

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2012132429/04, 28.12.2010

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
28.12.2009 DE 102009060811.7;
02.02.2010 US 61/282,395

(43) Дата публикации заявки: 10.02.2014 Бюл. № 4

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 30.07.2012(86) Заявка РСТ:
DE 2010/001530 (28.12.2010)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2011/079841 (07.07.2011)Адрес для переписки:
129090, Москва, ул. Б. Спасская, 25, стр.3, ООО
"Юридическая фирма Городисский и Партнеры"

(71) Заявитель(и):

АУДИОКЬЮР ФАРМА ГМБХ (DE)

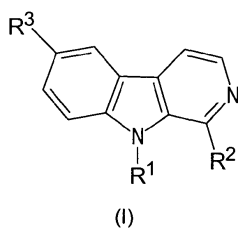
(72) Автор(ы):

РОММЕЛЬШПАХЕР Ханс (DE)

(54) **БЕТА-КАРБОЛИНЫ ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ НАРУШЕНИЯ СЛУХА И ГОЛОВОКРУЖЕНИЯ**

(57) Формула изобретения

1. Применение соединений общей формулы (I)



в которой

 R^1 представляет собой $-R^{12}$;

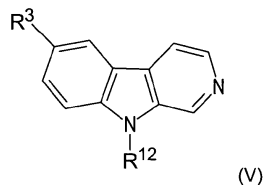
R^2 и R^3 представляют собой независимо друг от друга следующие фрагменты: $-R^7$, $-R^8$, $-H$, $-OH$, $-OR^7$, $-OCH_3$, $-OC_2H_5$, $-OC_3H_7$, $-O$ -цикло- C_3H_5 , $-OCH(CH_3)_2$, $-OC(CH_3)_3$, $-OC_4H_9$, $-OPh$, $-OCH_2-Ph$, $-OCPh_3$, $-F$, $-Cl$, $-Br$, $-I$, $-NH_2$, $-NHCH_3$, $-NHC_2H_5$, $-NHC_3H_7$, $-NH$ -цикло- C_3H_5 , $-NHCH(CH_3)_2$, $-NHC(CH_3)_3$, $-N(CH_3)_2$, $-N(C_2H_5)_2$, $-N(C_3H_7)_2$, $-N$ (цикло- C_3H_5) $_2$, $-N[CH(CH_3)_2]_2$, $-N[C(CH_3)_3]_2$, $-OCF_3$, $-OC_2F_5$,

R^7 , R^8 и R^{12} представляют собой независимо друг от друга следующие фрагменты: $-CH_2F$, $-CHF_2$, $-CF_3$, $-CH_2Cl$, $-CH_2Br$, $-CH_2I$, $-CH_2-CH_2F$, $-CH_2-CHF_2$, $-CH_2-CF_3$, $-CH_2-CH_2$

$C\equiv C-CH_3$, $-CH(CH_3)-CH_2-C\equiv C-CH_3$, $-CH(CH_3)-C\equiv C-C_2H_5$, $-C\equiv C-CH(CH_3)-C_2H_5$, $-C\equiv C-CH_2-CH(CH_3)_2$, $-CH(C_2H_5)-C\equiv C-CH_3$, $-C(CH_3)_2-C\equiv C-CH_3$, $-CH(C_2H_5)-CH_2-C\equiv CH$, $-CH_2-CH(C_2H_5)-C\equiv CH$, $-C(CH_3)_2-CH_2-C\equiv CH$, $-CH_2-C(CH_3)_2-C\equiv CH$, $-CH(CH_3)-CH(CH_3)-C\equiv CH$, $-CH(C_3H_7)-C\equiv CH$, $-C(CH_3)(C_2H_5)-C\equiv CH$, $-C_{14}H_{29}$, $-CH_2-CH_2-N(CH_3)_2$;

а также фармакологических приемлемых солей, сольватов, гидратов, энантиомеров, диастереомеров, а также рацематов вышеупомянутых соединений для получения фармацевтической композиции для профилактики и лечения нарушения слуха, головокружения и вестибулярных нарушений.

2. Применение по п.1 соединений общей формулы (V)



в которой фрагменты R^{12} и R^3 имеют значения, описанные в п.1.

3. Применение по п.1 соединений, выбранных из группы, состоящей из 9-метил-9Н-β-карболина, 6-метокси-9-изопропил-9Н-β-карболина, 9-[(1Z)-1-метилпроп-1-енил]-9Н-β-карболина, 1-хлор-9-[(1Z,3E)-2-метилпента-1,3-диенил]-9Н-β-карболина, 9-метил-6-пропокси-9Н-β-карболина, 9-циклопропил-6-метокси-9Н-β-карболина, 6-трифторметокси-9-метил-9Н-β-карболина, 6-диметиламино-9-метил-9Н-β-карболина, 1-метокси-6-хлор-9-метил-9Н-β-карболина, 1,9-диметил-9Н-β-карболина, 1-изопропил-6,9-диметил-9Н-β-карболина, 6,9-диметил-9Н-β-карболина, 6-метокси-9-метил-9Н-β-карболина, 9-(2-фторэтил)-9Н-β-карболина и 9-аллил-9Н-β-карболина.

4. Применение по п.1, в котором острые и хронические нарушения органов слуха и нарушения слуха, головокружение и вестибулярные нарушения представляют собой, в частности, острую потерю слуха, острую акустическую травму, травму после взрыва, периферическую глухоту в результате хронического воздействия шумов, пресбиакузис, травму при имплантации протеза внутреннего уха (травма вставки), головокружение в результате заболевания внутреннего уха, головокружение, связанное с и/или в качестве симптома болезни Меньера, вестибулярное нарушение, связанное с и/или в качестве симптома болезни Меньера, звон в ушах и нарушение слуха в результате приема антибиотиков и цитостатиков.

5. Фармацевтическая композиция, содержащая по меньшей мере одно соединение по любому из пп.1-3 в форме капель, мазей, спреев, липосом, гелей, эмульсий или растворов для инъекции для лечения заболеваний уха и нарушения слуха.