



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21), (22) Заявка: 2006101980/04, 24.06.2004

(30) Конвенционный приоритет:
25.06.2003 FR 03/07648

(43) Дата публикации заявки: 27.07.2006 Бюл. № 21

(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную фазу:
25.01.2006(86) Заявка РСТ:
FR 2004/001578 (24.06.2004)(87) Публикация РСТ:
WO 2005/000843 (06.01.2005)

Адрес для переписки:
129010, Москва, ул. Б.Спасская, 25, стр.3,
ООО "Юридическая фирма Городисский и
Партнеры", пат.пов. Г.Б. Егоровой, рег.№ 513

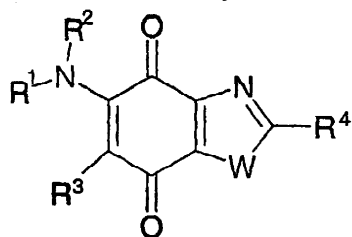
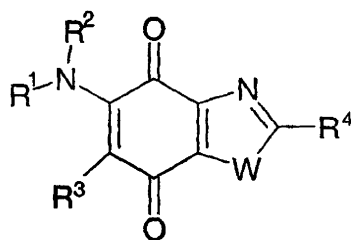
(71) Заявитель(и):
СОСЬЕТЕ ДЕ КОНСЕЙ ДЕ РЕШЕРШ
Э Д'АППЛИКАСЬОН СЪЕНТИФИК (С.К.Р.А.С.)
(FR)

(72) Автор(ы):
ГАЛЬСЕРА КОНТУР Мари-Одиль (FR),
ЛАВЕРНЬ Оливье (FR)

(74) Патентный поверенный:
Егорова Галина Борисовна

(54) БЕНЗОТИАЗОЛ-4, 7-ДИОНЫ И БЕНЗОКСАЗОЛ-4, 7-ДИОНЫ, ЗАМЕЩЕННЫЕ В ПОЛОЖЕНИИ
5 ИЛИ 6 И СПОСОБЫ ИХ ПОЛУЧЕНИЯ

(57) Формула изобретения

1. Способ получения соединения общей формулы (III)₁(III)₁или соединения общей формулы (III)₂(III)₂

в которых W обозначает атом серы в общей формуле $(III)_1$ и атом кислорода в общей формуле $(III)_2$;

R^1 обозначает атом водорода или радикал алкил, алкоксиалкил, алкилтиоалкил, циклоалкил, $-(CH_2)-X-Y$, $-(CH_2)-Z-NR^5R^6$ или радикал $-CHR^{35}R^{36}$, в котором R^{35} и R^{36} образуют вместе с атомом углерода, с которым они связаны, радикал инданил или тетралинил, или R^{35} и R^{36} образуют вместе с атомом углерода, с которым они связаны, насыщенный 5-7-членный гетероцикл, содержащий 1-2 гетероатома, выбранных из O, N и S, при этом атомы азота указанного гетероцикла возможно замещены радикалами, выбранными из радикалов алкила и радикала бензила, причем R^1 может также, если W обозначает O, обозначать, кроме того, карбоциклический радикал арил, возможно замещенный 1-3 раза заместителями, независимо выбранными из атома галогена и радикала алкила, галоалкила или алкоксила;

X обозначает связь или радикал алкилен, линейный или разветвленный, содержащий от 1 до 5 атомов углерода;

Y обозначает насыщенную углеродную циклическую систему, содержащую от 1 до 3 конденсированных циклов, независимо выбранных из 3-7-членных циклов, или Y обозначает насыщенный гетероцикл, содержащий 1-2 гетероатома, независимо выбранных из O, N и S и связанных с радикалом X звеном N или CH, причем указанный насыщенный гетероцикл, содержащий, кроме того, от 2 до 6 дополнительных звеньев, независимо выбранных из $-CHR^7-$, $-CO-$, $-NR^8-$, $-O-$ и $-S-$, при этом R^7 обозначает атом водорода или радикал алкил и R^8 обозначает атом водорода или радикал алкил или аралкил, или Y обозначает карбоциклический или гетероциклический радикал арил, возможно замещенный 1-3 раза заместителями, независимо выбранными из группы, состоящей из атома галогена, радикала алкила, радикала галоалкила, радикала алкоксила, радикала галоалкоксила, радикала гидроксила, радикала нитро, радикала циано, радикала фенила, радикала SO_2NHR^9 и радикала $NR^{10}R^{11}$, при этом R^9 обозначает атом водорода или радикал алкил или фенил и R^{10} и R^{11} независимо обозначают алкильные радикалы;

Z обозначает связь или радикал алкилен, линейный или разветвленный, содержащий от 1 до 5 атомов углерода;

при этом R^5 и R^6 независимо выбирают из атома водорода, радикала алкила, аралкила или $-(CH_2)_n-OH$, где n обозначает целое число от 1 до 6, или R^5 обозначает радикал алкоксикарбонил, галоалкоксикарбонил или аралкоксикарбонил и R^6 обозначает атом водорода или радикал метил, или R^5 и R^6 образуют вместе с атомом азота 4-7-членный гетероцикл, содержащий 1-2 гетероатома, причем звенья, необходимые для замыкания гетероцикла, независимо выбирают из радикалов $-CR^{12}R^{13}$, $-O-$, $-S-$, и $-NR^{14}$, при этом R^{12} и R^{13} независимо обозначают в каждом случае своего присутствия атом водорода или радикал алкил, и R^{14} обозначает атом водорода или радикал алкил или аралкил или R^{14} обозначает радикал фенил, возможно замещенный 1-3 раза заместителями, независимо выбранными из атома галогена или радикала алкила или алкоксила;

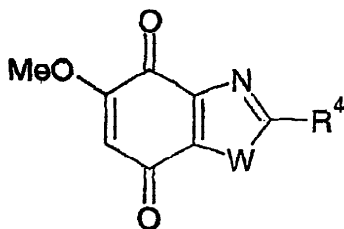
R^2 обозначает атом водорода или радикал алкил или аралкил;

или R^1 и R^2 образуют вместе с атомом азота 4-8-членный гетероцикл, содержащий 1-2 гетероатома, причем звенья, необходимые для замыкания гетероцикла, независимо выбирают из радикалов $-CR^{15}R^{16}$, $-O-$, $-S-$, и $-NR^{17}$, при этом R^{15} и R^{16} независимо обозначают в каждом случае своего присутствия атом водорода или радикал алкил, и R^{17} обозначает атом водорода или радикал алкил или аралкил; и

R^4 обозначает радикал алкил, циклоалкил, циклоалкилалкил, циано, amino, $-CH_2-COOR^{18}$, $-CH_2-CO-NR^{19}R^{20}$ или $-CH_2-NR^{21}R^{22}$ или R^4 обозначает карбоциклический или гетероциклический радикал арил, возможно замещенный 1-4 раза заместителями, независимо выбранными из атома галогена и радикала алкила, галоалкила, алкоксила, галоалкоксила или $NR^{37}R^{38}$ или R^4 обозначает радикал фенил, имеющий два заместителя, которые вместе образуют радикал метилendiоксил или этилендиоксил, при этом R^{18} обозначает атом водорода или радикал алкил, R^{19} обозначает

атом водорода или радикал алкил или аралкил, арильная группа которого возможно замещена 1-3 раза заместителями, независимо выбранными из группы, состоящей из атома галогена, радикала алкила, радикала галоалкила, радикала алкоксила, радикала галоалкоксила, радикала гидроксила, радикала нитро, радикала циано, радикала фенила, радикала $\text{SO}_2\text{NHR}^{23}$ и радикала $\text{NR}^{24}\text{R}^{25}$, причем R^{23} обозначает атом водорода или радикал алкил или фенил и R^{24} и R^{25} независимо обозначают алкильные радикалы, R^{20} обозначает атом водорода или радикал алкил, или R^{19} и R^{20} образуют вместе с атомом азота 4-7-членный гетероцикл, содержащий 1-2 гетероатома, причем звенья, необходимые для замыкания гетероцикла, независимо выбирают из радикалов $-\text{CR}^{26}\text{R}^{27}-$, $-\text{O}-$, $-\text{S}-$ и $-\text{NR}^{28}-$, при этом R^{26} и R^{27} независимо обозначают в каждом случае своего присутствия атом водорода или радикал алкил, и R^{28} обозначает атом водорода или радикал алкил или аралкил или R^{28} обозначает радикал фенил, возможно замещенный 1-3 раза заместителями, независимо выбранными из атома галогена или радикала алкила или алкоксила, R^{21} обозначает атом водорода или радикал алкил или аралкил, арильная группа которого возможно замещена 1-3 раза заместителями, независимо выбранными из группы, состоящей из атома галогена, радикала алкила, радикала галоалкила, радикала алкоксила, радикала галоалкоксила, радикала гидроксила, радикала нитро, радикала циано, радикала фенила, радикала $\text{SO}_2\text{NHR}^{29}$ и радикала $\text{NR}^{30}\text{R}^{31}$, причем R^{29} обозначает атом водорода или радикал алкил или фенил и R^{30} и R^{31} независимо обозначают алкильные радикалы, R^{22} обозначает атом водорода или радикал алкил, или R^{21} и R^{22} образуют вместе с атомом азота 4-7-членный гетероцикл, содержащий 1-2 гетероатома, причем звенья, необходимые для замыкания гетероцикла, независимо выбирают из радикалов $-\text{CR}^{32}\text{R}^{33}-$, $-\text{O}-$, $-\text{S}-$, и $-\text{NR}^{34}-$, при этом R^{32} и R^{33} независимо обозначают в каждом случае своего присутствия атом водорода или радикал алкил, и R^{34} обозначает атома водорода, радикал алкил или аралкил или R^{34} обозначает радикал фенил, возможно замещенный 1-3 раза заместителями, независимо выбранными из атома галогена или радикала алкила или алкоксила, R^{37} и R^{38} независимо выбирают из атома водорода и радикала алкила или R^{37} и R^{38} образуют вместе с атомом азота 4-7-членный гетероцикл, содержащий 1-2 гетероатома, причем звенья, необходимые для замыкания гетероцикла, независимо выбирают из радикалов $-\text{CR}^{39}\text{R}^{40}-$, $-\text{O}-$, $-\text{S}-$, и $-\text{NR}^{41}-$, при этом R^{39} и R^{40} независимо обозначают в каждом случае своего присутствия атом водорода или радикал алкил, и R^{41} обозначает атома водорода или радикал алкил; или R^4 обозначает радикал $-\text{CH}_2-\text{Ar}$, в котором Ar обозначает радикал арил, возможно замещенный 1-4 раза (в частности, 1-3 раза) заместителями, независимо выбранными из атома галогена и радикала алкила, галоалкила, алкоксила, галоалкоксила или $\text{NR}^{42}\text{R}^{43}$ или R^4 обозначает радикал бифенил, при этом R^{42} и R^{43} независимо выбирают из атома водорода и радикала алкила или R^{42} и R^{43} образуют вместе с атомом азота 4-7-членный гетероцикл, содержащий 1-2 гетероатома, причем звенья, необходимые для замыкания гетероцикла, независимо выбирают из радикалов $-\text{CR}^{44}\text{R}^{45}-$, $-\text{O}-$, $-\text{S}-$, и $-\text{NR}^{46}-$, при этом R^{44} и R^{45} независимо обозначают в каждом случае своего присутствия атом водорода или радикал алкил, и R^{46} обозначает атома водорода или радикал алкил;

причем указанный способ отличается тем, что в реакцию вводят соединение общей формулы (A)



(A)

в которой W обозначает атом серы или атом кислорода и R^4 имеет то же значение, что в общей формуле (III)₁ или (III)₂, и амин общей формулы R^1R^2NH в протонном растворителе.

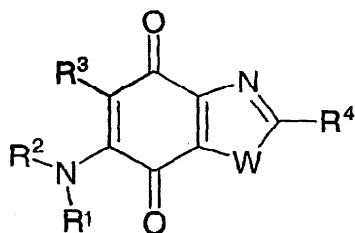
2. Способ по п.1, отличающийся тем, что соединение общей формулы (III)₁ или (III)₂ является таким,

что R^1 обозначает радикал $-(CH_2)-Z-NR^5R^6$;

R^2 обозначает атом водорода; и

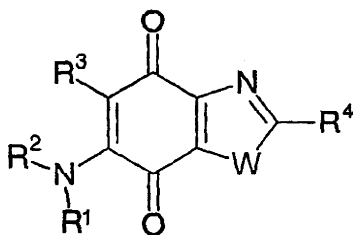
R^4 обозначает радикал алкил или радикал фенил, пиридил, тиенил или фуранил, возможно замещенный 1-4 (предпочтительно 1-3) атомами галогенов или радикалом $NR^{37}R^{38}$, или R^4 обозначает радикал $-CH_2-Ar$, в котором Ar обозначает радикал фенил или нафтил, возможно замещенный 1-4 раза (предпочтительно 1-3 раза) заместителями, независимо выбранными из атома галогена и радикала алкила, галоалкила, алкоксила или галоалкоксила.

3. Способ получения соединения общей формулы (III)₃



(III)₃

или соединения общей формулы (III)₄



(III)₄

в которых W обозначает атом серы в общей формуле (III)₃ и атом кислорода в общей формуле (III)₄;

R^1 обозначает атом водорода или радикал алкил, алкоксиалкил, алкилтиоалкил, циклоалкил, $-(CH_2)-X-Y$, $-(CH_2)-Z-NR^5R^6$ или радикал $-CHR^{35}R^{36}$, в котором R^{35} и R^{36} образуют вместе с атомом углерода, с которым они связаны, радикал инданил или тетралинил, или R^{35} и R^{36} образуют вместе с атомом углерода, с которым они связаны, насыщенный 5-7-членный гетероцикл, содержащий 1-2 гетероатома, выбранных из O, N и S, при этом атомы азота указанного гетероцикла возможно замещены радикалами, выбранными из радикалов алкила и радикала бензила, причем R^1 может также, если W обозначает O, обозначать, кроме того, карбоциклический радикал арил,

возможно замещенный 1-3 раза заместителями, независимо выбранными из атома галогена и радикала алкила, галоалкила или алкоксила;

X обозначает связь или радикал алкилен, линейный или разветвленный, содержащий от 1 до 5 атомов углерода,

Y обозначает насыщенную углеродную циклическую систему, содержащую от 1 до 3 конденсированных циклов, независимо выбранных из 3-7-членных циклов, или Y обозначает насыщенный гетероцикл, содержащий 1-2 гетероатома, независимо выбранных из O, N и S и связанных с радикалом X звеном N или CH, причем указанный насыщенный гетероцикл, содержит кроме того от 2 до 6 дополнительных звеньев, независимо выбранных из $-\text{CHR}^7-$, $-\text{CO}-$, $-\text{NR}^8-$, $-\text{O}-$ и $-\text{S}-$, при этом R^7 обозначает атом водорода или радикал алкил и R^8 обозначает атом водорода или радикал алкил или аралкил, или Y обозначает карбоциклический или гетероциклический радикал арил, возможно замещенный 1-3 раза заместителями, независимо выбранными из группы, состоящей из атома галогена, радикала алкила, радикала галоалкила, радикала алкоксила, радикала галоалкоксила, радикала гидроксила, радикала нитро, радикала циано, радикала фенила, радикала SO_2NHR^9 и радикала $\text{NR}^{10}\text{R}^{11}$, при этом R^9 обозначает атом водорода или радикал алкил или фенил и R^{10} и R^{11} независимо обозначают алкильные радикалы;

Z обозначает связь или радикал алкилен, линейный или разветвленный, содержащий от 1 до 5 атомов углерода;

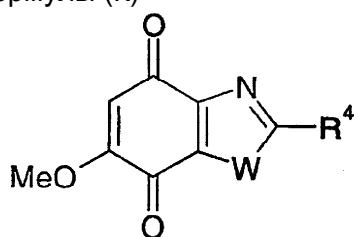
при этом R^5 и R^6 независимо выбирают из атома водорода, радикала алкила, аралкила или $-(\text{CH}_2)_n-\text{OH}$, где n обозначает целое число от 1 до 6, или R^5 обозначает радикал алкоксикарбонил, галоалкоксикарбонил или аралкоксикарбонил и R^6 обозначает атом водорода или радикал метил, или R^5 и R^6 образуют вместе с атомом азота 4-7-членный гетероцикл, содержащий 1-2 гетероатома, причем звенья, необходимые для замыкания гетероцикла, независимо выбирают из радикалов $-\text{CR}^{12}\text{R}^{13}-$, $-\text{O}-$, $-\text{S}-$, и $-\text{NR}^{14}-$, при этом R^{12} и R^{13} независимо обозначают в каждом случае своего присутствия атом водорода или радикал алкил, и R^{14} обозначает атом водорода или радикал алкил или аралкил или R^{14} обозначает радикал фенил, возможно замещенный 1-3 раза заместителями, независимо выбранными из атома галогена или радикала алкила или алкоксила;

R^2 обозначает атом водорода или радикал алкил или аралкил; или R^1 и R^2 образуют вместе с атомом азота 4-8-членный гетероцикл, содержащий 1-2 гетероатома, причем звенья, необходимые для замыкания гетероцикла, независимо выбирают из радикалов $-\text{CR}^{15}\text{R}^{16}-$, $-\text{O}-$, $-\text{S}-$ и $-\text{NR}^{17}-$, при этом R^{15} и R^{16} независимо обозначают в каждом случае своего присутствия атом водорода или радикал алкил, и R^{17} обозначает атом водорода или радикал алкил или аралкил; и

R^4 обозначает радикал алкил, циклоалкил, циклоалкилалкил, циано, amino, $-\text{CH}_2-\text{COOR}^{18}$, $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{NR}^{19}\text{R}^{20}$ или $-\text{CH}_2-\text{NR}^{21}\text{R}^{22}$ или R^4 обозначает карбоциклический или гетероциклический радикал арил, возможно замещенный 1-4 раза заместителями, независимо выбранными из атома галогена и радикала алкила, галоалкила, алкоксила, галоалкоксила или $\text{NR}^{37}\text{R}^{38}$ или R^4 обозначает радикал фенил, имеющий два заместителя, которые вместе образуют радикал метилendiоксил или этилендиоксил, при этом R^{18} обозначает атом водорода или радикал алкил, R^{19} обозначает атом водорода или радикал алкил или аралкил, арильная группа которого возможно замещена 1-3 раза заместителями, независимо выбранными из группы, состоящей из атома галогена, радикала алкила, радикала галоалкила, радикала алкоксила, радикала галоалкоксила, радикала гидроксила, радикала нитро, радикала циано, радикала фенила, радикала $\text{SO}_2\text{NHR}^{23}$ и радикала $\text{NR}^{24}\text{R}^{25}$, причем R^{23} обозначает атом водорода или радикал алкил или фенил и R^{24} и R^{25} независимо обозначают алкильные радикалы, R^{20} обозначает атом водорода или радикал алкил, или R^{19} и R^{20} образуют вместе с атомом азота 4-7-членный гетероцикл, содержащий 1-2 гетероатома, причем звенья, необходимые для замыкания гетероцикла, независимо выбирают из радикалов $-\text{CR}^{26}\text{R}^{27}-$, $-\text{O}-$, $-\text{S}-$, и $-\text{NR}^{28}-$, при этом R^{26} и R^{27} независимо обозначают в

каждом случае своего присутствия атом водорода или радикал алкил, и R^{28} обозначает атом водорода или радикал алкил или аралкил или R^{28} обозначает радикал фенил, возможно замещенный 1-3 раза заместителями, независимо выбранными из атома галогена или радикала алкила или алкоксила, R^{21} обозначает атом водорода или радикал алкил или аралкил, арильная группа которого возможно замещена 1-3 раза заместителями, независимо выбранными из группы, состоящей из атома галогена, радикала алкила, радикала галоалкила, радикала алкоксила, радикала галоалкоксила, радикала гидроксила, радикала нитро, радикала циано, радикала фенила, радикала SO_2NHR^{29} и радикала $NR^{30}R^{31}$, причем R^{29} обозначает атом водорода или радикал алкил или фенил и R^{30} и R^{31} независимо обозначают алкильные радикалы, R^{22} обозначает атом водорода или радикал алкил, или R^{21} и R^{22} образуют вместе с атомом азота 4-7-членный гетероцикл, содержащий 1-2 гетероатома, причем звенья, необходимые для замыкания гетероцикла, независимо выбирают из радикалов $-CR^{32}R^{33}-$, $-O-$, $-S-$, и $-NR^{34}-$, при этом R^{32} и R^{33} независимо обозначают в каждом случае своего присутствия атом водорода или радикал алкил, и R^{34} обозначает атома водорода, радикал алкил или аралкил или R^{34} обозначает радикал фенил, возможно замещенный 1-3 раза заместителями, независимо выбранными из атома галогена или радикала алкила или алкоксила, R^{37} и R^{38} независимо выбирают из атома водорода и радикала алкила или R^{37} и R^{38} образуют вместе с атомом азота 4-7-членный гетероцикл, содержащий 1-2 гетероатома, причем звенья, необходимые для замыкания гетероцикла, независимо выбирают из радикалов $-CR^{39}R^{40}-$, $-O-$, $-S-$, и $-NR^{41}-$, при этом R^{39} и R^{40} независимо обозначают в каждом случае своего присутствия атом водорода или радикал алкил, и R^{41} обозначает атома водорода или радикал алкил; или R^4 обозначает радикал $-CH_2-Ar$, в котором Ar обозначает радикал арил, возможно замещенный 1-4 раза (в частности, 1-3 раза) заместителями, независимо выбранными из атома галогена и радикала алкила, галоалкила, алкоксила, галоалкоксила или $NR^{42}R^{43}$ или R^4 обозначает радикал бифенил, при этом R^{42} и R^{43} независимо выбирают из атома водорода и радикала алкила или R^{42} и R^{43} образуют вместе с атомом азота 4-7-членный гетероцикл, содержащий 1-2 гетероатома, причем звенья, необходимые для замыкания гетероцикла, независимо выбирают из радикалов $-CR^{44}R^{45}-$, $-O-$, $-S-$, и $-NR^{46}-$, при этом R^{44} и R^{45} независимо обозначают в каждом случае своего присутствия атом водорода или радикал алкил, и R^{46} обозначает атома галогена или радикал алкил;

причем указанный способ отличается тем, что в реакцию вводят соединение общей формулы (K)



(K)

в которой W обозначает атом серы или атом кислорода и R^4 имеет то же значение, что в общей формуле (III)₃ или (III)₄, и амин общей формулы R^1R^2NH в протонном растворителе.

4. Способ по п.3, отличающийся тем, что соединение общей формулы (III)₃ или (III)₄ является таким,

что R^1 обозначает радикал $-(CH_2)-Z-NR^5R^6$;

R^2 обозначает атом водорода;

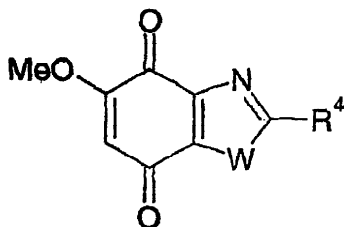
R^4 обозначает радикал алкил, или радикал фенил, пиридил, тиенил или фуранил, возможно замещенный 1-4 (предпочтительно 1-3) атомами галогенов или радикалом

NR ³⁷R³⁸, или R⁴ обозначает радикал -CH₂-Ar, в котором Ar обозначает радикал фенил или нафтил, возможно замещенный 1-4 раза (предпочтительно 1-3 раза) заместителями, независимо выбранными из атома галогена и радикала алкила, галоалкила, алкоксила или галоалкоксила.

5. Соединение одной из общих формул (III)₁, (III)₂, (III)₃ и (III)₄, таких как описаны в пп.1-3, отличающееся тем, что его выбирают из следующих соединений:

- (1) 2-(2,6-дифторфенил)-5-{[2-(диметиламино)этил]амино}-1,3-бензотиазол-4,7-дион;
- (2) 2-(2,5-дихлортиен-3-ил)-5-{[2-(диметиламино)этил]амино}-1,3-бензотиазол-4,7-дион;
- (3) 2-(2,5-дихлортиен-3-ил)-5-{[2-пирролидин-1-илэтил]амино}-1,3-бензотиазол-4,7-дион;
- (4) 5-{[2-(диметиламино)этил]амино}-2-(4-фторфенил)-1,3-бензотиазол-4,7-дион;
- (5) 2-(4-фторфенил)-5-{[2-пирролидин-1-илэтил]амино}-1,3-бензотиазол-4,7-дион;
- (6) 2-(2-хлор-6-фторфенил)-5-{[2-(диметиламино)этил]амино}-1,3-бензотиазол-4,7-дион;
- (7) 2-(2-хлор-6-фторфенил)-5-{[2-пирролидин-1-илэтил]амино}-1,3-бензотиазол-4,7-дион;
- (8) 6-{[2-(диметиламино)этил]амино}-2-(4-фторфенил)-1,3-бензотиазол-4,7-дион;
- (9) 6-{[2-(диметиламино)этил]амино}-2-(1-нафтил)-1,3-бензотиазол-4,7-дион;
- (10) 2-(1,1'-бифенил-4-ил)-6-{[2-(диметиламино)этил]амино}-1,3-бензотиазол-4,7-дион;
- (11) 2-(4-бутилфенил)-6-{[2-(диметиламино)этил]амино}-1,3-бензотиазол-4,7-дион;
- (12) 2-(2-хлор-6-фторфенил)-6-{[2-(диметиламино)этил]амино}-1,3-бензотиазол-4,7-дион;
- (13) 6-{[2-(диметиламино)этил]амино}-2-(2-нафтил)-1,3-бензотиазол-4,7-дион;
- (14) 2-(2,5-дифторфенил)-6-{[2-(диметиламино)этил]амино}-1,3-бензотиазол-4,7-дион;
- (15) 2-(2,5-дифторфенил)-5-{[2-(диметиламино)этил]амино}-1,3-бензоксазол-4,7-дион;
- (16) 2-(2-бромфенил)-5-{[2-(диметиламино)этил]амино}-1,3-бензоксазол-4,7-дион;
- (17) 2-(3-бромфенил)-5-{[2-(диметиламино)этил]амино}-1,3-бензоксазол-4,7-дион;
- (18) 5-{[2-(диметиламино)этил]амино}-2-(4-фторфенил)-1,3-бензоксазол-4,7-дион;
- (19) 2-(3,5-дифторфенил)-5-{[2-(диметиламино)этил]амино}-1,3-бензоксазол-4,7-дион;
- (20) 2-(2,3-дифторфенил)-5-{[2-(диметиламино)этил]амино}-1,3-бензоксазол-4,7-дион;
- (21) 5-{[2-(диметиламино)этил]амино}-2-(3,4,5-трифторфенил)-1,3-бензоксазол-4,7-дион;
- (22) 5-{[2-(диметиламино)этил]амино}-2-(4-этилфенил)-1,3-бензоксазол-4,7-дион;
- (23) 2-бензил-5-{[2-(диметиламино)этил]амино}-1,3-бензоксазол-4,7-дион;
- (24) 2-(3-бромфенил)-5-{[2-пирролидин-1-илэтил]амино}-1,3-бензоксазол-4,7-дион;
- (25) 2-(3,5-дифторфенил)-5-{[2-пирролидин-1-илэтил]амино}-1,3-бензоксазол-4,7-дион;
- (26) 5-{[2-пирролидин-1-илэтил]амино}-2-(3,4,5-трифторфенил)-1,3-бензоксазол-4,7-дион;
- (27) 2-(2,5-дифторфенил)-6-{[2-(диметиламино)этил]амино}-1,3-бензоксазол-4,7-дион;
- (28) 2-(2-бромфенил)-6-{[2-(диметиламино)этил]амино}-1,3-бензоксазол-4,7-дион;
- (29) 2-(3-бромфенил)-6-{[2-(диметиламино)этил]амино}-1,3-бензоксазол-4,7-дион;
- (30) 2-(3-хлорфенил)-6-{[2-(диметиламино)этил]амино}-1,3-бензоксазол-4,7-дион;
- (31) 2-(4-бромфенил)-6-{[2-(диметиламино)этил]амино}-1,3-бензоксазол-4,7-дион;
- (32) 2-(3,5-дибромфенил)-6-{[2-(диметиламино)этил]амино}-1,3-бензоксазол-4,7-дион;
- (33) 6-{[2-(диметиламино)этил]амино}-2-(4-фторфенил)-1,3-бензоксазол-4,7-дион;
- (34) 2-(3,5-дифторфенил)-6-{[2-(диметиламино)этил]амино}-1,3-бензоксазол-4,7-дион;
- (35) 2-(2,3-дифторфенил)-6-{[2-(диметиламино)этил]амино}-1,3-бензоксазол-4,7-дион;
- (36) 6-{[2-(диметиламино)этил]амино}-2-(3,4,5-трифторфенил)-1,3-бензоксазол-4,7-дион;
- (37) 2-(4-бром-3-метилфенил)-6-{[2-(диметиламино)этил]амино}-1,3-бензоксазол-4,7-дион;
- (38) 6-{[2-(диметиламино)этил]амино}-2-(4-этилфенил)-1,3-бензоксазол-4,7-дион;
- (39) 2-(4-бром-2-хлорфенил)-6-{[2-(диметиламино)этил]амино}-1,3-бензоксазол-4,7-дион;
- (40) 6-{[2-(диметиламино)этил]амино}-2-(3,4,5-триметоксифенил)-1,3-бензоксазол-4,7-дион;
- (41) 2-(3,4-диметоксифенил)-6-{[2-(диметиламино)этил]амино}-1,3-бензоксазол-4,7-дион;
- (42) 2-(2,6-дихлорбензил)-6-{[2-(диметиламино)этил]амино}-1,3-бензоксазол-4,7-дион;
- (43) 2-(2-хлор-6-фторбензил)-6-{[2-(диметиламино)этил]амино}-1,3-бензоксазол-4,7-дион;
- (44) 6-{[2-(диметиламино)этил]амино}-2-(1-нафтилметил)-1,3-бензоксазол-4,7-дион;
- (45) 2-(2-бромфенил)-6-{[2-пирролидин-1-илэтил]амино}-1,3-бензоксазол-4,7-дион;
- (46) 2-(3-бромфенил)-6-{[2-пирролидин-1-илэтил]амино}-1,3-бензоксазол-4,7-дион;
- (47) 2-(3-хлорфенил)-6-{[2-пирролидин-1-илэтил]амино}-1,3-бензоксазол-4,7-дион;

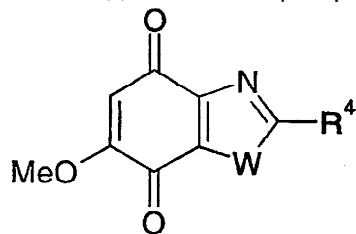
- (48) 2-(4-бромфенил)-6-[(2-пирролидин-1-илэтил)амино]-1,3-бензоксазол-4,7-дион;
 (49) 2-(3,5-дибромфенил)-6-[(2-пирролидин-1-илэтил)амино]-1,3-бензоксазол-4,7-дион;
 (50) 2-(4-фторфенил)-6-[(2-пирролидин-1-илэтил)амино]-1,3-бензоксазол-4,7-дион;
 (51) 2-(3,5-дифторфенил)-6-[(2-пирролидин-1-илэтил)амино]-1,3-бензоксазол-4,7-дион;
 (52) 6-[(2-пирролидин-1-илэтил)амино]-2-(3,4,5-трифторфенил)-1,3-бензоксазол-4,7-дион;
 (53) 2-(4-бром-3-метилфенил)-6-[(2-пирролидин-1-илэтил)амино]-1,3-бензоксазол-4,7-дион;
 (54) 2-(4-этилфенил)-6-[(2-пирролидин-1-илэтил)амино]-1,3-бензоксазол-4,7-дион;
 (55) 2-(4-бром-2-хлорфенил)-6-[(2-пирролидин-1-илэтил)амино]-1,3-бензоксазол-4,7-дион;
 (56) 6-[(2-пирролидин-1-илэтил)амино]-2-(3,4,5-триметоксифенил)-1,3-бензоксазол-4,7-дион;
 (57) 2-(3,4-диметоксифенил)-6-[(2-пирролидин-1-илэтил)амино]-1,3-бензоксазол-4,7-дион;
 (58) 2-(2-хлор-6-фторбензил)-6-[(2-пирролидин-1-илэтил)амино]-1,3-бензоксазол-4,7-дион;
 (59) 2-(1,3-бензодиоксол-5-ил)-6-[(2-пирролидин-1-илэтил)амино]-1,3-бензоксазол-4,7-дион;
 (60) 6-[[2-(диметиламино)этил]амино]-2-гексил-1,3-бензотиазол-4,7-дион;
 а также солей указанных соединений.
6. Соединение по п.5, отличающееся тем, что его выбирают из следующих соединений:
 (1) 2-(2-хлор-6-фторфенил)-5-[[2-(диметиламино)этил]амино]-1,3-бензотиазол-4,7-дион;
 (2) 6-[[2-(диметиламино)этил]амино]-2-(2-нафтил)-1,3-бензотиазол-4,7-дион;
 (3) 6-[[2-(диметиламино)этил]амино]-2-(4-этилфенил)-1,3-бензоксазол-4,7-дион;
 или соли одного из указанных соединений.
7. Соединение общей формулы (III)₁, такое как указано в п.5, отличающееся тем, что его выбирают из следующих соединений:
 (1) 2-(2,6-дифторфенил)-5-[[2-(диметиламино)этил]амино]-1,3-бензотиазол-4,7-дион;
 (2) 2-(2,5-дихлортиен-3-ил)-5-[[2-(диметиламино)этил]амино]-1,3-бензотиазол-4,7-дион;
 (3) 2-(2,5-дихлортиен-3-ил)-5-[(2-пирролидин-1-илэтил)амино]-1,3-бензотиазол-4,7-дион;
 (4) 5-[[2-(диметиламино)этил]амино]-2-(4-фторфенил)-1,3-бензотиазол-4,7-дион;
 (5) 2-(4-фторфенил)-5-[(2-пирролидин-1-илэтил)амино]-1,3-бензотиазол-4,7-дион;
 (6) 2-(2-хлор-6-фторфенил)-5-[[2-(диметиламино)этил]амино]-1,3-бензотиазол-4,7-дион;
 (7) 2-(2-хлор-6-фторфенил)-5-[(2-пирролидин-1-илэтил)амино]-1,3-бензотиазол-4,7-дион;
 или соли одного из указанных соединений.
8. Применение соединения по любому из пп.5-7 или фармацевтически приемлемой соли одного из этих соединений в качестве лекарственного средства.
9. Применение соединения по любому из пп.5-7 или фармацевтически приемлемой соли одного из этих соединений для получения лекарственного средства, предназначенного для лечения рака.
10. Применение по п.9, отличающееся тем, что рак выбирают из рака груди, лимфом, рака шеи и головы, рака легкого, рака прямой кишки, рака простаты и рака поджелудочной железы.
11. Соединение общей формулы (A)



(A)

в которой W и R⁴ указаны в п.1,
 однако, при условии, что если W обозначает атом серы, то R⁴ не обозначает метил,
 или соль этого соединения.

12. Соединение общей формулы (K)



(K)

в которой W и R⁴ указаны в п.3,
однако, при условии, что если W обозначает атом серы, то R⁴ не обозначает фенильную
группу,
или соль этого соединения.