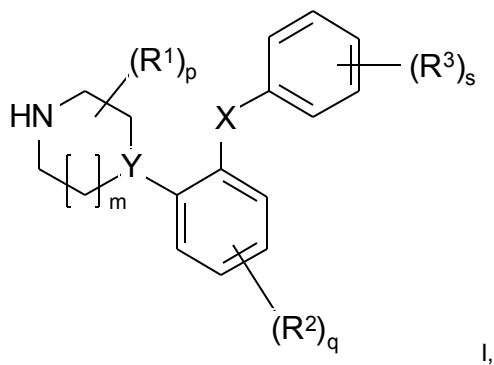


# 1. Застосування похідних фенілпіперазину загальної формули I



де

Y являє собою N;

X являє собою S;

m дорівнює 1 або 2;

p дорівнює 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 або 8;

q дорівнює 0, 1, 2, 3 або 4;

s дорівнює 1 або 2;

кожний R<sup>1</sup> є незалежно вибраним з групи, представленої C<sub>1-6</sub>-алкілом, або два R<sup>1</sup>, приєднані до одного й того ж атома вуглецю, можуть утворювати 3-6-членний спіроприєднаний циклоалкіл;

кожний R<sup>2</sup> є незалежно вибраним з груп, представлених галогеном, ціаногрупою, нітрогрупою, C<sub>1-6</sub>-алк(ен/ін)ілом, C<sub>1-6</sub>-алк(ен/ін)ілоксигрупою, C<sub>1-6</sub>-алк(ен/ін)ілсульфанілом, гідроксигрупою, гідрокси-C<sub>1-6</sub>-алк(ен/ін)ілом, галоген-C<sub>1-6</sub>-алк(ен/ін)ілом, галоген-C<sub>1-6</sub>-алк(ен/ін)ілоксигрупою, C<sub>3-8</sub>-циклоалк(ен)ілом, C<sub>3-8</sub>-циклоалк(ен)іл-C<sub>1-6</sub>-алк(ен/ін)ілом, ацилом, C<sub>1-6</sub>-алк(ен/ін)ілоксикарбонілом, C<sub>1-6</sub>-алк(ен/ін)ілсульфонілом або -NR<sup>x</sup>R<sup>y</sup>; -NR<sup>x</sup>CO-C<sub>1-6</sub>-алк(ен/ін)ілом;

кожний R<sup>3</sup> є вибраним з групи, що складається з галогену, C<sub>1-6</sub>-алкоксигрупи, C<sub>1-6</sub>-алкілсульфанілу, C<sub>1-6</sub>-алкілу, гідроксигрупи або трифторометилу;

де кожний R<sup>x</sup> і R<sup>y</sup> є незалежно вибраним з групи, представленої воднем, C<sub>1-6</sub>-алк(ен/ін)ілом, C<sub>3-8</sub>-циклоалк(ен)ілом, C<sub>3-8</sub>-циклоалк(ен)іл-C<sub>1-6</sub>-алк(ен/ін)ілом або арилом; або R<sup>x</sup> і R<sup>y</sup> разом з азотом, до якого вони приєднані, утворюють 3-7-членне кільце, яке необов'язково містить один додатковий гетероатом;

або їх фармацевтично прийнятних кислотно-адитивних солей як лікарського засобу для лікування афективних розладів, таких як депресія, тривожні розлади, включаючи генералізований тривожний розлад, панічний розлад і обсесивно-компульсивний розлад.

2. Застосування за п. 1, де p дорівнює 0, 1 або 2.

3. Застосування за будь-яким з пп. 1, 2, де R<sup>1</sup> являє собою C<sub>1-6</sub>-алкіл.

4. Застосування за будь-яким з пп. 1-3, де m дорівнює 1 або 2.

5. Застосування за будь-яким з пп. 1-4, де q дорівнює 0, 1 або 2.

6. Застосування за будь-яким з пп. 1-5, де R<sup>2</sup> являє собою трифторометил або C<sub>1-6</sub>-алкіл.

7. Застосування за п. 1, де згадана сполука вибрана з групи, що містить:

- 1-[2-(2-трифторометилфенілсульфаніл)феніл]піперазин,
- 1-[2-(4-бромфенілсульфаніл)феніл]піперазин,
- 1-[2-[4-(метилсульфаніл)фенілсульфаніл]феніл]піперазин,
- 1-[2-(4-гідроксифенілсульфаніл)феніл]піперазин,
- 1-[2-(2,4-диметилфенілсульфаніл)феніл]піперазин,
- 1-[2-(3,5-диметилфенілсульфаніл)феніл]піперазин,
- 1-[2-(2,6-диметилфенілсульфаніл)феніл]піперазин,
- 1-[2-(2,5-диметилфенілсульфаніл)феніл]піперазин,
- 1-[2-(2-трифторометилфенілсульфаніл)феніл]-[1,4]діазепан,
- 1-[2-(3-метилфенілсульфаніл)феніл]-[1,4]діазепан,
- 2-(4-метилфенілсульфаніл)феніл-1-піперазин,
- 1-[2-(4-хлорофенілсульфаніл)феніл]піперазин,
- 1-[2-(4-метоксифенілсульфаніл)-4-хлорофеніл]піперазин,
- 1-[2-(4-метоксифенілсульфаніл)-4-метилфеніл]піперазин,
- 1-[2-(4-метоксифенілсульфаніл)-5-метилфеніл]піперазин,
- 1-[2-(4-фторфенілсульфаніл)-5-метилфеніл]піперазин,
- 1-[2-(4-метоксифенілсульфаніл)-5-трифторометилфеніл]піперазин,
- 1-[2-(4-хлорофенілсульфаніл)феніл]-3-метилпіперазин,
- 1-[2-(4-хлорофенілсульфаніл)феніл]-3,5-диметилпіперазин

або їх фармацевтично прийнятні кислотно-адитивні солі.

8. Застосування за п. 1, де згадана сполука являє собою 1-[2-(2-трифторометилфеніл-сульфаніл)феніл]піперазин або його фармацевтично прийнятну кислотно-адитивну сіль.

9. Застосування за п. 1, де згадана сполука являє собою 1-[2-(4-бромфенілсульфаніл)феніл]піперазин або його фармацевтично прийнятну кислотно-адитивну сіль.

10. Застосування за п. 1, де згадана сполука являє собою 1-[2-[4-(метилсульфаніл)фенілсульфаніл]феніл]піперазин або його фармацевтично прийнятну кислотно-адитивну сіль.

11. Застосування за п. 1, де згадана сполука являє собою 1-[2-(4-гідроксифенілсульфаніл)феніл]піперазин або

його фармацевтично прийнятну кислотно-адитивну сіль.

12. Застосування за п. 1, де згадана сполука являє собою 1-[2-(2,4-диметилфенілсульфаніл)феніл]піперазин або його фармацевтично прийнятну кислотно-адитивну сіль.

13. Застосування за п. 1, де згадана сполука являє собою 1-[2-(3,5-диметилфенілсульфаніл)феніл]піперазин або його фармацевтично прийнятну кислотно-адитивну сіль.

14. Застосування за п. 1, де згадана сполука являє собою 1-[2-(2,6-диметилфенілсульфаніл)феніл]піперазин або його фармацевтично прийнятну кислотно-адитивну сіль.

15. Застосування за п. 1, де згадана сполука являє собою 1-[2-(2,5-диметилфенілсульфаніл)феніл]піперазин або його фармацевтично прийнятну кислотно-адитивну сіль.

16. Застосування за п. 1, де згадана сполука являє собою 1-[2-(2-трифторометилфенілсульфаніл)феніл]-[1,4]діазепан або його фармацевтично прийнятну кислотно-адитивну сіль.

17. Застосування за п. 1, де згадана сполука являє собою 1-[2-(3-метилфенілсульфаніл)феніл]-[1,4]діазепан або його фармацевтично прийнятну кислотно-адитивну сіль.

18. Застосування за п. 1, де згадана сполука являє собою 2-(4-метилфенілсульфаніл)феніл-1-піперазин або його фармацевтично прийнятну кислотно-адитивну сіль.

19. Застосування за п. 1, де згадана сполука являє собою 1-[2-(4-хлорофенілсульфаніл)феніл]піперазин або його фармацевтично прийнятну кислотно-адитивну сіль.

20. Застосування за п. 1, де згадана сполука являє собою 1-[2-(4-метоксифенілсульфаніл)-4-хлорофеніл]піперазин або його фармацевтично прийнятну кислотно-адитивну сіль.

21. Застосування за п. 1, де згадана сполука являє собою 1-[2-(4-метоксифенілсульфаніл)-4-метилфеніл]піперазин або його фармацевтично прийнятну кислотно-адитивну сіль.

22. Застосування за п. 1, де згадана сполука являє собою 1-[2-(4-метоксифенілсульфаніл)-5-метилфеніл]піперазин або його фармацевтично прийнятну кислотно-адитивну сіль.

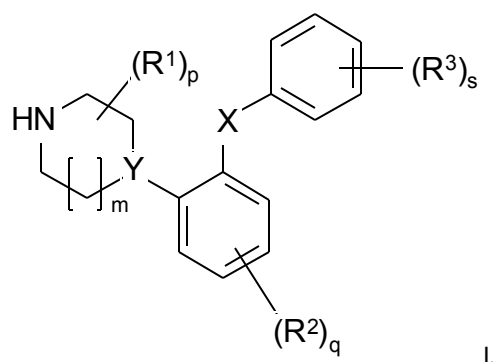
23. Застосування за п. 1, де згадана сполука являє собою 1-[2-(4-фторофенілсульфаніл)-5-метилфеніл]піперазин або його фармацевтично прийнятну кислотно-адитивну сіль.

24. Застосування за п. 1, де згадана сполука являє собою 1-[2-(4-метоксифенілсульфаніл)-5-трифторометилфеніл]піперазин або його фармацевтично прийнятну кислотно-адитивну сіль.

25. Застосування за п. 1, де згадана сполука являє собою 1-[2-(4-хлорофенілсульфаніл)феніл]-3-метилпіперазин або його фармацевтично прийнятну кислотно-адитивну сіль.

26. Застосування за п. 1, де згадана сполука являє собою 1-[2-(4-хлорофенілсульфаніл)феніл]-3,5-диметилпіперазин або його фармацевтично прийнятну кислотно-адитивну сіль.

27. Фармацевтична композиція, яка містить сполуку формули I



де

Y являє собою N;

X являє собою S;

m дорівнює 1 або 2;

p дорівнює 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 або 8;

q дорівнює 0, 1, 2, 3 або 4;

s дорівнює 1 або 2;

кожний R<sup>1</sup> є незалежно вибраним з групи, представленої C<sub>1-6</sub>-алкілом, або два R<sup>1</sup>, приєднані до одного й того ж атома вуглецю, можуть утворювати 3-6-членний спіроприєднаний циклоалкіл;

кожний R<sup>2</sup> є незалежно вибраним з груп, представлених галогеном, ціаногрупою, нітрогрупою, C<sub>1-6</sub>-алк(ен/ін)ілом, C<sub>1-6</sub>-алк(ен/ін)ілоксигрупою, C<sub>1-6</sub>-алк(ен/ін)ілсульфанілом, гідроксигрупою, гідрокси-C<sub>1-6</sub>-алк(ен/ін)ілом, галоген-C<sub>1-6</sub>-алк(ен/ін)ілом, галоген-C<sub>1-6</sub>-алк(ен/ін)ілоксигрупою, C<sub>3-8</sub>-циклоалк(ен)ілом, C<sub>3-8</sub>-циклоалк(ен)іл-C<sub>1-6</sub>-алк(ен/ін)ілом, ацилом, C<sub>1-6</sub>-алк(ен/ін)ілоксикарбонілом, C<sub>1-6</sub>-алк(ен/ін)ілсульфонілом або -NR<sup>x</sup>R<sup>y</sup>; -NR<sup>x</sup>CO-C<sub>1-6</sub>-алк(ен/ін)ілом;

кожний R<sup>3</sup> є вибраним з групи, що складається з галогену, C<sub>1-6</sub>-алкоксигрупи, C<sub>1-6</sub>-алкілсульфанілу, C<sub>1-6</sub>-алкілу, гідроксигрупи або трифторометилу;

де кожний R<sup>x</sup> і R<sup>y</sup> є незалежно вибраним з групи, представленої воднем, C<sub>1-6</sub>-алк(ен/ін)ілом, C<sub>3-8</sub>-циклоалк(ен)ілом, C<sub>3-8</sub>-циклоалк(ен)іл-C<sub>1-6</sub>-алк(ен/ін)ілом або арилом; або R<sup>x</sup> і R<sup>y</sup> разом з азотом, до якого вони приєднані, утворюють 3-7-членне кільце, яке необов'язково містить один додатковий гетероатом;

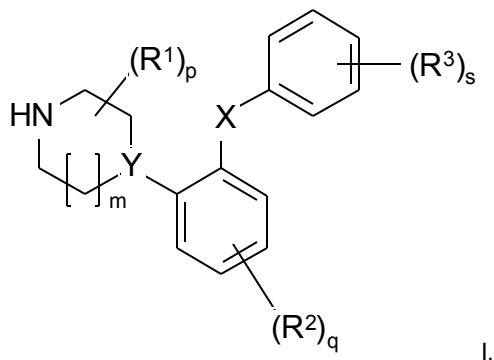
або її фармацевтично прийнятну кислотно-адитивну сіль і принаймні один фармацевтично прийнятний носій або розріджувач.

28. Фармацевтична композиція за п. 27, яка **відрізняється** тим, що p дорівнює 0, 1 або 2.

29. Фармацевтична композиція за п. 27, 28, яка **відрізняється** тим, що R<sup>1</sup> являє собою C<sub>1-6</sub>-алкіл.

30. Фармацевтична композиція за п. 27-29, яка **відрізняється** тим, що m дорівнює 1 або 2.

- [illegible]



де

Y являє собою N;

X являє собою S;

m дорівнює 1 або 2;

p дорівнює 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 або 8;

q дорівнює 0, 1, 2, 3 або 4;

s дорівнює 1 або 2;

кожний R<sup>1</sup> є незалежно вибраним з групи, представленої C<sub>1-6</sub>-алкілом, або два R<sup>1</sup>, приєднані до одного й того ж атома вуглецю, можуть утворювати 3-6-членний спіроприєднаний циклоалкіл;

кожний R<sup>2</sup> є незалежно вибраним з груп, представлених галогеном, ціаногрупою, нітрогрупою, C<sub>1-6</sub>-алк(ен/ін)ілом, C<sub>1-6</sub>-алк(ен/ін)ілоксигрупою, C<sub>1-6</sub>-алк(ен/ін)ілсульфанілом, гідроксигрупою, гідрокси-C<sub>1-6</sub>-алк(ен/ін)ілом, галоген-C<sub>1-6</sub>-алк(ен/ін)ілом, галоген-C<sub>1-6</sub>-алк(ен/ін)ілоксигрупою, C<sub>3-8</sub>-циклоалк(ен)ілом, C<sub>3-8</sub>-циклоалк(ен)іл-C<sub>1-6</sub>-алк(ен/ін)ілом, ацилом, C<sub>1-6</sub>-алк(ен/ін)ілоксикарбонілом, C<sub>1-6</sub>-алк(ен/ін)ілсульфонілом або -NR<sup>x</sup>R<sup>y</sup>; -NR<sup>x</sup>CO-C<sub>1-6</sub>-алк(ен/ін)ілом;

кожний R<sup>3</sup> є вибраним з групи, що складається з галогену, C<sub>1-6</sub>-алкоксигрупи, C<sub>1-6</sub>-алкілсульфанілу, C<sub>1-6</sub>-алкілу, гідроксигрупи або трифторометилу;

де кожний R<sup>x</sup>; R<sup>y</sup> є незалежно вибраним з групи, представленої воднем, C<sub>1-6</sub>-алк(ен/ін)ілом, C<sub>3-8</sub>-циклоалк(ен)ілом, C<sub>3-8</sub>-циклоалк(ен)іл-C<sub>1-6</sub>-алк(ен/ін)ілом або арилом; або R<sup>x</sup> і R<sup>y</sup> разом з азотом, до якого вони приєднані, утворюють 3-7-членне кільце, яке необов'язково містить один додатковий гетероатом;

або їх фармацевтично прийнятних кислотно-адитивних солей, для приготування лікарського засобу для лікування афективних розладів, таких як депресія, тривожні розлади, включаючи генералізований тривожний розлад, панічний розлад і обсесивно-компульсивний розлад.

54. Застосування за п. 53, де p дорівнює 0, 1 або 2.

55. Застосування за будь-яким з пп. 53-54, де R<sup>1</sup> являє собою C<sub>1-6</sub>-алкіл.

56. Застосування за будь-яким з пп. 53-55, де m дорівнює 1 або 2.

57. Застосування за будь-яким з пп. 53-56, де q дорівнює 0, 1 або 2.

58. Застосування за будь-яким з пп. 53-57, де R<sup>2</sup> являє собою трифторометил або C<sub>1-6</sub>-алкіл.

59. Застосування за п. 53, де згадана сполука вибрана з групи, що містить:

1-[2-(2-трифторометилфенілсульфаніл)феніл]піперазин,  
 1-[2-(4-бромфенілсульфаніл)феніл]піперазин,  
 1-[2-[4-(метилсульфаніл)фенілсульфаніл]феніл]піперазин,  
 1-[2-(4-гідроксифенілсульфаніл)феніл]піперазин,  
 1-[2-(2,4-диметилфенілсульфаніл)феніл]піперазин,  
 1-[2-(3,5-диметилфенілсульфаніл)феніл]піперазин,  
 1-[2-(2,6-диметилфенілсульфаніл)феніл]піперазин,  
 1-[2-(2,5-диметилфенілсульфаніл)феніл]піперазин,  
 1-[2-(2-трифторометилфенілсульфаніл)феніл]-[1,4]діазепан,  
 1-[2-(3-метилфенілсульфаніл)феніл]-[1,4]діазепан,  
 2-(4-метилфенілсульфаніл)феніл-1-піперазин,  
 1-[2-(4-хлорфенілсульфаніл)феніл]піперазин,  
 1-[2-(4-метоксифенілсульфаніл)-4-хлорфеніл]піперазин,  
 1-[2-(4-метоксифенілсульфаніл)-4-метилфеніл]піперазин,  
 1-[2-(4-метоксифенілсульфаніл)-5-метилфеніл]піперазин,  
 1-[2-(4-фторфенілсульфаніл)-5-метилфеніл]піперазин,  
 1-[2-(4-метоксифенілсульфаніл)-5-трифторометилфеніл]піперазин,  
 1-[2-(4-хлорфенілсульфаніл)феніл]-3-метилпіперазин,  
 1-[2-(4-хлорфенілсульфаніл)феніл]-3,5-диметилпіперазин  
 або їх фармацевтично прийнятні кислотно-адитивні солі.

60. Застосування за п. 53, де згадана сполука являє собою 1-[2-(2-трифторометилфенілсульфаніл)феніл]піперазин або його фармацевтично прийнятну кислотно-адитивну сіль.

61. Застосування за п. 53, де згадана сполука являє собою 1-[2-(4-бромфенілсульфаніл)феніл]піперазин або його фармацевтично прийнятну кислотно-адитивну сіль.

62. Застосування за п. 53, де згадана сполука являє собою 1-[2-[4-(метилсульфаніл)фенілсульфаніл]феніл]піперазин або його фармацевтично прийнятну кислотно-адитивну сіль.

63. Застосування за п. 53, де згадана сполука являє собою 1-[2-(4-гідроксифенілсульфаніл)феніл]піперазин або його фармацевтично прийнятну кислотно-адитивну сіль.

- [illegible]