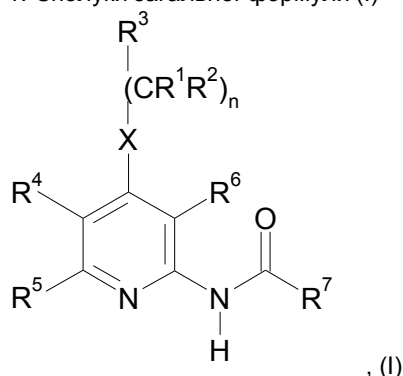


1. Сполуки загальної формули (I)



в якій

$R^1$  означає атом водню або нерозгалужений або розгалужений  $C_{1-4}$  алкіл;

$R^2$  означає атом водню або нерозгалужений або розгалужений  $C_{1-4}$  алкіл;

$R^3$  означає атом водню або нерозгалужений або розгалужений  $C_{1-4}$  алкіл, або феніл, тієніл або фурил, необов'язково, заміщений однією або більшою кількістю нерозгалужених або розгалужених  $C_{1-4}$  алкільних груп, нерозгалужених або розгалужених  $C_{1-4}$  алкоксигруп або атомів галогену, або для 5- або 6-членного гетероароматичного кільця містить один, два або три атоми азоту, або один атом азоту і один атом кисню, або один атом азоту і один атом сірки, необов'язково, заміщений однією або більшою кількістю нерозгалужених або розгалужених  $C_{1-4}$  алкільних груп, нерозгалужених або розгалужених  $C_{1-4}$  алкоксигруп або атомів галогену;

$R^4$  і  $R^5$  утворюють разом 1,3-бутадієнільну групу, необов'язково, заміщену метилендіоксигрупою або однією або більшою кількістю нерозгалужених або розгалужених  $C_{1-4}$  алкільних груп, нерозгалужених або розгалужених  $C_{1-4}$  алкоксигруп, гідроксигруп або атомів галогену;

$R^6$  означає атом водню або ціано, амінокарбоніл,  $C_{1-4}$  алкоксикарбоніл або карбокси;

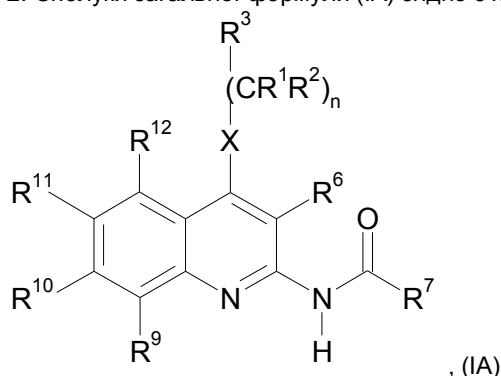
$R^7$  означає атом водню або нерозгалужений або розгалужений  $C_{1-4}$  алкіл, або феніл, бензил, тієніл або фурил, необов'язково, заміщений метилендіоксигрупою або однією або більшою кількістю нерозгалужених або розгалужених  $C_{1-4}$  алкільних груп, нерозгалужених або розгалужених  $C_{1-4}$  алкоксигруп, гідроксигруп, трифторметильних груп, ціаногруп або атомів галогену, або для 5- або 6-членного гетероароматичного кільця містить один, два або три атоми азоту, або один атом азоту і один атом кисню, або один атом азоту і один атом сірки, необов'язково, заміщений однією або більшою кількістю нерозгалужених або розгалужених  $C_{1-4}$  алкільних груп, нерозгалужених або розгалужених  $C_{1-4}$  алкоксигруп або атомів галогену;

X означає  $-CH_2-$ ,  $-NH-$ ,  $-NR^8-$  або атом сірки, або атом кисню, або сульфогрупу, або сульфоксигрупу, де  $R^8$  означає нерозгалужений або розгалужений  $C_{1-4}$  алкіл або  $C_{3-6}$  циклоалкіл-;

n означає нуль, 1 або 2,

і їх солі і сольвати, ізомери і їх солі і сольвати.

2. Сполуки загальної формули (IA) згідно з пунктом 1



де  $R^1$  означає атом водню або нерозгалужений або розгалужений  $C_{1-4}$  алкіл;

$R^2$  означає атом водню або нерозгалужений або розгалужений  $C_{1-4}$  алкіл;

$R^3$  означає атом водню або нерозгалужений або розгалужений  $C_{1-4}$  алкіл, або феніл, тієніл або фурил, необов'язково, заміщений однією або більшою кількістю нерозгалужених або розгалужених  $C_{1-4}$  алкільних груп, нерозгалужених або розгалужених  $C_{1-4}$  алкоксигруп або атомів галогену, або для 5- або 6-членного гетероароматичного кільця містить один, два або три атоми азоту, або один атом азоту і один атом кисню, або один атом азоту і один атом сірки, необов'язково, заміщений однією або більшою кількістю нерозгалужених або розгалужених  $C_{1-4}$  алкільних груп, нерозгалужених або розгалужених  $C_{1-4}$  алкоксигруп або атомів галогену;

$R^6$  означає атом водню або ціано, амінокарбоніл,  $C_{1-4}$  алкоксикарбоніл або карбокси;

$R^7$  означає атом водню або нерозгалужений або розгалужений  $C_{1-4}$  алкіл, або феніл, бензил, тієніл або фурил, необов'язково, заміщений метилендіоксигрупою або однією або більшою кількістю нерозгалужених або розгалужених  $C_{1-4}$  алкільних груп, нерозгалужених або розгалужених  $C_{1-4}$  алкоксигруп, гідроксигруп,

трифторметильних груп, ціаногруп або атомів галогену, або для 5- або 6-членного гетероароматичного кільця містить один, два або три атоми азоту, або один атом азоту і один атом кисню, або один атом азоту і один атом сірки, необов'язково, заміщений однією або більшою кількістю нерозгалужених або розгалужених C<sub>1-4</sub> алкільних груп, нерозгалужених або розгалужених C<sub>1-4</sub> алкоксигруп або атомів галогену, X означає -CH<sub>2</sub>-, -NH-, -NR<sup>8</sup>- або атом сірки, або атом кисню, або сульфогрупу, або сульфоксигрупу, де R<sup>8</sup> означає нерозгалужений або розгалужений C<sub>1-4</sub> алкіл або C<sub>3-6</sub> циклоалкіл-;

n означає нуль, 1 або 2,

і їх солі і сольвати, ізомери і їх солі і сольвати.

3. Сполуки формули (IA) згідно з пунктом 2, в якій

R<sup>1</sup> означає атом водню або метил;

R<sup>2</sup> означає атом водню або метил;

R<sup>3</sup> означає феніл, тієніл або фурил;

R<sup>9</sup>, R<sup>10</sup>, R<sup>11</sup> і R<sup>12</sup> означають, незалежно, атом водню або нерозгалужений або розгалужений C<sub>1-4</sub> алкіл, або нерозгалужений або розгалужений C<sub>1-4</sub> алкокси, або гідрокси, або атом галогену, або

R<sup>9</sup> і R<sup>12</sup> означають атом водню і R<sup>10</sup> і R<sup>11</sup> утворюють разом метилендіоксигрупу;

R<sup>6</sup> означає атом водню або ціано;

R<sup>7</sup> означає 4-метоксифеніл, 3-метилфеніл, 3-метоксифеніл, 3-тієніл або 3-фурил,

X означає -NH- або атом кисню, і

n означає 1,

і їх солі, сольвати, ізомери і їх солі і сольвати.

4. Сполуки згідно з пунктами 1-3, які є наступними:

3-метил-N-(4-бензиламіно-3-ціанохінолін-2-іл)бензамід;

4-метокси-N-(4-бензиламіно-3-ціанохінолін-2-іл)бензамід;

3-метокси-N-(4-бензиламіно-3-ціанохінолін-2-іл)бензамід;

3,4-метилендіокси-N-(4-бензиламіно-3-ціанохінолін-2-іл)бензамід;

N-(4-бензиламіно-3-ціанохінолін-2-іл)тіофен-3-карбоксамід;

N-(4-[2-тієнілметиламіно]-3-ціанохінолін-2-іл)тіофен-3-карбоксамід;

4-метокси-N-(4-[2-тієнілметиламіно]-3-ціанохінолін-2-іл)бензамід;

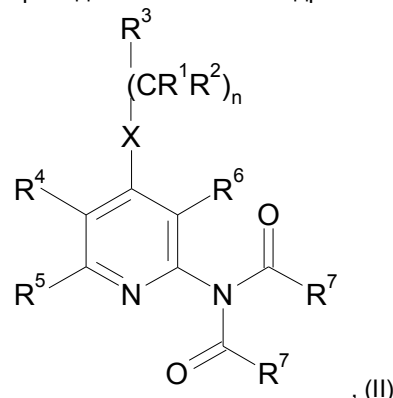
3,4-метилендіокси-N-(4-[2-тієнілметиламіно]-3-ціанохінолін-2-іл)бензамід;

N-(4-[2-фурилметиламіно]-3-ціанохінолін-2-іл)фуран-2-карбоксамід;

N-(4-[2-фурилметиламіно]-3-ціанохінолін-2-іл)тіофен-2-карбоксамід

і їх солі, сольвати, ізомери і їх солі і сольвати.

5. Спосіб одержання сполуки загальної формули (I), її солей, сольватів, ізомерів і їх солей і сольватів, де в формулі R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup>, X і n мають значення, вказані в пункті 1, який характеризується тим, що проводять селективний гідроліз біскарбоксаміду загальної формули (II)



в якій R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup>, X і n мають значення вказані в пункті 1, і, при бажанні, трансформують замісники сполуки загальної формули (I), одержаної таким чином, один в одний за допомогою способів відомих *per se*, і/або трансформують сполуку загальної формули (I), одержану таким чином, в її солі або сольвати, або вивільнюють сполуку з її солей або сольватів, і/або розділяють сполуку на її ізомерні форми, або трансформують оптично активні форми в рацемічну форму.

6. Спосіб згідно з пунктом 5, який характеризується тим, що селективний гідроліз проводять в спиртовому середовищі в присутності гідроксиду лужного металу, переважно гідроксиду натрію або калію.

7. Фармацевтична композиція, що містить як активний інгредієнт одну або більшу кількість сполук загальної формули (I), в якій R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup>, X і n мають значення, вказані в пункті 1, або їх солей, сольватів або ізомерів і їх солей, сольватів, у поєднанні з одним або більшою кількістю екціпієнтів, що використовуються в фармацевтичній промисловості.

8. Фармацевтична композиція згідно з пунктом 7, що містить як активний інгредієнт одну або більшу кількість сполук загальної формули (IA), в якій R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup>, R<sup>10</sup>, R<sup>11</sup>, R<sup>12</sup>, X і n мають значення, вказані в пункті 2, або їх солей, сольватів або ізомерів і їх солей, сольватів, у поєднанні з одним або більшою кількістю екціпієнтів, що використовуються в фармацевтичній промисловості.

9. Фармацевтична композиція згідно з пунктом 8, що містить як активний інгредієнт одну або більшу кількість сполук згідно з пунктом 4.

10. Застосування сполук загальної формули (I), в якій R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup>, X і n мають значення, вказані в пункті 1, для виготовлення фармацевтичної композиції для лікування захворювань, у розвитку яких

приймає участь рецептор  $A_3$ .

11. Застосування сполук загальної формули (I), в якій  $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, X$  і  $n$  мають значення, вказані в пункті 1, згідно з пунктом 10 як  $A_3$  лігандів для виготовлення фармацевтичної композиції для лікування захворювань серця, нирок, респіраторних органів і центральної нервової системи, для інгібування захисної дії аденозину на ракові клітини, що ростуть, попередження дегрануляції стовбурових клітин, інгібування продукування цитокіну, зменшення внутрішньоокулярного тиску, інгібування вивільнення  $TNF\alpha$ , інгібування міграції еозинофілів, нейтрофілів і інших імунних клітин, інгібування бронхостенозу і екстравазації плазми.

12. Застосування сполук загальної формули (I), в якій  $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, X$  і  $n$  мають значення вказані в пункті 1, згідно з пунктами 10 або 11 як антагоністів  $A_3$  рецептора для виготовлення протизапальних, протиастматичних, протиішемічних, антидепресантних, антиаритмічних фармацевтичних композицій, фармацевтичних композицій для захисту нирок, протиракових фармацевтичних композицій, фармацевтичних композицій для лікування хвороби Паркінсона і фармацевтичних композицій, що підвищують когнітивні функції, і композицій для лікування або попередження ушкодження внаслідок реперфузії міокарда, хронічного обструктивного захворювання легені (COPD) і респіраторного дистрессиндрому повнолітніх (ARDS), включаючи хронічний бронхіт, легеневу емфізему або ядуху, алергічних реакцій (наприклад, риніт, відповіді на отруєння плющем, кропивниця, склеродерма, артрит), інші аутоімунні захворювання, запального захворювання кишечника, хвороби Аддісона, хвороби Крона, псоріазу, ревматизму, гіпертензії, розладів нейрогенних функцій, глаукоми і діабету.

13. Застосування сполук загальної формули (I), в якій  $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, X$  і  $n$  мають значення, вказані в пункті 1, згідно з будь-яким з пунктів 10, 11 і 12 як антагоністів  $A_3$  рецептора для виготовлення фармацевтичної композиції для лікування захворювання, такого як астма, COPD і ARDS, глаукома, рак, алергічні і запальні захворювання, ішемія, гіпоксія, аритмія і захворювання нирок.

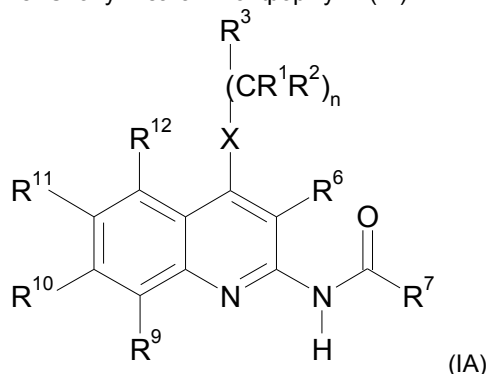
14. Застосування сполук загальної формули (IA), в якій  $R^1, R^2, R^3, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}, X$  і  $n$  мають значення, вказані в пункті 2, для виготовлення фармацевтичної композиції для лікування захворювань, у розвитку яких приймає участь рецептор  $A_3$ .

15. Застосування сполук загальної формули (IA), в якій  $R^1, R^2, R^3, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}, X$  і  $n$  мають значення, вказані в пункті 2, згідно з пунктом 14 як  $A_3$  лігандів для виготовлення фармацевтичної композиції для лікування захворювань серця, нирок, респіраторних органів і центральної нервової системи, для інгібування захисної дії аденозину на ракові клітини, що ростуть, попередження дегрануляції стовбурових клітин, інгібування продукування цитокіну, зменшення внутрішньоокулярного тиску, інгібування вивільнення  $TNF\alpha$ , інгібування міграції еозинофілів, нейтрофілів і інших імунних клітин, інгібування бронхостенозу і екстравазації плазми.

16. Застосування сполук загальної формули (IA), в якій  $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}, X$  і  $n$  мають значення, вказані в пункті 2, згідно з пунктами 14 або 15 як антагоністів  $A_3$  рецептора для виготовлення протизапальних, протиастматичних, протиішемічних, антидепресантних, антиаритмічних фармацевтичних композицій, фармацевтичних композицій для захисту нирок, протиракових фармацевтичних композицій, фармацевтичних композицій для лікування хвороби Паркінсона і фармацевтичних композицій, що підвищують когнітивні функції, і композицій для лікування або попередження ушкодження внаслідок реперфузії міокарда, хронічного обструктивного захворювання легені (COPD) і респіраторного дистрессиндрому повнолітніх (ARDS), включаючи хронічний бронхіт, легеневу емфізему або ядуху, алергічних реакцій (наприклад, риніт, відповіді, індуковані на отруту плюща, кропивниця, склеродерма, артрит), інші аутоімунні захворювання, запального захворювання кишечника, хвороби Аддісона, хвороби Крона, псоріазу, ревматизму, гіпертензії, розладів нейрогенних функцій, глаукоми і діабету.

17. Застосування сполук загальної формули (IA), в якій  $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, X$  і  $n$  мають значення, вказані в пункті 1, згідно з будь-яким з пунктів 14, 15 і 16 як антагоністів  $A_3$  рецептора, для виготовлення фармацевтичної композиції для лікування захворювання, такого як астма, COPD і ARDS, глаукома, рак, алергічні і запальні захворювання, ішемія, гіпоксія, аритмія і захворювання нирок.

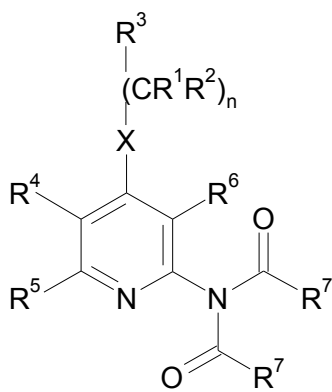
18. Сполуки загальної формули (IA)



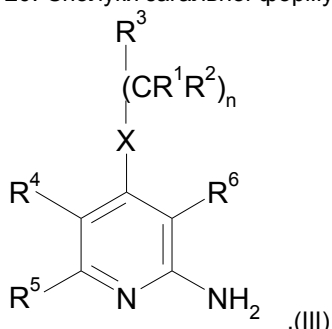
і їх солі, сольвати, ізомери і їх солі і сольвати,

в якій  $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, X$  і  $n$  мають значення, вказані в пункті 1.

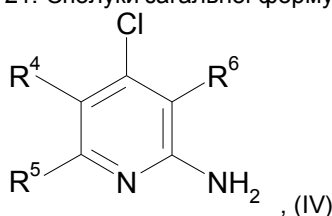
19. Сполуки загальної формули (II)



в якій  $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, X$  і  $n$  мають значення, вказані в пункті 1.  
 20. Сполуки загальної формули (III)



в якій  $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, X$  і  $n$  мають значення, вказані в пункті 1, за умови, що  $R^3$  не може означати феніл, якщо  $R^1$  і  $R^2$  означають атоми водню,  $n = 1$ ,  $X$  означає  $-NH-$ ,  $R^4$  і  $R^5$  утворюють разом 1,3-бутадієнільну групу, і  $R^6$  означає ціано, і за наступної умови, що  $R^3$  не може означати нерозгалужений або розгалужений  $C_{1-4}$  алкіл або феніл, заміщений нерозгалуженим або розгалуженим  $C_{1-4}$  алкокси, якщо  $n = 0$ ,  $X$  означає  $-NH-$  або  $-NR^8-$ ,  $R^8$  має значення, вказані в пункті 1,  $R^4$  і  $R^5$  утворюють разом 1,3-бутадієнільну групу, і  $R^6$  означає ціано, і за наступної умови, що  $R^3$  не може означати атом водню, якщо  $n = 0$ ,  $X$  означає  $-CH_2-$ ,  $R^4$  і  $R^5$  утворюють разом 1,3-бутадієнільну групу, і  $R^6$  означає ціано або амінокарбоніл.  
 21. Сполуки загальної формули (IV)



в якій  $R^4, R^5$ , і  $R^6$  мають значення, вказані в пункті 1, за умови, що  $R^6$  не може означати атом водню, якщо  $R^4$  і  $R^5$  означають атом водню.