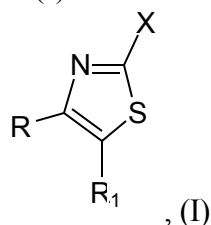


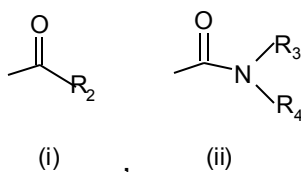
## 1. Застосування сполуки формули (I)



де

- R та R<sub>1</sub> однакові або різні та представляють феніл або піридиніл, який може бути заміщений 1-3 замісниками Y, де Y представляє замісник з групи метил, етил, пропіл, метокси, етокси, гідрокси, гідроксиметил, гідроксietил, хлор, йод, бром, фтор, трифторметил, трифторметокси, метилсульфоніл, метилсульфаніл, трифторметилсульфоніл, феніл або ціан, за умови, що X не представляє підгрупу (ii),

або одна з частин R та R<sub>1</sub> представляє фенільну або піридинільну групу, яка може бути заміщена 1-3 замісниками Y, де Y має вищенаведені значення, а інша частина представляє атом водню або C<sub>1-8</sub> розгалужену або лінійну алкільну групу, C<sub>3-8</sub> розгалужену або лінійну гетероалкільну групу, що містить один гетероатом з групи (N, O, S), C<sub>3-7</sub> циклоалкільну групу, C<sub>3-7</sub>-циклоалкіл-C<sub>1-3</sub>-алкільну групу, C<sub>3-7</sub>-гетероциклоалкіл-C<sub>1-3</sub>-алкільну групу, які можуть бути заміщені гідрокси, метокси, метильною, трифторметилсульфонільною або трифторметильною групою, або атомом фтору, причому C<sub>3-7</sub>-гетероциклоалкіл-C<sub>1-3</sub>-алкільна група містить один або два гетероатоми з групи (O, N, S), або зазначена інша частина містить бензильну групу, яка може бути заміщена у фенільному кільці 1-3 замісниками Y, де Y має вищенаведене значення, X представляє одну з підгруп (i) або (ii),



де

- R<sub>2</sub> представляє C<sub>1-8</sub> розгалужену або лінійну алкільну групу, C<sub>3-7</sub>-циклоалкільну групу, C<sub>3-7</sub>-циклоалкіл-C<sub>1-2</sub>-алкільну групу, C<sub>3-7</sub>-гетероциклоалкіл-C<sub>1-2</sub>-алкільну групу, причому ці групи можуть бути заміщені гідрокси, метильною або трифторметильною групою, або атомом фтору, а C<sub>3-7</sub>-гетероциклоалкіл-C<sub>1-2</sub>-алкільна група містить один або два гетероатоми з групи (O, N, S), або R<sub>2</sub> представляє фенільну, бензильну, фенетильну або фенілпропильну групу, яка може бути заміщена у фенільному кільці 1-3 замісниками Y, де Y має вищенаведене значення, або R<sub>2</sub> представляє піридинільну, тієнільну або нафтильну групу, причому нафтильна група може бути заміщена атомом галогену, метильною групою або метокси або трифторметильною групою,

- R<sub>3</sub> представляє атом водню або розгалужену або лінійну C<sub>1-3</sub> алкільну групу,

- R<sub>4</sub> представляє водень, розгалужену або лінійну C<sub>1-10</sub> алкільну або C<sub>3-8</sub>-циклоалкіл-C<sub>1-2</sub>-алкільну групу, розгалужену або лінійну C<sub>1-10</sub> алкокси, C<sub>3-8</sub>-циклоалкільну, C<sub>5-10</sub> біциклоалкільну, C<sub>5-10</sub>-біциклоалкіл-C<sub>1-2</sub>-алкільну, C<sub>6-10</sub>-трициклоалкільну, C<sub>6-10</sub>-трициклоалкілметильну, розгалужену або лінійну C<sub>3-10</sub> алкенільну, C<sub>5-8</sub> циклоалкенільну групу, причому ці групи можуть містити один або більше гетероатомів з групи (O, N, S) і можуть бути заміщені гідроксигрупою, 1-3 метильними групами, етильною групою або 1-3 атомами фтору, або R<sub>4</sub> представляє фенільну, феніламінову, фенокси, бензильну, фенетильну або фенілпропильну групу, які можуть бути заміщені у фенільному кільці 1-3 замісниками Y, де Y має вищенаведене значення, або R<sub>4</sub> представляє піридинільну або тієнільну групу, або R<sub>4</sub> представляє групу NR<sub>5</sub>R<sub>6</sub>, де

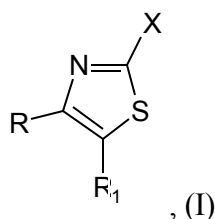
R<sub>5</sub> та R<sub>6</sub> разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, утворюють насичену або ненасичену, моноциклічну або біциклічну, гетероциклічну групу з 4-10 атомами у кільці, яка

містить один або більше гетероатомів з групи (O, N, S) і може бути заміщена розгалуженою або лінійною C<sub>1-3</sub> алкільною, фенільною, гідрокси або трифторметильною групою або атомом фтору, або R<sub>3</sub> та R<sub>4</sub> разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, утворюють насичену або ненасичену, моноциклічну або біциклічну, гетероциклічну групу з 4-10 атомами у кільці, яка містить один або більше гетероатомів з групи (O, N, S) і може бути заміщена розгалуженою або лінійною C<sub>1-3</sub> алкільною, фенільною, аміно, гідрокси, метокси, ціано або трифторметильною групою або атомом фтору або хлору,

та їх фармакологічно прийнятні солі, а також пролікарські речовини, що є похідними сполук формули (I), де присутня група, яка легко видаляється після потрапляння до організму, **в**ибрані з-поміж амідину, енаміну, основи Манніха, похідного гідроксиметилєну, похідного O-(ацилоксиметилєнкарбамату), карбамату або енаміну,

для виготовлення фармацевтичної композиції для лікування психозу, бентежності, депресії, дефіциту уваги, розладів пам'яті, гіперсексуальності, алкоголізму, наркозалежності, дистонії, м'язових спазмів, дрижавки, хвороби Паркінсона, епілепсії, хвороби Гантінгтона, синдрому Туретта, травми хребта, вірусного енцефаліту, больових синдромів, септичного шоку, глаукоми, раку, блювання, нудоти, сексуальних розладів та діареї.

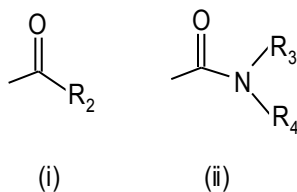
## 2. Сполука формули (I)



де

- R та R<sub>1</sub> однакові або різні та представляють феніл, 3-піридиніл або 4-піридиніл, який може бути заміщений 1-3 замісниками Y, де Y представляє замісник з групи метил, етил, пропіл, метокси, етокси, гідрокси, гідрокс**и**метил, гідроксіетил, хлор, йод, бром, фтор, трифторметил, трифторметокси, метилсульфоніл, метилсульфаніл, трифторметилсульфоніл, феніл або ціан, за умови, що X не представляє підгрупу (ii),

або одна з частин R та R<sub>1</sub> представляє фенільну, 3-піридинільну або 4-піридинільну групу, яка може бути заміщена 1-3 замісниками Y, де Y має вищенаведені значення, а друга частина представляє C<sub>2-8</sub> розгалужену або лінійну алкільну групу, C<sub>3-8</sub> розгалужену або лінійну гетероалкільну групу, що містить один гетероатом з групи (N, O, S), C<sub>3-7</sub> циклоалкільну групу, C<sub>3-7</sub>-циклоалкіл-C<sub>1-3</sub>-алкільну групу, C<sub>3-7</sub>-гетероциклоалкіл-C<sub>1-3</sub>-алкільну групу, причому ці групи можуть бути заміщені гідрокси, метокси, метильною, трифторметилсульфонільною або трифторметильною групою або атомом фтору, а C<sub>3-7</sub>-гетероциклоалкіл-C<sub>1-3</sub>-алкільна група містить один або два гетероатоми з групи (O, N, S), або зазначена друга частина представляє бензильну групу, яка може бути заміщена у фенільному кільці 1-3 замісниками Y, де Y має вищенаведені значення, X представляє одну з підгруп (i) або (ii),



де

- R<sub>2</sub> представляє C<sub>3-8</sub> розгалужену або лінійну алкільну групу, C<sub>3-7</sub> циклоалкільну групу, C<sub>3-7</sub>-циклоалкіл-C<sub>1-2</sub>-алкільну групу, C<sub>3-7</sub>-гетероциклоалкіл-C<sub>1-2</sub>-алкільну групу, які можуть бути заміщені гідрокси, метильною або трифторметильною групою або атомом фтору, а C<sub>3-7</sub>-гетероциклоалкіл-C<sub>1-2</sub>-алкільна група містить один або два гетероатоми з групи (O, N, S), або R<sub>2</sub> представляє фенільну, бензильну, фенетильну або фенілпропильну групу, яка може бути заміщена у фенільному кільці 1-3 замісниками Y, де Y має вищенаведені значення, або R<sub>2</sub> представляє піридинільну, тієнільну або нафтильну групу, причому нафтильна група може бути заміщена атомом галогену, метильною групою або метокси або

трифторметильною групою за умови, що, коли R<sub>2</sub> представляє феніл, R не є фенільна, 4-хлорфенільна, 4-метилфенільна або 4-метоксифенільна група,

- R<sub>3</sub> представляє атом водню або розгалужену або лінійну C<sub>1-3</sub> алкільну групу,

- R<sub>4</sub> представляє розгалужену або лінійну C<sub>1-10</sub> алкільну або C<sub>3-8</sub>-циклоалкіл-C<sub>1-2</sub>-алкільну групу, розгалужену або лінійну C<sub>1-10</sub>алкокси, C<sub>3-8</sub>циклоалкільну, C<sub>5-10</sub>біциклоалкільну, C<sub>5-10</sub>-біциклоалкіл-C<sub>1-2</sub>-алкільну C<sub>6-10</sub> трициклоалкільну, C<sub>6-10</sub> трициклоалкілметильну, розгалужену або лінійну C<sub>3-10</sub> алкенільну, C<sub>5-8</sub> циклоалкенільну групу, причому ці групи можуть містити один або більше гетероатомів з групи (O, N, S) і можуть бути заміщені гідроксигрупою, 1-3 метильними групами, етильною групою або 1-3 атомами фтору, або R<sub>4</sub> представляє фенільну, феніламінову, фенокси, бензильну, фенетильну або фенілпропільну групу, які можуть бути заміщені у фенільному кільці 1-3 замісниками Y, де

- Y має вищенаведені значення, або R<sub>4</sub> представляє піридинільну або тієнільну групу, або R<sub>4</sub> представляє групу NR<sub>5</sub>R<sub>6</sub>, де R<sub>5</sub> та R<sub>6</sub> разом з атомом водню, до якого вони приєднані утворюють насичену або ненасичену, моноциклічну або біциклічну, гетероциклічну групу з 4-10 атомами у кільці, причому ця гетероциклічна група містить один або більше гетероатомів з групи (O, N, S) і може бути заміщена розгалуженою або лінійною C<sub>1-3</sub> алкільною, фенільною, гідрокси або трифторметильною групою або атомом фтору, або R<sub>4</sub> представляє групу NR<sub>5</sub>R<sub>6</sub>, де R<sub>5</sub> та R<sub>6</sub> разом з атомом водню, до якого вони приєднані, утворюють насичену або ненасичену, моноциклічну або біциклічну, гетероциклічну групу з 4-10 атомами у кільці, причому ця гетероциклічна група містить один або більше гетероатомів з групи (O, N, S) і може бути заміщена розгалуженою або лінійною C<sub>1-3</sub> алкільною, фенільною, аміною, гідрокси, метокси, ціано або трифторметильною групою або атомом фтору або хлору,

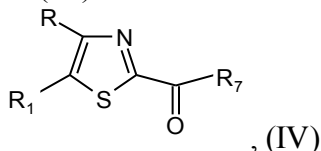
та їх фармакологічно прийнятні солі, а також пролікарські речовини, що є похідними сполук формули (I), де присутня група, яка легко видаляється після потрапляння до організму, **вибрані** з-поміж амідину, енаміну, **основи** Манніха, похідного гідроксиметилену, похідного O-(ацилоксиметиленкарбамату), карбамату або енаміну,

3. Сполука за п. 2 або її сіль для застосування **як** лікарського засобу.

4. Фармацевтична композиція, яка містить принаймні одну сполуку за п. 2 **як** діючу речовину.

5. Застосування сполуки за п. 2 для виготовлення фармацевтичної композиції для лікування таких хвороб, як психоз, бентежність, депресія, дефіцит уваги, розлади пам'яті, розлади сприйняття, відсутність апетиту, опасистість, алкоголізм, гіперсексуальність, наркозалежність, нейродегенеративні розлади, недоумство, дистонія, м'язові спазми, дрижка, епілепсія, множинний склероз, травматичні пошкодження мозку, інсульт, хвороба Паркінсона, хвороба Альцгеймера, хвороба Гантінгтона, синдром Туретта, мозкова ішемія, церебральна апоплексія, черепно-мозкова травма, травми хребта, бляшковий склероз, вірусний енцефаліт, розлади демієлінізації, лікування септичного шоку, глаукоми, раку, діабету, блювання, нудоти, астми, респіраторних захворювань, шлунково-кишкових захворювань, виразки шлунку, діареї та серцево-судинних захворювань.

6. Сполука загальної формули (IV)



де один з R та R<sub>1</sub> представляє фенільну, або 3-піридинільну, або 4-піридинільну групу, яка може бути заміщена 1-3 замісниками Y, де Y має значення, наведені вище, а друга частина представляє C<sub>2-8</sub> розгалужену або лінійну алкільну групу, C<sub>3-8</sub> розгалужену або лінійну гетероалкільну групу, що містить один гетероатом з групи (N, O, S) або групу SO<sub>2</sub>, C<sub>3-7</sub> циклоалкільну групу, C<sub>3-7</sub>-циклоалкіл-C<sub>1-3</sub>-алкільну групу, C<sub>3-7</sub>-гетероциклоалкіл-C<sub>1-3</sub>-алкільну групу, причому ці групи можуть бути заміщені гідрокси, метокси, метильною, трифторметилсульфонільною або трифторметильною групою або атомом фтору, а C<sub>3-7</sub>-гетероциклоалкіл-C<sub>1-3</sub>-алкільна група містить один або два гетероатоми з групи (O, N, S), або

зазначена друга частина представляє бензильну групу, яка може бути заміщена у фенільному кільці 1-3 замісниками Y, де Y має вищенаведене значення, а R<sub>7</sub> представляє гідрокси, C<sub>1-4</sub> розгалужену або лінійну алкоксигрупу, або бензилоксигрупу, або атом хлору, або N-метокси-N-метиламінову групу, причому ці сполуки можуть застосовуватися при синтезі сполук загальної формули (I).