

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

(21)(22) Заявка: 2012102094/04, 22.06.2010

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
26.06.2009 IN 1320/DEL/2009;
10.03.2010 IN 555/DEL/2010;
03.06.2010 IN 1297/DEL/2010

(43) Дата публикации заявки: 10.08.2013 Бюл. № 22

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 26.01.2012(86) Заявка РСТ:
IN 2010/000428 (22.06.2010)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2010/150281 (29.12.2010)

Адрес для переписки:

123242, Москва, Кудринская площадь, 1, а/я 35,
"Михайлюк, Сороколат и партнеры-патентные
поверенные"

(71) Заявитель(и):

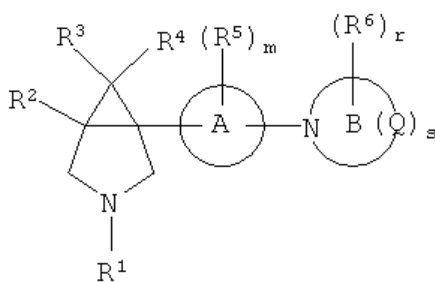
ПАНАЦЕА БИОТЕК ЛТД. (IN)

(72) Автор(ы):

**ДЖАИН Раджеш (IN),
ТРЕХАН Санджай (IN),
ДАС Джагаттаран (IN),
КАУР Гурмит (IN),
КАНВАР Сандип (IN),
СИНГХ Нишан (IN),
НАНДА Гурмит Каур (IN),
МАГАДИ Ситарам Кумар (IN),
ШАРМА Садхир Кумар (IN)**(54) **НОВЫЕ АЗАБИЦИКЛОГЕКСАНЫ**

(57) Формула изобретения

1. Соединение формулы Ib,



Формула Ib,

или его фармацевтически приемлемые производные, таутомерные формы,
стереоизомеры, включающие R и S изомеры, полиморфы, пролекарства, метаболиты,
соли или их сольваты, где:

кольцо А является, или арилом, или гетероарилом;

кольцо В представляет собой гетероцикл, присоединенный к кольцу А через атом
азота в любом доступном положении кольца А, кольцо В дополнительно может быть
конденсировано с одним или несколькими арильными, гетероарильными,

циклоалкильными или гетероциклическими кольцами, при условии, что кольцо Б не может быть изоксазолилом, -CH₂-N-пирролилом, 1,1-диоксидо-2-изотиазолидинилом, тиенилом, тиазолилом, пиридилом или 2-пирролидинонилом;

R¹, R² и R⁴ независимо выбраны из -H, C₁₋₁₂алкила, C₂₋₁₂алкенила, C₂₋₁₂алкинила, C₁₋₁₂алкоксиалкила, C₂₋₁₂алкоксиалкенила, C₂₋₁₂алкоксиалкинила, C₃₋₂₀циклоалкила, C₃₋₂₀циклоалкенила, C₆₋₂₀циклоалкинила, гетероциклила, арила, гетероарила, C₁₋₁₂алкил-циклоалкила, C₁₋₁₂алкил-гетероциклила, C₁₋₁₂алкил-арила, C₁₋₁₂алкил-гетероарила; C₂₋₁₂алкенил-циклоалкила, C₂₋₁₂алкенил-гетероциклила, C₂₋₁₂алкенил-арила, C₂₋₁₂алкенил-гетероарила; C₂₋₁₂алкинил-циклоалкила, C₂₋₁₂алкинил-гетероциклила, C₂₋₁₂алкинил-арила, C₂₋₁₂алкинил-гетероарила, -CN, -NH₂, -CHO, -COR^a, -CSR^a, -COOR^a, -NR^aR^b, -CONR^aNR^bR^c, -(C=NR^a)-NR^bR^c, -CHS, -COOH, -COCOR^a, -CONH₂, -CONHNH₂, -CSNHNH₂, -CONR^aR^b, -CSNH₂, -CSNR^aR^b, -C(=NOR^b)R^a-NH₂, -NHNH₂, -NR^aNR^bR^c, -N(R^a)(CO)R^b, -N(R^a)(CO)OR^b, -N(R^a)(CO)NR^aR^b, -N(R^a)(CS)R^b, -N(R^a)(CS)OR^b, -N(R^a)(CS)NR^aR^b, -NR^a(C=NR^a)NR^aR^b, -SO₃H, -SOR^a, -SO₂R^a, -SO₂NR^aR^b, -P(O)R^aR^b, -P(O)OR^aR^b, -P(O)R^aOR^b, -P(O)NR^aOR^b, -P(O)NR^aR^b, -OH или -OR^a; каждый из которых факультативно может быть замещен в любом доступном положении одним или несколькими заместителями, выбранными без ограничения из галогена, -CN, -CHO, -COR^a, -CHS, -CSR^a, -COOH, -COOR^a, -COCN, -CONH₂, -CONHNH₂, -CSNHNH₂, -CONR^aR^b, -CSNH₂, -CSNR^aR^b, -C(=NOR^b)R^a, оксо, -NH₂, -NHNH₂, -NR^aR^b, -NR^aR^bR^c, -N₃, -NO₂, -N(R^a)(CO)R^b, -N(R^a)(CO)OR^b, -N(R^a)(CO)NR^aR^b, -N(R^a)(CS)R^b, -N(R^a)(CS)OR^b, -N(R^a)(CS)NR^aR^b, -NR^a(C=NR^a)NR^aR^b, -OH, -OR^a, -OCOR^a, -OCOOR^a, -OCONR^aR^b, -SH, -SR^a, -SO₃H, -SOR^a, -SO₂R^a, -SO₂NR^aR^b, -P(O)R^aR^b, -P(O)OR^aOR^b, -P(O)R^aR^b, -P(O)NR^aOR^b, -P(O)NR^aR^b, -C₁₋₁₂алкила, -C₂₋₁₂алкенила, -C₂₋₁₂алкинила, C₃₋₂₀циклоалкила, C₃₋₂₀циклоалкенила, C₆₋₂₀циклоалкинила, гетероциклила, арила, гетероарила;

R^a представляет -(CH₂)_pZ;

Z выбран из -H, галогена, C₂₋₁₂алкенила, C₂₋₁₂алкинила, C₁₋₁₂галогеналкила, C₂₋₁₂галогеналкенила, C₂₋₁₂галогеналкинила, C₃₋₂₀циклоалкила, C₃₋₂₀циклоалкенила, C₆₋₂₀циклоалкинила, гетероциклила, арила, гетероарила, -NH₂, -CHO, -COR^a, -CSR^a, -COOR^a, -CONR^aR^b, -CSNR^aR^b, -NR^aR^b, -CONR^aR^bR^c, -(C=NR^a)-NR^bR^c, -OH или -OR^a; каждый из которых факультативно может быть замещен в любом доступном положении одним или несколькими заместителями, выбранными без ограничения из галогена, -CN, -CHO, -COR^a, -CHS, -CSR^a, -COOH, -COOR^a, -COCN, -CONH₂, -CONHNH₂, -CSNHNH₂, -CONR^aR^b, -CSNH₂, -CSNR^aR^b, -C(=NOR^b)R^a, оксо, -NH₂, -NHNH₂, -NR^aR^b, -NR^aR^bR^c, -N₃, -NO₂, -N(R^a)(CO)R^b, -N(R^a)(CO)OR^b, -N(R^a)(CO)NR^aR^b, -N(R^a)(CS)R^b, -N(R^a)(CS)OR^b, -N(R^a)(CS)NR^aR^b, -NR^a(C=NR^a)NR^aR^b, -OH, -OR^a, -OCOR^a, -OCOOR^a, -OCONR^aR^b, -SH, -SR^a, -SO₃H, -SOR^a, -SO₂R^a, -SO₂NR^aR^b, -P(O)R^aR^b, -P(O)OR^aOR^b, -P(O)R^aOR^b, -P(O)NR^aOR^b, -P(O)NR^aR^b;

R^5 независимо выбран из -H, галогена, C_{1-12} алкила, C_{2-12} алкенила, C_{2-12} алкинила, C_{1-12} галогеналкила, C_{2-12} галогеналкенила, C_{2-12} галогеналкинила, C_{3-20} циклоалкила, C_{3-20} циклоалкенила, C_{6-20} циклоалкинила, гетероциклила, арила, гетероарила, C_{1-12} алкил-циклоалкила, C_{1-12} алкил-гетероциклила, C_{1-12} алкил-арила, C_{1-12} алкил-гетероарила; C_{2-12} алкенил-циклоалкила, C_{2-12} алкенил-гетероциклила, C_{2-12} алкенил-арила, C_{2-12} алкенил-гетероарила; C_{2-12} алкинил-циклоалкила, C_{2-12} алкинил-гетероциклила, C_{2-12} алкинил-арила, C_{2-12} алкинил-гетероарила, оксо, $-NH_2$, $-CHO$, $-COR^a$, $-CSR^a$, $-COOR^a$, $-CONR^aR^b$, $-CSNR^aR^b$, $-NR^aR^b$, $-CONR^aN(R^b)_2$, $-(C=NR^a)-NR^bR^c$, $-(CH_2)_n-N_3$, $-(CH_2)_n-NCS$, $-C(=Y)R^a$, $-C(=Y)OR^a$, $-C(=Y)NR^aR^b$, $-(CH_2)_nYR^a$, $-(CH_2)_nOP(=O)R^aR^b$, $-(CH_2)_nNHP(=O)R^aR^b$, $-(CH_2)_nOC(=Y)R^a$, $-(CH_2)_nOC(=Y)OR^a$, $-(CH_2)_nC(=Y)R^a$, $-(CH_2)_nC(=Y)NR^aR^b$, $-(CH_2)_nOC(=Y)NR^aR^b$, $-(CH_2)_nC(=Y)OR^a$, $-(CH_2)_nNR^aR^b$, $-(CH_2)_nNR^aC(=Y)R^b$, $-(CH_2)_nNR^aC(=Y)OR^b$, $-(CH_2)_nNR^aC(=Y)NR^aR^b$, $-(CH_2)_nNR^aSO_2R^b$, -OH или $-OR^a$; каждый из которых факультативно может быть замещен в любом доступном положении одним или несколькими заместителями, выбранными без ограничения из галогена, $-CN$, $-CHO$, $-COR^a$, $-CHS$, $-CSR^a$, $-COOH$, $-COOR^a$, $-COCN$, $-CONH_2$, $-CONHNH_2$, $-CSNHNH_2$, $-CONR^aR^b$, $-CSNH_2$, $-CSNR^aR^b$, $-C(=NOR^b)R^a$, оксо, $-NH_2$, $-NHNH_2$, $-NR^aR^b$, $-NR^aNR^bR^c$, $-N_3$, $-NO_2$, $-N(R^a)(CO)R^b$, $-N(R^a)(CO)OR^b$, $-N(R^a)(CO)NR^aR^b$, $-N(R^a)(CS)R^b$, $-N(R^a)(CS)OR^b$, $-N(R^a)(CS)NR^aR^b$, $-NR^a(C=NR^a)NR^aR^b$, -OH, $-OR^a$, $-OCOR^a$, $-OCOOR^a$, $-OCONR^aR^b$, $-SH$, $-SR^a$, $-SO_3H$, $-SOR^a$, $-SO_2R^a$, $-SO_2NR^aR^b$, $-P(O)R^aR^b$, $-P(O)OR^aOR^b$, $-P(O)R^aOR^b$, $-P(O)NR^aOR^b$, $-P(O)NR^aR^b$, $-C_{1-12}$ алкила, $-C_{2-12}$ алкенила, $-C_{2-12}$ алкинила, C_{3-20} циклоалкила, C_{3-20} циклоалкенила, C_{6-20} циклоалкинила, гетероциклила, арила, гетероарила;

R^6 независимо выбран из -H, галогена, C_{1-12} алкила, C_{2-12} алкенила, C_{2-12} алкинила, C_{1-12} галогеналкила, C_{2-12} галогеналкенила, C_{2-12} галогеналкинила, C_{3-20} циклоалкила, C_{3-20} циклоалкенила, C_{6-20} циклоалкинила, гетероциклила, арила, гетероарила, C_{1-12} алкил-циклоалкила, C_{1-12} алкил-гетероциклила, C_{1-12} алкил-арила, C_{1-12} алкил-гетероарила; C_{2-12} алкенил-циклоалкила, C_{2-12} алкенил-гетероциклила, C_{2-12} алкенил-арила, C_{2-12} алкенил-гетероарила; C_{2-12} алкинил-циклоалкила, C_{2-12} алкинил-гетероциклила, C_{2-12} алкинил-арила, C_{2-12} алкинил-гетероарила, оксо, $-NH_2$, $-CHO$, $-COR^a$, $-CSR^a$, $-COOR^a$, $-CONR^aR^b$, $-CSNR^aR^b$, $-NR^aR^b$, $-CONR^aN(R^b)_2$, $-(C=NR^a)-NR^bR^c$, $-(CH_2)_n-N_3$, $-(CH_2)_n-NCS$, $-C(=Y)R^a$, $-C(=Y)OR^a$, $-C(=Y)NR^aR^b$, $-(CH_2)_nYR^a$, $-(CH_2)_nOP(=O)R^aR^b$, $-(CH_2)_nNHP(=O)R^aR^b$, $-(CH_2)_nOC(=Y)R^a$, $-(CH_2)_nOC(=Y)OR^a$, $-(CH_2)_nC(=Y)R^a$, $-(CH_2)_nC(=Y)NR^aR^b$, $-(CH_2)_nOC(=Y)NR^aR^b$, $-(CH_2)_nC(=Y)OR^a$, $-(CH_2)_nNR^aR^b$, $-(CH_2)_nNR^aC(=Y)R^b$, $-(CH_2)_nNR^aC(=Y)OR^b$, $-(CH_2)_nNR^aC(=Y)NR^aR^b$, $-(CH_2)_nNR^aSO_2R^b$, -OH или $-OR^a$; каждый из которых факультативно может быть замещен в любом доступном положении одним или несколькими заместителями, выбранными без ограничения из галогена, $-CN$, $-CHO$, $-COR^a$, $-CHS$, $-CSR^a$, $-COOH$, $-COOR^a$, $-COCN$, $-CONH_2$, $-CONHNH_2$, $-CSNHNH_2$, $-CONR^aR^b$,

-CSNH₂, -CSNR^aR^b, -C(=NOR^b)R^a, оксо, -NH₂, -NHNH₂, -NR^aR^b, -NR^aNR^bR^c, -N₃, -NO₂, -N(R^a)(CO)R^b, -N(R^a)(CO)OR^b, -N(R^a)(CO)NR^aR^b, -N(R^a)(CS)R^b, -N(R^a)(CS)OR^b, -N(R^a)(CS)NR^aR^b, -NR^a(C=NR^a)NR^aR^b, -OH, -OR^a, -OCOR^a, -OCOR^a, -OCONR^aR^b, -SH, -SR^a, -SO₃H, -SOR^a, -SO₂R^a, -SO₂NR^aR^b, -P(O)R^aR^b, -P(O)OR^aOR^b, -P(O)R^aOR^b, -P(O)NR^aOR^b, -P(O)NR^aR^b, -C₁₋₁₂алкила, -C₂₋₁₂алкенила, -C₂₋₁₂алкинила, C₃₋₂₀циклоалкила, C₃₋₂₀циклоалкенила, C₆₋₂₀циклоалкинила, гетероциклила, арила, гетероарила;

при условии, что когда кольцо Б является оксазолидинилом, а r равняется 1, тогда R₆ не может быть C₁₋₁₂алкилом, C₂₋₁₂алкенилом, C₂₋₁₂алкинилом, C₁₋₁₂алкоксиалкилом, C₂₋₁₂алкоксиалкенилом, C₂₋₁₂алкоксиалкинилом, C₃₋₂₀циклоалкилом, C₃₋₂₀циклоалкенилом, C₆₋₂₀циклоалкинилом, гетероциклилом, арилом, гетероарилом, -(CH₂)_n-циклоалкилом, -(CH₂)_n-гетероциклилом, -(CH₂)_n-арилом, -(CH₂)_n-гетероарилом, -(CH₂)_n-N₃, -(CH₂)_n-NCS, -C(=Y)R^a, -C(=Y)OR^a, -C(=Y)NR^aR^b, -(CH₂)_nYR^a, -(CH₂)_nOP(=O)R^aR^b, -(CH₂)_nNHP(=O)R^aR^b, -(CH₂)_nOC(=Y)R^a, -(CH₂)_nOC(=Y)OR^a, -(CH₂)_nC(=Y)R^a, -(CH₂)_nC(=Y)NR^aR^b, -(CH₂)_nOC(=Y)NR^aR^b, -(CH₂)_nC(=Y)OR^a, -(CH₂)_nNR^aR^b, -(CH₂)_nNR^aC(=Y)R^b, -(CH₂)_nNR^aC(=Y)OR^b, -(CH₂)_nNR^aC(=Y)NR^aR^b или -(CH₂)_nNR^aSO₂R^b;

R₅ и R₆ соединены вместе с образованием 5-10-членного гетероциклического кольца, которое факультативно может быть замещено в любом доступном положении C₁₋₁₂алкилом, C₂₋₁₂алкенилом, C₂₋₁₂алкинилом, C₁₋₁₂галогеналкилом, C₃₋₂₀циклоалкилом, гетероциклилом, арилом, гетероарилом, оксо, -NH₂, -NO₂, -N₃, -CN, -CHO, -COR^c, -CHS, -CSR^c, -COOH, -COOR^c, -OH, -OR^c, -SH или -SR^c;

Q независимо выбран из -CH₂-, O, S, SO, SO₂, -N(R^a)-, -(CO)-, -(CS)-, -CR^a(N(R^b)₂)-, -C(=NR^a)-, -CR^a(OR^b)-, -CR^aR^b-, -P(O)R^a-, -P(O)(OR^a)-, -CR^a(SR^b)-, -CR^a(SO₃R^b)-, -CR^a(SOR^b)-, -CR^a(SO₂R^b)- или -CR^a(SO₂NR^bR^c)-;

R^a и R^b являются одинаковыми или различными и независимо могут быть выбраны из -H, C₁₋₁₂алкила, C₂₋₁₂алкенила, C₂₋₁₂алкинила, C₁₋₁₂галогеналкила, C₂₋₁₂галогеналкенила, C₂₋₁₂галогеналкинила, C₃₋₂₀циклоалкила, C₃₋₂₀циклоалкенила, C₆₋₂₀циклоалкинила, гетероциклила, арила, гетероарила, C₁₋₁₂алкил-циклоалкила, C₁₋₁₂алкил-гетероциклила, C₁₋₁₂алкил-арила, C₁₋₁₂алкил-гетероарила; C₂₋₁₂алкенил-циклоалкила, C₂₋₁₂алкенил-гетероциклила, C₂₋₁₂алкенил-арила, C₂₋₁₂алкенил-гетероарила; C₂₋₁₂алкинил-циклоалкила, C₂₋₁₂алкинил-гетероциклила, C₂₋₁₂алкинил-арила или C₂₋₁₂алкинил-гетероарила; каждый из которых факультативно может быть замещен в любом доступном положении одним или несколькими заместителями, выбранными без ограничения из галогена, -CN, -CHO, -COR^c, -CHS, -CSR^c, -COOH, -COOR^c, -COCN, -CONH₂, -CONHNH₂, -CSNHNH₂, -CONR^cR^b, -CSNH₂, -CSNR^cR^d, -C(=NOR^c)R^d, оксо, -NH₂, -NHNH₂, -NR^cR^d, -NR^cN(R^d)₂, -N₃, -NO₂, -N(R^c)(CO)R^d, -N(R^c)(CO)OR^d, -N(R^c)(CO)N(R^d)₂, -N(R^c)(CS)R^d, -N(R^c)(CS)OR^d, -N(R^c)(CS)N(R^d)₂, -NR^a(C=NR^a)NR^aR^b, -OH, -OR^c, -OCOR^c, -OCOR^c, -OCONR^cR^d, -SH, -SR^c, -SO₃H, -SOR^c, -SO₂R^c, -SO₂NR^cR^d,

-P(O)R^cR^d, -P(O)OR^cOR^d, -P(O)R^cOR^d, -P(O)NR^cOR^d, -P(O)NR^cR^d, -C₁₋₁₂алкила, -C₂₋₁₂алкенила, -C₂₋₁₂алкинила, C₃₋₂₀циклоалкила, C₃₋₂₀циклоалкенила, C₆₋₂₀циклоалкинила, гетероциклила, арила, гетероарила;

или

R^a и R^b соединены вместе с образованием C₃₋₂₀циклоалкильного, C₃₋₂₀циклоалкенильного, C₆₋₂₀циклоалкинильного, гетероциклильного, арильного или гетероарильного кольца, которое факультативно может быть замещено в любом доступном положении Q;

R^c и R^d являются одинаковыми или различными и независимо могут быть выбраны из -H, C₁₋₁₂алкила, C₂₋₁₂алкенила, C₂₋₁₂алкинила, C₃₋₂₀циклоалкила, гетероциклила, арила, гетероарила, -CN, -CHO, -COOH, -COCN, -CONH₂, -CONHNH₂, -CSNHNH₂, -CSNH₂, оксо, -NH₂, -NHNH₂, -N₃, -NO₂, -OH, -SH, -SO₃H или галогена;

Y представляет собой O или S;

m равняется 0, 1, 2, 3 или 4;

n равняется 0, 1, 2, 3 или 4;

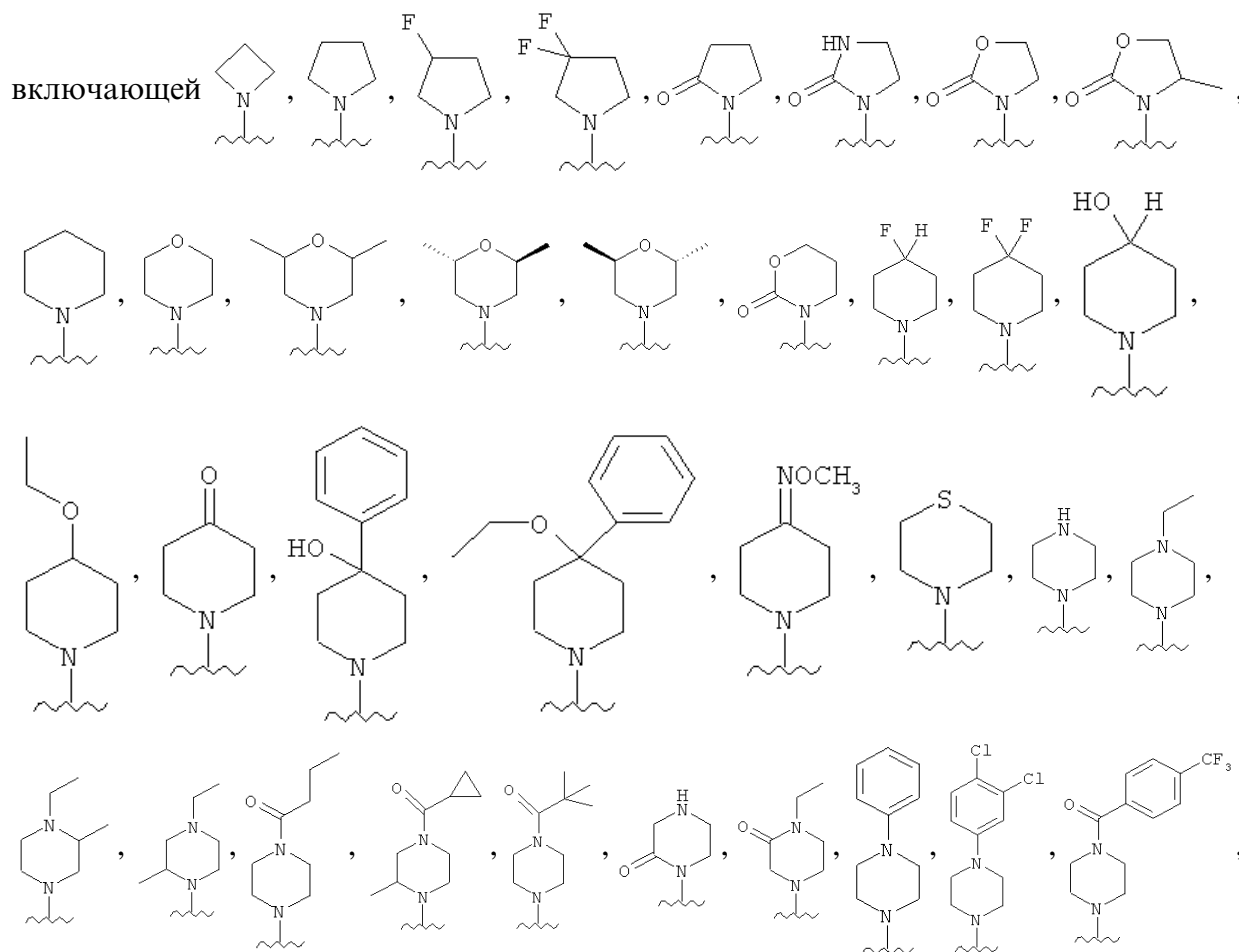
r равняется 0, 1, 2, 3 или 4;

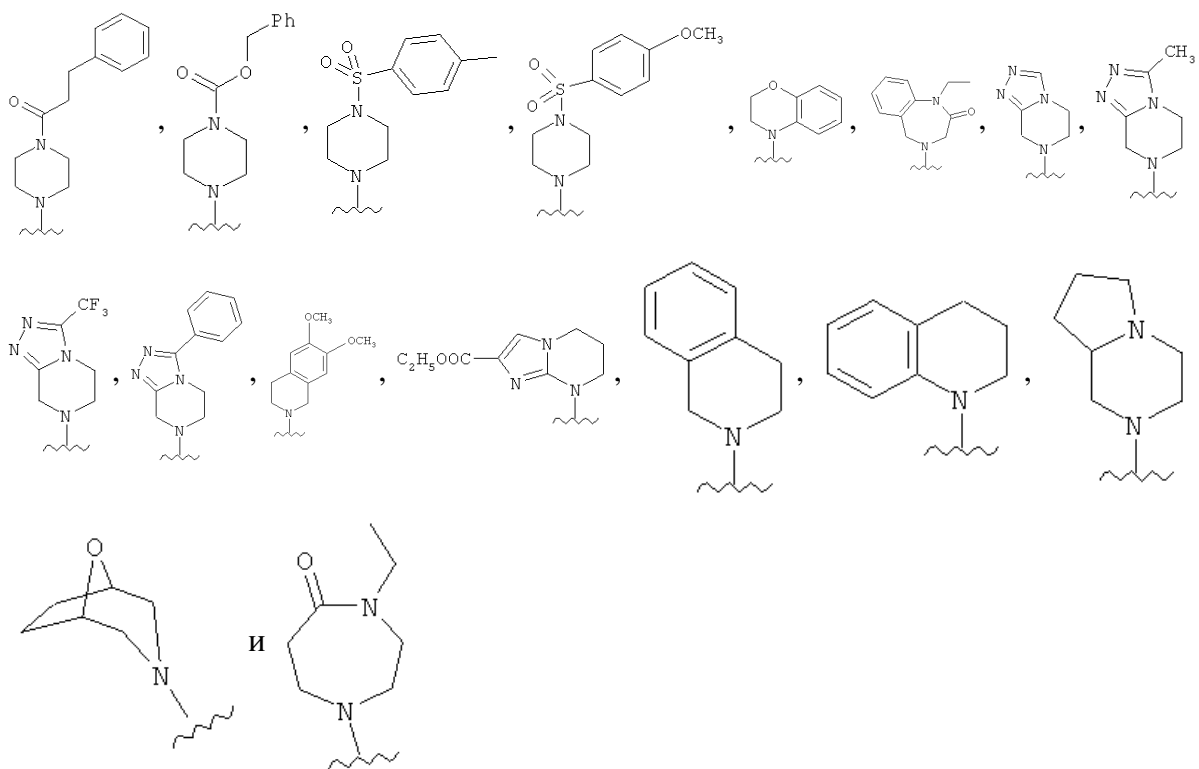
p равняется 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 или 10;

s равняется 0, 1, 2, 3 или 4.

2. Соединение по п.1, имеющее формулу Ib, где кольцо А выбрано из группы, включающей фенил, пиридил, бензотиофен и нафтил.

3. Соединение по п.1, имеющее формулу Ib, где кольцо Б выбрано из группы,





4. Соединение по п.1, имеющее формулу Ib, где R^1 выбран из группы, включающей -H, C_{1-4} алкил, C_{2-4} алкенил, C_{2-4} алкинил, C_{1-4} алкоксиалкил, C_{3-7} циклоалкил, гетероциклил, арил, гетероарил, C_{3-7} алкил-циклоалкил, C_{1-12} алкил-гетероциклил, C_{1-12} алкил-арил, C_{1-12} алкил-гетероарил, OR^a , $-COOR^a$, $-CONR^aR^b$, $-COR^a$ и $-SO_2R^a$; каждый из которых является незамещенным или замещенным в любом доступном положении одним или несколькими заместителями, независимо выбранными из группы, включающей галоген, $-CN$, $-CHO$, $-COR^a$, $-CHS$, $-CSR^a$, $-COOH$, $-COOR^a$, $-COCN$, $-CONH_2$, $-CONHNH_2$, $-CSNHNH_2$, $-CONR^aR^b$, $-CSNH_2$, $-CSNR^aR^b$, $-C(=NOR^b)R^a$, оксо, $-NH_2$, $-NHNH_2$, $-NR^aR^b$, $-NR^aNR^bR^c$, $-N_3$, $-NO_2$, $-N(R^a)(CO)R^b$, $-N(R^a)(CO)OR^b$, $N(R^a)(CO)NR^aR^b$, $-N(R^a)(CS)R^b$, $-N(R^a)(CS)OR^b$, $-N(R^a)(CS)NR^aR^b$, $-NR^a(C=NR^a)NR^aR^b$, $-OH$, $-OR^a$, $-OCOR^a$, $-OCOOR^b$, $-OCONR^aR^b$, $-SH$, $-SR^a$, $-SO_3H$, $-SOR^a$, $-SO_2R^a$, $-SO_2NR^aR^b$, $-P(O)R^aR^b$, $-P(O)OR^aOR^b$, $-P(O)R^aOR^b$, $-P(O)NR^aOR^b$, $-P(O)NR^aR^b$, $-C_{1-12}$ алкил, $-C_{2-12}$ алкенил, $-C_{2-12}$ алкинил, C_{3-20} циклоалкил, C_{3-20} циклоалкенил, C_{6-20} циклоалкинил, гетероциклил, арил или гетероарил.

5. Соединение по п.1, имеющее формулу Ib, где R^1 выбран из группы, включающей -H, C_{1-4} алкил, C_{2-4} алкенил, C_{2-4} алкинил, C_{1-4} алкоксиалкил, C_{3-7} циклоалкил, C_{3-7} алкил-циклоалкил, $-OR^a$, $-COOR^a$, $-CONR^aR^b$, $-COR^a$ и $-SO_2R^a$.

6. Соединение по п.1, имеющее формулу Ib, где R^2 выбран из водорода, алкила или C_{1-4} алкоксиалкила.

7. Соединение по п.1, имеющее формулу Ib, где R^3 выбран из группы, включающей водород, $-(CH_2)_p-CHO$, $-(CH_2)_p-OH$, $-(CH_2)_p-OR^a$, $-(CH_2)_p-COOR^a$, $-(CH_2)_p-CONR^aR^b$, $-(CH_2)_p-CSNR^aR^b$, $-(CH_2)_p-NR^aR^b$, $-(CH_2)_p-CONR^aNR^bR^c$, $-(CH_2)_p-(C=NR^a)NR^bR^c$ и -

$(CH_2)_p-NH_2$, где p равняется 0, 1, 2 или 3.

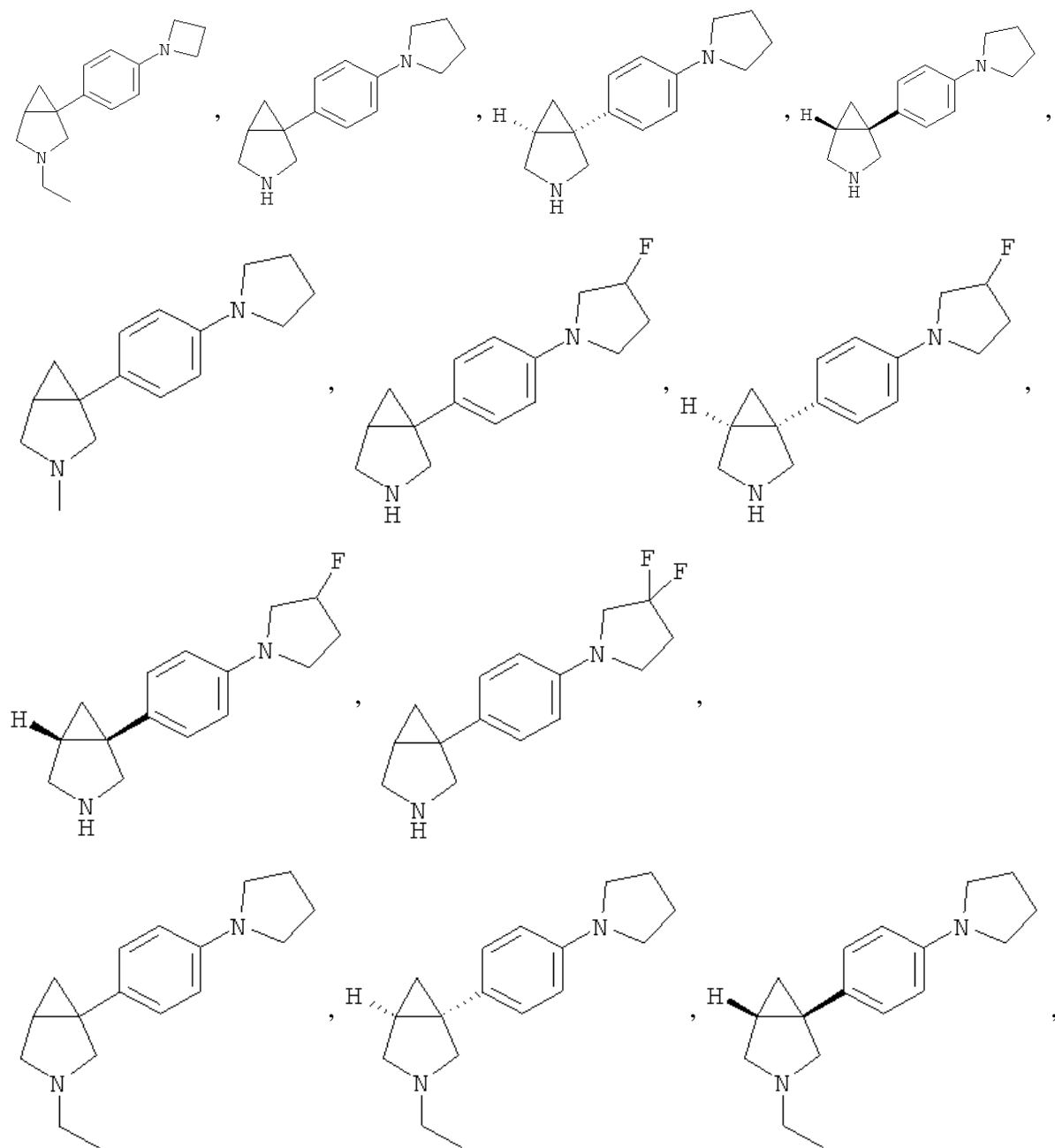
8. Соединение по п.1, имеющее формулу Ib, где R^4 выбран из группы, включающей водород, $-CHO$, $-OH$, OR^a , $COOR^a$, $-CONR^aR^b$, $-CSNR^aR^b$, $-NR^aR^b$, $-CONR^aNR^bR^c$, $-(C=NR^a)-NR^bR^c$ и $-NH_2$.

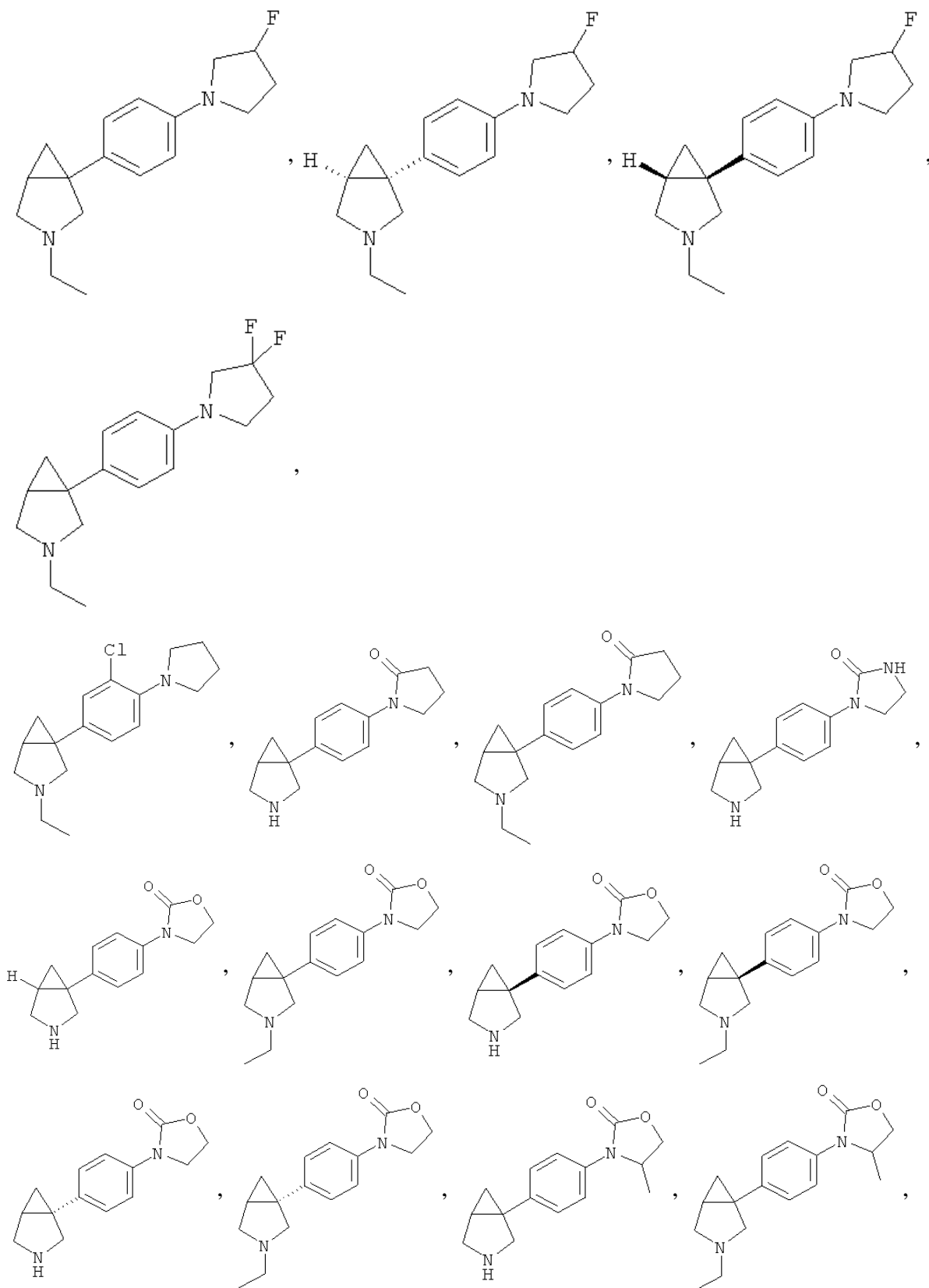
9. Соединение по п.1, имеющее формулу Ib, где R^5 выбран из $-H$, C_{1-4} алкила, C_{1-2} галогеналкила, $-NH_2$, $-NR^aR^b$, $-OH$, $-OR^a$ или галогена.

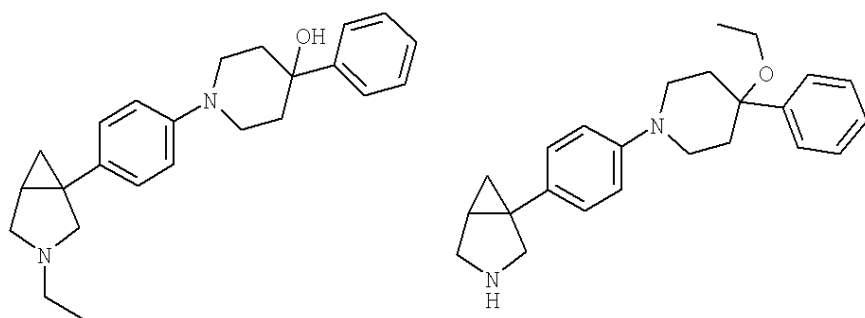
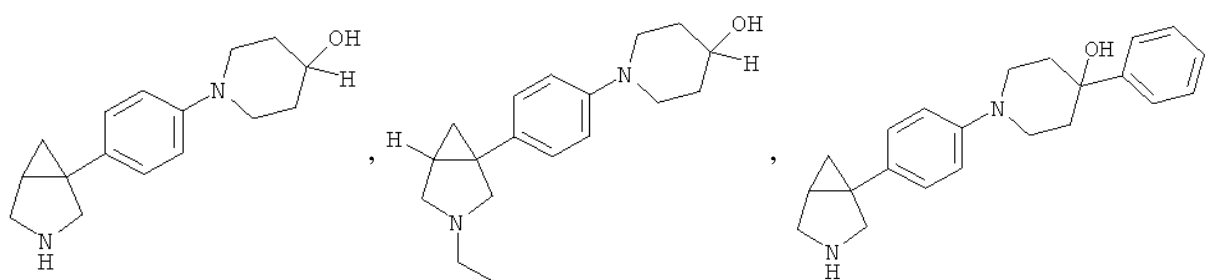
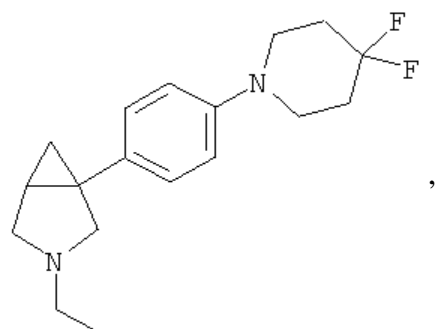
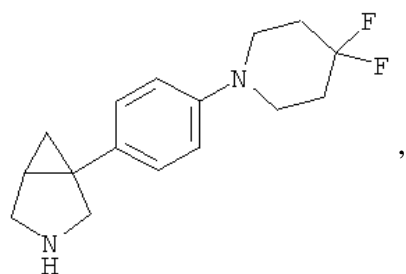
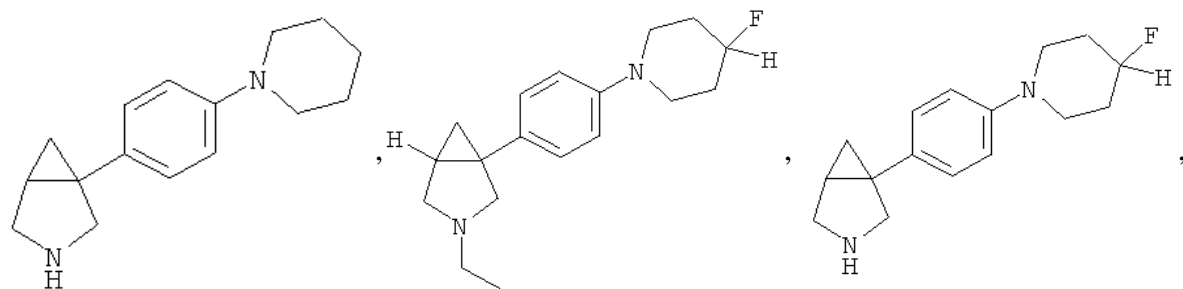
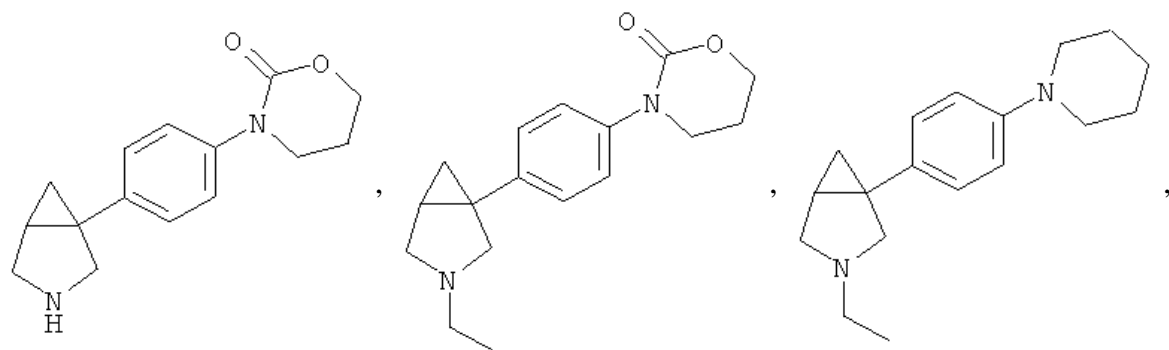
10. Соединение по п.1, имеющее формулу Ib, где R^6 выбран из группы, включающей $-H$, C_{1-4} алкил, $-OH$, оксо, галоген, $-OR^a$, $-NH_2$ и $-NR^aR^b$.

11. Соединение по п.1, имеющее формулу Ib, где Q выбран из группы, включающей $-CH_2-$, O , S , $-C(=NR^a)-$, $-N(R^a)-$, $-(CO)-$ и $-CR^a(OR^b)-$.

12. Соединение, которое выбрано из группы, включающей

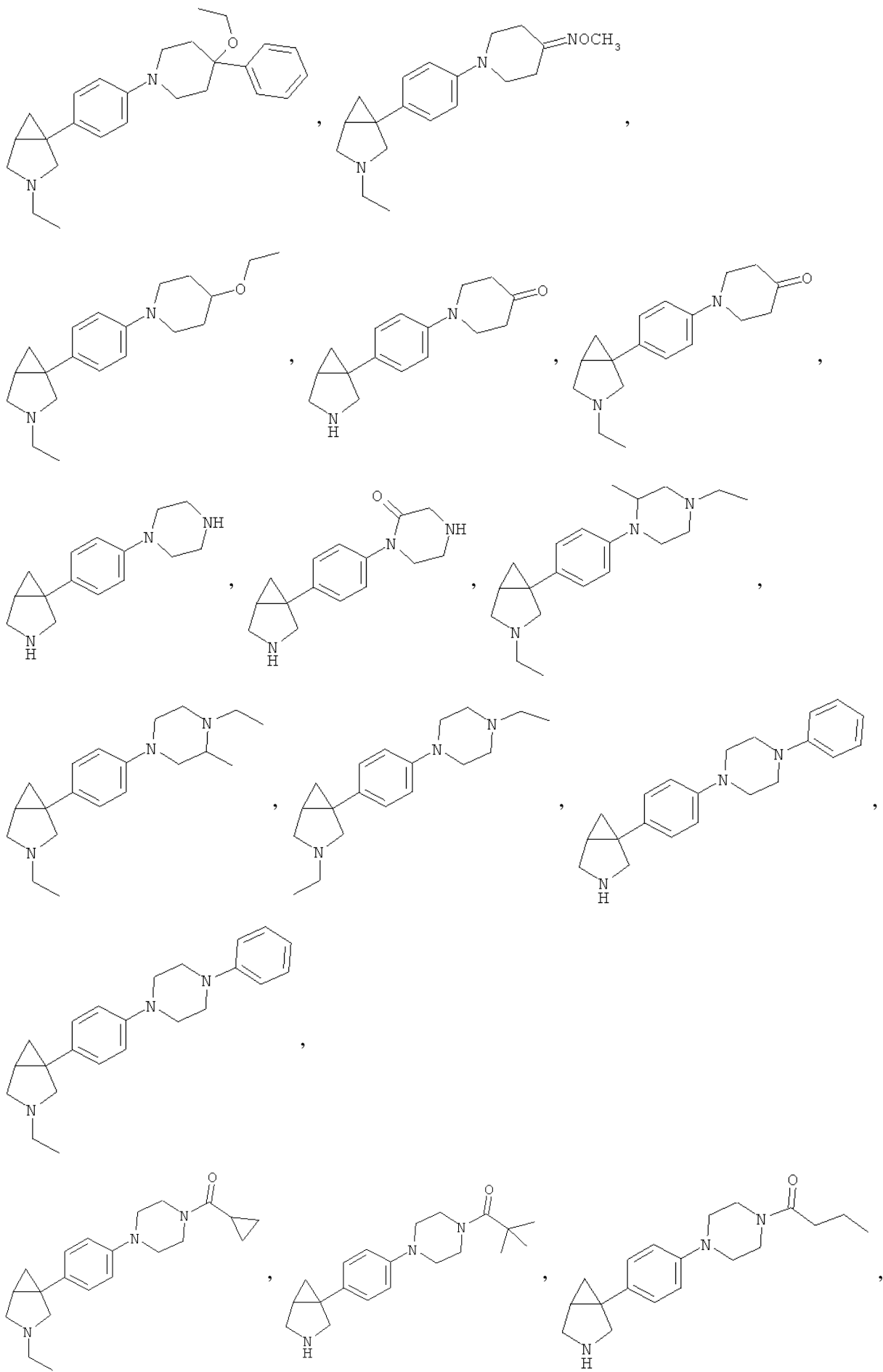


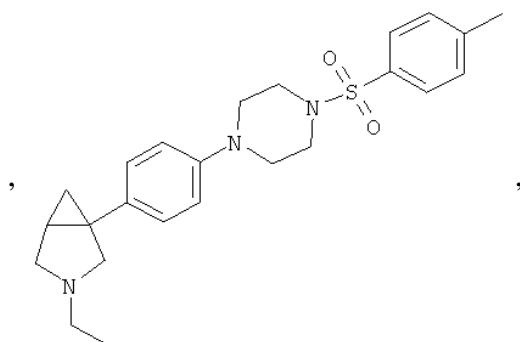
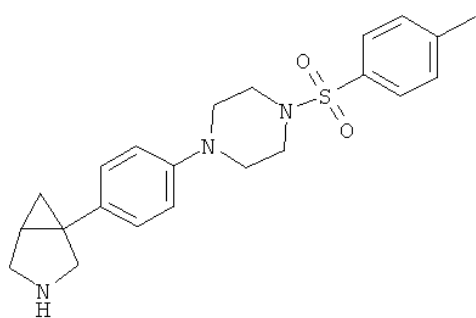
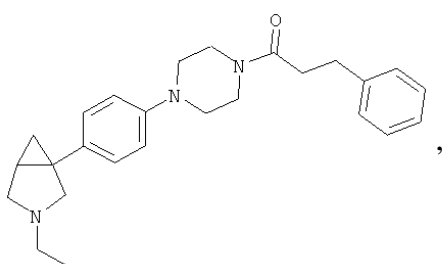
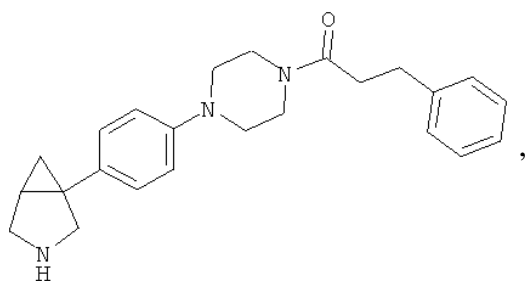
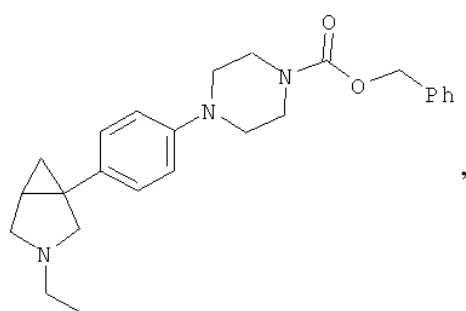
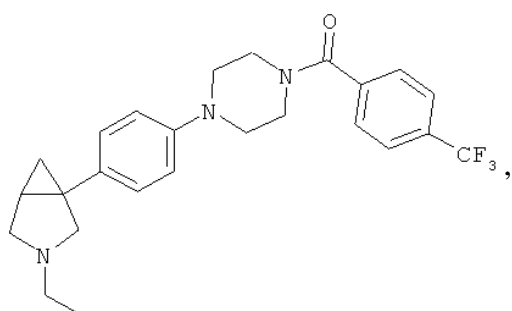
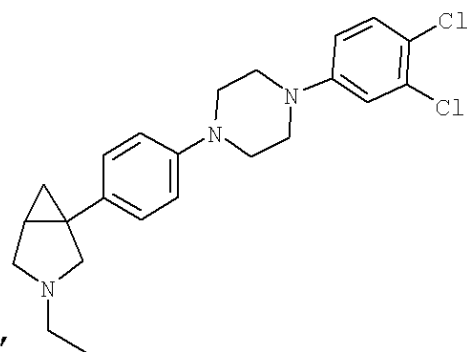
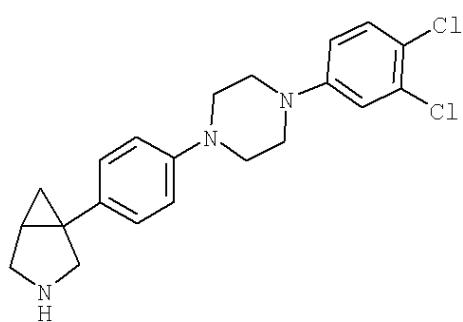
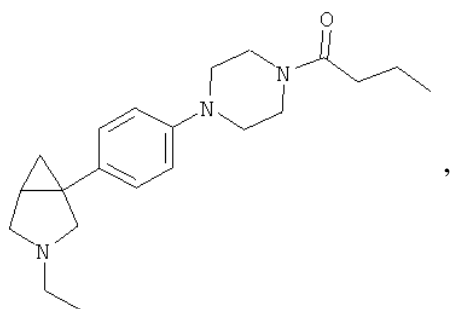




UR

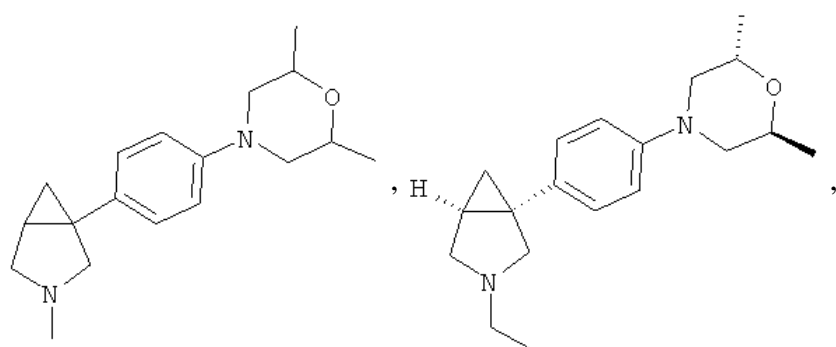
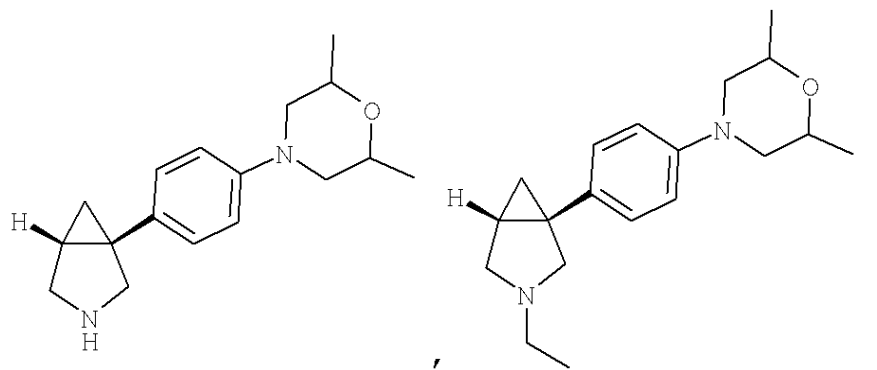
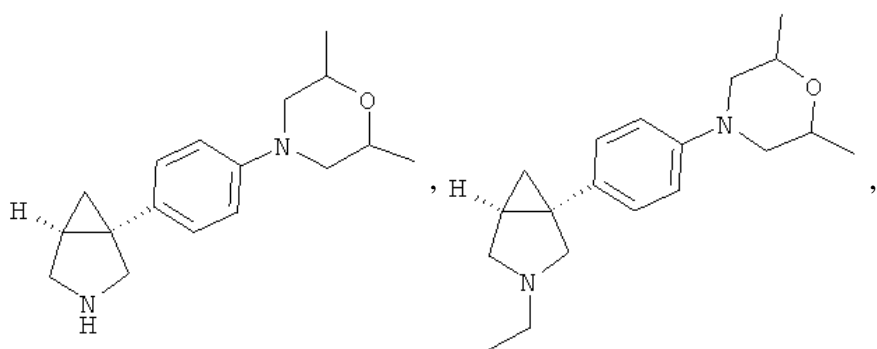
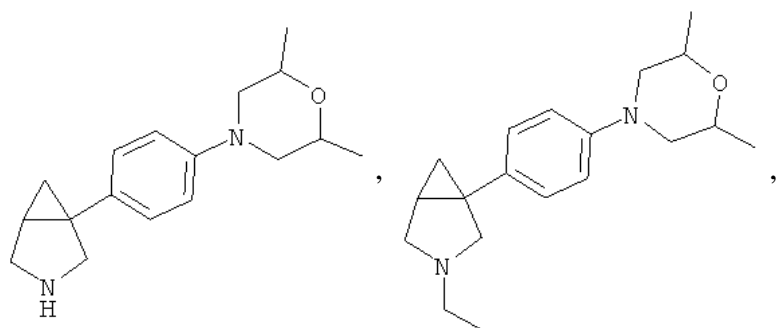
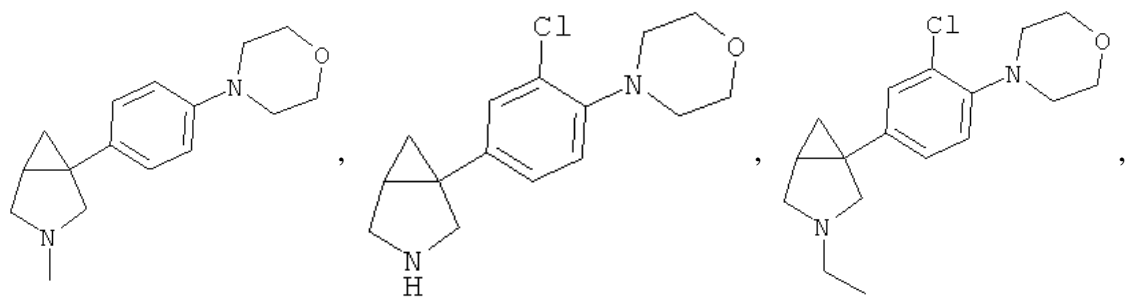
A

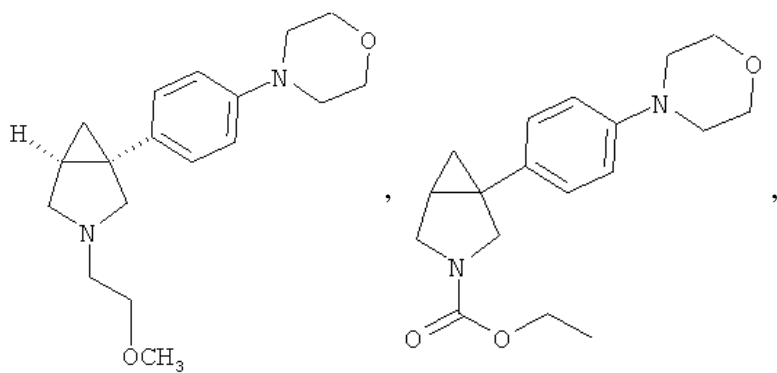
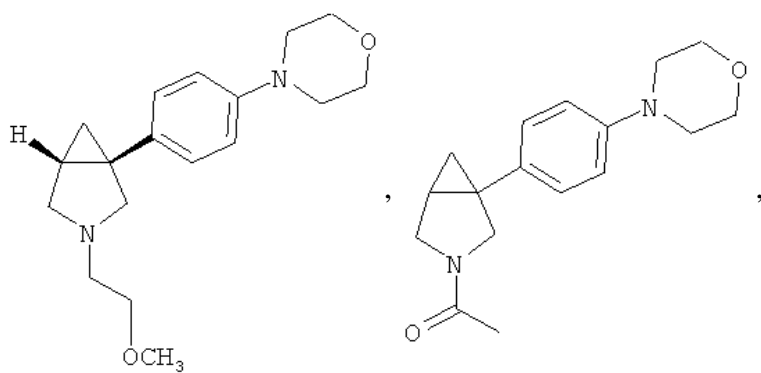
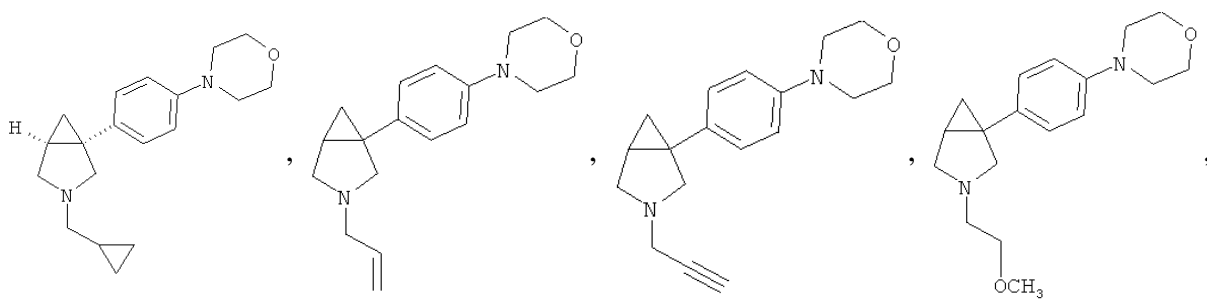
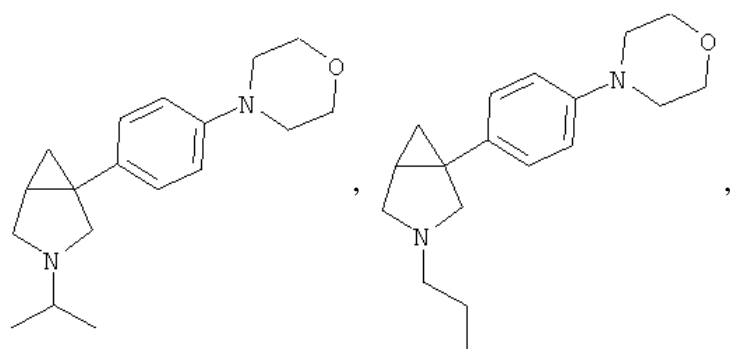
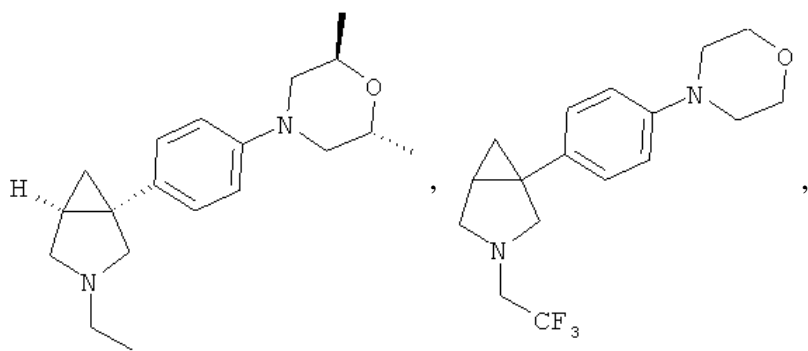


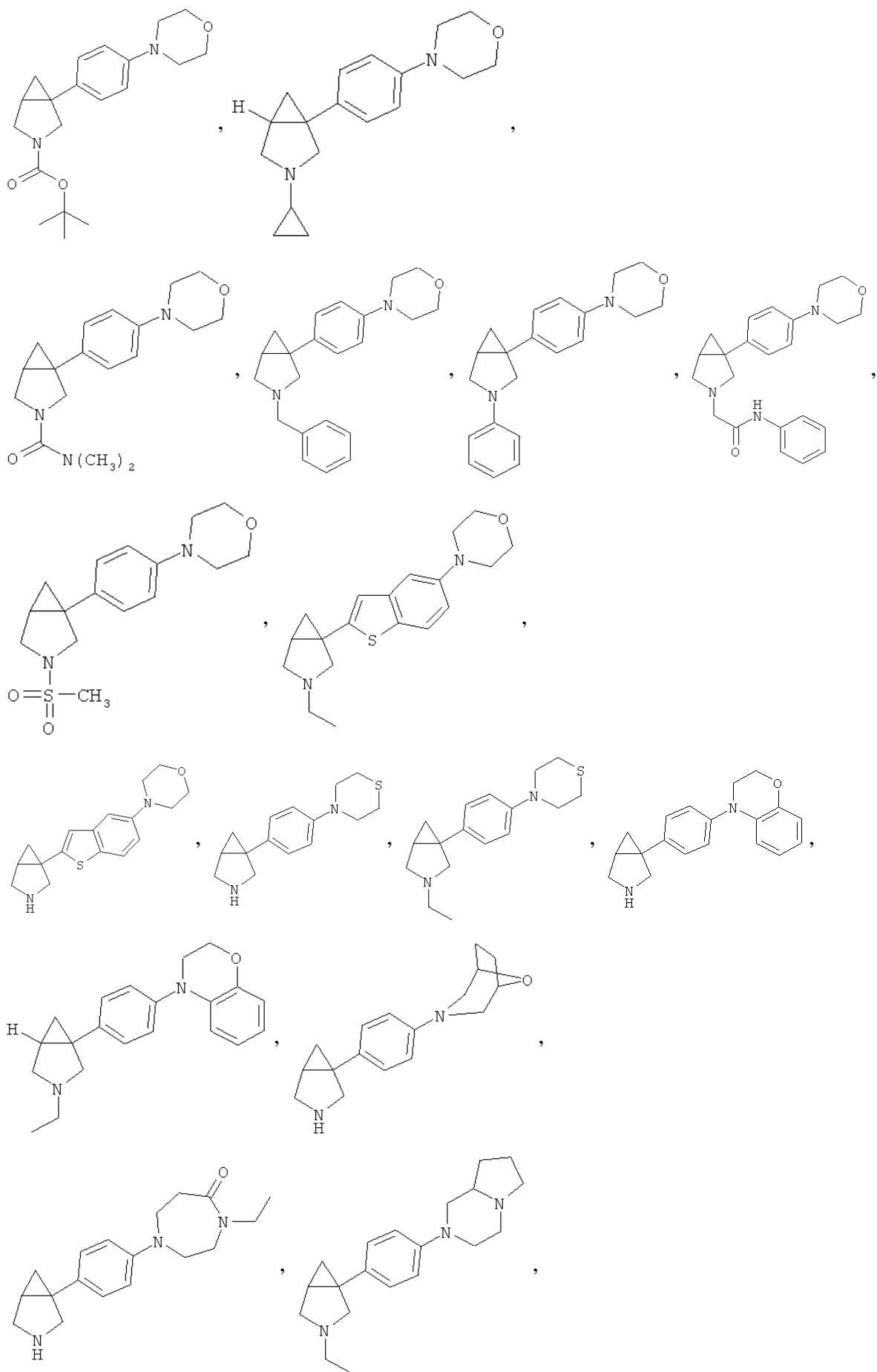


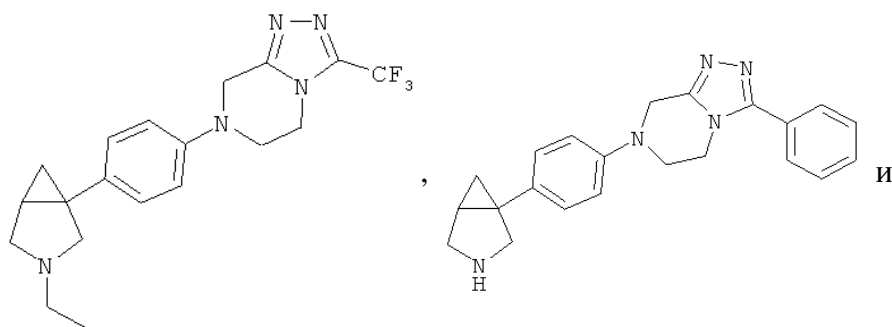
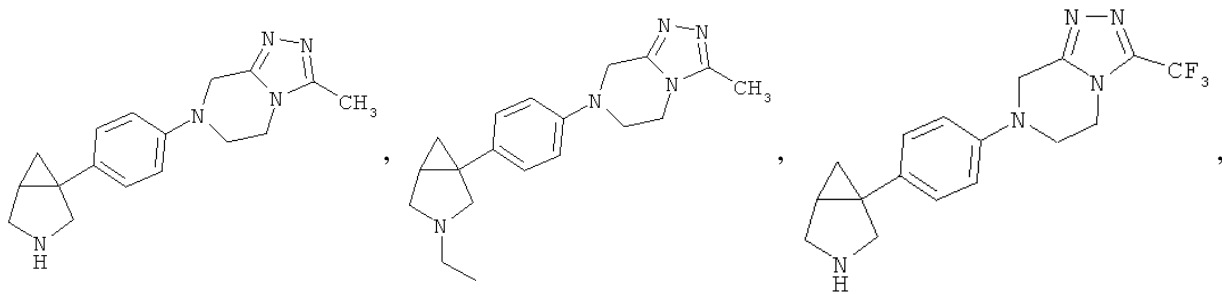
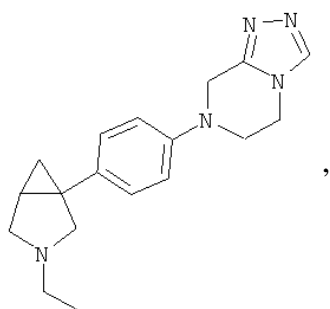
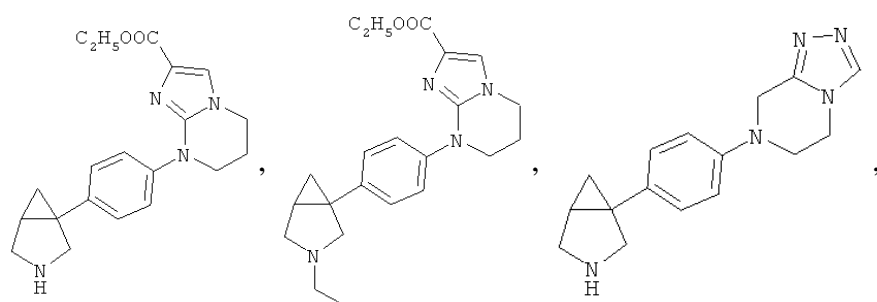
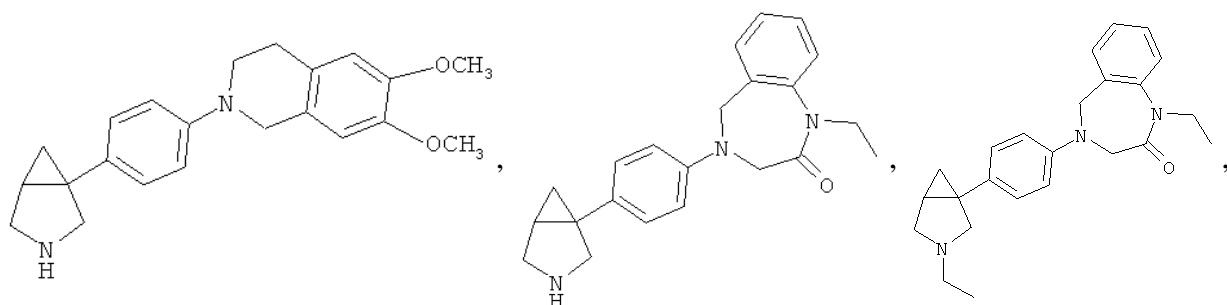
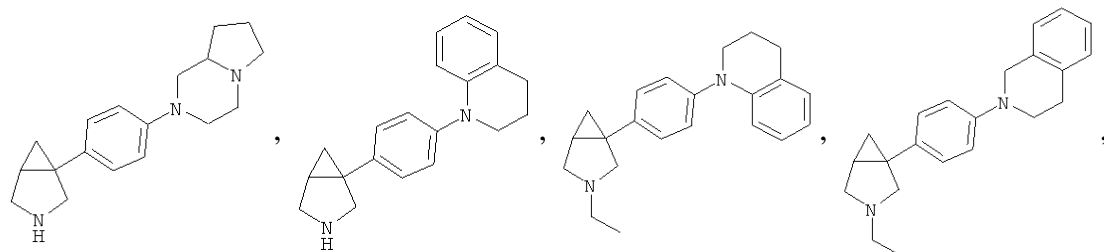
A

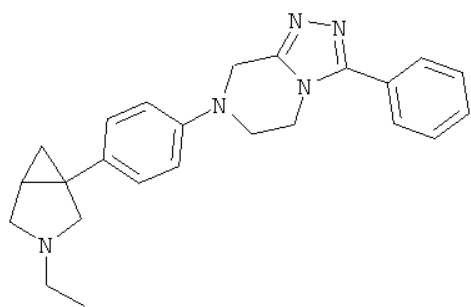






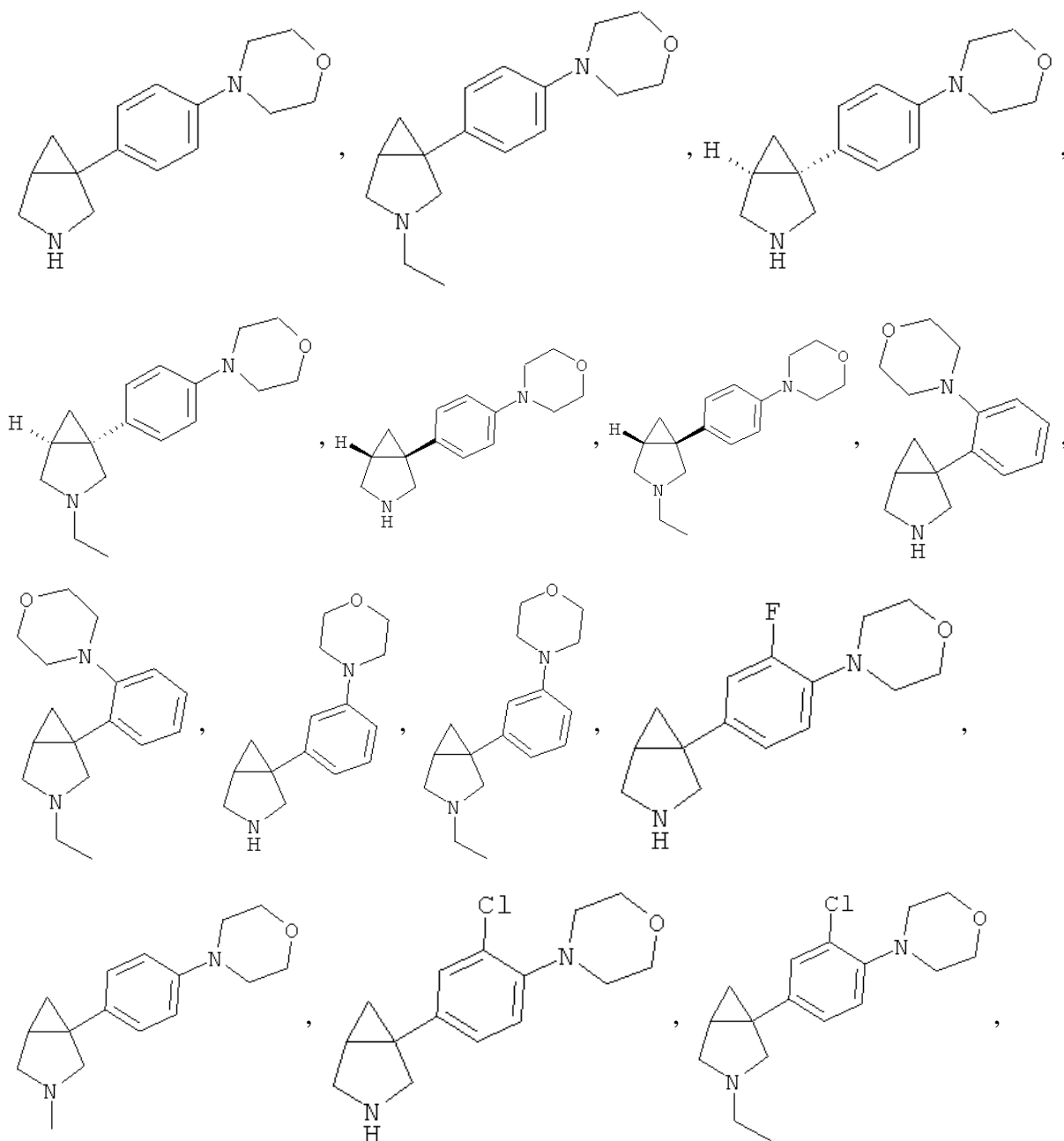






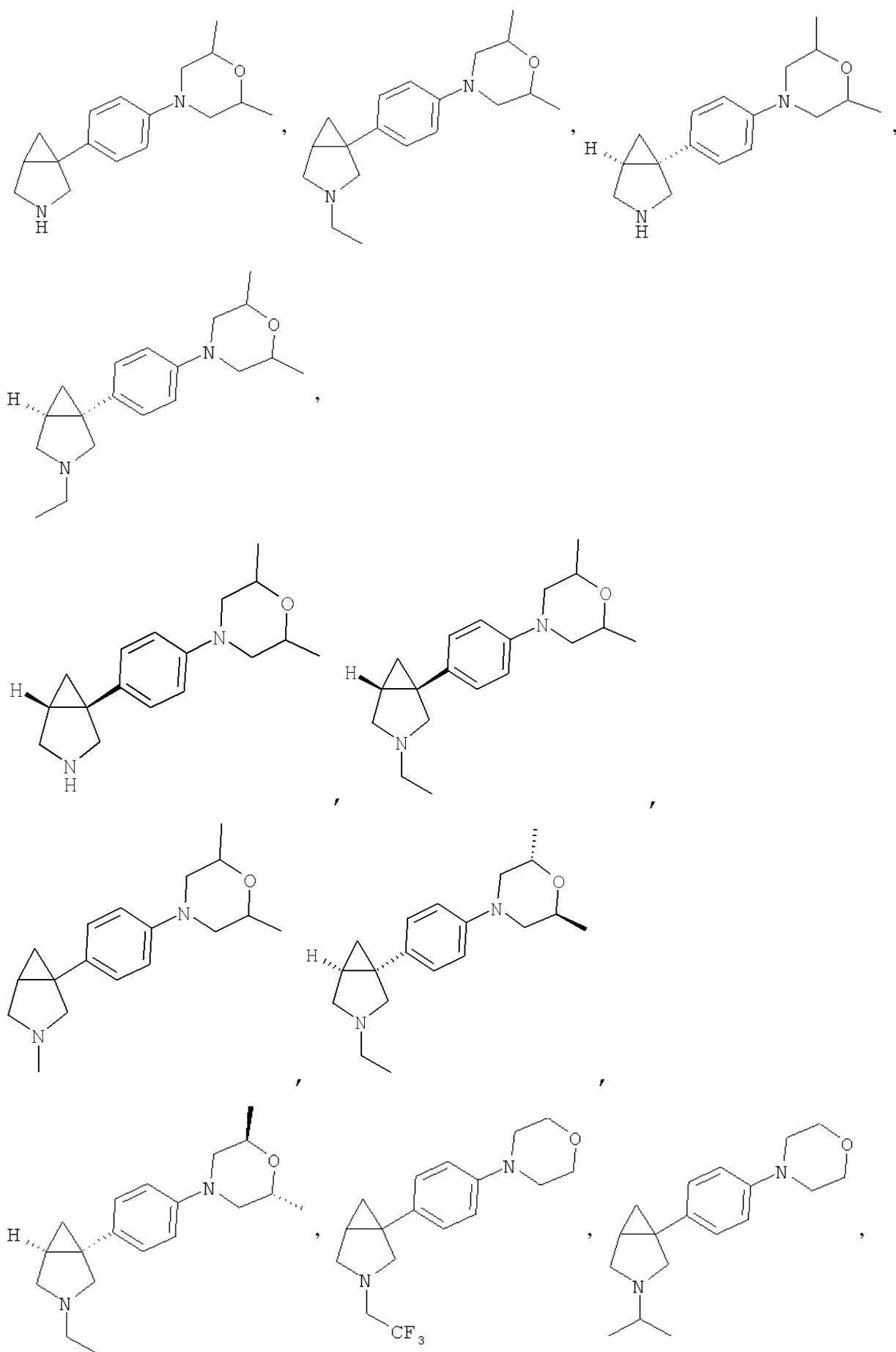
и его фармацевтически приемлемые соли или его сольваты.

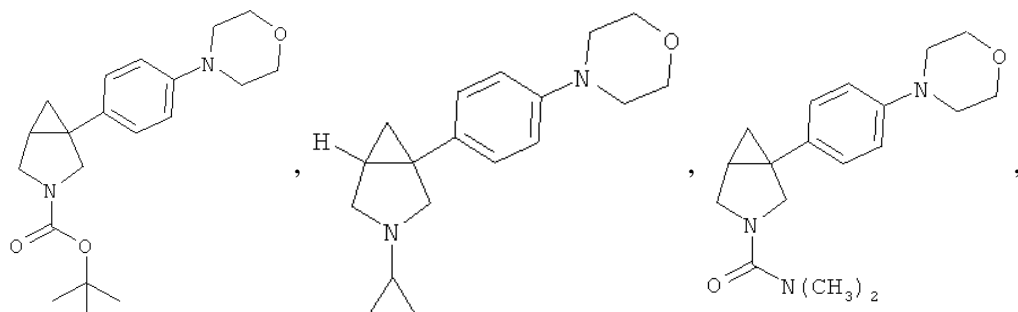
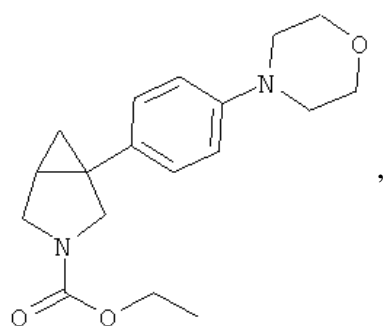
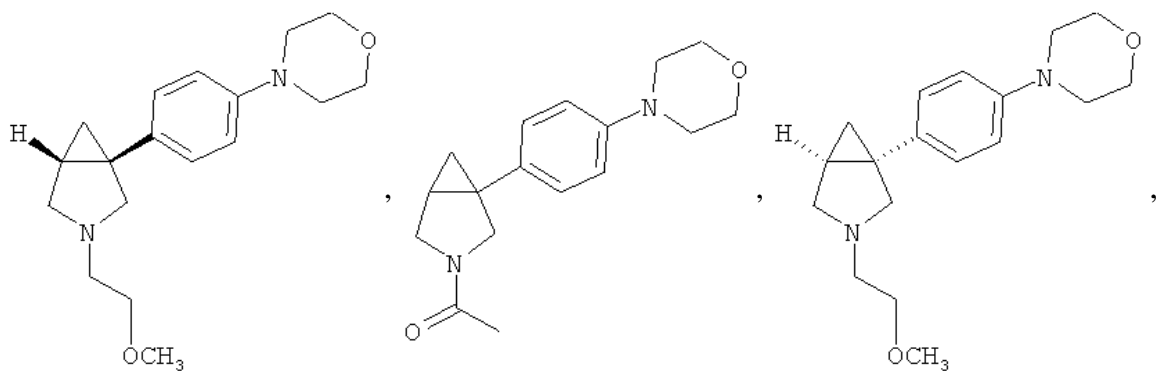
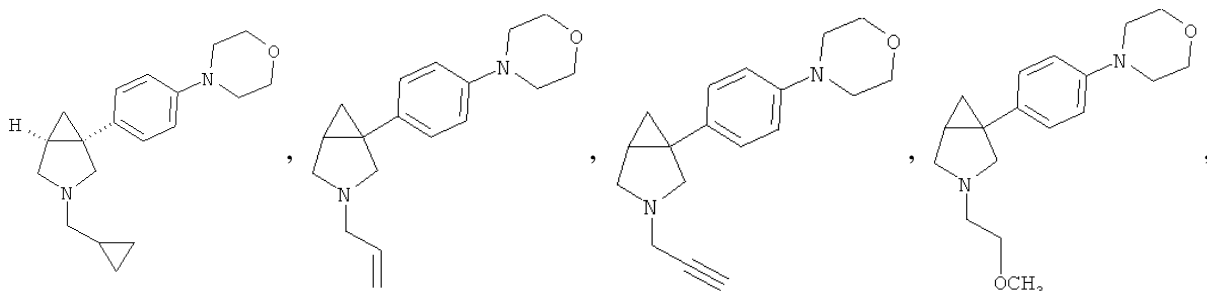
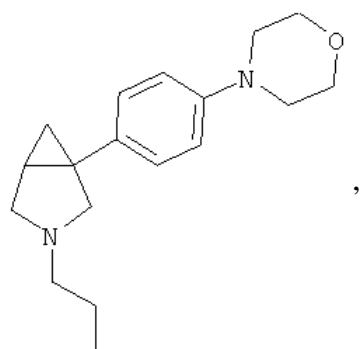
13. Соединение, которое выбрано из группы, включающей:

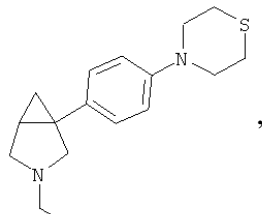
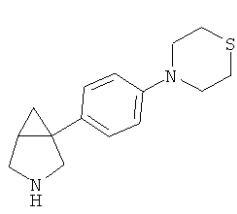
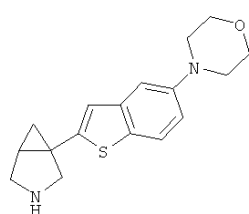
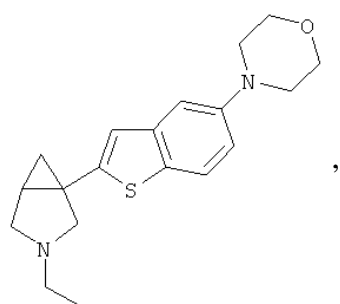
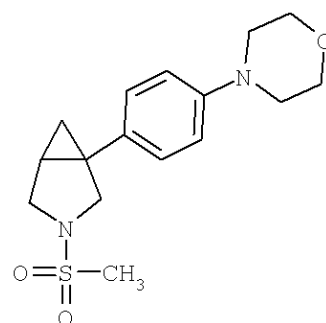
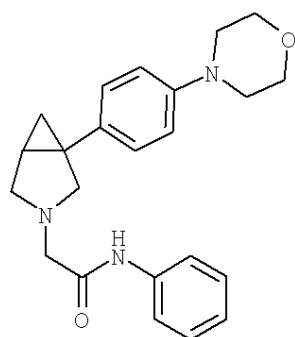
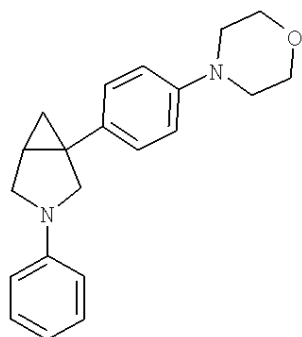
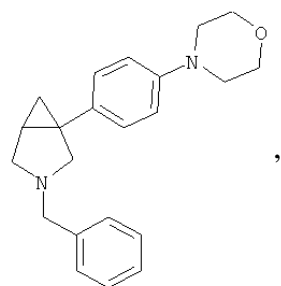


RU 2012102094 A

A 4602012102 RU

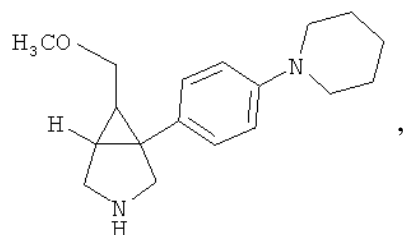
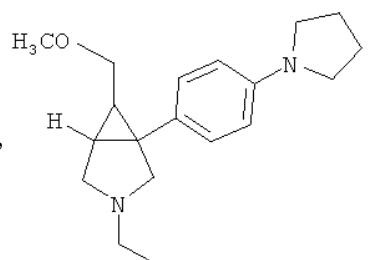
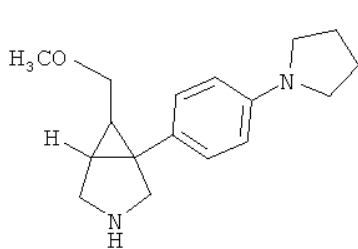
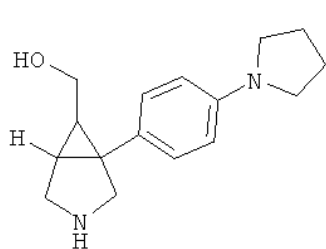


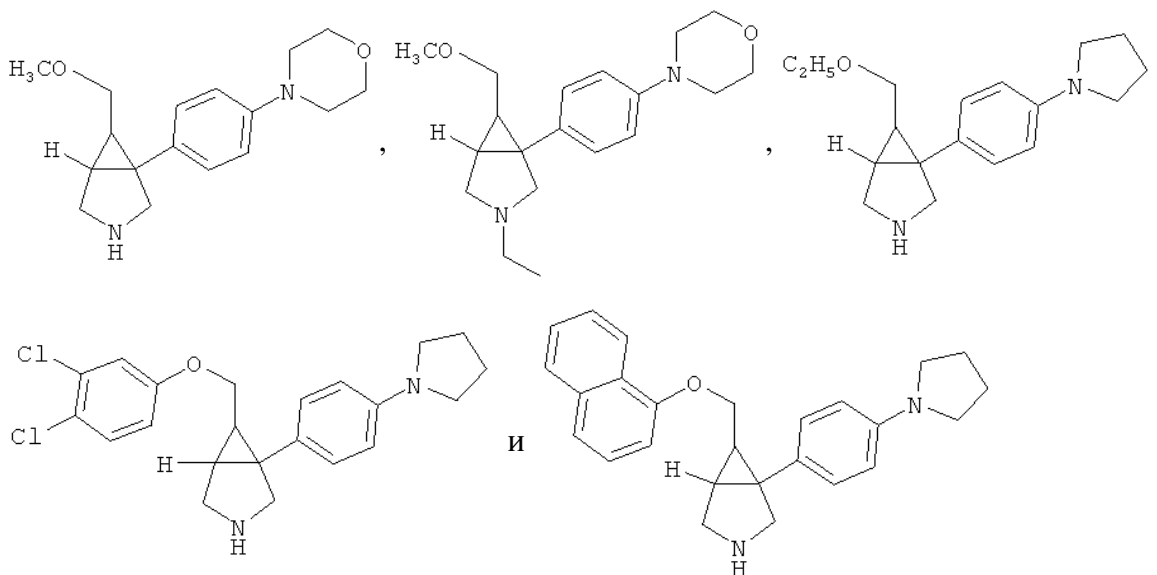




и его фармацевтически приемлемые соли или его сольваты.

14. Соединение, которое выбрано из группы, включающей





и его фармацевтически приемлемые соли или его сольваты.

15. Фармацевтическая композиция, включающая соединение по пп.1, 12-14, или его фармацевтически приемлемые производные, таутомерные формы, стереоизомеры, полиморфы, пролекарства, метаболиты, соли или их сольваты, факультативно в комбинации с одним или несколькими фармацевтически приемлемым (и) носителем (носителями).

16. Способ профилактики, улучшения и/или лечения одного или нескольких состояний/болезней/расстройств центральной и/или периферической нервной системы у субъекта, нуждающегося в этом, при котором вводят терапевтически эффективное количество соединения по пп.1, 12-14 или его фармацевтически приемлемых производных, таутомерных форм, стереоизомеров, полиморфов, пролекарств, метаболитов, солей или их сольватов.

17. Применение соединения по пп.1, 12-14 или его фармацевтически приемлемых производных, таутомерных форм, стереоизомеров, полиморфов, пролекарств, метаболитов, солей, сложных эфиров или их сольватов, для изготовления медикамента для профилактики, улучшения и/или лечения одного или нескольких состояний/болезней/расстройств центральной и/или периферической нервной системы у субъекта, нуждающегося в этом.

18. Применение соединения по пп.1, 12-14 или его фармацевтически приемлемых производных, таутомерных форм, стереоизомеров, полиморфов, пролекарств, метаболитов, солей или их сольватов в комбинации с другими терапевтическими средствами.

19. Применение по п.17, где медикамент вводится перорально, парентерально или местно.