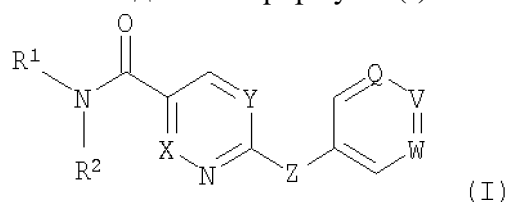




ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**(21), (22) Заявка: **2008129622/04**, 18.12.2006(30) Конвенционный приоритет:
20.12.2005 EP 05027934.8
11.09.2006 EP 06120424.4(43) Дата публикации заявки: **27.01.2010** Бюл. № 3(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную
фазу: **21.07.2008**(86) Заявка РСТ:
EP 2006/012181 (18.12.2006)(87) Публикация РСТ:
WO 2007/071358 (28.06.2007)Адрес для переписки:
**101000, Москва, М.Златоустинский пер., 10,
кв.15, "ЕВРОМАРКПАТ"**(71) Заявитель(и):
НОВАРТИС АГ (CH)(72) Автор(ы):
**ГЛАТТХАР Ральф (DE),
ОПЕН Давид (FR),
ШПАНКА Карстен (DE)**(54) **ПРОИЗВОДНЫЕ НИКОТИНОВОЙ КИСЛОТЫ В КАЧЕСТВЕ МОДУЛЯТОРОВ
МЕТАБОТРОПНЫХ ГЛУТАМАТНЫХ РЕЦЕПТОРОВ**(57) **Формула изобретения**

1. Соединение формулы (I)



в которой R^1 представляет собой необязательно замещенный алкил или необязательно замещенный бензил и

R^2 представляет собой водород (H), необязательно замещенный алкил или необязательно замещенный бензил;

или

R^1 и R^2 образуют вместе с атомом азота, к которому они присоединены, необязательно замещенный гетероцикл, имеющий менее, чем 14 атомов кольца;

R^3 представляет собой галоген, гидроксид (OH) группу, алкил, алкокси группу, группы amino, алкиламино или диалкиламино;

R^4 представляет собой гидроксид (OH) группу, галоген, amino группу, алкиламино

группу, диалкиламиноалкил или алкокси группу;

Q представляет собой группы CH, CR⁴ или N;

V представляет собой группы CH, CR⁴ или N;

W представляет собой группы CH, CR⁴ или N;

X представляет собой группы CH или N;

Y представляет собой группы CH, CR³ или N;

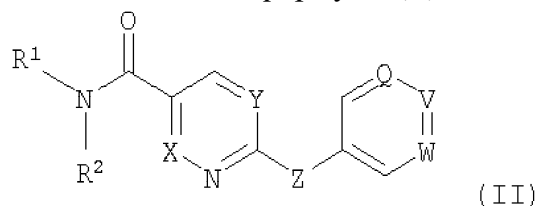
Z представляет собой группы CR^{6a}R^{6b}, NR⁵ или O;

R⁵ представляет собой водород или гидроксид (OH);

R^{6a} и R^{6b} каждый независимо выбран из водорода, галогена, групп гидроксид (OH), amino, алкила, алкокси группы или галоалкила; и

при условии, что одновременно группы Q, V, W не являются N, в виде свободного основания или в виде кислотно-аддитивной соли.

2. Соединение формулы (II)



в которой Q представляет собой группы CH, CR⁴ или N;

V представляет собой группы CH, CR⁴, или N;

W представляет собой группы CH, CR⁴ или N;

X представляет собой группы CH или N;

Y представляет собой группы CH, CR³ или N;

Z представляет собой группы CR^{6a}R^{6b}, NR⁵ или O;

R¹ представляет собой необязательно замещенный алкил или необязательно замещенный бензил и

R² представляет собой водород (H), необязательно замещенный алкил или необязательно замещенный бензил; или

R¹ и R² образуют вместе с атомом азота, к которому они присоединены, необязательно замещенный гетероцикл, имеющий менее, чем 14 атомов кольца;

R³ представляет собой галоген, гидроксид (OH) группу, алкил, группы алкокси, amino, алкиламино, диалкиламино;

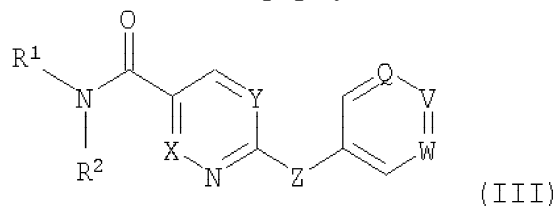
R⁴ представляет собой гидроксид (OH) группу, галоген, группы amino, алкиламино, диалкиламиноалкил, алкокси;

R⁵ представляет собой водород, гидроксид (OH);

R^{6a} и R^{6b} каждый независимо выбраны из водорода, галогена, гидроксид (OH) группы, amino группы, алкила, алкокси группы, галоалкила; и

при условии, что одновременно группы Q, V, W не являются N, и при условии, что по крайней мере одна из групп Q, V, W представляет собой N, в виде свободного основания или в виде кислотно-аддитивной соли.

3. Соединение формулы (III)



в которой Q представляет собой группы CH, CR⁴ или N;

V представляет собой группы CH, CR⁴ или N;

W представляет собой группы CH, CR⁴ или N;

X представляет собой группы CH или N;

Y представляет собой группу CR³;

Z представляет собой группы CR^{6a}R^{6b}, NR или O;

R¹ представляет собой необязательно замещенный алкил или необязательно замещенный бензил и

R² представляет собой водород (H), необязательно замещенный алкил или необязательно замещенный бензил; или

R¹ и R² образуют вместе с атомом азота, к которому они присоединены, необязательно замещенный гетероцикл, имеющий менее, чем 14 атомов кольца;

R³ представляет собой галоген, гидроксид (OH) группу, алкил, группы алкокси, amino, алкиламино или диалкиламино;

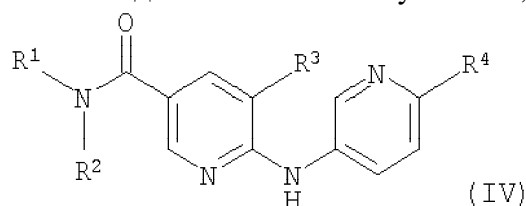
R⁴ представляет собой гидроксид (OH) группу, галоген, группы amino, алкиламино, диалкиламиноалкил или алкокси группу;

R⁵ представляет собой водород или гидроксид (OH);

R^{6a} и R^{6b} каждый независимо выбраны из водорода, галогена, гидроксид (OH) группы, amino группы, алкила, алкокси группы или галоалкила; и

при условии, что одновременно группы Q, V, W не являются N и при условии, что по крайней мере, одна из групп Q, V, W представляет собой N, в виде свободного основания или в виде кислотно-аддитивной соли.

4. Соединение по любому из пп.1, 2 или 3, имеющее формулу (IV)



R¹ представляет собой необязательно замещенный алкил или необязательно замещенный бензил и

R² представляет собой водород (H), необязательно замещенный алкил или необязательно замещенный бензил, или

R¹ и R² образуют вместе с атомом азота, к которому они присоединены, необязательно замещенный гетероцикл, имеющий менее, чем 14 атомов кольца;

R³ представляет собой галоген, алкил, группы алкокси, amino, алкиламино или диалкиламино; и

R⁴ представляет собой гидроксид (OH) группу, галоген, алкил или алкокси.

5. Соединение по п.1, которое выбрано из группы, включающей:

гидрохлорид 6-(4-хлорфениламино)-N,N-диэтилникотинамида

гидрохлорид N,N-диэтил-6-п-толиламиноникотинамида

гидрохлорид N,N-диэтил-6-(4-метоксифениламино)никотинамида

гидрохлорид 6-(4-хлорфениламино)-N,N-бис(2-метоксиэтил)никотинамида

[6-(4-хлор-3-фторфениламино)пиридин-3-ил]пиперидин-1-илметанон

[6-(4-бромфениламино)пиридин-3-ил]пиперидин-1-илметанон

4-[5-(пиперидин-1-карбонил)пиридин-2-иламино]бензонитрил

пиперидин-1-ил-[6-(4-трифторметоксифениламино)пиридин-3-ил]метанон

гидрохлорид

[6-(4-хлорфениламино)пиридин-3-ил]-(2-метилпиперидин-1-ил)метанона

- (2-метилпиперидин-1-ил)-(6-п-толиламинопиридин-3-ил)метанон
гидрохлорид
- [6-(4-метоксифениламино)пиридин-3-ил]-(2-метилпиперидин-1-ил)метанона
рац-[6-(4-хлорфениламино)пиридин-3-ил]-(3-метилпиперидин-1-ил)метанон
[6-(4-хлорфениламино)пиридин-3-ил]-(S-3-метилпиперидин-1-ил)метанон
[6-(4-хлорфениламино)пиридин-3-ил]-(R-3-метилпиперидин-1-ил)метанон
(3-метилпиперидин-1-ил)-(6-п-толиламинопиридин-3-ил)метанон
гидрохлорид
- [6-(4-метоксифениламино)пиридин-3-ил]-(3-метилпиперидин-1-ил)метанона
(3-метилпиперидин-1-ил)-(6-фениламинопиридин-3-ил)метанон
гидрохлорид
- [6-(3-хлорфениламино)пиридин-3-ил]-(3-метилпиперидин-1-ил)метанона
гидрохлорид [6-(4-хлорфениламино)пиридин-3-ил]морфолин-4-илметанона
гидрохлорид [6-(4-метоксифениламино)пиридин-3-ил]морфолин-4-илметанона
гидрохлорид
- цис-[6-(4-хлорфениламино)пиридин-3-ил]-(2,6-диметилморфолин-4-ил)метанона
гидрохлорид
- цис-2,6-диметилморфолин-4-ил)-(6-п-толиламинопиридин-3-ил)метанона
гидрохлорид
- (цис-2,6-диметилморфолин-4-ил)-[6-(4-метоксифениламино)пиридин-3-ил]метанона
[6-(5-хлорпиридин-2-иламино)пиридин-3-ил]пиперидин-1-илметанон
азепан-1-ил-[6-(пиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]метанон
[6-(3,4-дифторфениламино)пиридин-3-ил]пиперидин-1-илметанон
рац-(2-азабицикло[2.2.1]гепт-2-ил)-[5-хлор-6-
(4-хлорфениламино)пиридин-3-ил]метанон
[5-хлор-6-(4-хлорфениламино)пиридин-3-ил]тиоморфолин-4-илметанон
рац-[5-хлор-6-(6-метоксипиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-
(3-метилпиперидин-1-ил)метанон
азепан-1-ил-[5-хлор-6-(6-метоксипиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]метанон
[5-хлор-6-(6-метоксипиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]пиперидин-1-илметанон
[5-хлор-6-(6-этоксипиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]пиперидин-1-илметанон
рац-[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-
(3-метилпиперидин-1-ил)метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-(S-
3-метилпиперидин-1-ил)метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-(R-
3-метилпиперидин-1-ил)метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]пиперидин-1-илметанон
азепан-1-ил-[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]метанон
рац-(2-азабицикло[2.2.1]гепт-2-ил)-[5-хлор-6-
(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]тиазолидин-3-илметанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]тиоморфолин-4-илметанон
[5-хлор-6-(2-метилпиридин-5-иламино)пиридин-3-ил]-
(3-метилпиперидин-1-ил)метанон
[5-хлор-6-(2-метилпиридин-5-иламино)пиридин-3-ил]пиперидин-1-илметанон
азепан-1-ил-[5-хлор-6-(2-метилпиридин-5-иламино)пиридин-3-ил]метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-
(3-этилпиперидин-1-ил)метанон
[5-хлор-6-(6-метоксипиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-

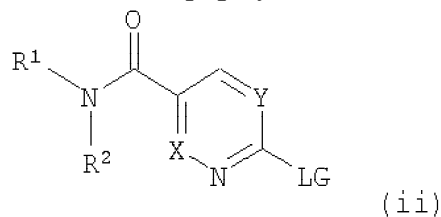
- (3-этилпиперидин-1-ил)метанон
[5-хлор-6-(4-хлорфениламино)пиридин-3-ил]-(3-этилпиперидин-1-ил)метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-
(3-пропилпиперидин-1-ил)метанон
[5-хлор-6-(6-трифторметилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-((R)-
2-этилпиперидин-1-ил)метанон
[5-хлор-6-(6-метоксипиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-((R)-
2-этилпиперидин-1-ил)метанон
рац-[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-илокси)пиридин-3-ил]-
(3-метилпиперидин-1-ил)метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-илокси)пиридин-3-ил]пиперидин-1-илметанон
азепан-1-ил-[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-илокси)пиридин-3-ил]метанон
[6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]пиперидин-1-илметанон азепан-1-ил-
[6-(4-хлорфениламино)пиридин-3-ил]метанон
[6-(4-хлорфениламино)пиридин-3-ил]-(3,3-дифторпиперидин-1-ил)метанон
[6-(4-хлорфениламино)пиридин-3-ил]-(4-метилпиперидин-1-ил)метанон
[6-(4-хлорфениламино)пиридин-3-ил]-(3,5-диметилпиперидин-1-ил)метанон
рац-[6-(4-хлорфениламино)пиридин-3-ил]-(3-гидроксиметилпиперидин-1-ил)метанон
рац-[6-(4-хлорфениламино)пиридин-3-ил]-(3-метоксипиперидин-1-ил)метанон
[6-(4-хлорфениламино)пиридин-3-ил]-(октагидрохиолин-1-ил)метанон
(диастереомерная смесь, цис/транс)
(3-азабицикло[3.2.2]нон-3-ил)-[6-(4-хлорфениламино)пиридин-3-ил]метанон
(2-азатрицикло[3.3.1,1*3,7*]дец-2-ил)-[6-(4-хлорфениламино)пиридин-3-ил]метанон
[6-(4-хлорфениламино)пиридин-3-ил]-
(3-гидрокси-8-азабицикло[3.2.1]окт-8-ил)метанон
рац-(2-азабицикло[2.2.1]гепт-2-ил)-[6-(4-хлорфениламино)пиридин-3-ил]метанон
рац-(3-метилпиперидин-1-ил)-[6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]метанон
(S-3-метилпиперидин-1-ил)-[6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]метанон
(R-3-метилпиперидин-1-ил)-[6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]метанон
[6-(4-хлорфениламино)пиридин-3-ил]-(rel-(3aR,4S,7aR))-
4-гидрокси-4-м-толилэтинилоктагидроиндол-1-ил)метанон
азепан-1-ил-[6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]метанон
азокан-1-ил-[6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-
(2-этилпиперидин-1-ил)метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-((R)-
2-этилпиперидин-1-ил)метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-((S)-
2-этилпиперидин-1-ил)метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-
(2,3-диметилпиперидин-1-ил)метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-((2S,3S)-
2,3-диметилпиперидин-1-ил)метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-((2R,3R)-
2,3-диметилпиперидин-1-ил)метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-((S)-
2-метилпиперидин-1-ил)метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-((R)-
2-метилпиперидин-1-ил)метанон
[5-хлор-6-

(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-(октагидро[1]пириндин-1-ил)метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-
(4aS,7aS)-октагидро[1]пириндин-1-илметанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-
(4aR,7aR)-октагидро[1]пириндин-1-илметанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-
(2-изопропилпиперидин-1-ил)метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-((R)-
2-изопропилпиперидин-1-ил)метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-((S)-
2-изопропилпиперидин-1-ил)метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-((R)-
3-этилпиперидин-1-ил)метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-((S)-
3-этилпиперидин-1-ил)метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-
(3-циклопропилпиперидин-1-ил)метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-
(2-пропилпиперидин-1-ил)метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-((S)-
2-пропилпиперидин-1-ил)метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-((R)-
2-пропилпиперидин-1-ил)метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-
(2,3-диэтилпиперидин-1-ил)метанон
(2-бутилпиперидин-1-ил)-[5-хлор-6-
(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-[2-
(1-этилпропил)пиперидин-1-ил]метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-
(2-этил-3-метилпиперидин-1-ил)метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-
(2-фенилпиперидин-1-ил)метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-(3,4,5,6-тетрагидро-2Н-
[2,2']бипиридинил-1-ил)метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-(3,4,5,6-тетрагидро-2Н-
[2,3']бипиридинил-1-ил)метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-
[2-(тетрагидрофуран-2-ил)пиперидин-1-ил]метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-[2-
(5-метилфуран-2-ил)пиперидин-1-ил]метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-
(2-оксазол-2-илпиперидин-1-ил)метанон
[2-(2-хлорэтил)пиперидин-1-ил]-[5-хлор-6-
(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-
(2,6-диметилпиперидин-1-ил)метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-
(2,2,6,6-тетраметилпиперидин-1-ил)метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-

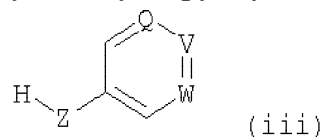
- (2-метил-6-пропилпиперидин-1-ил)метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-((2R,6R)-
2-этил-6-пропилпиперидин-1-ил)метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-
(5-метил-2-пропилпиперидин-1-ил)метанон
[5-хлор-6-(4-хлорфениламино)пиридин-3-ил]-(октагидро[1]пириндин-1-ил)метанон
[5-хлор-6-(4-хлорфениламино)пиридин-3-ил]-((R)-2-этилпиперидин-1-ил)метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-
(2-винилпиперидин-1-ил)метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-[((Z)-
2-пропенил)пиперидин-1-ил]метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-
[3-этилиденпиперидин-1-ил]метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-
[3-пропилиденпиперидин-1-ил]метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-
(2-этоксиметилпиперидин-1-ил)метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-(2-
thoxуметил-пиперидин-1-ил)метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-[2-
(2-гидроксиэтил)пиперидин-1-ил] метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-
(5-фтор-2-пропилпиперидин-1-ил)метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-[2-
(1,2-дифторпропил)пиперидин-1-ил]метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-[2-
(2-фторпропил)пиперидин-1-ил]метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-(2-этил-
[1,3]оксазепан-3-ил)метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-(2-пропил-
[1,3]оксазепан-3-ил)метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-[2-(1-этилпропил)-
[1,3]оксазепан-3-ил]метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-(2-пропил-
[1,3]оксазинан-3-ил)метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-[2-(1-этилпропил)-
[1,3]оксазинан-3-ил]метанон
(2-бутил-[1,3]оксазинан-3-ил)-[5-хлор-6-
(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]метанон
[5-хлор-6-(6-метидпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-[2-
(2-метоксиэтил)пиперидин-1-ил]метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-
(2-фенилпирролидин-1-ил)метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-
(2-пиридин-2-илпирролидин-1-ил)метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-((R)-
2-этоксипирролидин-1-ил)метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-[2-
(5-метилтиофен-2-ил)пирролидин-1-ил]метанон
[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-(2-пропилазепан-1-ил)метанон

[5-хлор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-
 (3-пропилморфолин-4-ил)метанон
 рац-[5-хлор-6-(4-хлорфениламино)пиридин-3-ил]-(3-метилпиперидин-1-ил)метанон
 [5-хлор-6-(4-хлорфениламино)пиридин-3-ил]-(S-3-метилпиперидин-1-ил)метанон
 [5-хлор-6-(4-хлорфениламино)пиридин-3-ил]-(S-3-метилпиперидин-1-ил)метанон
 азепан-1-ил-[2-(4-хлорфениламино)пиримидин-5-ил]метанон
 [2-(4-хлорфениламино)пиримидин-5-ил]пиперидин-1-илметанон
 рац-[2-(4-хлорфениламино)пиримидин-5-ил]-(3-метилпиперидин-1-ил)метанон
 азепан-1-ил-[6-(4-хлорфениламино)-5-метоксипиридин-3-ил]метанон
 азепан-1-ил-[5-метокси-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]метанон
 [6-(4-хлорфениламино)-5-метоксипиридин-3-ил]пиперидин-1-илметанон
 [5-метокси-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]пиперидин-1-илметанон
 азепан-1-ил-[6-(4-хлорфениламино)-5-этоксипиридин-3-ил]метанон
 азепан-1-ил-[5-этокси-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]метанон
 [5-этокси-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]пиперидин-1-илметанон
 [5-хлор-6-(6-хлорпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]-
 (3-метилпиперидин-1-ил)метанон

[6-(4-хлорфениламино)пиридазин-3-ил]пиперидин-1-илметанон
 рац-[6-(4-хлорфениламино)пиридазин-3-ил]-(3-метилпиперидин-1-ил)метанон
 [6-(4-хлорфениламино)пиридазин-3-ил]-(3,3-диметилпиперидин-1-ил)метанон
 [6-(4-хлорфениламино)пиридазин-3-ил]-(3,4-дигидро-1H-изохинолин-2-ил)метанон
 [6-(4-хлорфениламино)пиридазин-3-ил]-(4-метилпиперидин-1-ил)метанон
 [5-метил-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]пиперидин-1-илметанон
 [5-фтор-6-(6-метилпиридин-3-иламино)пиридин-3-ил]пиперидин-1-илметанон
 6. Способ получения соединения по любому из п.п.1, 2 или 3, или его соли,
 а) когда Z представляет собой группу NH или O, включающий стадию реакции
 соединения формулы (ii)



в которой R¹ и R² являются такими, как определено выше, LG представляет собой уходящую группу, с соединением формулы (iii)

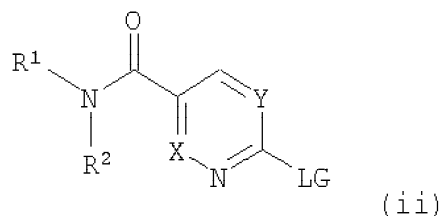


в которой Q, V, W являются такими, как определено выше, и Z представляет собой группу NH или O,

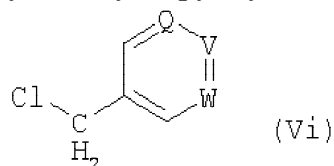
и выделение полученного соединения формулы (I), (II), (III) или (IV) в виде свободного основания или кислотно-аддитивной соли

или

б) когда Z представляет собой группу CH₂, включающий стадию реакции
 соединения формулы (ii)



в которой R^1 и R^2 являются такими, как определено в п.2, LG представляет собой уходящую группу, с соединением формулы (vi)



в которой Q, V, W являются такими, как определено выше и Z представляет собой группу NH или O, необязательно в присутствии вспомогательных веществ,

и выделение полученного соединения формулы (I), (II), (III) или (IV) в виде свободного основания или кислотно-аддитивной соли.

7. Соединение по пп.1, 2 или 3 в виде свободного основания или фармацевтически приемлемой кислотно-аддитивной соли, для применения в качестве фармацевтического препарата.

8. Соединение по пп.1, 2 или 3 в виде свободного основания или фармацевтически приемлемой кислотно-аддитивной соли, для применения в профилактике, лечении или задержке прогрессирования заболеваний, связанных с патологией передачи глутаматергического сигнала, заболеваний нервной системы и GI и заболеваний желудочно-кишечного тракта GI или мочевых путей, опосредованных полностью или частично рецептором mGluR5.

9. Фармацевтическая композиция, включающая соединение по любому из пп.1-5 в виде свободного основания или фармацевтически приемлемой кислотно-аддитивной соли, совместно с фармацевтически приемлемым носителем или растворителем.

10. Применение соединения по любому из пп.1-5 в виде свободного основания или фармацевтически приемлемой кислотно-аддитивной соли для профилактики, лечения или задержки прогрессирования заболеваний, связанных с патологией передачи глутаматергического сигнала, заболеваний нервной системы и заболеваний желудочно-кишечного тракта GI или мочевых путей, опосредованных полностью или частично рецептором mGluR5.

11. Применение соединения по любому из пп.1-5 в виде свободного основания или фармацевтически приемлемой кислотно-аддитивной соли, для изготовления фармацевтической композиции, предназначенной для профилактики, лечения или задержки прогрессирования заболеваний, связанных с патологией передачи глутаматергического сигнала, заболеваний нервной системы и заболеваний желудочно-кишечного тракта GI или мочевых путей, опосредованных полностью или частично рецептором mGluR5.

12. Способ профилактики, лечения или задержки прогрессирования заболеваний, связанных с патологией передачи глутаматергического сигнала, заболеваний нервной системы и заболеваний желудочно-кишечного тракта GI или мочевых путей, опосредованных полностью или частично рецептором mGluR5, где способ включает введение субъекту, нуждающемуся в таком лечении, терапевтически эффективного количества соединения по любому из пп.1-5 в виде свободного основания или фармацевтически приемлемой кислотно-аддитивной соли.