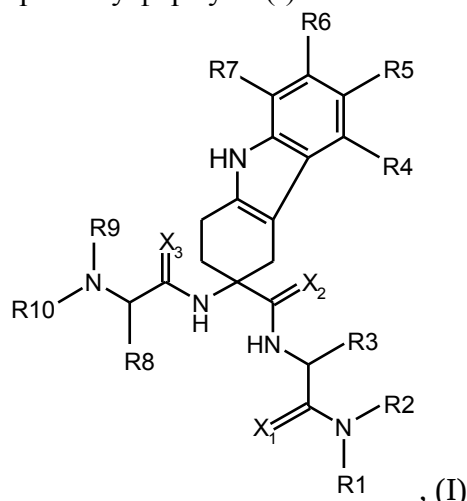


1. Сполука тетрагідрокарбазолу формули (I):



у якій:

X₁ являє собою S, O або S⁺-O-,

X₂ та X₃ незалежно один від іншого являють собою O або гемінально прикріплені H₂,

R₁ та R₂ незалежно один від іншого вибирають з групи, що включає -H, арильний, алкільний та арилалкільний радикали, які необов'язково заміщені у алкільній та/або арильній групі за допомогою до 3 замісників, незалежно вибраних з групи, що включає -Hal, -CN та -O-алкіл, де R₁ та R₂ зокрема кожен являє собою атом водню,

R₃ являє собою алкільний, арилалкільний або гетероарилалкільний радикали, які необов'язково заміщені за допомогою до 3 замісників, незалежно вибраних з групи, що включає -Hal, -CN, -CO-O-R₁₂, -CO-NR₁₂R_{12'}, -OH, -O-R₁₃, -O-CO-R₁₃, -O-SO₂-OR₁₂, -O-SO₂-R₁₂, -SO₂-OR₁₂, -SO-R₁₂, -O-PO(OR₁₂)(OR_{12'}), -O-PO(NR₁₂R_{12'})₂, -O-CO-O-R₁₃, -O-CO-NR₁₂R_{12'}, -O-CS-NR₁₂R_{12'}, -S-R₁₂, -NR₁₂R_{12'}, -NH-CO-R₁₃, -NH-SO₂-R₁₂, -NH-CO-O-R₁₃, -NH-CO-NHR₁₂, -NH-C(NH)-NH₂,

R₄, R₅, R₆ та R₇ вибирають незалежно один від іншого з групи, що включає H, -Hal, -CN, -CONH₂, -COOH, -CF₃, -O-алкіл, -OCF₃, -NO₂ та алкільний, арилалкільний та гетероарилалкільний радикали;

R₉ являє собою атом водню, алкільний, арильний, гетероарильний, арилалкільний або гетероарилалкільний радикали, переважно атом водню;

R₁₀ являє собою атом водню або радикал -R₁₁, -CO-R₁₁, -CO-OR₁₁, -CO-NHR₁₁, -C(NH)-NHR₁₁, -SO₂-R₁₁ або -SO₂-NHR₁₁;

R₁₁ являє собою алкільний, арильний, гетероарильний, арилалкільний або гетероарилалкільний радикали, які необов'язково заміщені за допомогою одного або більше замісників, незалежно вибраних з групи, що включає -Hal, -CN, -алкіл, -CF₃, -OCF₃, -OH, -O-алкіл та -O-(CH₂CH₂-O)_n-CH₃;

R₈ являє собою -C₁-C₆-алкіларил або -C₁-C₆-алкілгетероарил, де арильна або гетероарильна група заміщена за допомогою до трьох, переважно за допомогою одного замісника, незалежно вибраного з групи, що включає -O-(CH₂CH₂-O)_n-CH₃, -O-CO-R₁₂, -O-CO-(CH₂CH₂-O)_n-CH₃, -O-SO₂-OR₁₂, -O-SO₂-R₁₂, -O-PO(OR₁₂)(OR_{12'}), -O-PO(NR₁₂R_{12'})₂, -O-CO-OR₁₃, -O-CO-NR₁₂R_{12'} та -O-CS-NR₁₂R_{12'}, або,

де, однак, принаймні

(i) X₁ являє собою S, або

(ii) R₁₀ не являє собою H та R₁₁ являє собою арилалкільний або гетероарилалкільний радикали, які заміщені у арильній або гетероарильній групі за допомогою одного або більше замісників, незалежно вибраних з групи, що включає Hal, -CN, -алкіл, -CF₃, -OCF₃, -OH, -O-алкіл та -O-(CH₂CH₂-O)_n-CH₃,

R₈ також приймає значення, показані для R₃;

R₁₂ та R_{12'} незалежно один від іншого являють собою H або алкільний,

арилалкільний, арильний, гетероарилалкільний або гетероарильний радикал, переважно атоми водню,

R13 вибирають з групи, що включає алкільний, арилалкільний, арильний, гетероарилалкільний та гетероарильний радикал або являє собою групу $-(CH_2CH_2-O)_n-CH_3$, та

п являє собою ціле число від 1 до 10, переважно від 1 до 6;

та фізіологічно прийнятні солі, похідні або аналоги сполуки формули (I), де сполука формули (I) та її солі, похідні або аналоги можуть бути у формі їх рацематів, у формі чистих енантіомерів та/або діастереомерів або у формі сумішей цих енантіомерів та/або діастереомерів, у формі їх таутомерів, сольватів та гідратів та у їх поліморфних формах.

2. Сполука формули (I) за п. 1, у якій X_1 являє собою S^+-O- .

3. Сполука формули (I) за п. 1 або 2, у якій сполука формули (I) знаходиться у R-конфігурації при атомі вуглецю, заміщеному за допомогою $-NH-CX_3-$ та $-CX_2-NH-$.

4. Сполука формули (I) за п. 3, у якій сполука формули (I) знаходиться у S-конфігурації при атомі вуглецю, заміщеному за допомогою $-CX_3-NH-$, $-R_8$ та $-NR_9R_{10}$, а також у S-конфігурації при атомі вуглецю, заміщеному за допомогою $-NH-CX_2-$, $-R_3$ та $-CX_1-NR_1R_2$.

5. Сполука формули (I) за будь-яким з пп. 1, 3 та 4, у якій X_1 являє собою S, та R_8 являє собою алкільний, арилалкільний або гетероарилалкільний радикал, які є необов'язково заміщеними за допомогою до 3 замісників, незалежно вибраних з групи, що включає $-Hal$, $-CN$, $-CO-O-R_{12}$, $-CO-NR_{12}R_{12}'$, $-OH$, $-O-R_{13}$, $-O-CO-R_{13}$, $-O-SO_2-OR_{12}$, $-O-SO_2-R_{12}$, $-SO_2-OR_{12}$, $-SO-R_{12}$, $-O-PO(OR_{12})(OR_{12}')$, $-O-PO(NR_{12}R_{12}')_2$, $-O-CO-O-R_{13}$, $-O-CO-NR_{12}R_{12}'$, $-O-CS-NR_{12}R_{12}'$, $-S-R_{12}$, $-NR_{12}R_{12}'$, $-NH-CO-R_{13}$, $-NH-SO_2-R_{12}$, $-NH-CO-O-R_{13}$, $-NH-CO-NHR_{12}$, $-NH-C(NH)-NH_2$.

6. Сполука формули (I) за п. 2, у якій R_8 являє собою алкільний, арилалкільний або гетероарилалкільний радикал, які необов'язково заміщені за допомогою до 3 замісників, незалежно вибраних з групи, що включає $-Hal$, $-CN$, $-CO-OR_{12}$, $-CO-NR_{12}R_{12}'$, $-OH$, $-O-R_{13}$, $-O-CO-R_{13}$, $-O-SO_2-OR_{12}$, $-O-SO_2-R_{12}$, $-SO_2-OR_{12}$, $-SO-R_{12}$, $-O-PO(OR_{12})(OR_{12}')$, $-O-PO(NR_{12}R_{12}')_2$, $-O-CO-OR_{13}$, $-O-CO-NR_{12}R_{12}'$, $-O-CS-NR_{12}R_{12}'$, $-S-R_{12}$, $-NR_{12}R_{12}'$, $-NH-CO-R_{13}$, $-NH-SO_2-R_{12}$, $-NH-CO-O-R_{13}$, $-NH-CO-NHR_{12}$, $-NH-C(NH)-NH_2$.

7. Сполука формули (I) за будь-яким з пп. 1-4, у якій

R_{10} являє собою радикал $-R_{11}$, $-CO-R_{11}$, $-CO-OR_{11}$, $-CO-NHR_{11}$, $-C(NH)-NHR_{11}$, $-SO_2-RH$ або $-SO_2NHR_{11}$,

R_{11} являє собою арилалкільний або гетероарилалкільний радикал, який є заміщеним у арильний або гетероарильний групі за допомогою одного або більше замісників, незалежно вибраних з групи, що включає Hal , $-CN$, $-алкіл$, $-CF_3$, $-OCF_3$, $-OH$, $-O-алкіл$ та $-O-(CH_2CH_2-O)_n-CH_3$, та

R_8 являє собою алкільний, арилалкільний або гетероарилалкільний радикал, який є необов'язково заміщеним за допомогою до 3 замісників, незалежно вибраних з групи, що включає $-Hal$, $-CN$, $-CO-O-R_{12}$, $-CO-NR_{12}R_{12}'$, $-OH$, $-O-R_{13}$, $-O-CO-R_{13}$, $-O-SO_2-OR_{12}$, $-SO_2-OR_{12}$, $-O-SO_2-R_{12}$, $-SO-R_{12}$, $-O-PO(OR_{12})(OR_{12}')$, $-O-PO(NR_{12}R_{12}')_2$, $-O-CO-O-R_{13}$, $-O-CO-NR_{12}R_{12}'$, $-O-CS-NR_{12}R_{12}'$, $-S-R_{12}$, $-NR_{12}R_{12}'$, $-NH-CO-R_{13}$, $-NH-SO_2-R_{12}$, $-NH-CO-O-R_{13}$, $-NH-CO-NHR_{12}$, $-NH-C(NH)-NH_2$.

8. Сполука формули (I) за будь-яким з пп. 1-4, у якій R_8 являє собою або $-C_1-C_6$ -алкіларил або $-C_1-C_6$ -алкілгетероарил, де арильна або гетероарильна група заміщена за допомогою від одного до трьох, переважно за допомогою одного, замісників, незалежно вибраних з групи, що включає $-O-(CH_2CH_2-O)_n-CH_3$, $-O-CO-(CH_2CH_2-O)_n-CH_3$, $-O-SO_2-OR_{12}$, $-O-SO_2-R_{12}$, $-O-PO(OR_{12})(OR_{12}')$, $-O-PO(NR_{12}R_{12}')_2$, $-O-CO-OR_{13}$, $-O-CO-NR_{12}R_{12}'$ та $-O-CS-NR_{12}R_{12}'$.

9. Сполука формули (I) за будь-яким з пп. 1-8, у якій принаймні один, переважно принаймні два, з радикалів R_4 , R_5 , R_6 та R_7 , переважно R_5 та R_7 , не являють собою атоми

водню.

10. Сполука формули (I) за п. 9, у якій радикали R4 та R6 кожен являє собою атом водню та радикали R5 та R7 вибирають незалежно один від іншого з групи, що включає -H, -Hal, -CN, -CF₃, -O-алкіл та -OCF₃, та являють собою переважно -H, -Hal або -CF₃.

11. Сполука формули (I) за п. 10, у якій радикал R5 являє собою H або Hal та радикал R7 являє собою Hal або -CF₃.

12. Сполука формули (I) за будь-яким з пп. 1-11, у якій X₂ та X₃ кожен являє собою O.

13. Сполука формули (I) за будь-яким з пп. 1-12, у якій R3 являє собою C₁-C₆-алкільний радикал, переважно C₁-C₄-алкільний радикал.

14. Сполука формули (I) за будь-яким з пп. 1-13, у якій R1 та R2 кожен являє собою атом водню.

15. Сполука формули (I) за будь-яким з пп. 1-14, у якій R9 та, якщо присутні, R12 та R12' кожен являє собою атом водню.

16. Сполука формули (I) за будь-яким з пп. 1-15, у якій R13 являє собою феніл-C₁-C₄-алкільний радикал або групу -(CH₂CH₂-O)_n-CH₃.

17. Сполука формули (I) за будь-яким з пп. 1-16, у якій R10 являє собою радикал -CO-R11 або -CO-OR11 або радикал R11.

18. Сполука формули (I) за будь-яким з пп. 1-17, у якій R11 являє собою феніл-C₁-C₄-алкільний радикал, переважно бензильний або фенілетильний радикал, який заміщений у фенільній групі необов'язково за допомогою від одного до трьох, переважно одного або двох, замісників, незалежно вибраних з групи, що включає -Hal, -C₁-C₄-алкіл, -CF₃, -OCF₃, -OH, -O-C₁-C₄-алкіл та -O-(CH₂CH₂-O)_n-CH₃.

19. Сполука формули (I) за будь-яким з пп. 1-4, у якій X₁ являє собою або O, S або S⁺-O⁻,

X₂ та X₃ кожен являє собою O,

R1 та R2 кожен являє собою атом водню,

R3 являє собою C₁-C₆-алкільний радикал, переважно C₁-C₄-алкільний радикал,

R4 та R6 кожен являє собою атом водню,

R5 являє собою або атом водню або Hal,

R7 являє собою або Hal або -CF₃,

R9 являє собою атом водню,

R10 являє собою радикал -CO-R11 або -CO-OR11 або радикал R11,

R11 являє собою феніл-C₁-C₄-алкільний радикал, переважно бензильний або фенілетильний радикал, який є заміщеним у фенільній групі необов'язково за допомогою від одного до трьох, переважно одного або двох, замісників, незалежно вибраних з групи, що включає -Hal, -C₁-C₄-алкіл, -CF₃, -OCF₃, -OH, -O-C₁-C₄-алкіл та -O-(CH₂CH₂-O)_n-CH₃, та

R8 являє собою феніл-C₁-C₄-алкільний радикал, переважно бензильний або фенілетильний радикал, який є заміщеним у фенільній групі за допомогою замісника, вибраного з групи, що включає -O-(CH₂CH₂-O)_n-CH₃, -O-CO-(CH₂CH₂-O)_n-CH₃ та -O-PO(OR12)(OR12'), -O-CO-OR13, або, де, однак, принаймні

(i) X₁ являє собою S, або

(ii) R11 являє собою феніл-C₁-C₄-алкільний радикал, переважно бензильний або фенілетильний радикал, який є заміщеним у фенільній групі за допомогою одного замісника, незалежно вибраного з групи, що включає -Hal, -C₁-C₄-алкіл, -CF₃, -OCF₃, -OH, -O-C₁-C₄-алкіл та -O-(CH₂CH₂-O)_n-CH₃,

R8 являє собою також -C₁-C₆-алкільний радикал, переважно -C₁-C₄-алкільний радикал, або феніл-C₁-C₄-алкільний радикал, переважно бензильний або фенілетильний радикал, ці радикали необов'язково заміщені за допомогою замісника, вибраного з групи, що включає -OH, -O-R13 та -NR12R12';

R12, R12' незалежно один від іншого являють собою H або C₁-C₄-алкільний, бензильний або фенілетильний радикал, переважно H;

R13 вибирають з групи, що включає C₁-C₄-алкільний, феніл-C₁-C₄-алкільний та фенільний радикал, або являє собою групу -(CH₂CH₂-O)_n-CH₃ та являє собою переважно бензильний або фенетильний радикал, та

n являє собою ціле число від 1 до 6, переважно від 1 до 4.

20. Сполука формули (I) за п. 19, у якій

X₁ являє собою S або S⁺-O⁻, переважно S,

R3 та R8 кожен являє собою C₁-C₄-алкільний радикал,

R4 та R6 кожен являє собою атом водню,

R5 та R7 кожен являє собою Hal, або R5 являє собою атом водню та R7 являє собою групу -CF₃,

R10 являє собою радикал -CO-R11,

R11 являє собою бензильний або фенілетильний радикал, який заміщений у фенільній групі за допомогою одного або двох замісників, незалежно вибраних з групи, що включає -Hal, -OCF₃ та -OCH₃.

21. Сполука формули (I) за п. 19, у якій X₁ являє собою O,

R3 являє собою C₁-C₄-алкільний радикал,

R4 та R6 кожен являє собою атом водню,

R5 та R7 кожен являє Hal, або R5 являє собою атом водню та R7 являє собою групу -

CF₃,

R10 являє собою радикал -CO-R11 або -CO-OR11 або радикал R11,

R11 являє собою бензильний або фенілетильний радикал, який заміщений у фенільній групі за допомогою одного або двох Hal атомів, та

R8 являє собою C₁-C₄-алкільний, бензильний або фенілетильний радикал, де фенільний радикал є необов'язково заміщеним за допомогою -OH.

22. Сполука формули (I) за п. 19, у якій

X₁ являє собою S або S⁺-O⁻, переважно S,

R3 являє собою C₁-C₄-алкільний радикал,

R4 та R6 кожен являє собою атом водню,

R5 та R7 кожен являє собою Hal,

R10 являє собою радикал -CO-OR11,

R11 являє собою бензильний або фенілетильний радикал, який заміщений у фенольній групі, де прийнятно, за допомогою одного або двох Hal атомів, та

R8 являє собою C₁-C₄-алкільний, бензильний або фенілетильний радикал, де фенільний радикал є необов'язково заміщеним за допомогою -OH.

23. Сполука формули (I) за п. 19, у якій

X₁ являє собою O, S або S⁺-O⁻, переважно O або S,

R3 являє собою C₁-C₄-алкільний радикал,

R4 та R6 кожен являє собою атом водню,

R5 та R7 кожен являє собою Hal, або R5 являє собою атом водню та R7 являє собою групу -CF₃,

R10 являє собою радикал -CO-R11 або -CO-OR11,

R11 являє собою бензильний або фенілетильний радикал, який є заміщеним у фенільній групі, де прийнятно, за допомогою одного або двох Hal атомів, та

R8 являє собою бензильний або фенілетильний радикал, який є заміщеним у фенільній групі за допомогою -O-PO(OH)₂ радикала.

24. Сполука формули (I) за п. 1 або 19, вибрана з групи, що включає:

4-хлорбензил {(S)-1-[(R)-3-((S)-1-карбамоїл-2-метилпропілкарбамоїл)-6,8-дихлор-2,3,4,9-тетрагідро-1H-карбазол-3-ілкарбамоїл]-2-метилпропіл} карбамат (1),

4-хлорбензил {(S)-1-[(R)-3-((S)-1-карбамоїл-2-метилпропілкарбамоїл)-6,8-дихлор-2,3,4,9-тетрагідро-1H-карбазол-3-ілкарбамоїл]-2-метилбутил} карбамат (2),

4-хлорбензил {(S)-1-[(R)-3-((S)-карбамоїл-2-метилбутилкарбамоїл)-6,8-дихлор-2,3,4,9-

тетрагідро-1Н-карбазол-3-ілкарбамоїл]-2-метилбутил} карбамат (3),
(R)-6,8-дихлор-3-{(S)-2-[2-(2-фторфеніл)ацетиламіно]-3-метилпентаноїламіно}-2,3,4,9-тетрагідро-1Н-карбазол-3-карбонової кислоти ((S)-1-карбамоїл-2-метилбутил)амід (4),
(R)-6,8-дихлор-3-{(S)-2-[2-(3-фторфеніл)ацетиламіно]-3-метилпентаноїламіно}-2,3,4,9-тетрагідро-1Н-карбазол-3-карбонової кислоти ((S)-1-карбамоїл-2-метилбутил)амід (5),
2-хлорбензил {(S)-1-[(R)-3-((S)-карбамоїл-2-метилбутилкарбамоїл)-6,8-дихлор-2,3,4,9-тетрагідро-1Н-карбазол-3-ілкарбамоїл]-2-метилбутил} карбамат (6),
бензил {(S)-1-[(R)-6,8-дихлор-3-((S)-2-метил-1-тіокарбамоїлбутилкарбамоїл)-2,3,4,9-тетрагідро-1Н-карбазол-3-ілкарбамоїл]-2-метилбутил} карбамат (7),
бензил 4-{(S)-3-бензилоксикарбоніламіно-3-[(R)-3-((S)-1-карбамоїл-2-метилбутилкарбамоїл)-6,8-дихлор-2,3,4,9-тетрагідро-1Н-карбазол-3-ілкарбамоїл]пропіл} фенілкарбонат (8),
бензил [(S)-1-[(R)-3-((S)-1-карбамоїл-2-метилбутилкарбамоїл)-6,8-дихлор-2,3,4,9-тетрагідро-1Н-карбазол-3-ілкарбамоїл]-2-(4-фосфоноксифеніл)етил]карбамат (9),
бензил [(S)-1-[(R)-6,8-дихлор-3-((S)-2-метил-1-тіокарбамоїлбутилкарбамоїл)-2,3,4,9-тетрагідро-1Н-карбазол-3-ілкарбамоїл]-3-(4-гідроксифеніл)пропіл]карбамат (10),
бензил [(S)-1-[(R)-3-((S)-карбамоїл-2-метилбутилкарбамоїл)-6,8-дихлор-2,3,4,9-тетрагідро-1Н-карбазол-3-ілкарбамоїл]-3-(4-фосфоноксифеніл)пропіл]карбамат (11),
бензил [(S)-1-[(R)-6,8-дихлор-3-((S)-2-метил-1-тіокарбамоїлбутилкарбамоїл)-2,3,4,9-тетрагідро-1Н-карбазол-3-ілкарбамоїл]-3-(4-фосфоноксифеніл)пропіл]карбамат (12),
(R)-6,8-дихлор-3-{(S)-2-[2-(2-фторфеніл)ацетиламіно]-3-метилпентаноїламіно}-2,3,4,9-тетрагідро-1Н-карбазол-3-карбонової кислоти ((S)-2-метил-1-тіокарбамоїлбутил)амід (13),
(R)-6,8-дихлор-3-[(S)-2-[2-(2-фторфеніл)ацетиламіно]-4-(4-гідроксифеніл)бутириламіно]-2,3,4,9-тетрагідро-1Н-карбазол-3-карбонової кислоти ((S)-2-метил-1-тіокарбамоїлбутил)амід (14),
моно(4-{(S)-3-[(R)-6,8-дихлор-3-((S)-2-метил-1-тіокарбамоїлбутилкарбамоїл)-2,3,4,9-тетрагідро-1Н-карбазол-3-ілкарбамоїл]-3-[2-(2-фторфеніл)ацетиламіно]пропіл} фенілфосфат (15),
(R)-6,8-дихлор-3-{(S)-2-[3-(4-фторфеніл)пропіоніламіно]-3-метилпентаноїламіно}-2,3,4,9-тетрагідро-1Н-карбазол-3-карбонової кислоти ((S)-1-карбамоїл-2-метилпропіл)амід (16),
(S)-5-[(R)-3-((S)-1-карбамоїл-2-метилпропілкарбамоїл)-6,8-дихлор-2,3,4,9-тетрагідро-1Н-карбазол-3-ілкарбамоїл]-5-[3-(4-фторфеніл)пропіоніламіно]пентиламоній трифторацетат (17),
(S)-6,8-дихлор-3-{(S)-2-[3-(2-гідроксифеніл)пропіоніламіно]-3-метилпентаноїламіно}-2,3,4,9-тетрагідро-1Н-карбазол-3-карбонової кислоти ((S)-1-карбамоїл-2-метилбутил)амід (18),
бензил {(S)-1-[(R)-3-((S)-1-карбамоїл-2-метилбутилкарбамоїл)-6,8-дихлор-2,3,4,9-тетрагідро-1Н-карбазол-3-ілкарбамоїл]-2-[4-(2-{2-[2-(2-метоксіетоксі)етоксі]-етоксі}етокси)феніл]етил} карбамат (19),
(R)-6,8-дихлор-3-((S)-2-[3-[2-(2-{2-[2-(2-метоксіетоксі)етоксі]етокси}етоксі)феніл]-пропіоніламіно]-3-метилпентаноїламіно)-2,3,4,9-тетрагідро-1Н-карбазол-3-карбонової кислоти ((S)-1-карбамоїл-2-метилбутил)амід (20),
(R)-6,8-дихлор-3-((S)-2-[2-[2-(2-{2-[2-(2-метоксіетоксі)етоксі]етоксі}етоксі)феніл]-ацетиламіно]-3-метилпентаноїламіно)-2,3,4,9-тетрагідро-1Н-карбазол-3-карбонової кислоти ((S)-1-карбамоїл-2-метилбутил)амід (21),
(R)-6,8-дихлор-3-[(S)-2-[3-(2-фторфеніл)пропіоніламіно]-4-(4-гідроксифеніл)-бутириламіно]-2,3,4,9-тетрагідро-1Н-карбазол-3-карбонової кислоти ((S)-1-карбамоїл-2-метилбутил)амід (22),
(R)-6,8-дихлор-3-{(S)-2-[3-(2-фторфеніл)пропіоніламіно]-3-метилпентаноїламіно}-2,3,4,9-тетрагідро-1Н-карбазол-3-карбонової кислоти ((S)-1-карбамоїл-2-метилбутил)амід (23),
бензил {(S)-1-[(R)-6,8-дихлор-3-((S)-2-метил-1-тіокарбамоїлбутилкарбамоїл)-2,3,4,9-тетрагідро-1Н-карбазол-3-ілкарбамоїл]-3-[4-(2-{2-[2-(2-метоксіетоксі)етоксі]етоксі}етокси)-феніл]пропіл} карбамат (24),
бензил {(S)-1-[(R)-8-хлор-6-фтор-3-((S)-2-метил-1-тіокарбамоїлбутилкарбамоїл)-2,3,4,9-

[illegible]

[illegible]

(R)-8-хлор-3-((S)-2-[2-(2,6-дифторфеніл)ацетиламіно]-3-метилпентаноїламіно}-6-фтор-2,3,4,9-тетрагідро-1H-карбазол-3-карбонової кислоти ((S)-2-циклопропіл-1-тіокарбамоїлетил)амід (77).

25. Фармацевтична композиція, яка містить фармацевтично активну кількість принаймні одного активного інгредієнта зі сполук за будь-яким з пп. 1-24 та принаймні один фармацевтично прийнятний носій.

26. Фармацевтична композиція за п. 25, яка активний інгредієнт містить у одиничній дозі від 0,001 мг до 100 мг на кг маси тіла пацієнта.

27. Фармацевтична композиція за будь-яким з пп. 25-26, яка додатково містить принаймні один додатковий активний інгредієнт.

28. Сполука за будь-яким з пп. 1-24 для застосування як лікарського засобу.

29. Застосування сполуки за будь-яким з пп. 1-24 для виробництва лікарського засобу для лікування або профілактики патологічних станів, опосередкованих G-білок сполученим рецептором, або патологічних станів, які можуть лікуватися модуляцією цього рецептора.

30. Застосування за п. 29, де G-білок сполучений рецептор являє собою LHRH рецептор.

31. Застосування за п. 29, де G-білок сполучений рецептор являє собою рецептор нейрокінінового сімейства, зокрема NK₁ та/або NK₂ рецептор.

32. Застосування за п. 30, де сполука за будь-яким з пп. 1-24 діє як антагоніст LHRH рецептора.

33. Застосування за п. 31, де сполука за будь-яким з пп. 1-23 діє як антагоніст NK₁ та/або NK₂ рецептора.

34. Застосування за п. 30 або 32 для лікування доброякісної та злоякісної пухлинних хвороб, у контролі запліднюючої здатності у чоловіків, у гормональній терапії, у гормонозамісній терапії, для лікування та/або контролю жіночої недостатньої репродуктивної функції або безпліддя, для контрольованої стимуляції яєчників при *in vitro* заплідненні, для жіночої контрацепції та для захисту від побічних ефектів хіміотерапії.

35. Застосування за п. 30 або 32, де патологічні стани, опосередковані LHRH рецептором, або патологічні стани, які можуть лікуватися модуляцією LHRH рецептора, вибирають з групи, що включає: доброякісну гіперплазію простати (BPH), ендометріоз, фіброми матки, міоми матки, гіперплазію ендометрія, дисменорею та дисфункціональні маточні кровотечі (менорагія, метрорагія), передчасне статеве дозрівання, гірсутизм, синдром полікістозу яєчників, гормонозалежні пухлинні хвороби, ВІЛ-інфекції або СНІД, неврологічні або нейродегенеративні розлади, ARC (СНІД-зв'язаний комплекс), саркому Капоші, пухлини, які виникають у головному мозку та/або нервовій системі, та/або оболонках мозку, деменцію та хворобу Альцгеймера.

36. Застосування за п. 35, де гормонозалежні пухлинні хвороби вибирають з групи, що включає: рак простати, рак молочної залози, рак матки, ендометріальний рак, цервікальний рак, рак яєчників.

37. Застосування за п. 31 або 33 для лікування та профілактики нудоти та блювання, для лікування болю, запалень та ревматичних чи артритичних патологічних станів.