазол-5-ила,  
2-метоксиметил-1,3-тиазол-5-ила, 2-изобутил-1,3-тиазол-5-ила,  
2-этиламинокарбонил-1,3-тиазол-5-ила,  
2-(пирролидин-1-илкарбонил)-1,3-тиазол-5-ила,  
2-(морфолин-4-илкарбонил)-1,3-тиазол-5-ила,  
2-(3-пиридил)-1,3-тиазол-5-ила, 2-(2-пиридил)-1,3-тиазол-5-ила,  
4-метил-1,3-тиазол-2-ила, 1,3-бензотиазол-2-ила,  
пиримидин-5-ила, пиримидин-2-ила, пиридазин-4-ила,  
пиридазин-3-ила, пиразин-2-ила, 2-метоксипиримидин-5-ила,  
2-этоксипиримидин-5-ила, 2-(2-фторэтокси)пиримидин-5-ила,  
2-метилпиримидин-5-ила, 2-этилпиридин-5-ила,  
2-изопропилпиримидин-5-ила, 2-циклопропилпиримидин-5-ила,  
пиримидин-4-ила, 4-(пиримидин-5-ил)фенила,  
4-(1,3-оксазол-2-ил)фенила, 4-(1Н-имидазол-1-ил)фенила,  
4-(морфолин-4-ил)фенила, 5-(пиразин-2-ил)пиридин-2-ила,  
4-(1-метил-1Н-имидазол-5-ил)фенила,  
4-(4,6-диметилпиримидин-5-ил)фенила, 6-бромпиридин-3-ила,  
5-бромпиридин-2-ила, 4'-(метилсульфонил)бифенил-4-ила,  
3'-(метилсульфонил)бифенил-4-ила,  
3'-(метоксикарбонил)бифенил-4-ила,  
4-(2,3-дигидро-1,4-бензодиоксин-6-ил)фенила,  
4'-(диметиламино)бифенил-4-ила, 4-(пиридин-3-ил)фенила,  
4-(1Н-пиразол-4-ил)фенила, 3,3'-бипиридин-6-ила,  
3,4'-бипиридин-6-ила, 5-(3-ацетилфенил)пиридин-2-ила,

5-[3-(диметиламино)фенил]пиридин-2-ила,  
5-[3-(трифторметил)фенил]пиридин-2-ила,  
5-[4-(метилсульфонил)фенил]пиридин-2-ила,  
5-(4-метоксифенил)пиридин-2-ила,  
5-(3-метоксифенил)пиридин-2-ила,  
5-[3-(аминокарбонил)фенил]пиридин-2-ила,  
5-(4-фторфенил)пиридин-2-ила, 5-(3,4-дифторфенил)пиридин-2-ила,  
5-(3,5-диметилизоксазол-4-ил)пиридин-2-ила,  
5-(1-метил-1Н-пиразол-4-ил)пиридин-2-ила,  
5-(1Н-пиразол-4-ил)пиридин-2-ила,  
5-(1-бензофуран-2-ил)пиридин-2-ила,  
5-(1,3-бензодиоксол-5-ил)пиридин-2-ила,  
5-(2-формилфенил)пиридин-2-ила, 4-(2'-формилбифенил)-4-ила,  
5-(1,3-оксазол-2-ил)пиридин-2-ила,  
6-(1,3-оксазол-2-ил)пиридин-3-ила, 4-(1,3-тиазол-2-ил)фенила,  
5-(1,3-тиазол-2-ил)пиридин-2-ила,  
6-(1,3-тиазол-2-ил)пиридин-3-ила,  
6-(1Н-имидазол-1-ил)пиридин-3-ила,  
5-(1Н-имидазол-1-ил)пиридин-2-ила, 6-фенилпиридин-3-ила,  
5-(пиримидин-5-ил)пиридин-2-ила,  
5-(пиримидин-2-ил)пиридин-2-ила,  
5-(3-аминокарбонилфенил)пиридин-2-ила,  
4-(1-метил-1Н-имидазол-4-ил)фенила, 4-(1Н-имидазол-4-ил)фенила,  
5-[2-(гидроксиметил)фенил]пиридин-2-ила,  
2'-(гидроксиметил)бифенил-4-ила,  
5-{2-[(диметиламино)метил]фенил}пиридин-2-ила,  
2'-[(диметиламино)метил]бифенил-4-ила,  
5-фторметилпиразин-2-ила, 5-дифторметилпиразин-2-ила,  
5-метилпиразин-2-ила, 2-метилпиримидин-5-ила,  
2-фторметилпиримидин-5-ила, 2-дифторметилпиримидин-5-ила,  
2-трифторметилпиримидин-5-ила, 2-циклопропилпиримидин-5-ила,  
изотиазол-5-ила, 3-метилизотиазол-5-ила,  
3-фторметилизотиазол-5-ила, 4-(диметиламинокарбонил)фенила,  
4-(метиламинокарбонил)фенила, 4-(морфолин-4-илкарбонил)фенила,  
4-(пиперидин-1-илкарбонил)фенила,  
3-фтор-4-(пирролидин-1-илкарбонил)фенила,  
5-(пирролидин-1-илкарбонил)пиридин-2-ила,  
5-(диметиламинокарбонил)пиридин-2-ила,  
5-(морфолин-4-илкарбонил)пиридин-2-ила, хинолин-4-ила,  
6-метоксипиридин-3-ила, 6-(морфолин-4-ил)пиридин-3-ила,  
4-(диметиламинометил)фенила,  
5-(диметиламинометил)пиридин-2-ила,  
5-(диметиламинокарбонил)пиридин-2-ила,  
4-[гидрокси(пиридин-3-ил)метил]фенила,  
6-[(гидрокси(пиридин-3-ил)метил]пиридин-3-ила,  
6-(диметиламинокарбонил)пиридин-3-ила,  
4-(4-гидроксипиперидин-1-илкарбонил)фенила,  
4-(4-метоксипиперидин-1-илкарбонил)фенила,  
5-(4-метоксипиперидин-1-илкарбонил)пиридин-2-ила,  
6-(4-метоксипиперидин-1-илкарбонил)пиридин-3-ила, фенокси,  
бензилокси, 2-тиенила, 2-изопропил-1,3-тиазол-5-ила,  
4-(пиримидин-2-ил)фенила, 4-(пиримидин-4-ил)фенила и  
5-(метоксиметил)пиридин-2-ила и  
X-Y-Z представляет



где  $m=1$

### 6. Соединение формулы III



### III

его энантимеры, диастереоизомеры, энантимерно обогащенные смеси, его рацемические смеси, его пролекарства, кристаллические формы, некристаллические формы, его аморфные формы, его сольваты, его метаболиты и фармацевтически приемлемые соли, где

$R_1$  независимо выбирают из группы, состоящей из карбоцикла, гетероцикла, арила, гетероарила, арилалкила, гетероарилалкила, арилалкенила, гетероарилалкенила, арилалкинила, гетероарилалкинила, ариламинокрбонила, гетероариламинокрбонила, арилкарбоксамидо, гетероарилкарбоксамидо, арилуреидо, гетероарилуреидо, арилокси, гетероарилокси, арилалкокси, гетероарилалкокси, ариламино или гетероариламино, и где указанные группы карбоцикла, гетероцикла, арила, арилалкила, гетероарила или гетероарилалкила, могут быть замещены 0-3 заместителями  $R_{1a}$ , где  $R_{1a}$  независимо выбирают из группы, состоящей из галогена, алкила, алкенила, алкинила, алкокси, алкоксиалкила, алкилтиоалкила, гидроксиалкила, моно-, ди- или тригалогеноалкила, моно-, ди- или тригалогеноалкокси, нитро, amino, моно- или дизамещенного amino, моно- или дизамещенного aminoалкила, аминокрбонила, моно- или дизамещенного аминокрбонила, циклического аминокрбонила, аминосульфонила, моно- или дизамещенного аминосульфонила, алкилкарбонила, циклического алкилкарбонила, арилкарбонила, гетероарилкарбонила, алкилсульфонила, циклического алкилсульфонила, арилсульфонила, гетероарилсульфонила, карбоновой кислоты, этерифицированной карбоновой кислоты, алкилкарбониламино, циклического алкилкарбониламино, арилкарбониламино, гетероарилкарбониламино, циано, арилалкила, гетероарилалкила, арилоксиалкила, гетероарилоксиалкила, арилтиоалкила, гетероарилтиоалкила, карбамата, моно- или дизамещенного карбамата,  $R_{1b}$ -арила или  $R_{1b}$ -гетероарила, где  $R_{1b}$  представляет H, галоген, OH, amino, моно- или дизамещенный amino, моно-, ди- или тригалогеноалкил, алкокси, моно-, ди- или тригалогеноалкокси, гидроксиалкил, алкоксиалкил, aminoалкил, моно- или дизамещенный aminoалкил, карбоксамид, сульфонамид, карбамат, мочевино или циано;

$R_2$  независимо выбирают из группы, состоящей из H, amino, моно- или дизамещенного amino, OH, карбоксила, этерифицированного карбоксила, карбоксамидо, N-монозамещенного карбоксамидо и N,N-дизамещенного карбоксамидо, циано, алкила, алкенила, алкинила, циклоалкила, циклоалкенила, алкокси, тиоалкила, моно-, ди- или тригалогеноалкила, галогена, арила или гетероарила;

необязательно  $R_1$  и  $R_2$  могут быть связаны друг с другом с образованием спироцикла;

$R_3$ ,  $R_4$ ,  $R_5$ , и  $R_6$  независимо выбирают из группы, состоящей из H, amino, OH, алкила, галогеноалкила, дигалогеноалкила, тригалогеноалкила, алкенила, алкинила, арила, гетероарила, арилалкила, гетероарилалкила, алкокси и тиоалкила,

необязательно  $R_1$  и  $R_3$  могут быть циклизованы с образованием карбоцикла или гетероцикла, содержащего 0-3 заместителя  $R_a$ , где  $R_a$  выбирают из группы, состоящей из галогена, алкила, алкокси, тиоалкила, моно-, ди- или тригалогеноалкила, моно-, ди- или тригалогеноалкокси, нитро, amino, карбоксила, этерифицированного карбоксила,

карбоксамидо, тиокарбоксамидо, циано, моно-, дизамещенного или полизамещенного арила и гетероцикла, необязательно содержащих 0-3 R<sub>b</sub>, где R<sub>b</sub> выбирают из группы, состоящей из галогена, алкила, алкокси, тиаалкила, моно-, ди- или тригалогеноалкила, моно-, ди- или тригалогеноалкокси, нитро, amino, карбоксила, этерифицированного карбоксила, карбоксамидо, тиокарбоксамидо и циано;

необязательно R<sub>3</sub> и R<sub>4</sub> или R<sub>5</sub> и R<sub>6</sub> циклизованы с образованием мостиковой бициклической системы, содержащей этиленовый мостик;

необязательно R<sub>3</sub> и R<sub>6</sub> циклизованы с образованием мостиковой бициклической системы, содержащей метиленовую группу или этиленовую группу, или гетероатом, выбранный из группы, состоящей из N, O и S;

R<sub>7</sub> и R<sub>8</sub> независимо выбирают из группы, состоящей из водорода, C<sub>1-8</sub>алкила, причем необязательно цепь C<sub>1-8</sub>алкила может быть прервана кислородом или серой; алкокси, моно-, ди- или тригалогеноалкила, моно-, ди- или тригалогеноалкокси, алкоксиалкила, арилокси, гетероарилокси, арилалкокси, гетероарилалкокси, арилоксиалкила, гетероарилоксиалкила, арилалкоксиалкила или гетероарилалкоксиалкила;

необязательно R<sub>7</sub> и R<sub>8</sub> могут быть циклизованы с образованием спирокарбоцикла или спирогетероцикла;

и m=0-5.

7. Соединение, выбранное из группы, состоящей из

N-(2-(((3S,4S)-1-циклогексил-4-гидроксипирролидин-3-ил)амино)-2-оксоэтил)-3-(трифторметил)бензамида,

N-(2-(((3S,4S)-4-(бут-2-ин-1-илокси)-1-циклогексилпирролидин-3-ил)амино)-2-оксоэтил)-3-(трифторметил)бензамида,

N-(2-(((3S,4S)-4-(бензилокси)-1-циклогексилпирролидин-3-ил)амино)-2-оксоэтил)-3-(трифторметил)бензамида,

N-(2-(((3S,4S)-1-циклогексил-4-(пиридин-2-илметокси)пирролидин-3-ил)амино)-2-оксоэтил)-3-(трифторметил)бензамида,

N-(2-(((3S,4S)-1-циклогексил-4-(пиридин-3-илметокси)пирролидин-3-ил)амино)-2-оксоэтил)-3-(трифторметил)бензамида,

N-(2-(((3S,4S)-4-гидрокси-1-(4-гидрокси-4-фенилциклогексил)пирролидин-3-ил)амино)-2-оксоэтил)-3-(трифторметил)бензамида,

N-(2-(((3S,4S)-4-гидрокси-1-(4-гидрокси-4-пиридин-2-илциклогексил)пирролидин-3-ил)амино)-2-оксоэтил)-3-(трифторметил)бензамида,

N-[2-(((3S,4S)-4-гидрокси-1-[4-гидрокси-4-(4-метилфенил)циклогексил]пирролидин-3-ил)амино)-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,

N-[2-(((3S,4S)-4-гидрокси-1-[4-гидрокси-4-(3-метилфенил)циклогексил]пирролидин-3-ил)амино)-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,

N-[2-(((3S,4S)-4-гидрокси-1-[4-гидрокси-4-(2-метилфенил)циклогексил]пирролидин-3-ил)амино)-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,

N-[2-(((3S,4S)-1-[4-(4-бромфенил)-4-гидроксициклогексил]-4-гидроксипирролидин-3-ил)амино)-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,

N-[2-(((3S,4S)-1-[4-(3-бромфенил)-4-гидроксициклогексил]-4-гидроксипирролидин-3-ил)амино)-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,

N-[2-(((3S,4S)-1-[4-(4-хлорфенил)-4-гидроксициклогексил]-4-гидроксипирролидин-3-ил)амино)-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,

N-[2-(((3S,4S)-1-[4-(3-хлорфенил)-4-гидроксициклогексил]-4-гидроксипирролидин-3-ил)амино)-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,

N-[2-(((3S,4S)-4-гидрокси-1-[4-гидрокси-4-(4-трифторметилфенил)циклогексил]пирролидин-3-ил)амино)-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,

N-[2-(((3S,4S)-4-гидрокси-1-[4-гидрокси-4-(3-трифторметилфенил)циклогексил]пирролидин-3-ил)амино)-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,

N-[2-(((3S,4S)-4-гидрокси-1-[4-гидрокси-4-(2-трифторметилфенил)циклогексил]пирролидин-3-ил)амино)-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,

N-[2-(((3S,4S)-4-гидрокси-1-[4-гидрокси-4-(4-метоксифенил)циклогексил]пирролидин-3-









амино)-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-[2-((3S,4S)-1-[4-гидрокси-4-(6-метоксипиридин-3-ил)циклогексил]-4-пропокси-пирролидин-3-ил)амино)-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-[2-((3S,4S)-1-[4-гидрокси-4-(4-метилпиридин-2-ил)циклогексил]-4-пропокси-пирролидин-3-ил)амино)-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-[2-((3S,4S)-1-[4-гидрокси-4-(5-метилпиридин-2-ил)циклогексил]-4-пропокси-пирролидин-3-ил)амино)-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-[2-((3S,4S)-1-[4-гидрокси-4-(6-метилпиридин-2-ил)циклогексил]-4-пропокси-пирролидин-3-ил)амино)-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-[2-((3S,4S)-1-[4-гидрокси-4-(6-метоксипиридин-2-ил)циклогексил]-4-пропокси-пирролидин-3-ил)амино)-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-[2-((3S,4S)-1-[4-гидрокси-4-(1-оксидопиридин-3-ил)циклогексил]-4-пропокси-пирролидин-3-ил)амино)-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-[2-((3S,4S)-1-[4-гидрокси-4-фенилциклогексил]-4-пропокси-пирролидин-3-ил)амино)-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-[2-((3S,4S)-1-[4-гидрокси-4-(4-метоксифенил)циклогексил]-4-пропокси-пирролидин-3-ил)амино)-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-[2-((3S,4S)-1-[4-гидрокси-4-(3,4-метилendioксифенил)циклогексил]-4-пропокси-пирролидин-3-ил)амино)-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-(2-оксо-2-((3S,4S)-4-пропокси-1-(4-пиридин-3-ил)циклогексил)пирролидин-3-ил)амино)-этил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-(2-оксо-2-((3S,4S)-4-пропокси-1-(4-пиридин-4-ил)циклогексил)пирролидин-3-ил)амино)-этил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-[2-((3S,4S)-1-[4-(3-метил-1H-пиразол-1-ил)циклогексил]-4-пропокси-пирролидин-3-ил)амино)-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-[2-((3S,4S)-1-[4-(3,5-диметил-1H-пиразол-1-ил)циклогексил]-4-пропокси-пирролидин-3-ил)амино)-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-(2-оксо-2-((3S,4S)-4-пропокси-1-(3H-спиро[2-бензофуран-1,1'-циклогексан]-4'-ил)пирролидин-3-ил)амино)-этил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-(2-оксо-2-((3S,4S)-4-пропокси-1-спиро[циклогексан-1,1'-инден]-4-ил)пирролидин-3-ил)амино)-этил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-(((3R)-1-[4-гидрокси-4-(6-метоксипиридин-3-ил)циклогексил]пирролидин-3-илкарбамоил)метил)-3-трифторметилбензамид,  
N-(2-(((3R)-1-(4-гидрокси-4-пиридин-2-ил)циклогексил)пирролидин-3-ил)амино)-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-[2-(((3R)-1-[4-(6-азетидин-1-ил)пиридин-3-ил]-4-гидроксициклогексил]пирролидин-3-ил)амино)-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-[2-(((3R)-1-[4-(5-цианопиридин-2-ил)-4-гидроксициклогексил]пирролидин-3-ил)амино)-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-[2-(((3R)-1-[4-(6-цианопиридин-3-ил)-4-гидроксициклогексил]пирролидин-3-ил)амино)-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-[2-(((3R)-1-{транс-4-гидрокси-4-[5-(метоксиметил)пиридин-2-ил]циклогексил}пирролидин-3-ил)амино)-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-[2-(((3R)-1-[4-гидрокси-4-[5-(1-гидрокси-1-метилэтил)пиридин-2-ил]циклогексил}пирролидин-3-ил)амино)-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-(2-(((3R)-1-[4-{5-[(диметиламино)метил]пиридин-2-ил}-4-гидроксициклогексил]пирролидин-3-ил)амино)-2-оксоэтил)-3-(трифторметил)бензамида,  
N-(2-(((3R)-1-(4-гидрокси-4-пиридин-3-ил)циклогексил)пирролидин-3-ил)амино)-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-(2-(((3R)-1-(4-гидрокси-4-пиридин-4-ил)циклогексил)пирролидин-3-ил)амино)-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-[2-(((3R)-1-[4-гидрокси-4-(6-метилпиридин-2-ил)циклогексил]пирролидин-3-ил)амино)-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-[2-(((3R)-1-[4-гидрокси-4-(5-метилпиридин-2-ил)циклогексил]пирролидин-3-ил)амино)-







циклогексил)пирролидин-3-ил]амино}-2-оксоэтил)-3-(трифторметил)бензамида,  
N,N-диметил-5-(4-{{(3R)-3-[[{3-(трифторметил)бензоил]амино}ацетил]амино}пирролидин-1-ил}циклогексил)пирролидин-2-карбоксамида,  
N-(2-{{(3R)-1-(4-{{4-[[4-гидроксиперидин-1-ил]карбонил]фенил}}циклогексил)пирролидин-3-ил]амино}-2-оксоэтил)-3-(трифторметил)бензамида,  
N-(2-{{(3R)-1-(4-{{4-[[3-гидроксиперидин-1-ил]карбонил]фенил}}циклогексил)пирролидин-3-ил]амино}-2-оксоэтил)-3-(трифторметил)бензамида,  
N-(2-{{(3R)-1-(4-{{4-[[4-метоксиперидин-1-ил]карбонил]фенил}циклогексил)пирролидин-3-ил]амино}-2-оксоэтил)-3-(трифторметил)бензамида,  
N-(2-{{(3R)-1-(4-{{4-[[3-метоксиперидин-1-ил]карбонил]фенил}циклогексил)пирролидин-3-ил]амино}-2-оксоэтил)-3-(трифторметил)бензамида,  
N-(2-{{(3R)-1-(4-{{5-[[4-метоксиперидин-1-ил]карбонил]пиридин-2-ил}}циклогексил)пирролидин-3-ил]амино}-2-оксоэтил)-3-(трифторметил)бензамида,  
N-(2-{{(3R)-1-(4-{{6-[[4-метоксиперидин-1-ил]карбонил]пиридин-3-ил}}циклогексил)пирролидин-3-ил]амино}-2-оксоэтил)-3-(трифторметил)бензамида,  
N-(2-оксо-2-{{(3R)-1-(4-феноксипирролидин-3-ил]амино}этил)-3-(трифторметил)бензамида,  
N-[2-{{(3R)-1-[4-(бензилокси)циклогексил]пирролидин-3-ил]амино}-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-(2-{{(3R)-1-(4,4-дифенилциклогексил)пирролидин-3-ил]амино}-2-оксоэтил)-3-(трифторметил)бензамида,  
N-[2-{{(3R)-1-[транс-2-(бензилокси)циклогексил]пирролидин-3-ил]амино}-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-[2-{{(3R)-1-[цис-2-(бензоиламино)циклогексил]пирролидин-3-ил]амино}-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-{2-оксо-2-{{(3R)-1-{{цис-2-[[фенилацетил]амино}циклогексил]пирролидин-3-ил]амино}этил}-3-(трифторметил)бензамида,  
N-[2-{{(3R)-1-{{цис-2-(бензиламино)циклогексил]пирролидин-3-ил]амино}-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-[2-{{(3R)-1-[4-гидрокси-4-(1,3-тиазол-2-ил)циклогексил]пирролидин-3-ил]амино}-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-[2-{{(3R)-1-[4-(5-этил-1,3-тиазол-2-ил)-4-гидроксициклогексил]пирролидин-3-ил]амино}-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
2-(1-гидрокси-4-{{(3R)-3-[[{3-(трифторметил)бензоил]амино}ацетил]амино}пирролидин-1-ил}циклогексил)-N-метил-1,3-тиазол-5-карбоксамида,  
3-(трифторметил)-N-[2-{{(3R)-1-[4-гидрокси-4-(1,3-тиазол-5-ил)циклогексил]пирролидин-3-ил]амино}-2-оксоэтил]бензамида,  
метил[5-(1-гидрокси-4-{{(3R)-3-[[{3-(трифторметил)бензоил]амино}ацетил]амино}пирролидин-1-ил}циклогексил)-1,3-тиазол-2-ил]карбамата,  
N-[2-{{(3R)-1-[4-гидрокси-4-(2-изопропил-1,3-тиазол-5-ил)циклогексил]пирролидин-3-ил]амино}-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-[2-{{(3R)-1-[4-гидрокси-4-(5-пиридин-3-ил-1,3-тиазол-2-ил)циклогексил]пирролидин-3-ил]амино}-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-[2-{{(3R)-1-[4-гидрокси-4-[5-(морфолин-4-илкарбонил)-1,3-тиазол-2-ил]циклогексил]пирролидин-3-ил]амино}-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
2-(1-гидрокси-4-{{(3R)-3-[[{3-(трифторметил)бензоил]амино}ацетил]амино}пирролидин-1-ил}циклогексил)-1,3-тиазол-5-карбоксамида,  
2-(1-гидрокси-4-{{(3R)-3-[[{3-(трифторметил)бензоил]амино}ацетил]амино}пирролидин-1-ил}циклогексил)-N,N-диметил-1,3-тиазол-5-карбоксамида,  
N-[2-{{(3R)-1-[4-гидрокси-4-[5-(пирролидин-1-илкарбонил)-1,3-тиазол-2-ил]циклогексил]пирролидин-3-ил]амино}-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-[2-{{(3R)-1-[4-(5-аллил-1,3-тиазол-2-ил)-4-гидроксициклогексил]пирролидин-3-ил]амино}-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-[2-{{(3R)-1-[4-гидрокси-4-(5-пропил-1,3-тиазол-2-ил)циклогексил]пирролидин-3-ил]





пирролидин-3-ил)амино]этил}-3-(трифторметил)бензамида,  
N-[2-оксо-2-((3R)-1-[4-(2-тиенил)циклогексил]пирролидин-3-ил)амино]этил]-3-(трифторметил)бензамида,  
3-(трифторметил)-N-[2-((3R)-1-[4-[5-(метоксиметил)-1,3-тиазол-2-ил]циклогексил]пирролидин-3-ил)амино]-2-оксоэтил}бензамида,  
3-(трифторметил)-N-[2-((3R)-1-[4-[5-(морфолин-4-илкарбонил)-1,3-тиазол-2-ил]циклогексил]пирролидин-3-ил)амино]-2-оксоэтил}бензамида,  
N-((3R)-1-[4-гидрокси-4-(2-изопропил-1,3-тиазол-5-ил)циклогексил]пирролидин-3-ил)-4-оксо-4-[3-(трифторметил)фенил]бутанамида,  
4-[3-(трифторметил)фенил]-N-((3R)-1-[4-гидрокси-4-[5-(метоксиметил)-1,3-тиазол-2-ил]циклогексил]пирролидин-3-ил)-4-оксобутанамида,  
4-[3-(трифторметил)фенил]-N-((3R)-1-[4-гидрокси-4-[5-(метоксиметил)-1,3-тиазол-2-ил]циклогексил]пирролидин-3-ил)-4-оксобутанамида,  
N-((3R)-1-[4-гидрокси-4-[5-(метоксиметил)-1,3-тиазол-2-ил]-4-гидроксициклогексил]пирролидин-3-ил)-4-[3-(трифторметил)фенил]бутанамида,  
N-((3R)-1-[4-[5-(метоксиметил)-1,3-тиазол-2-ил]-4-гидроксициклогексил]пирролидин-3-ил)-2-((3-трифторметил)фенил)сульфонил}амино)ацетамида,  
N-((3R)-1-[4-гидрокси-4-[2-(метоксиметил)-1,3-тиазол-5-ил]циклогексил]пирролидин-3-ил)-3-[3-(трифторметил)фенил]-4,5-дигидроизоксазол-5-карбоксамид,  
(4Z) и (4E)-4-(гидроксиимино)-N-((3R)-1-[4-гидрокси-4-[5-(метоксиметил)-1,3-тиазол-2-ил]циклогексил]пирролидин-3-ил)-4-[3-(трифторметил)фенил]бутанамида,  
(4Z) и (4E)-4-(этоксиимино)-N-((3R)-1-[4-гидрокси-4-[5-(метоксиметил)-1,3-тиазол-2-ил]циклогексил]пирролидин-3-ил)-4-[3-(трифторметил)фенил]бутанамида,  
N-[2-((3R)-1-[4-фтор-4-(1,3-тиазол-2-ил)циклогексил]пирролидин-3-ил)амино]-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-(2-((3R)-1-(4-фтор-4-пиридин-3-ил)циклогексил)пирролидин-3-ил)амино}-2-оксоэтил)-3-(трифторметил)бензамида,  
N-[2-((3R)-1-[4-фтор-4-(6-метоксипиридин-3-ил)циклогексил]пирролидин-3-ил)амино]-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-[2-((3R)-1-[4-фтор-4-[6-(1,3-оксазол-2-ил)пиридин-3-ил]циклогексил]пирролидин-3-ил)амино]-2-оксоэтил}-3-(трифторметил)бензамида,  
N-(2-((3R)-1-(4-фтор-4-[4-((метиламино)карбонил)фенил]циклогексил]пирролидин-3-ил)амино)-2-оксоэтил)-3-(трифторметил)бензамида,  
N-(2-((3R)-1-(4-гидрокси-4-пиримидин-5-ил)циклогексил)пирролидин-3-ил)амино}-2-оксоэтил)-3-(трифторметил)бензамида,  
N-((3R)-1-(4-гидрокси-4-пиримидин-2-ил)циклогексил)пирролидин-3-илкарбамоил}метил}-3-трифторметилбензамида,  
N-[2-((3R)-1-[4-гидрокси-4-пиридазин-3-ил]циклогексил]пирролидин-3-ил)амино]-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-(2-((3R)-1-(4-гидрокси-4-пиразин-2-ил)циклогексил)пирролидин-3-ил)амино}-2-оксоэтил)-3-(трифторметил)бензамида,  
N-(2-((3R)-1-(4-гидрокси-4-пиразин-2-ил)циклогексил)пирролидин-3-ил)амино}-2-оксоэтил)-3-(трифторметил)бензамида,  
N-[2-((3R)-1-[4-[2-(2-фторэтокси)пиримидин-5-ил]-4-гидроксициклогексил]пирролидин-3-ил)амино]-2-оксоэтил}-3-(трифторметил)бензамида,  
N-[2-((3R)-1-[4-гидрокси-4-(2-метоксипиримидин-5-ил)циклогексил]пирролидин-3-ил)амино]-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-(2-((3R)-1-(4-гидрокси-4-пиримидин-4-ил)циклогексил)пирролидин-3-ил)амино}-2-оксоэтил)-3-(трифторметил)бензамида,  
N-[2-((3R)-1-[4-гидрокси-4-(4-пиримидин-5-ил)фенил]циклогексил]пирролидин-3-ил)амино]-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-[2-((3R)-1-[4-гидрокси-4-(4-оксазол-2-ил)фенил]циклогексил]пирролидин-3-ил)амино]-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-[2-((3R)-1-[4-гидрокси-4-(4-1H-имидазол-1-ил)фенил]циклогексил]пирролидин-3-ил)



пирролидин-3-ил)амино]-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-{2-[(3R)-1-{4-[5-(1,3-бензодиоксол-5-ил)пиридин-2-ил]-4-гидроксициклогексил}  
пирролидин-3-ил)амино]-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-{2-[(3R)-1-{4-[5-(2-формилфенил)пиридин-2-ил]-4-гидроксициклогексил}пирролидин-3-  
ил)амино]-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-{2-[(3R)-1-{4-гидрокси-4-[5-(1,3-оксазол-2-ил)пиридин-2-ил]циклогексил}  
пирролидин-3-ил)амино]-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-{2-[(3R)-1-{4-гидрокси-4-[6-(1,3-оксазол-2-ил)пиридин-3-ил]циклогексил}  
пирролидин-3-ил)амино]-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-{2-[(3R)-1-{4-гидрокси-4-[4-(1,3-тиазол-2-ил)фенил]циклогексил}пирролидин-3-  
ил)амино]-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-{2-[(3R)-1-{4-гидрокси-4-[5-(1,3-тиазол-2-ил)пиридин-2-ил]циклогексил}пирролидин-  
3-ил)амино]-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-{2-[(3R)-1-{4-гидрокси-4-[6-(1,3-тиазол-2-ил)пиридин-3-ил]циклогексил}пирролидин-  
3-ил)амино]-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-{2-[(3R)-1-{4-гидрокси-4-[5-(1H-имидазол-1-ил)пиридин-2-ил]циклогексил}  
пирролидин-3-ил)амино]-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-{2-[(3R)-1-{4-гидрокси-4-[6-(1H-имидазол-1-ил)пиридин-3-ил]циклогексил}  
пирролидин-3-ил)амино]-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-{2-[(3R)-1-{4-гидрокси-4-(6-фенилпиридин-3-ил)циклогексил}пирролидин-3-ил)амино]-  
2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-{2-[(3R)-1-{4-гидрокси-4-(5-пиримидин-5-илпиридин-2-ил)циклогексил}пирролидин-3-  
ил)амино]-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-{2-[(3R)-1-{4-гидрокси-4-(5-пиримидин-2-илпиридин-2-ил)циклогексил}пирролидин-3-  
ил)амино]-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-(2-[(3R)-1-(4-{5-[3-(аминокарбонил)фенил]пиридин-2-ил}-4-  
гидроксициклогексил}пирролидин-3-ил)амино]-2-оксоэтил)-3-(трифторметил)бензамида,  
N-{2-[(3R)-1-{4-гидрокси-4-[4-(1-метил-1H-имидазол-4-ил)фенил]циклогексил}  
пирролидин-3-ил)амино]-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-{2-[(3R)-1-{4-гидрокси-4-[4-(1H-имидазол-4-ил)фенил]циклогексил}пирролидин-3-  
ил)амино]-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-(2-[(3R)-1-(4-гидрокси-4-[5-[2-(гидроксиметил)фенил]пиридин-2-ил]  
циклогексил}пирролидин-3-ил)амино]-2-оксоэтил)-3-(трифторметил)бензамида,  
N-{2-[(3R)-1-{4-гидрокси-4-[2'-(гидроксиметил)бифенил-4-ил]циклогексил}пирролидин-  
3-ил)амино]-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-{2-[(3R)-1-{4-(5-{2-[(диметиламино)метил]фенил}пиридин-2-ил)-4-  
гидроксициклогексил}пирролидин-3-ил)амино]-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,  
N-(2-[(3R)-1-(4-{2'-(диметиламино)метил}бифенил-4-ил)-4-  
гидроксициклогексил}пирролидин-3-ил)амино]-2-оксоэтил)-3-(трифторметил)бензамида,  
N-{2-[(3R)-1-{4-(бензоиламино)циклогексил}пирролидин-3-ил)амино]-2-оксоэтил]-3-  
(трифторметил)бензамида,  
N-(4-{(3R)-3-[(2-{(3-(трифторметил)бензоил}амино)ацетил)амино]пирролидин-1-ил}  
циклогексил)пиридин-2-карбоксамида,  
N-(4-{(3R)-3-[(2-{(3-(трифторметил)бензоил}амино)ацетил)амино]пирролидин-1-ил}  
циклогексил)пиридин-3-карбоксамида,  
N-(4-{(3R)-3-[(2-{(3-(трифторметил)бензоил}амино)ацетил)амино]пирролидин-1-ил}  
циклогексил)пиридин-4-карбоксамида,  
6-метил-N-(4-{(3R)-3-[(3-(трифторметил)бензоил}амино)ацетил)амино]пирролидин-1-ил}  
циклогексил)пиридин-2-карбоксамида,  
5-метил-N-(4-{(3R)-3-[(3-(трифторметил)бензоил}амино)ацетил)амино]пирролидин-1-ил}  
циклогексил)пиридин-2-карбоксамида,  
4-метил-N-(4-{(3R)-3-[(3-(трифторметил)бензоил}амино)ацетил)амино]пирролидин-1-ил}  
циклогексил)пиридин-2-карбоксамида,  
6-метокси-N-(4-{(3R)-3-[(3-(трифторметил)бензоил}амино)ацетил)амино]пирролидин-1-

ил}циклогексил)пиридин-2-карбоксамид,

N-(4-((3R)-3-((2-((3-(трифторметил)бензоил)амино)ацетил)амино)пирролидин-1-ил}циклогексил)хинолин-4-карбоксамид,

N-(2-((3R)-1-(3-гидрокси-3-пиридин-2-илбицикло[3.2.1]окт-8-ил)пирролидин-3-ил}амино)-2-оксоэтил)-3-(трифторметил)бензамида,

N-[2-((3R)-1-[3-гидрокси-3-(5-метилпиридин-2-ил)бицикло[3.2.1]окт-8-ил]пирролидин-3-ил}амино)-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,

N-(2-((3R)-1-(3-гидрокси-3-пиридин-3-илбицикло[3.2.1]окт-8-ил)пирролидин-3-ил}амино)-2-оксоэтил)-3-(трифторметил)бензамида,

N-[2-((3R)-1-[3-гидрокси-3-(6-метоксипиридин-3-ил)бицикло[3.2.1]окт-8-ил]пирролидин-3-ил}амино)-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,

N-(2-((3R)-1-(8-гидрокси-8-фенилбицикло[3.2.1]окт-3-ил)пирролидин-3-ил}амино)-2-оксоэтил)-3-(трифторметил)бензамида,

N-(2-((3R)-1-(5-гидрокси-5-фенилбицикло[2.2.1]гепт-2-ил)пирролидин-3-ил}амино)-2-оксоэтил)-3-(трифторметил)бензамида,

N-(2-((3R)-1-(5-гидрокси-5-пиридин-2-илбицикло[2.2.1]гепт-2-ил)пирролидин-3-ил}амино)-2-оксоэтил)-3-(трифторметил)бензамида

N-(2-((3R)-1-(5-гидрокси-5-пиридин-3-илбицикло[2.2.1]гепт-2-ил)пирролидин-3-ил}амино)-2-оксоэтил)-3-(трифторметил)бензамида,

N-[2-((3R)-1-[5-гидрокси-5-(6-метоксипиридин-3-ил)бицикло[2.2.1]гепт-2-ил]пирролидин-3-ил}амино)-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,

N-(2-((3R)-1-(5-гидрокси-5-пиридин-4-илбицикло[2.2.1]гепт-2-ил)пирролидин-3-иламино)-2-оксоэтил)-3-(трифторметил)бензамида,

N-(2-((3R,5S)-1-(4-гидрокси-4-фенилциклогексил)-5-метилпирролидин-3-ил}амино)-2-оксоэтил)-3-(трифторметил)бензамида,

N-[2-((3R,5S)-1-[4-гидрокси-4-(4-метилфенил)циклогексил]-5-метилпирролидин-3-ил}амино)-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,

N-(2-((3R,5S)-1-(4-гидрокси-4-пиридин-2-илциклогексил)-5-метилпирролидин-3-ил}амино)-2-оксоэтил)-3-(трифторметил)бензамида,

N-(2-((3R,5S)-1-(4-гидрокси-4-пиридин-3-илциклогексил)-5-метилпирролидин-3-ил}амино)-2-оксоэтил)-3-(трифторметил)бензамида,

N-(2-((3R,5S)-1-(4-гидрокси-4-пиридин-4-илциклогексил)-5-метилпирролидин-3-ил}амино)-2-оксоэтил)-3-трифторметил)бензамида

N-[2-((3R,5S)-1-[4-гидрокси-4-(5-метилпиридин-2-ил)циклогексил]-5-метилпирролидин-3-ил}амино)-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,

N-[2-((3R,5S)-1-[4-гидрокси-4-(6-метилпиридин-3-ил)циклогексил]-5-метилпирролидин-3-ил}амино)-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,

2-(1,3-бензотиазол-2-иламино)-N-[(3R)-1-(4-гидрокси-4-пиридин-2-илциклогексил)пирролидин-3-ил]ацетамида,

N-[(3R)-1-(4-гидрокси-4-пиридин-2-илциклогексил)пирролидин-3-ил]-2-[[5-(трифторметил)пиримидин-2-ил]амино]ацетамида,

N-[1-((3R)-1-(4-фенилциклогексил)пирролидин-3-ил}амино)карбонил]циклопропил]-3-(трифторметил)бензамида,

N-(2-[[3-(фторметил)-1-(4-гидрокси-4-фенилциклогексил)пирролидин-3-ил}амино]-2-оксоэтил)-3-(трифторметил)бензамида,

N-[2-((3R)-1-[(3aR,6aS)-5-гидрокси-5-(6-метоксипиридин-3-ил)октагидропентален-2-ил]пирролидин-3-ил}амино)-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,

N-[2-((3R)-1-[(3aR,6aS)-5-гидрокси-5-фенилоктагидропентален-2-ил]пирролидин-3-ил}амино)-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,

N-[2-((3JR)-1-[(3aR,6aS)-5-гидрокси-5-пиридин-3-илоктагидропентален-2-ил]пирролидин-3-ил}амино)-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,

N-(2-((3R)-1-(5-гидрокси-5-пиридин-3-илбицикло[2.2.2]окт-2-ил)пирролидин-3-ил}амино)-2-оксоэтил)-3-(трифторметил)бензамида,

N-[2-((3R)-1-[4-гидрокси-4-(3-метилизотиазол-5-ил)циклогексил]пирролидин-3-ил}

амино)-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,

N-{2-[(3R)-1-[4-[3-(фторметил)изотиазол-5-ил]-4-гидроксициклогексил]пирролидин-3-ил]амино}-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,

N-(2-[(3R)-1-(4-гидрокси-4-изотиазол-5-ил)циклогексил]пирролидин-3-ил)амино)-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,

N-[2-[(3R)-1-[4-гидрокси-4-(4-пиримидин-2-ил)фенил]циклогексил]пирролидин-3-ил]амино)-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида,

N-[2-[(3R)-1-[4-(2-циклопропилпиримидин-5-ил)-4-гидроксициклогексил]пирролидин-3-ил]амино)-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида и

N-(2-[(3R)-1-(4-гидрокси-4-пиридазин-4-ил)циклогексил]пирролидин-3-ил)амино)-2-оксоэтил]-3-(трифторметил)бензамида.

8. Фармацевтическая композиция для лечения воспаления, ревматоидного артрита, атеросклероза, невропатической боли, волчанки, системной красной волчанки, рестеноза, иммунных нарушений и отторжения трансплантатов у нуждающегося в этом млекопитающего, содержащая терапевтически эффективное количество соединения по пп.1, 2, 3, 4, 5, 6 или 7 в смеси с фармацевтически приемлемым эксципиентом, разбавителем или носителем.

9. Способ модулирования активности рецепторов хемокинов у млекопитающего, включающий введение эффективного количества соединения по пп.1, 2, 3, 4, 5, 6 или 7.

10. Способ лечения CCR2-опосредствованного состояния или заболевания у субъекта, причем указанный способ включает введение нуждающемуся в этом субъекту эффективного количества соединения по пп.1, 2, 3, 4, 5, 6 или 7.

11. Способ лечения CCR5-опосредствованного состояния или заболевания у субъекта, причем указанный способ включает введение нуждающемуся в этом субъекту эффективного количества соединения по пп.1, 2, 3, 4, 5, 6 или 7.