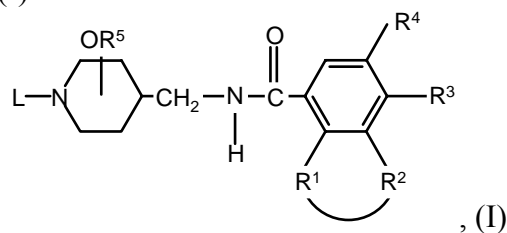


1. Сполука формули (I)



, (I)

її стереохімічно ізомерні форми, її N-оксидні форми або її фармацевтично прийнятні кислотні- або основно-адитивні солі,

де

$-R^1-R^2-$ являє собою двовалентний радикал формули

$-O-CH_2-O-$, (a-1)

$-O-CH_2-CH_2-$, (a-2)

$-O-CH_2-CH_2-O-$, (a-3)

$-O-CH_2-CH_2-CH_2-$, (a-4)

$-O-CH_2-CH_2-CH_2-O-$, (a-5)

$-O-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$, (a-6)

$-O-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-O-$, (a-7)

$-O-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$, (a-8)

де в зазначених двовалентних радикалах, при потребі, один або два атоми водню на одному або різних атомах вуглецю можуть бути замінені C_{1-6} -алкілом або гідроксигрупою,

R^3 являє собою водень, галоген, C_{1-4} -алкіл;

R^4 являє собою C_{1-6} -алкіл, C_{1-6} -алкіл, заміщений ціаногрупою або C_{1-6} -алкілоксигрупою, C_{1-6} -алкілоксигрупу, ціаногрупу, аміногрупу або моно- або ді(C_{1-6} -алкіл)аміногрупу;

R^5 являє собою водень або C_{1-6} -алкіл, а радикал $-OR^5$ розташовується в 3 або 4 положенні піперидинової складової;

L являє собою водень, або L являє собою радикал формули

$-Alk-R^6$, (b-1)

$-Alk-X-R^7$, (b-2)

$-Alk-Y-C(=O)-R^9$ (b-3) або

$-Alk-Z-C(=O)-NR^{11}R^{12}$, (b-4)

де кожен Alk являє собою C_{1-12} -алкандііл; та

R^6 являє собою водень, гідроксигрупу, ціаногрупу, C_{3-6} -циклоалкіл; C_{1-6} -алкілсульфоніламіногрупу, арил або Het;

R^7 являє собою C_{1-6} -алкіл, C_{1-6} -алкіл, заміщений гідроксигрупою, C_{3-6} -циклоалкіл, арил або Het;

X являє собою O, S, SO_2 або NR^8 , при цьому зазначений R^8 являє собою водень або C_{1-6} -алкіл;

R^9 являє собою водень, C_{1-6} -алкіл, C_{3-6} -циклоалкіл, гідроксигрупу або арил;

Y являє собою прямий зв'язок або NR^{10} , де R^{10} являє собою водень або C_{1-6} -алкіл;

Z являє собою прямий зв'язок, O, S або NR^{10} , де R^{10} являє собою водень або C_{1-6} -алкіл;

R^{11} та R^{12} являють собою, кожен незалежно, водень, C_{1-6} -алкіл, C_{3-6} -циклоалкіл, або

R^{11} та R^{12} , об'єднані з атомом азоту, до якого R^{11} та R^{12} приєднані, можуть утворювати піролідинілове, піперидинілове, піперазинілове або 4-морфолінілове кільце, при цьому обидва, при потребі, можуть бути замінені C_{1-6} -алкілом;

арил являє собою незаміщений феніл або феніл, заміщений одним, двома або трьома замісниками, кожен з яких незалежно один від одного вибраний з атома галогену, гідроксигрупи, C_{1-6} -алкілу, C_{1-6} -алкілоксигрупи, C_{1-6} -алкілкарбонілу, нітрогрупи, трифторметилу, аміногрупи, амінокарбонілу та аміносульфонілу, та

Het являє собою фураніл, фураніл, заміщений C_{1-6} -алкілом або галогеном,

тетрагідрофураніл, тетрагідрофураніл, заміщений C₁₋₆-алкілом, діоксоланіл, діоксоланіл, заміщений C₁₋₆-алкілом, діоксаніл, діоксаніл, заміщений C₁₋₆-алкілом, тетрагідропіраніл, тетрагідропіраніл, заміщений C₁₋₆-алкілом, 2,3-дигідро-2-оксо-1Н-імідазоліл, 2,3-дигідро-2-оксо-1Н-імідазоліл, заміщений одним або двома замісниками, вибраними, кожен незалежно, з галогену або C₁₋₆-алкілу, піролідиніл, піролідиніл, заміщений одним або двома замісниками, вибраними, кожен незалежно, з галогену, гідроксигрупи або C₁₋₆-алкілу, піридиніл, піридиніл, заміщений одним або двома замісниками, вибраними, кожен незалежно, з галогену, гідроксигрупи або C₁₋₆-алкілу, піримідиніл, піримідиніл, заміщений одним або двома замісниками, вибраними, кожен незалежно, з галогену, гідроксигрупи або C₁₋₆-алкілу, піридазиніл, піридазиніл, заміщений одним або двома замісниками, вибраними, кожен незалежно, з гідроксигрупи, C₁₋₆-алкілоксигрупи, C₁₋₆-алкілу або галогену, піразиніл, піразиніл, заміщений одним або двома замісниками, вибраними, кожен незалежно, з гідроксигрупи, C₁₋₆-алкілоксигрупи, C₁₋₆-алкілу або галогену.

2. Сполука за п. 1, яка **відрізняється** тим, що -R¹-R²- являє собою двовалентний радикал формули

-O-CH₂-CH₂-O-, (a-3)

-O-CH₂-CH₂-CH₂-O-, (a-5)

R³ являє собою водень, галоген, C₁₋₄-алкіл;

R⁴ являє собою C₁₋₆-алкіл, C₁₋₆-алкіл, заміщений ціаногрупою або C₁₋₆-алкілоксигрупою, C₁₋₆-алкілоксигрупу, ціаногрупу, аміногрупу або моно- або ді(C₁₋₆-алкіл)аміногрупу;

R⁵ являє собою водень або C₁₋₆-алкіл, та радикал -OR⁵ розташовується в положенні 3 або 4 піперидинової групи;

L являє собою водень, або L являє собою радикал формули

-Alk-R⁶, (b-1)

-Alk-X-R⁷, (b-2)

-Alk-Y-C(=O)-R⁹ (b-3) або

-Alk-Z-C(=O)-NR¹¹R¹², (b-4)

де кожен Alk являє собою C₁₋₁₂-алкандііл; і

R⁶ являє собою водень, гідроксигрупу, ціаногрупу, C₃₋₆-циклоалкіл, C₁₋₆-алкілсульфоніламіногрупу, арил або Het;

R⁷ являє собою C₁₋₆-алкіл, C₁₋₆-алкіл, заміщений гідроксигрупою, C₃₋₆-циклоалкіл, арил або Het;

X являє собою O, S, SO₂ або NR⁸, причому зазначений R⁸ являє собою водень або C₁₋₆-алкіл;

R⁹ являє собою C₁₋₆-алкіл або гідроксигрупу;

Y являє собою прямий зв'язок;

Z являє собою прямий зв'язок або O;

R¹¹ та R¹² являють собою, кожен незалежно, водень або C₁₋₆-алкіл, або R¹¹ та R¹², об'єднані з атомом азоту, до якого приєднані R¹¹ та R¹², можуть утворювати піролідиніл або піперазиніл, заміщений C₁₋₆-алкілом;

арил представляє незаміщений феніл або феніл, заміщений 1, 2 або 3 замісниками, вибраними, кожен незалежно, з галогену, гідроксигрупи, C₁₋₆-алкілу, C₁₋₆-алкілоксигрупи та аміносульфонілу; та

Het являє собою тетрагідрофураніл, тетрагідрофураніл, заміщений C₁₋₆-алкілом, діоксоланіл, діоксоланіл, заміщений C₁₋₆-алкілом, піридиніл, піридиніл, заміщений одним або двома замісниками, вибраними, кожен незалежно, з галогену, гідроксигрупи, C₁₋₆-алкілу, піримідиніл, піримідиніл, заміщений одним або двома замісниками, вибраними, кожен незалежно, з галогену, гідроксигрупи або C₁₋₆-алкілу, піридазиніл, піридазиніл, заміщений одним або двома замісниками, вибраними, кожен незалежно, з гідроксигрупи, C₁₋₆-алкілоксигрупи, C₁₋₆-алкілу або галогену; піразиніл, піразиніл, заміщений одним або двома

замісниками, вибраними, кожен незалежно, з гідроксигрупи, C₁₋₆-алкілоксигрупи, C₁₋₆-алкілу або галогену.

3. Сполука за п. 1 або п. 2, яка **відрізняється** тим, що радикал -OR⁵ розташовується в положенні 3 піперидинової групи, що має трансконфігурацію.

4. Сполука за п. 3, яка **відрізняється** тим, що абсолютною конфігурацією зазначеної піперидинової групи є (3S,4S)-конфігурація.

5. Сполука за будь-яким з попередніх пунктів, яка **відрізняється** тим, що -R¹-R²- являє собою радикал формули (a-5), R³ являє собою водень, R⁴ являє собою метил, та R⁵ являє собою водень.

6. Сполука за п. 5, яка **відрізняється** тим, що L являє собою радикал формули (b-2), де X являє собою O, Alk являє собою C₁₋₄-алкандііл, та R⁷ являє собою C₁₋₆-алкіл.

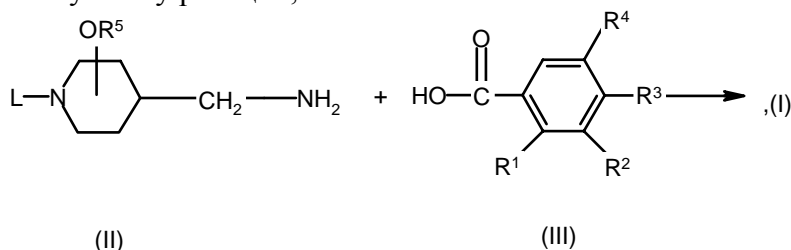
7. Сполука за п. 1, яка **відрізняється** тим, що є сполукою (3S-транс)-8-метил-3,4-дигідро-2H-бензо[b][1,4]діоксипін-6-карбоксильна кислота [3-гідрокси-1-(3-метоксипропіл)-піперидин-4-ілметил]-амідом або її фармацевтично прийнятною кислотно-адитивною сіллю.

8. Фармацевтична композиція, що містить фармацевтично прийнятний носій та терапевтично ефективну кількість сполуки за будь-яким з пп. 1-7.

9. Спосіб одержання фармацевтичної композиції за п. 8, де терапевтично ефективну кількість сполуки за будь-яким з пп. 1-7 ретельно змішують з фармацевтично прийнятним носієм.

10. Сполука за будь-яким з пп. 1-7 для застосування як лікарського засобу.

11. Спосіб одержання сполуки формули (I), при якому проміжну сполуку формули (II) піддають реакції з похідним карбонової кислоти формули (III) або її функціональним похідним, здатним вступати у реакцію;



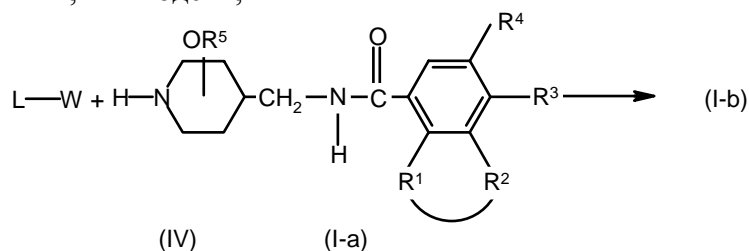
де радикали -R¹-R²-, R³, R⁴, R⁵ та L мають значення, визначені в п. 1;

або сполуки формули (I) перетворюють одну в іншу за допомогою відомих з рівня техніки реакцій перетворення; або,

якщо бажано, сполуку формули (I) перетворюють у фармацевтично прийнятну адитивну сіль, або, навпаки, адитивну сіль кислоти сполуки формули (I) перетворюють лугом у форму вільної основи;

та при цьому, якщо бажано, одержують її стереохімічно ізомерну форму.

12. Спосіб одержання сполуки формули (I), при якому проміжну сполуку формули (V) N-алкілюють сполукою формули (I-a), визначеною як сполука формули (I), де L являє собою водень, у розчиннику, інертному для реакції, та, при потребі, у присутності придатної основи, причому в такий спосіб одержують сполуки формули (I-b), визначені як сполуки формули (I), де L інший, ніж водень,



де радикали -R¹-R²-, R³, R⁴, R⁵ та L мають значення, визначені в п. 1, та W являє собою придатну кінцеву групу;

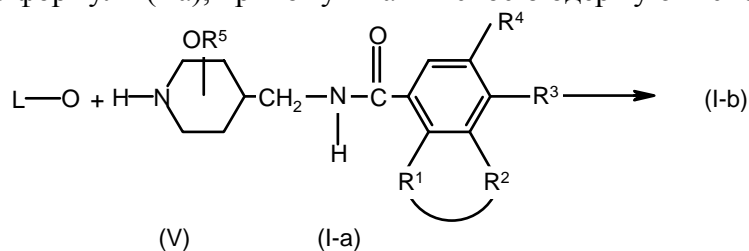
або сполуки формули (I) перетворюють одну в іншу за допомогою відомих з рівня техніки реакцій перетворення; або,

якщо бажано, сполуку формули (I) перетворюють у фармацевтично прийнятну адитивну сіль,

або, навпаки, адитивну сіль кислоти сполуки формули (I) перетворюють лугом у форму вільної основи;

та при цьому, якщо бажано, одержують її стереохімічно ізомерну форму.

13. Спосіб одержання сполуки формули (I), при якому відповідний проміжний кетон або проміжний альдегід формули $L'=O$ (V), причому зазначений $L'=O$ являє собою сполуки формули L-H, де два гем-атоми водню в C_{1-12} -аландіільній групі замінені $=O$, піддають реакції зі сполукою формули (I-a), причому в такий спосіб одержують сполуки формули (I-b)



де радикали $-R^1-R^2-$, R^3 , R^4 , R^5 та L мають значення, визначені в п. 1;

або сполуки формули (I) перетворюють одну в іншу за допомогою відомих з рівня техніки реакцій перетворення; або,

якщо бажано, сполуку формули (I) перетворюють у фармацевтично прийнятну адитивну сіль, або, навпаки,

адитивну сіль кислоти сполуки формули (I) перетворюють лугом у форму вільної основи;

та при цьому, якщо бажано, одержують її стереохімічно ізомерну форму.