

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,  
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

## (12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21)(22) Заявка: 2010109455/04, 14.08.2008

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:

15.08.2007 IB PCT/IB2007/053249

(43) Дата публикации заявки: 20.09.2011 Бюл. № 26

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на  
национальной фазе: 15.03.2010(86) Заявка РСТ:  
IB 2008/053264 (14.08.2008)(87) Публикация заявки РСТ:  
WO 2009/022311 (19.02.2009)Адрес для переписки:  
101000, Москва, М.Златоустинский пер., 10,  
кв.15, "ЕВРОМАРКПАТ", пат.пov.  
И.А.Веселицкой, рег.№ 0011

(71) Заявитель(и):

АКТЕЛИОН ФАРМАСЬЮТИКЛЗ  
ЛТД (CH)

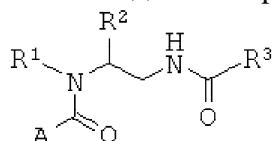
(72) Автор(ы):

АЙССАОИ Хамед (FR),  
БОСС Кристоф (CH),  
ГУДЕ Маркус (CH),  
КОБЕРШТАЙН Ральф (DE),  
ЗИФФЕРЛЕН Тьери (FR)

## (54) ПРОИЗВОДНЫЕ 1,2-ДИАМИДОЭТИЛЕНА В КАЧЕСТВЕ АНТАГОНИСТОВ ОРЕКСИНА

## (57) Формула изобретения

## 1. Соединение формулы (I)



(I)

где

$\text{R}^1$  представляет собой водород,  $\text{C}_{1-6}$ алкил,  $\text{C}_{3-6}$ циклоалкил,  $\text{C}_{3-6}$ циклоалкил $\text{C}_{1-4}$ алкил или арил $\text{C}_{1-4}$ алкил, где арил является незамещенным или монозамещенным, при этом заместитель выбирают из группы, включающей  $\text{C}_{1-4}$ алкил,  $\text{C}_{1-4}$ алкоксигруппу, трифторметил и галоген;

$\text{R}^2$  представляет собой водород,  $\text{C}_{1-4}$ алкил,  $\text{C}_{3-6}$ циклоалкил или арил $\text{C}_{1-4}$ алкил, где арил является незамещенным или моно-, ди- или тризамещенным, при этом заместители независимо друг от друга выбирают из группы, включающей  $\text{C}_{1-4}$ алкил,  $\text{C}_{1-4}$ алкоксигруппу, трифторметил и галоген;

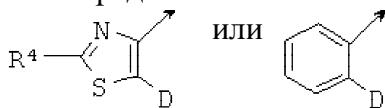
RU 20109455 A

RU 20109455 A

где  $R^1$  и  $R^2$  одновременно не представляют собой водород;

$R^3$  представляет собой гетероциклик, который является незамещенным, моно-, ди- или тризамещенным, где заместители независимо друг от друга выбирают из группы, включающей  $C_{1-4}$ алкил,  $C_{1-4}$ алкоксигруппу, галоген и трифторметил;

А представляет собой



$R^4$  представляет собой  $C_{1-4}$ алкил, бром, циклопропил или  $-NR^5R^6$ ;

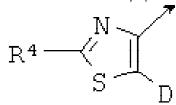
$R^5$  представляет собой водород или  $C_{1-4}$ алкил;

$R^6$  представляет собой водород или  $C_{1-4}$ алкил; и

Д представляет собой арил, который является незамещенным, моно-, ди- или тризамещенным, где заместители независимо друг от друга выбирают из группы, включающей  $C_{1-4}$ алкил,  $C_{1-4}$ алкоксигруппу, трифторметил, трифторметоксигруппу, цианогруппу и галоген;

или соль такого соединения.

2. Соединение формулы (I) по п.1, где А представляет собой



или соль такого соединения.

3. Соединение формулы (I) по п.1 или 2, где  $R^4$  представляет собой метил,  $-NH_2$ , бром или циклопропил; или соль такого соединения.

4. Соединение формулы (I) по п.3, где D представляет собой фенил, который является незамещенным, моно- или дизамещенным, где заместители независимо друг от друга выбирают из группы, включающей  $C_{1-4}$ алкил,

С<sub>1-4</sub>алкоксигруппу, трифторметил, цианогруппу и галоген;

или соль такого соединения.

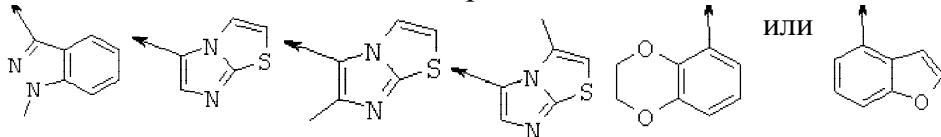
5. Соединение по п.4, где R<sup>1</sup> представляет собой водород, метил, циклопропил, циклопропилметил или арилC<sub>1-4</sub>алкил, где арил является незамещенным или монозамещенным, где заместитель выбирают из группы, включающей трифторметил и галоген; или соль такого соединения.

6. Соединение по п.5, где  $R^2$  представляет собой водород, метил, циклопропил или арил $C_{1-2}$ алкил, где арил является незамещенным; или соль такого соединения.

7. Соединение по п.6, где  $R^3$  представляет собой группу, выбранную из: хинолин-8-ил, изохинолин-1-ил, индол-3-ил, индол-4-ил, индол-7-ил, индазол-3-ил, индазол-4-ил, индазол-7-ил, бензофуран-4-ил, бензофуран-7-ил, бензоизоксазол-3-ил, бензоизоксазол-4-ил, бензоизоксазол-7-ил, бензоксазол-4-ил, бензоксазол-7-ил, бензоксациазол-4-ил, бензоксациазол-7-ил, бензотиофен-3-ил, бензотиофен-4-ил, бензотиофен-7-ил, бензотиазол-4-ил, бензотиазол-7-ил, бензоизотиазол-3-ил, бензоизотиазол-4-ил, бензоизотиазол-7-ил, бензотиадиазол-4-ил, бензотиадиазол-7-ил, бензимидазол-4-ил, бензимидазол-7-ил, имидазо[2,1-*b*]тиазол-3-ил, имидазо[2,1-*b*]тиазол-5-ил, пирацоло[1,5-*a*]пиридин-3-ил, имидазо[1,2-*a*]пиридин-3-ил, 2,3-дигидротиено[3,4-*b*][1,4]диоксин-5-ил, бензо[1,3]диоксол-4-ил, 2,3-дигидробензофуран-4-ил, 2,3-дигидробензофуран-7-ил, 4Н-бензо[1,3]диоксин-8-ил, 4Н-бензо[1,3]диоксин-5-ил и 2,3-дигидробензо[1,4]диоксин-5-ил; где названная группа является незамещенной, моно- или дизамещенной, при этом заместители независимо друг от друга выбирают из группы, включающей метил, метоксигруппу, галоген и

трифторметил; или соли таких соединений.

8. Соединение по п.6, где  $R^3$  представляет собой



или соль такого соединения.

9. Соединение по п.1, которое выбирают из группы, включающей

{2-[(бензофуран-4-карбонил)амино]-1-циклогексилпропил}метиламид 2-метил-5-фенилтиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[(бензофуран-4-карбонил)амино]этил}бензиламид 5-(4-фторфенил)-2-метилтиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[(бензофуран-4-карбонил)амино]этил}метиламид 5-(4-фторфенил)-2-метилтиазол-4-карбоновой кислоты,

(2-{{[5-(4-фторфенил)-2-метилтиазол-4-карбонил]метиламино}этил)амид 1-метил-1Н-индазол-3-карбоновой кислоты,

{2-[(2,3-дигидробензофуран-7-карбонил)амино]этил}метиламид 5-(4-фторфенил)-2-метилтиазол-4-карбоновой кислоты,

(2-{[5-(4-фторфенил)-2-метилтиазол-4-карбонил]метиламино}этил)амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

бензил-{2-[(2,3-дигидробензо[1,4]диоксин-5-карбонил)амино]этил}амид 5-(4-фторфенил)-2-метилтиазол-4-карбоновой кислоты,

(2-{бензил[5-(4-фторфенил)-2-метилтиазол-4-карбонил]амино}этил)амид 1-метил-1Н-индазол-3-карбоновой кислоты,

бензил-{2-[2,3-дигидробензофуран-7-карбонил]амино]этил}амид 5-(4-фторфенил)-2-метилтиазол-4-карбоновой кислоты,

(2-{бензил-[5-(4-фторфенил)-2-метилтиазол-4-карбонил]амино}этил)амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

{2-[(бензофуран-4-карбонил)амино]этил}-(3,3-диметилбутил)амид 2-метил-5-фенилтиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[(3,3-диметилбутил)-(2-метил-5-фенилтиазол-4-карбонил)амино]этил}амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

{2-[(2,3-дигидробензо[1,4]диоксин-5-карбонил)амино]этил}-(3,3-диметилбутил)амид 2-метил-5-фенилтиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[(бензофуран-4-карбонил)амино]этил}-(3-фенилпропил)амид 2-метил-5-фенилтиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[(2-метил-5-фенилтиазол-4-карбонил)-(3-фенилпропил)амино]этил}амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

{2-[(2,3-дигидробензо[1,4]диоксин-5-карбонил)амино]этил}-(3-фенилпропил)амид 2-метил-5-фенилтиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[(бензофуран-4-карбонил)амино]этил}-(4-фторбензил)амид 2-метил-5-фенилтиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[(4-фторбензил)-(2-метил-5-фенилтиазол-4-карбонил)амино]этил}амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

{2-[(2,3-дигидробензо[1,4]диоксин-5-карбонил)амино]этил}(4-фторбензил)амид 2-метил-5-фенилтиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[(бензофуран-4-карбонил)амино]этил}фенетиламид 2-метил-5-фенилтиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[(2-метил-5-фенилтиазол-4-карбонил)фенетиламино]этил}амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

{2-[(2,3-дигидробензо[1,4]диоксин-5-карбонил)амино]этил}фенетиламид 2-метил-5-фенилтиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[(бензофуран-4-карбонил)амино]этил}-(4-трифторметилбензил)амид 2-метил-5-фенилтиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[(2-метил-5-фенилтиазол-4-карбонил)-(4-трифторметилбензил)амино]этил} амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

{2-[(2,3-дигидробензо[1,4]диоксин-5-карбонил)амино]этил}-(4-трифторметилбензил)амид 2-метил-5-фенилтиазол-4-карбоновой кислоты

{2-[(бензофуран-4-карбонил)амино]этил}циклогексилметиламид 2-метил-5-фенилтиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[циклогексилметил-(2-метил-5-фенилтиазол-4-карбонил)амино]этил}амид 6-метилемидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

циклогексилметил-{2-[2,3-дигидробензо[1,4]диоксин-5-карбонил)амино]этил}амид 2-метил-5-фенилтиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[(бензофуран-4-карбонил)амино]этил}изобутиламид 2-метил-5-фенилтиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[изобутил-(2-метил-5-фенилтиазол-4-карбонил)амино]этил}амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

{2-[(2,3-дигидробензо[1,4]диоксин-5-карбонил)амино]этил}изобутиламид 2-метил-5-фенилтиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[(бензофуран-4-карбонил)амино]этил}циклопропилметиламид 2-метил-5-фенилтиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[циклогексилметил-(2-метил-5-фенилтиазол-4-карбонил)амино]этил}амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

циклогексилметил-{2-[(2,3-дигидробензо[1,4]диоксин-5-карбонил)амино]этил} амид 2-метил-5-фенилтиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[(бензофуран-4-карбонил)амино]этил}бензиламид 2-метил-5-фенилтиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[бензил-2-метил-5-фенилтиазол-4-карбонил)амино]этил}амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

бензил-{2-[2-(3,5-дигидробензо[1,4]диоксин-5-карбонил)амино]этил}амид 2-метил-5-фенилтиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[(бензофуран-4-карбонил)амино]этил}метиламид 2-метил-5-фенилтиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[метил-(2-метил-5-фенилтиазол-4-карбонил)амино]этил}амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

{2-[(2,3-дигидробензо[1,4]диоксин-5-карбонил)амино]этил}метиламид 2-метил-5-фенилтиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[(бензофуран-4-карбонил)амино]этил}циклопропиламид 2-метил-5-фенилтиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[циклогексил-(2-метил-5-фенилтиазол-4-карбонил)амино]этил}амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

циклогексил-2-[(2,3-дигидробензо[1,4]диоксин-5-карбонил)амино]этил}амид 2-метил-5-фенилтиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[(бензофуран-4-карбонил)амино]-1-циклогексилэтокси}бензиламид 2-метил-5-фенилтиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[(бензофуран-4-карбонил)амино]-1-циклогексилэтил}амид 2-Метил-5-фенилтиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[(бифенил-2-карбонил)амино]-2-циклогексилэтил}амид бензофuran-4-карбоновой кислоты,





{2-[бензилбифенил-2-карбонил]амино}-3-фенилпропил}амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]-тиазол-5-карбоновой кислоты,

{2-[бензилбифенил-2-карбонил]амино}-3-метилбутил}амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]-тиазол-5-карбоновой кислоты,

{2-[бензилбифенил-2-карбонил)амино]-4-метилпентил}амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]-тиазол-5-карбоновой кислоты,

{2-[циклогексил-(2-циклогексил-5-фенилтиазол-4-карбонил)амино]этил}амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

{2-[циклогексил-(2-циклогексил-5-м-толилтиазол-4-карбонил)амино]этил}амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

(2-{|5-(4-хлорфенил)-2-метилтиазол-4-карбонил|циклогексиламино}этил)амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

(2-{циклогексил-5-(3-метоксифенил)-2-метилтиазол-4-карбонил}амино)этил)амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

(2-{|5-(3-цианофенил)-2-метилтиазол-4-карбонилциклопропиламино}этил)амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

(2-{циклогексил-[(3,4-диметилфенил)-2-метилтиазол-4-карбонил]амино} этил)амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

{2-[циклогексил-(2-метил-5-п-толилтиазол-4-карбонил)амино]этил}амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

{2-[циклогексил-(3'-метилоифенил-2-карбонил)амино]этил}амид б-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

{2-[циклогексил-(4'-метилоифенил-2-карбонил)амино]этил}амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

{2-[циклогексил-(4-фторобифенил-2-карбонил)амино]этил}амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

{2-[циклогептил-(2-циклогептил-5-фенилтиазол-4-карбонил)амино]этил}амид 1-метил-1Н-индазол-3-карбоновой кислоты,

{2-[циклогорил-(2-циклогорил-5-м-толилтиазол-4-карбонил)амино]этил}амид 1-метил-1Н-индазол-3-карбоновой кислоты,

(2-{циклогептил-[2-циклогептил-5-(5-метоксифенил)тиазол-4-карбонил]амино} этил)амид 1-метил-1Н-индазол-3-карбоновой кислоты,

{2-[*z*-амино-5-м-толилгидразол-4-карбонил]циклогексилпропиламино}этил амид 1-метил-1Н-индазол-3-карбоновой кислоты,

(2-{[2-амино-5-(3-фторфенил)тиазол-4-карбонил]циклогексиламином}этил)амид 1-метил-1Н-индазол-3-карбоновой кислоты,

(2-{[2-амино-3-(3-метоксифенил)тиазол-4-карбоний]циклогексиламино} этил)амид 1-метил-1Н-индазол-3-карбоновой кислоты,

(2-[(2-амино-5-методиазол-4-карбонил)циклогексиламин]-этил)амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

{2-[(2-амино-5-м-голилиазол-4-карбонил)циклогептиламино]этил}амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

(2-[(2-амино-5-(3-фторфенил)тиазол-4-карбонил]циклогексиламино)этил]амид 6-метилемидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

(2-{[2-амино-5-(3-метоксифенил)тиазол-4-карбонил]циклогексиламино} этил)амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

(2-[(2-амино-5-(4-фторфенил)тиазол-4-карбонил]циклогексиламино)этил)амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

(2-[(2-амино-5-(5-хлорфенил)тиазол-4-карбонил)циклоопропиламином]этил)амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

R U 2 0 1 0 9 4 5 5 A

{2-[(2-амино-5-фенилтиазол-4-карбонил)циклогексиламино]этил}амид 6-метилимидазо[2,1-b]тиазол-5-карбоновой кислоты,  
(2-{[2-бром-5-(3-метоксифенил)тиазол-4-карбонил]циклогексиламино}этил)амид 6-метилимидазо[2,1-b]тиазол-5-карбоновой кислоты,  
{2-[(2-бром-5-п-толилтиазол-4-карбонил)циклогексиламино]этил}амид 6-метилимидазо[2,1-b]тиазол-5-карбоновой кислоты,  
(2-{циклогексил-[5-(2-фторфенил)-2-метилтиазол-4-карбонил]амино}этил)амид 6-метилимидазо[2,1-b]тиазол-5-карбоновой кислоты,  
(2-{циклогексил-[2-метил-5-(3-трифторметилфенил)тиазол-4-карбонил]амино}этил)амид 6-метилимидазо[2,1-b]тиазол-5-карбоновой кислоты,  
(2-{циклогексил-[5-(3-фторфенил)-2-метилтиазол-4-карбонил]амино}этил)амид 6-метилимидазо[2,1-b]тиазол-5-карбоновой кислоты,  
(2-{[2-амино-5-(4-фторфенил)тиазол-4-карбонил]циклогексиламино}этил)амид 1-метил-1Н-индазол-3-карбоновой кислоты,  
(2-{[2-амино-5-(3-хлорфенил)тиазол-4-карбонил]циклогексиламино}этил)амид 1-метил-1Н-индазол-3-карбоновой кислоты,  
{2-[(2-амино-5-фенилтиазол-4-карбонил)циклогексиламино]этил}амид 1-метил-1Н-индазол-3-карбоновой кислоты,  
(2-{[2-бром-5-(3-метоксифенил)тиазол-4-карбонил]циклогексиламино}этил)амид 1-метил-1Н-индазол-3-карбоновой кислоты,  
{2-[(2-бром-5-п-толилтиазол-4-карбонил)циклогексиламино}этил}амид 1-метил-1Н-индазол-3-карбоновой кислоты,  
(2-{циклогексил-[5-(2-фторфенил)-2-метилтиазол-4-карбонил]амино}этил)амид 1-метил-1Н-индазол-3-карбоновой кислоты,  
(2-{циклогексил-[2-метил-5-(3-трифторметилфенил)тиазол-4-карбонил]амино}этил)амид 1-метил-1Н-индазол-3-карбоновой кислоты,  
(2-{циклогексил-[5-(3-фторфенил)-2-метилтиазол-4-карбонил]амино}этил)амид 1-метил-1Н-индазол-3-карбоновой кислоты,  
(2-{циклогексил-[2-метил-5-(4-фторфенил)тиазол-4-карбонил]амино}этил)амид 1-метил-1Н-индазол-3-карбоновой кислоты,  
(2-{циклогексил-[2-метил-5-(3-хлорфенил)тиазол-4-карбонил]амино}этил)амид 1-метил-1Н-индазол-3-карбоновой кислоты,  
(2-{[5-(4-хлорфенил)-2-метилтиазол-4-карбонил]циклогексиламино}этил)амид 1-метил-1Н-индазол-3-карбоновой кислоты,  
(2-{циклогексил-[5-(3-метоксифенил)-2-метилтиазол-4-карбонил]амино}этил)амид 1-метил-1Н-индазол-3-карбоновой кислоты,  
(2-{[5-(3-цианофенил)-2-метилтиазол-4-карбонил]циклогексиламино}этил)амид 1-метил-1Н-индазол-3-карбоновой кислоты,  
(2-{циклогексил-[5-(3,4-диметилфенил)-2-метилтиазол-4-карбонил]амино}этил)амид 1-метил-1Н-индазол-3-карбоновой кислоты,  
{2-[циклогексил-(2-метил-5-п-толилтиазол-4-карбонил)амино}этил}амид 1-метил-1Н-индазол-3-карбоновой кислоты,  
{2-[циклогексил-(3'-метилбифенил-2-карбонил)амино}этил}амид 1-метил-1Н-индазол-3-карбоновой кислоты,  
{2-[циклогексил-(4'-метилбифенил-2-карбонил)амино}этил}амид 1-метил-1Н-индазол-3-карбоновой кислоты,  
{2-[циклогексил-(4'-фторбифенил-2-карбонил)амино}этил}амид 1-метил-1Н-индазол-3-карбоновой кислоты,  
{2-[(бензофуран-4-карбонил)амино}этил}циклогексиламид 2-циклогексил-5-м-толилтиазол-4-карбоновой кислоты,

R U 2 0 1 0 9 4 5 5 A

{2-[(бензофуран-4-карбонил)амино]этил}циклопропиламид 2-циклогексил-5-метилтиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[(бензофуран-4-карбонил)амино]этил}циклопропиламид 2-цикlopропил-5-м-толилтиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[(бензофуран-4-карбонил)амино]этил}циклогексиламид 2-амино-5-метилтиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[(бензофуран-4-карбонил)амино]этил}циклопропиламид 2-амино-5-(3-фторфенил)тиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[(бензофуран-4-карбонил)амино]этил}циклогексиламид 2-амино-5-(3-метоксифенил)тиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[(бензофуран-4-карбонил)амино]этил}циклогексиламид 2-амино-5-(4-фторфенил)тиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[(бензофуран-4-карбонил)амино]этил}циклогексиламид 2-амино-5-(3-хлорфенил)тиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[(бензофуран-4-карбонил)амино]этил}циклопропиламид 2-амино-5-фенилтиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[(бензофуран-4-карбонил)амино]этил}циклопропиламид 2-бром-5-(3-метоксифенил)тиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[(бензофuran-4-карбонил)амино]этил}циклогексиламид 2-бром-5-п-толилтиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[(бензофуран-4-карбонил)амино]этил}циклопропиламид 5-(2-фторфенил)-2-метилтиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[(бензофуран-4-карбонил)амино]этил}циклопропиламид 2-метил-5-(3-трифторметилфенил)тиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[(бензофуран-4-карбонил)амино]этил}циклопропиламид 5-(3-фторфенил)-2-метилтиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[(бензофуран-4-карбонил)амино]этил}циклогексиламид 2-метил-5-(4-трифторметилфенил)тиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[(бензофуран-4-карбонил)амино]этил}циклогексиламид 5-(4-хлорфенил)-2-метилтиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[(бензофуран-4-карбонил)амино]этил}циклопропиламид 5-(3-метоксифенил)-метилтиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[(бензофуран-4-карбонил)амино]этил}циклопропиламид 5-(3-цианофенил)-2-метилтиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[(бензофуран-4-карбонил)амино]этил}циклопропиламид 5-(3,4-диметилфенил)-2-метилтиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[(бензофуран-4-карбонил)амино]этил}циклогептиламид 2-метил-5-пирролидинил-4-карбоновой кислоты,

{2-[циклогептил-(3'-метилоифенил-2-карбонил)амино]этил}амид бензофуран-4-карбоновой кислоты,

{2-[циклогексил-(4-метилоифенил-2-карбонил)амино]этил}амид бензофуран-4-карбоновой кислоты,

{2-[циклогексил-(4-фторои фенил-2-карбонил)амино]этил}амид бензофуран-4-карбоновой кислоты,

{2-[циклогексилметил-(2-циклогексил-5-фенилиазол-4-карбонил)амино]этил}амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

{2-[циклогексилметил-(2-циклогексил-5-м-толилтиазол-4-карбонил)амино]этил} амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

(2-{[2-циклогексил-5-(3-метоксифенил)тиазол-4-карбонил]имидазол-6-метилимидазол[2,1-*b*]тиазол-5-карбонил}метиламино)тиазол-6-метилимидазол[2,1-*b*]тиазол-5-карбонил

циклогопропилметиламино}этил)амид 6-метилимидазо[2,1-б]тиазол-5-карбоновой

## КИСЛОТЫ,

{2-[(2-амино-5-м-толилтиазол-4-карбонил)циклогексилметиламино]этил}амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

(2-{{2-амино-5-(3-фторфенил)тиазол-4-карбонил}циклогексилметиламино}этил)амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

(2-{[2-амино-5-(3-метоксифенил)тиазол-4-карбонил]циклогексилметиламино} этил)амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

{2-({2-амино-5-(4-фторфенил)тиазол-4-карбонил}циклогексилметиламино} этил)амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

{2-{[2-амино-5-(3-хлорфенил)тиазол-4-карбонил]циклогексилметиламино}этил)амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

{2-[(2-амино-5-фенилтиазол-4-карбонил)циклогексилметиламино]этил}амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

{2-{[2-бром-5-(3-метоксифенил)тиазол-4-карбонил]циклогексилметиламино}этил}амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

{2-[(2-бром-5-п-толилтиазол-4-карбонил)циклогексилметиламино]этил}амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

(2-{циклогексилметил-[5-(2-фторфенил)-2-метилтиазол-4-карбонил]амино} этил)амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

(2-{циклогексилметил-[2-метил-5-(3-трифторметилфенил)тиазол-4-карбониламино} этил)амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

(2-{циклогексилметил-[5-(3-фторфенил)-2-метилтиазол-4-карбонил]амино} этил)амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

(2-{циклогексилметил-[2-метил-5-(4-трифторметилфенил)тиазол-4-карбониламино]этил)амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,  
(2-[(5-(4-трифторметилфенил)тиазол-4-карбониламинометил)метил]имидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновая кислота).

(2-{|5-(4-хлорфенил)-2-метилтиазол-4-карбонил|циклогексилметиламино} этил)амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

(2-{циклогексилметил-[5-(3-метоксифенил)-2-метилтиазол-4-карбонил]амино} этил)амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

(2-{|5-(3-цианофенил)-2-метилтиазол-4-карбонил|циклогексилметиламино} этил)амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

(2-{циклогексилметил-[5-(3,4-диметилфенил)-2-метилтиазол-4-карбонил]амино} этил)амид 6-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

{2-[циклогексилметил-(2-метил-5-п-толилтиазол-4-карбонил)амино]этил}амида 6-метилимидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

{2-[циклогексилметил-(3-метилютидин-2-карбонил)амино]этил}амид 6-метилемидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

{2-[циклогексилметил-(4-метилюанилин-2-карбонил)амино]этил}амид 6-метилемидазо[2,1-*b*]тиазол-5-карбоновой кислоты,

{2-[Циклопропилметил-(2-циклопропил-5-фенилтиазол-4-карбонил)амино]этил}амид 1-метил-1Н-индазол-3-карбоновой кислоты,

{2-[циклогексилметил-(2-циклогексил-5-м-толилтиазол-4-карбонил)амино]этил}амид 1-метил-1Н-индазол-3-карбоновой кислоты,

(2-[(2-циклогексил-5-(3-метоксифенил)тиазол-4-карбонил]циклогексилметиламино}этил)амид 1-метил-1Н-индазол-3-карбоновой кислоты, (2-[(2-амино-5-м-толилтиазол-4-карбонил)циклогексилметиламино]этил)амид

{2-[(2-амино-5-м-голилтиазол-4-карбонил)циклогексилметиламино]этил}амид 1-метил-1Н-индазол-3-карбоновой кислоты,  
 (2-[(2-амино-5-(2-фторфенил)тиазол-4-карбонил)циклогексилметиламино]этил)амид 1-

(2-{[2-амино-5-(3-фторфенил)тиазол-4-карбонил]циклогексилметиламино} этил)амид 1-метил-1Н-индазол-3-карбоновой кислоты,

(2-{[2-амино-5-(3-метоксифенил)тиазол-4-карбонил]циклогексилметиламино}



## амино-5-(3-хлорфенил)тиазол-4-карбоновой кислоты

циклогексил-{2-[(2,3-дигидробензо[1,4]диоксин-5-карбонил)амино]этил}амид 2-амино-5-фенилтиазол-4-карбоновой кислоты,

циклогексил-{2-[(2,3-дигидробензо[1,4]диоксин-5-карбонил)амино]этил}амид 2-бром-5-(3-метоксифенил)тиазол-4-карбоновой кислоты,

циклогексил-{2-[(2,3-дигидробензо[1,4]диоксин-5-карбонил)амино]этил}амид 2-бром-5-п-толилтиазол-4-карбоновой кислоты,

циклогексил-{2-[(2,3-дигидробензо[1,4]диоксин-5-карбонил)амино]этил}амид 5-(2-фторфенил)-2-метилтиазол-4-карбоновой кислоты,

циклогексил-{2-[(2,3-дигидробензо[1,4]диоксин-5-карбонил)амино]этил}амид 2-метил-5-(3-трифторометилфенил)тиазол-4-карбоновой кислоты,

циклогексил-{2-[2-(3,5-дигидробензо[1,4]диоксин-5-карбонил)амино]этил}амид 5-(3-фторфенил)-2-метилтиазол-4-карбоновой кислоты,

циклогексил-{2-[(2,3-дигидробензо[1,4]диоксин-5-карбонил)амино]этил}амид 5-(4-хлорфенил)-2-метилтиазол-4-карбоновой кислоты,

циклогексил-{2-[2,3-дигидробензо[1,4]диоксин-5-карбонил)амино]этил}амид 5-(3-метоксифенил)-2-метилтиазол-4-карбоновой кислоты,

циклогексил-{2-[2,3-дигидробензо[1,4]диоксин-5-карбонил]амино}этил}амид 5-(3,4-диметилфенил)-2-метилтиазол-4-карбоновой кислоты,

циклогептил- $\{\text{2-}[(2,3\text{-дигидробензо[1,4]диоксин-3-карбонил)амино]этил}\}\text{амида 2-метил-5-п-толилтиазол-4-карбоновой кислоты,}$

{2-[циклогексил-(3'-метилбифенил-2'-карбонил)амино]этил}амид 2,3-дигидробензо[1,4]диоксин-5-карбоновой кислоты,

{2-[циклогорил-(4'-метиоифенил-2-карбонил)амино]этил}амид 2,3-дигидробензо[1,4]диоксин-5-карбоновой кислоты,

дигидробензо[1,4]диоксин-5-карбоновой кислоты,  
циклогексилметил-[2-[(2,3-дигидробензо[1,4]диоксии-5-карбонил)аминогруппы]этил]амид 2,3-

циклогексилметил-[2-[(2,3-дигидробензо[1,4]диоксин-5-карбонил)амино]этил]амид 2-циклогексилтиазол-4-карбоновой кислоты,

циклогексилметил-{2-[2,3-дигидробензо[1,4]диоксин-5-карбонил)амино]этил}амид 2-циклогексил-5-м-толилтиазол-4-карбоновой кислоты, циклопропилметил-{2-[2,3-дигидробензо[1,4]диоксин-5-карбонил)амино]этил}

амид 2-циклогексил-5-(3-метоксифенил)тиазол-4-карбоновой кислоты, циклопропилметил-{2-[(2,3-дигидробензо[1,4]диоксин-5-карбонил)амино]этил}

амид 2-амино-5-м-толилтиазол-4-карбоновой кислоты,  
циклогексилметил-{2-[(2,3-дигидробензо[1,4]диоксин-5-карбонил)амино]этил}

амид 2-амино-5-(3-фторфенил)тиазол-4-карбоновой кислоты,  
циклогексилметил-{2-[(2,3-дигидробензо[1,4]диоксин-5-карбонил)амино]этил}

амид 2-амино-5-(3-метоксифенил)тиазол-4-карбоновой кислоты,  
циклогексилметил-{2-[(2,3-дигидробензо[1,4]диоксин-5-карбонил)амино]этил}

амид 2-амино-5-фенилтиазол-4-карбоновой кислоты,  
циклогексилметил-{2-[(2,3-дигидробензо[1,4]диоксин-5-карбонил)амино]этил}

амид 2-бром-5-(3-метоксифенил)тиазол-4-карбоновой кислоты,  
циклогексилметил-{2-[(2,3-дигидробензо[1,4]диоксин-5-карбонил)амино]этил}

амид 2-бром-5-п-толилтиазол-4-карбоновой кислоты,  
циклогексилметил-{2-[(2,3-дигидробензо[1,4]диоксин-5-карбонил)амино]этил}

амид 5-(2-фторфенил)-2-метилтиазол-4-карбоновой кислоты,  
циклогексилметил-{2-[(2,3-дигидробензо[1,4]диоксин-5-карбонил)амино]этил}

амид 2-метил-5-(3-трифторметилфенил)тиазол-4-карбоновой кислоты, циклопропилметил-{2-[(2,3-дигидробензо[1,4]диоксин-5-карбонил)амино]этил}

Стр.: 12



2-метилтиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[(бензофуран-4-карбонил)амино]этил}циклопропилметиламид 5-(3,4-диметилфенил)-2-метилтиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[(бензофуран-4-карбонил)амино]этил}циклопропилметиламид 2-метил-5-п-толилтиазол-4-карбоновой кислоты,

{2-[циклопропилметил-(3'-метилбифенил-2-карбонил)амино]этил}амид бензофуран-4-карбоновой кислоты,

{2-[циклопропилметил-(4'-метилбифенил-2-карбонил)амино]этил}амид бензофуран-4-карбоновой кислоты и

{2-[циклопропилметил-(4'-фторбифенил-2-карбонил)амино]этил}амид бензофуран-4-карбоновой кислоты;

или соли этих соединений.

10. Фармацевтическая композиция, содержащая в качестве активного компонента соединение формулы (I) по п.1 или его фармацевтически приемлемую соль и по крайней мере одно терапевтически инертное вспомогательное вещество.

11. Соединение по п.1 или его фармацевтически приемлемая соль для применения в качестве лекарственного средства.

12. Соединение по п.1 или его фармацевтически приемлемая соль для профилактики или лечения болезней, выбранных из группы, включающей все типы заболеваний, связанных с расстройством сна, обусловленные стрессами синдромы, применение и злоупотребление психотропными средствами, когнитивные дисфункции в здоровой популяции и при психиатрических и неврологических расстройствах, при расстройствах, связанных с приемом пищи и питья.

13. Применение соединения по одному из пп.1-9 или его фармацевтически приемлемой соли для профилактики или лечения болезней, выбранных из группы, включающей все типы заболеваний, связанных с расстройством сна, обусловленные стрессами синдромы, применение и злоупотребление психотропными средствами, когнитивные дисфункции в здоровой популяции и при психиатрических и неврологических расстройствах, при расстройствах, связанных с приемом пищи и питья.