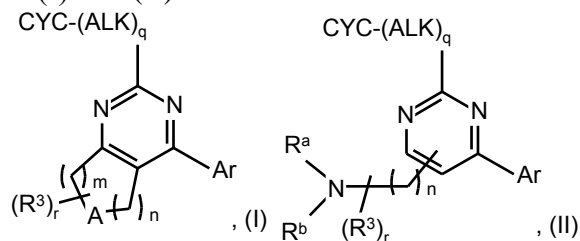


1. Сполука Формули (I) або (II):



де

m означає 1, 2 або 3;

n означає 1, 2 або 3;

коли m та n присутні, сума m+n є більшою ніж або дорівнює 2 та є меншою ніж або дорівнює 4;

R^a та R^b незалежно являють собою -H, -C₁₋₇алкіл або -C₃₋₇циклоалкіл, або R^a та R^b, взяті разом з азотом приєднання, утворюють піперидиніл, піролідиніл, морфолініл, тіоморфолініл або піперазиніл, де кожний R^a та R^b необов'язково та незалежно заміщений -C₁₋₄алкілом;

q означає 0 або 1;

A являє собою >NR¹, >CHNR^cR^d, >CHOH або -CH₂-, де

R¹ вибраний з групи, що включає -H, -C₁₋₇алкіл, -C₃₋₇циклоалкіл та бензил, де кожний алкіл, циклоалкіл або бензил є необов'язково моно-, ди- або тризаміщений R^e;

R^e вибраний з групи, що включає -C₁₋₄алкіл, -C₂₋₄алкеніл, -C₂₋₄алкініл, -C₃₋₆циклоалкіл, галоген, -CF₃, -OH, -OC₁₋₄алкіл, -OCF₃, -N(R^f)R^g (де R^f та R^g незалежно являють собою -H або -C₁₋₄алкіл, або R^f та R^g, взяті разом з азотом приєднання, утворюють піперидиніл, піролідиніл, морфолініл, тіоморфолініл або піперазиніл), -C(O)N(R^f)R^g, -N(R^h)C(O)R^h, -N(R^h)SO₂C₁₋₇алкіл (де R^h являє собою -H або -C₁₋₄алкіл, або два R^h в одному заміснику, взяті разом з амідом приєднання, утворюють інше аліфатичне 4-6-членне кільце), -S(O)₀₋₂-C₁₋₄алкіл, -SO₂N(R^f)R^g, -SCF₃, -C(O)C₁₋₄алкіл, -CN, -COOH та -COOC₁₋₄алкіл;

R^c та R^d незалежно вибрані з групи, що включає -H, -C₁₋₇алкіл, -C₃₋₇алкеніл, -C₃₋₇алкініл, -C₃₋₇циклоалкіл, -C₁₋₇алкілC₃₋₇циклоалкіл та -C₃₋₇циклоалкілC₁₋₇алкіл, або R^c та R^d, взяті разом з азотом приєднання, утворюють піперидиніл, піролідиніл, морфолініл, тіоморфолініл або піперазиніл, де кожний R^c та R^d необов'язково та незалежно заміщений R^e;

R³ являє собою -C₁₋₄алкіл, -C₁₋₄алкеніл або бензил, кожний необов'язково заміщений -C₁₋₃алкілом, -OH або галогеном, або два замісники R³, взяті разом, утворюють C₂₋₅алкілен, необов'язково заміщений -C₁₋₃алкілом, -OH або галогеном;

r означає 0 або ціле число, яке менше ніж або дорівнює сумі m+n+1;

Ag являє собою арильне або гетероарильне кільце, вибране з групи, що включає:

a) феніл, необов'язково моно-, ди- або тризаміщений Rⁱ або дизаміщений на сусідніх атомах вуглецю -OC₁₋₄алкіленO-, -(CH₂)₂₋₃NH-, -(CH₂)₁₋₂NH(CH₂)-, -(CH₂)₂₋₃N(C₁₋₄алкіл)- або -(CH₂)₁₋₂N(C₁₋₄алкіл)(CH₂)-;

Rⁱ вибраний з групи, що включає -C₁₋₇алкіл, -C₂₋₇алкеніл, -C₂₋₇алкініл, -C₃₋₇циклоалкіл, галоген, -CF₃, -OH, -OC₁₋₇алкіл, -OCF₃, -OC₃₋₇алкеніл, -OC₃₋₇алкініл, -N(R^j)R^k (де R^j та R^k незалежно являють собою -H або -C₁₋₄алкіл), -C(O)N(R^j)R^k, -N(R^j)C(O)R^k, -N(R^j)SO₂C₁₋₆алкіл, -S(O)₀₋₂C₁₋₆алкіл, -SO₂N(R^j)R^k, -SCF₃, -C(O)C₁₋₆алкіл, -NO₂, -CN, -COOH та -COOC₁₋₇алкіл;

b) моноциклічну ароматичну вуглеводневу групу, що містить п'ять кільцевих атомів, містить атом вуглецю, який є точкою приєднання, містить один атом вуглецю, замінений на >O, >S, >NH або >N(C₁₋₄алкіл), містить до двох додаткових атомів вуглецю, необов'язково замічених на -N=, необов'язково моно- або дизаміщену Rⁱ;

(c) моноциклічну ароматичну вуглеводневу групу, що містить шість кільцевих атомів, містить атом вуглецю, який є точкою приєднання, містить один або два атоми вуглецю, замінені на -N=, необов'язково моно- або дизаміщену Rⁱ; та

(d) феніл або піридил, заміщений замісником, вибраним з групи, що включає феніл,

фенокси, піридил, тіофеніл, оксазоліл та тетразоліл, де одержаний заміщений компонент необов'язково додатково моно-, ди- або тризаміщений R^i ;

ALK являє собою розгалужений або нерозгалужений C_{1-7} алкілен, C_{2-7} алкенілен, C_{2-7} алкінілен, C_{3-7} циклоалкілен або C_{3-7} циклоалкенілен, необов'язково моно-, ди- або тризаміщений R^m ;

R^m вибраний з групи, що включає галоген, $-CF_3$, $-OH$, $-OC_{1-7}$ алкіл, $-OC_{3-7}$ циклоалкіл, $-OCF_3$, $-N(R^p)R^s$ (де R^p та R^s незалежно являють собою $-H$ або $-C_{1-7}$ алкіл), $-C(O)N(R^p)R^s$, $-N(R^t)C(O)R^t$, $-N(R^t)SO_2C_{1-6}$ алкіл (де R^t являє собою $-H$ або $-C_{1-7}$ алкіл), $-S(O)_{0-2}C_{1-6}$ алкіл, $-SO_2N(R^p)R^s$, $-SCF_3$, $-CN$, $-NO_2$, $-C(O)C_{1-7}$ алкіл, $-COOH$ та $-COOC_{1-7}$ алкіл;

CYC являє собою $-H$ або кільцеву систему, вибрану з групи, що включає:

i) феніл, необов'язково моно-, ди- або тризаміщений R^u або дизаміщений на сусідніх атомах вуглецю $-OC_{1-4}$ алкіленО-, $-(CH_2)_{2-3}NH-$, $-(CH_2)_{1-2}NH(CH_2)-$, $-(CH_2)_{2-3}N(C_{1-4}$ алкіл)- або $-(CH_2)_{1-2}N(C_{1-4}$ алкіл)(CH_2)-;

R^u вибраний з групи, що включає C_{1-4} алкіл, $-C_{3-7}$ циклоалкіл, феніл, бензил, галоген, $-CF_3$, $-OH$, $-OC_{1-7}$ алкіл, $-OC_{3-7}$ циклоалкіл, $-O$ феніл, $-O$ бензил, $-OCF_3$, $-N(R^v)R^w$ (де R^v та R^w незалежно являють собою $-H$ або $-C_{1-7}$ алкіл, або R^v та R^w , взяті разом з азотом приєднання, утворюють піперидиніл, піролідиніл, морфолініл, тіоморфолініл або піперазиніл, де кожний R^v та R^w необов'язково та незалежно заміщений $-OH$ або $-C_{1-7}$ алкілом), $-C(O)N(R^v)R^w$, $-N(R^x)C(O)R^x$, $-N(R^x)SO_2C_{1-6}$ алкіл (де R^x являє собою $-H$ або $-C_{1-7}$ алкіл, або два R^x в одному заміснику, взяті разом з амідом приєднання, утворюють інше аліфатичне 4-6-членне кільце), $-N(SO_2C_{1-6}$ алкіл) $_2$, $-S(O)_{0-2}C_{1-6}$ алкіл, $-SO_2N(R^v)R^w$, $-SCF_3$, $-C(O)C_{1-6}$ алкіл, $-NO_2$, $-CN$, $-COOH$ та $-COOC_{1-7}$ алкіл;

ii) моноциклічну ароматичну вуглеводневу групу, що містить п'ять кільцевих атомів, містить атом вуглецю, який є точкою приєднання, містить один атом вуглецю, замінений на $>O$, $>S$, $>NH$ або $>N(C_{1-4}$ алкіл), містить до одного додаткового атома вуглецю, необов'язково заміненого на $-N=$, необов'язково моно- або дизаміщену R^u ;

iii) моноциклічну ароматичну вуглеводневу групу, що містить шість кільцевих атомів, містить атом вуглецю, який є точкою приєднання, містить один або два атоми вуглецю, замінені на $-N-$, необов'язково моно- або дизаміщену R^u ; та

iv) неароматичне гетероциклічне кільце, що містить 4-8 членів, зазначене кільце містить 0, 1 або 2 несуміжні гетероатомні члени, вибрані з групи, що включає O , S , $-N=$, $>NH$ та $>N(C_{1-4}$ алкіл), містить 0, 1 або 2 подвійні зв'язки, містить 0, 1 або 2 вуглецеві члени, які є карбонілом, необов'язково містить один вуглецевий член, який утворює місток, містить 0-5 замісників R^u , та де, коли q означає 0, зазначене кільце містить атом вуглецю, який є точкою приєднання;

та її енантіомери, діастереомери, гідрати, сольвати та фармацевтично прийнятні солі, ефіри та аміді;

за умови, що у Формулі (I):

(a) коли ALK являє собою метилен, етилен, пропілен або ізопропілен, CYC являє собою $-H$, Ag являє собою феніл або монозаміщений феніл, m означає 2, n означає 1, та A являє собою $>NR^1$, тоді R^1 не являє собою $-C_{1-4}$ алкіл або бензил;

(b) коли q означає 0, CYC являє собою феніл, Ag являє собою феніл або 3-хлорфеніл, m означає 2, та n означає 1, тоді A не являє собою незаміщений $-CH_2-$; та

(c) коли q означає 0, CYC являє собою 2-піридил, Ag являє собою 2-піридил, m означає 2, та n означає 1, тоді A не являє собою незаміщений $-CH_2-$.

2. Сполука за пунктом 1, де m означає 1 та n означає 1.

3. Сполука за пунктом 1, де m означає 1 та n означає 2.

4. Сполука за пунктом 1, де m означає 2 та n означає 1.

5. Сполука за пунктом 1, де m означає 2 та n означає 2.

6. Сполука за пунктом 1, де m означає 1 та n означає 3.

7. Сполука за пунктом 1, де m означає 3 та n означає 1.

8. Сполука за пунктом 1, де n означає 1 у Формулі (II).
9. Сполука за пунктом 1, де n означає 2 у Формулі (II).
10. Сполука за пунктом 1, де q означає 1.
11. Сполука за пунктом 1, де $-N(R^a)R^b$ являє собою аміно, метиламіно, етиламіно, ізопропіламіно, диметиламіно, діетиламіно, діізопропіламіно, циклопропіламіно, циклопентиламіно, піперидиніл, піролідиніл, морфолініл, тіоморфолініл або піперазиніл.
12. Сполука за пунктом 1, де $-N(R^a)R^b$ являє собою аміно, метиламіно, диметиламіно або N-метилпіперазиніл.
13. Сполука за пунктом 1, де A являє собою $>NR^1$.
14. Сполука за пунктом 1, де R^1 вибраний з групи, що включає водень, метил, етил, ізопропіл, бутил, гексил, циклопропіл, циклобутил, циклопентил та бензил, кожний необов'язково моно-, ди- або тризаміщений R^e .
15. Сполука за пунктом 1, де R^1 , необов'язково заміщений R^c , вибраний з групи, що включає водень, метил, етил, ізопропіл та бензил.
16. Сполука за пунктом 1, де R^1 являє собою водень або метил.
17. Сполука за пунктом 1, де R^3 , необов'язково заміщений, вибраний з групи, що включає метил, етил, пропіл, ізопропіл, бутил, метилен, аліл та бензил.
18. Сполука за пунктом 1, де два замісники R^3 , взяті разом, утворюють етилен.
19. Сполука за пунктом 1, де R^3 являє собою метил.
20. Сполука за пунктом 1, де g означає 0, 1 або 2.
21. Сполука за пунктом 1, де Ar , необов'язково заміщений, вибраний з групи, що включає:
- a) феніл, 5-, 6-, 7-, 8-бензо-1,4-діоксаніл, 4-, 5-, 6-, 7-бензо-1,3-діоксоліл, 4-, 5-, 6-, 7-індолініл, 4-, 5-, 6-, 7-ізоіндолініл, 1,2,3,4-тетрагідрохінолін-4-, -5-, -6 або -7-іл, 1,2,3,4-тетрагідроізохінолін-4-, -5-, -6 або -7-іл,
 - b) фураніл, оксазоліл, ізоксазоліл, 1,2,3-оксадіазоліл, 1,2,4-оксадіазоліл, 1,2,5-оксадіазоліл, 1,3,4-оксадіазоліл, тіофеніл, тіазоліл, ізотіазоліл, піроліл, імідазоліл, піразоліл, 1,2,3-триазоліл, 1,2,4-триазоліл,
 - c) піридиніл, піридиніл-N-оксид, піразиніл, піримідиніл, піридазиніл, та
 - d) біфеніл та 4-тетразолілфеніл.
22. Сполука за пунктом 1, де Ar , необов'язково заміщений, вибраний з групи, що включає феніл, піридил, тіофен-2-іл та тіофен-3-іл.
23. Сполука за пунктом 1, де Ar вибраний з групи, що включає феніл, 2-метоксифеніл, 3-метоксифеніл, 4-метоксифеніл, 2-метилфеніл, 3-метилфеніл, 4-метилфеніл, 4-етилфеніл, 2-хлорфеніл, 3-хлорфеніл, 4-хлорфеніл, 2-фторфеніл, 3-фторфеніл, 4-фторфеніл, 2-бромфеніл, 3-бромфеніл, 4-бромфеніл, 2-трифторметилфеніл, 3-трифторметилфеніл, 4-трифторметилфеніл, 3-трифторметоксифеніл, 4-трифторметоксифеніл, 3-ціанофеніл, 4-ціанофеніл, 3-ацетилфеніл, 4-ацетилфеніл, 3,4-дифторфеніл, 3,4-дихлорфеніл, 2,3-дифторфеніл, 2,3-дихлорфеніл, 2,4-дифторфеніл, 2,4-дихлорфеніл, 3-нітрофеніл, 4-нітрофеніл, 3-хлор-4-фторфеніл, 3-фтор-4-хлорфеніл, бензо[1,3]діоксол-4 або -5-іл, 3-гідроксифеніл, 4-гідроксифеніл, 4-гідрокси-2-метилфеніл, 4-гідрокси-3-фторфеніл, 3,4-дигідроксифеніл, 4-диметиламінофеніл, 4-карбамоїлфеніл, 4-фтор-3-метилфеніл, 2-феноксифеніл, фуран-2-іл, фуран-3-іл, 5-метилфуран-2-іл, тіофен-2-іл, тіофен-3-іл, 5-хлортіофен-2-іл, 5-метилтіофен-2-іл, 5-хлортіофен-3-іл, 5-метилтіофен-3-іл, оксазол-2-іл, 4,5-диметиллоксазол-2-іл, тіазол-2-іл, 3H-[1,2,3]триазол-4-іл, 2H-піразол-3-іл, 1H-піразол-4-іл, 4-піридил, 5-фторпіридин-2-іл, 4'-хлорбіфеніл та 4-тетразолілфеніл.
24. Сполука за пунктом 1, де ALK , необов'язково заміщений, вибраний з групи, що включає метилен, етилен, пропілен, бутилен, втор-бутилен, трет-бутилен, пентилен, 1-етилпропілен, 2-етилпропілен, 2-етилбутилен, ізопропілен, бут-3-енілен, ізобутилен, 3-метилбутилен, алілен, проп-2-енілен, циклопропілен, циклобутилен, циклопентилен, циклогексилен та циклогептилен.

25. Сполука за пунктом 1, де ALK вибраний з групи, що включає метилен, гідроксиметилен, фторметилен, дифторметилен, трифторметилметилен, 2,2,2-трифтор-1-трифторметилетилен, метоксикарбонілметил, метилкарбамоїлметил, етилен, 2-диметиламіноетилен, 2-ціаноетилен, 2-метоксіетилен, 1-карбоксіетилен, пропілен, 3-метоксикарбоніл, пропілен, 3-карбоксипропілен, ізопропілен, 1-фтор-1-метилетилен, 1-гідрокси-1-метилетилен, 1-карбокси-1-метилетилен, 1-етилпропілен, 2-етилпропілен, бутилен, трет-бутилен, втор-бутилен, ізобутилен, 4-гідроксибутилен, 4-метоксикарбоніл, бутилен, 4-карбоксибутилен, 2-етилбутилен, ізобутилен, 3-метилбутилен, проп-2-інілен, бут-3-енілен, пентилен, 5-гідроксипентилен, циклопропілен, циклобутилен, циклопентилен, циклопентенілен, 3,3-дифторциклопентилен, 3-гідроксициклогексилен, 4-фторциклогексилен, 4,4-дифторциклогексилен та 1-метилциклопропілен.

26. Сполука за пунктом 1, де СУС, необов'язково заміщений, являє собою водень або кільцеву систему, вибрану з групи, що включає:

i) феніл, 5-, 6-, 7-, 8-бензо-1,4-діоксаніл, 4-, 5-, 6-, 7-бензо-1,3-діоксоліл, 4-, 5-, 6-, 7-індолініл, 4-, 5-, 6-, 7-ізоіндолініл, 1,2,3,4-тетрагідрокхінолін-4-, -5-, -6 або -7-іл, 1,2,3,4-тетрагідроізохінолін-4-, -5-, -6 або -7-іл,

ii) фураніл, оксазоліл, ізоксазоліл, 1,2,3-оксадіазоліл, 1,2,4-оксадіазоліл, 1,2,5-оксадіазоліл, 1,3,4-оксадіазоліл, тіофеніл, тiazоліл, ізотіазоліл, піроліл, імідазоліл, піразоліл, 1,2,3-триазоліл, 1,2,4-триазоліл,

iii) піридиніл, піридиніл-N-оксид, піразиніл, піримідиніл, піридазиніл, та

iv) піролініл, піролідиніл, піразолініл, піперидиніл, гомопіперидиніл, азепаніл, тетрагідрофураніл, тетрагідропіраніл, піперазиніл, морфолініл, тіоморфолініл та піперидиноніл.

27. Сполука за пунктом 1, де СУС, необов'язково заміщений, вибраний з групи, що включає водень, феніл, тіофен-2-іл, тіофен-3-іл, фуран-2-іл, фуран-3-іл, піридиніл, піперидин-1-, -2-, -3 або -4-іл, 2-піролін-2-, -3-, -4 або -5-іл, 3-піролін-2 або -3-іл, 2-піразолін-3-, -4 або -5-іл, тетрагідрофуран-3-іл, тетрагідропіран-4-іл, морфолін-2-, -3 або -4-іл, тіоморфолін-2-, -3 або -4-іл, піперазин-1-, -2-, -3 або -4-іл, піролідин-1-, -2 або -3-іл та гомопіперидиніл.

28. Сполука за пунктом 1, де СУС, необов'язково заміщений, вибраний з групи, що включає водень, феніл, піридил, тіофен-2-іл, тіофен-3-іл, тетрагідропіраніл, фуран-2-іл, фуран-3-іл, тетрагідрофуран-3-іл та піперидиніл.

29. Сполука за пунктом 1, де СУС вибраний з групи, що включає водень, феніл, 2-метоксифеніл, 3-метоксифеніл, 4-метоксифеніл, 2-метилфеніл, 3-метилфеніл, 4-метилфеніл, 4-етилфеніл, 2-хлорфеніл, 3-хлорфеніл, 4-хлорфеніл, 2-фторфеніл, 3-фторфеніл, 4-фторфеніл, 2-бромфеніл, 3-бромфеніл, 4-бромфеніл, 2-трифторметилфеніл, 3-трифторметилфеніл, 4-трифторметилфеніл, 3-трифторметоксифеніл, 4-трифторметоксифеніл, 2-ціанофеніл, 3-ціанофеніл, 4-ціанофеніл, 3-ацетилфеніл, 4-ацетилфеніл, 3,4-дифторфеніл, 3,4-дихлорфеніл, 2,3-дифторфеніл, 2,3-дихлорфеніл, 2,4-дифторфеніл, 2,4-дихлорфеніл, 2,6-дифторфеніл, 2,6-дихлорфеніл, 2,6-диметилфеніл, 2,4,6-трифторфеніл, 2,4,6-трихлорфеніл, 3,4,5-триметоксифеніл, 4-фтор-3-метилфеніл, 3-нітрофеніл, 4-нітрофеніл, 4-метил-3-фторфеніл, 3,4-диметилфеніл, 4-метокси-3-фторфеніл, 4-метокси-2-метилфеніл, 3-амінофеніл, 4-амінофеніл, 4-карбометоксифеніл, 3-метансульфоніламінофеніл, 4-метансульфоніламінофеніл, 3-диметансульфоніламінофеніл, 4-диметансульфоніламінофеніл, тіофен-2-іл, тіофен-3-іл, 5-хлортіофен-2-іл, бензо[1,3]діоксол-4 або -5-іл, тетрагідрофуран-3-іл, тетрагідропіран-2-, -3 або -4-іл, фуран-2-іл, фуран-3-іл, 5-карбоксіетилфуран-2-іл, піперидиніл, 3,4-бісбензилоксифеніл, 2-гідроксифеніл, 3-гідроксифеніл, 4-гідроксифеніл, 4-гідрокси-2-метилфеніл, 4-гідрокси-3-фторфеніл, 3,4-дигідроксифеніл, 1-піперидиніл, 4-піперидиніл та 1-метил-4-піперидиніл.

30. Сполука, вибрана з групи, що включає:

2-трет-бутил-4-(4-фторфеніл)-5,6,7,8-тетрагідропіrido[4,3-d]піримідин;

2-бензил-4-(4-фторфеніл)-5,6,7,8-тетрагідропіrido[4,3-d]піримідин;

[illegible]

[illegible]

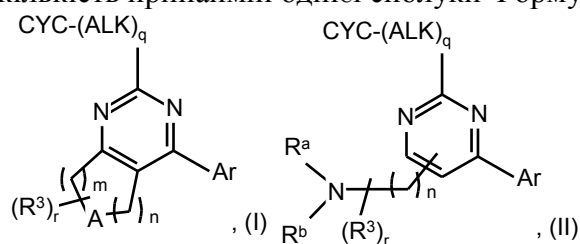
d]піримідин;
гідрохлорид 4-(4-фторфеніл)-2-ізопропіл-8-метил-5,6,7,8-тетрагідропіrido[4,3-d]піримідину;
гідрохлорид 4-(3-хлор-4-фторфеніл)-2-ізопропіл-8-метил-5,6,7,8-тетрагідропіrido[4,3-d]піримідину;
гідрохлорид 2-ізопропіл-8-метил-4-р-толіл-5,6,7,8-тетрагідропіrido[4,3-d]піримідину;
2-ізопропіл-8-метил-4-феніл-5,6,7,8-тетрагідропіrido[4,3-d]піримідин;
2-ізопропіл-8-метил-4-(4-трифторметилфеніл)-5,6,7,8-тетрагідропіrido[4,3-d]піримідин;
2-ізопропіл-8-метил-4-тіофен-3-іл-5,6,7,8-тетрагідропіrido[4,3-d]піримідин;
гідрохлорид 4-(4-фторфеніл)-2-ізопропіл-6,7-дигідро-5Н-піроло[3,4-d]піримідину;
4-(4-фторфеніл)-2-ізопропіл-7-піролідин-1-іл-5,6,7,8-тетрагідрокіназолін;
гідрохлорид [4-(4-фторфеніл)-2-ізопропіл-5,6,7,8-тетрагідрокіназолін-7-іл]-метиламіну;
гідрохлорид [4-(4-фторфеніл)-2-ізопропіл-5,6,7,8-тетрагідрокіназолін-6-іл]-метиламіну;
4-(4-фторфеніл)-2-ізопропіл-5,6,7,8-тетрагідрокіназолін-7-ол;
4-(4-фторфеніл)-2-ізопропіл-5,6,7,8-тетрагідрокіназолін;
(2-бензил-6-р-толілпіримідин-4-ілметил)-диметиламін;
2-бензил-4-(4-метилпіперазин-1-ілметил)-6-р-толілпіримідин;
[6-(4-фторфеніл)-2-ізопропілпіримідин-4-ілметил]-метиламін;
2-(2-бензил-6-р-толілпіримідин-4-іл)-етиламін;
[2-(4-фторбензил)-4-р-толілпіримідин-5-ілметил]-диметиламін;
4-(4-фторфеніл)-2-феніл-5,6,7,8-тетрагідропіrido[4,3-d]піримідин;
2-(3,3-дифторциклопентил)-4-(4-фторфеніл)-5,6,7,8-тетрагідропіrido[4,3-d]піримідин;
4-(4-фторфеніл)-2-(тетрагідрофуран-3-іл)-5,6,7,8-тетрагідропіrido[4,3-d]піримідин;
4-(4-фторфеніл)-2-(2-піперидин-1-ілетил)-5,6,7,8-тетрагідропіrido[4,3-d]піримідин;
2-(1-фтор-1-метилетил)-4-(4-фторфеніл)-5,6,7,8-тетрагідропіrido[4,3-d]піримідин;
3-(4-фторфеніл)-5-ізопропіл-4,6,12-триазатрицикло[7.2.1.0^{2,7}]додека-2,4,6-триєн;
7-(4-фторфеніл)-5-ізопропіл-4,6,13-триазатрицикло[8.2.1.0^{3,8}]тридека-3,5,7-триєн;
4-(4-фторфеніл)-2-(тетрагідропіран-4-іл)-5,6,7,8-тетрагідропіrido[4,3-d]піримідин;
4-(4-фторфеніл)-2-(тетрагідропіран-3-іл)-5,6,7,8-тетрагідропіrido[4,3-d]піримідин;
4-(4-фторфеніл)-2-(2-метоксіетил)-5,6,7,8-тетрагідропіrido[4,3-d]піримідин;
2-[4-(4-фторфеніл)-5,6,7,8-тетрагідропіrido[4,3-d]піримідин-2-іл]-пропан-2-ол;
4-(4-фторфеніл)-2-(1-метил-1-фенілетил)-5,6,7,8-тетрагідропіrido[4,3-d]піримідин;
2-циклопент-3-еніл-4-(4-фторфеніл)-5,6,7,8-тетрагідропіrido[4,3-d]піримідин;
3-[4-(4-фторфеніл)-5,6,7,8-тетрагідропіrido[4,3-d]піримідин-2-іл]-циклогексанол;
4-(4-фторфеніл)-2-піперидин-4-іл-5,6,7,8-тетрагідропіrido[4,3-d]піримідин;
4-(4-фторфеніл)-2-(1-метилпіперидин-4-іл)-5,6,7,8-тетрагідропіrido[4,3-d]піримідин;
[4-(4-фторфеніл)-5,6,7,8-тетрагідропіrido[4,3-d]піримідин-2-іл]-фенілметанол;
4-(4-фторфеніл)-2-(фторфенілметил)-5,6,7,8-тетрагідропіrido[4,3-d]піримідин;
2-(дифторфенілметил)-4-(4-фторфеніл)-5,6,7,8-тетрагідропіrido[4,3-d]піримідин;
4-(4-фторфеніл)-2-феніл-5,6,7,8-тетрагідропіrido[4,3-d]піримідин;
4-(4-фторфеніл)-2-(3-фторфеніл)-5,6,7,8-тетрагідропіrido[4,3-d]піримідин;
4-(4-фторфеніл)-2-(4-метоксифеніл)-5,6,7,8-тетрагідропіrido[4,3-d]піримідин;
4-(4-фторфеніл)-2-о-толіл-5,6,7,8-тетрагідропіrido[4,3-d]піримідин;
3-[4-(4-фторфеніл)-5,6,7,8-тетрагідропіrido[4,3-d]піримідин-2-іл]-бензонітрil;
4-(4-фторфеніл)-2-(2,2,2-трифтор-1-трифторметилетил)-5,6,7,8-тетрагідропіrido[4,3-d]піримідин;
4-(4-фторфеніл)-2-(1-метилциклопропіл)-5,6,7,8-тетрагідропіrido[4,3-d]піримідин;
2-[4-(4-фторфеніл)-5,6,7,8-тетрагідропіrido[4,3-d]піримідин-2-іл]-2-метилпропіонову кислоту;
2-[4-(4-фторфеніл)-5,6,7,8-тетрагідропіrido[4,3-d]піримідин-2-іл]-пропіонову кислоту;
2-(4-фторциклогексил)-4-(4-фторфеніл)-5,6,7,8-тетрагідропіrido[4,3-d]піримідин;
2-(4,4-дифторциклогексил)-4-(4-фторфеніл)-5,6,7,8-тетрагідропіrido[4,3-d]піримідин;

4-(4-фторфеніл)-2-фенетил-5,6,7,8-тетрагідропіридо[4,3-d]піримідин;
 4-фуран-2-іл-2-ізопропіл-5,6,7,8-тетрагідропіридо[4,3-d]піримідин;
 2-ізопропіл-4-(5-метилфуран-2-іл)-5,6,7,8-тетрагідропіридо[4,3-d]піримідин;
 4-фуран-3-іл-2-ізопропіл-5,6,7,8-тетрагідропіридо[4,3-d]піримідин;
 4-(5-фторпіридин-2-іл)-2-ізопропіл-5,6,7,8-тетрагідропіридо[4,3-d]піримідин;
 2-ізопропіл-4-оксазол-2-іл-5,6,7,8-тетрагідропіридо[4,3-d]піримідин;
 4-(4,5-диметилксазол-2-іл)-2-ізопропіл-5,6,7,8-тетрагідропіридо[4,3-d]піримідин;
 2-ізопропіл-4-тіазол-2-іл-5,6,7,8-тетрагідропіридо[4,3-d]піримідин;
 2-ізопропіл-4-(3Н-[1,2,3]тріазол-4-іл)-5,6,7,8-тетрагідропіридо[4,3-d]піримідин;
 2-ізопропіл-4-(2Н-піразол-3-іл)-5,6,7,8-тетрагідротридо[4,3-d]піримідин;
 2-ізопропіл-4-(1Н-піразол-4-іл)-5,6,7,8-тетрагідропіридо[4,3-d]піримідин;
 4-(4-фторфеніл)-2,6-діізопропіл-5,6,7,8-тетрагідропіридо[4,3-d]піримідин;
 6-етил-4-(4-фторфеніл)-2-ізопротл-5,6,7,8-тетрагідропіридо[4,3-d]піримідин;
 6-циклопропіл-4-(4-фторфеніл)-2-ізопропіл-5,6,7,8-тетрагідропіридо[4,3-d]піримідин;
 6-циклобутил-4-(4-фторфеніл)-2-ізопропіл-5,6,7,8-тетрагідропіридо[4,3-d]піримідин;
 6-циклопентил-4-(4-фторфеніл)-2-ізопропіл-5,6,7,8-тетрагідропіридо[4,3-d]піримідин;
 6-бутил-4-(4-фторфеніл)-2-ізопропіл-5,6,7,8-тетрагідропіридо[4,3-d]піримідин та
 4-(4-фторфеніл)-2-ізопропіл-5,6,7,8-тетрагідропіридо[4,3-d]піримідин, цитрат.

31. Сполука за пунктом 1, де зазначена фармацевтично прийнятна сіль являє собою ефективну адитивну сіль аміну.

32. Сполука за пунктом 1, де зазначена фармацевтично прийнятна сіль вибрана з групи, що включає гідробромід, гідрохлорид, сульфат, бісульфат, нітрат, ацетат, оксалат, валерат, олеат, пальмітат, стеарат, лаурат, борат, бензоат, лактат, фосфат, тозилат, цитрат, малеат, фумарат, сукцинат, тартрат, нафтилат, мезилат, глюкогептонат, лактіобіонат та лаурилсульфонат.

33. Фармацевтична композиція, що містить фармацевтично прийнятний носій та терапевтично ефективну кількість принаймні однієї сполуки Формули (I) або (II):



де

m означає 1, 2 або 3;

n означає 1, 2 або 3;

де, коли m та n обидва присутні, сума $m+n$ є більшою ніж або дорівнює 2 та є меншою ніж або дорівнює 4;

R^a та R^b незалежно являють собою -H, $-\text{C}_{1-7}$ алкіл або $-\text{C}_{3-7}$ циклоалкіл, або R^a та R^b , взяті разом з азотом приєднання, утворюють піперидиніл, піролідиніл, морфолініл, тіоморфолініл або піперазиніл, де кожний R^a та R^b необов'язково та незалежно заміщений $-\text{C}_{1-4}$ алкілом;

q означає 0 або 1;

A являє собою $>\text{NR}^1$, $>\text{CHNR}^c\text{R}^d$, $>\text{CHOH}$ або $-\text{CH}_2-$, де

R^1 вибраний з групи, що включає -H, $-\text{C}_{1-7}$ алкіл, $-\text{C}_{3-7}$ циклоалкіл та бензил, де кожний алкіл, циклоалкіл або бензил є необов'язково моно-, ди- або тризаміщений R^e ;

R^e вибраний з групи, що включає $-\text{C}_{1-4}$ алкіл, $-\text{C}_{1-4}$ алкеніл, $-\text{C}_{2-4}$ алкініл, $-\text{C}_{3-6}$ циклоалкіл, галоген, $-\text{CF}_3$, $-\text{OH}$, $-\text{OC}_{1-4}$ алкіл, $-\text{OCF}_3$, $-\text{N}(\text{R}^f)\text{R}^g$ (де R^f та R^g незалежно являють собою -H або $-\text{C}_{1-4}$ алкіл, або R^f та R^g , взяті разом з азотом приєднання, утворюють піперидиніл, піролідиніл, морфолініл, тіоморфолініл або піперазиніл), $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^f)\text{R}^g$, $-\text{N}(\text{R}^h)\text{C}(\text{O})\text{R}^h$, $-\text{N}(\text{R}^h)\text{SO}_2\text{C}_{1-7}$ алкіл (де R^h являє собою -H або $-\text{C}_{1-4}$ алкіл, або два R^h в одному заміснику, взяті

разом з амідом приєднання, утворюють інше аліфатичне 4-6-членне кільце), $-S(O)_{0-2}-C_{1-7}$ алкіл, $-SO_2N(R^f)R^g$, $-SCF_3$, $-C(O)C_{1-4}$ алкіл, $-CN$, $-COOH$ та $-COOC_{1-4}$ алкіл;

R^c та R^d незалежно вибрані з групи, що включає $-H$, $-C_{1-7}$ алкіл, $-C_{3-7}$ алкеніл, $-C_{3-7}$ алкініл, $-C_{3-7}$ циклоалкіл, $-C_{1-7}$ алкіл C_{3-7} циклоалкіл та $-C_{3-7}$ циклоалкіл C_{1-7} алкіл, або R^c та R^d , взяті разом з азотом приєднання, утворюють піперидиніл, піролідиніл, морфолініл, тіоморфолініл або піперазиніл, де кожний R^c та R^d необов'язково та незалежно заміщений R^e ;

R^3 являє собою $-C_{1-4}$ алкіл, $-C_{1-4}$ алкеніл або бензил, кожний необов'язково заміщений $-C_{1-3}$ алкілом, $-OH$ або галогеном, або два замісники R^3 , взяті разом, утворюють C_{2-5} алкілен, необов'язково заміщений $-C_{1-3}$ алкілом, $-OH$ або галогеном;

g означає 0 або ціле число, яке менше ніж або дорівнює сумі $m+n+1$;

Ag являє собою арильне або гетероарильне кільце, вибране з групи, що включає:

а) феніл, необов'язково моно-, ди- або тризаміщений R' або дизаміщений на сусідніх атомах вуглецю $-OC_{1-4}$ алкілен O , $-(CH_2)_{2-3}NH-$, $-(CH_2)_{1-2}H(CH_2)-$, $-(CH_2)_{2-3}N(C_{1-4}$ алкіл)- або $-(CH_2)_{1-2}N(C_{1-4}$ алкіл) $(CH_2)-$;

R^i вибраний з групи, що включає $-C_{1-7}$ алкіл, $-C_{2-7}$ алкеніл, $-C_{2-7}$ алкініл, $-C_{3-7}$ циклоалкіл, галоген, $-CF_3$, $-OH$, $-OC_{1-7}$ алкіл, $-OCF_3$, $-OC_{3-7}$ алкеніл, $-C_{3-7}$ алкініл, $-N(R^j)R^k$ (де R^j та R^k незалежно являють собою $-H$ або $-C_{1-4}$ алкіл), $-C(O)N(R^j)R^k$, $-N(R^j)C(O)R^k$, $-N(R^j)SO_2C_{1-6}$ алкіл, $-S(O)_{0-2}C_{1-6}$ алкіл, $-SO_2N(R^j)R^k$, $-SCF_3$, $-C(O)C_{1-6}$ алкіл, $-NO_2$, $-CN$, $-COOH$ та $-COOC_{1-7}$ алкіл;

б) моноциклічну ароматичну вуглеводневу групу, що містить п'ять кільцевих атомів, містить атом вуглецю, який є точкою приєднання, містить один атом вуглецю, замінений на $>O$, $>S$, $>NH$ або $>N(C_{1-4}$ алкіл), містить до двох додаткових атомів вуглецю, необов'язково замінених на $-N=$, необов'язково моно- або дизаміщену R^i ;

(с) моноциклічну ароматичну вуглеводневу групу, що містить шість кільцевих атомів, містить атом вуглецю, який є точкою приєднання, містить один або два атоми вуглецю, замінені на $-N=$, необов'язково моно- або дизаміщену R^i ; та

(d) феніл або піридил, заміщений замісником, вибраним з групи, що включає феніл, фенокси, піридил, тіофеніл, оксазоліл та тетразоліл, де одержаний заміщений компонент необов'язково додатково моно-, ди- або тризаміщений R^i ;

ALK являє собою розгалужений або нерозгалужений C_{1-7} алкілен, C_{2-7} алкенілен, C_{2-7} алкінілен, C_{3-7} циклоалкілен або C_{3-7} циклоалкенілен, необов'язково моно-, ди- або тризаміщений R^m ;

R^m вибраний з групи, що включає галоген, $-CF_3$, $-OH$, $-OC_{1-7}$ алкіл, $-OC_{3-7}$ циклоалкіл, $-OCF_3$, $-N(R^p)R^s$ (де R^p та R^s незалежно являють собою $-H$ або $-C_{1-7}$ алкіл), $-C(O)N(R^p)R^s$, $-N(R^t)C(O)R^t$, $-N(R^t)SO_2C_{1-6}$ алкіл (де R^t являє собою $-H$ або $-C_{1-7}$ алкіл), $-S(O)_{0-2}C_{1-6}$ алкіл, $-SO_2N(R^p)R^s$, $-SCF_3$, $-CN$, $-NO_2$, $-C(O)C_{1-7}$ алкіл, $-COOH$ та $-COOC_{1-7}$ алкіл;

CYC являє собою $-H$ або кільцеву систему, вибрану з групи, що включає:

i) феніл, необов'язково моно-, ди- або тризаміщений R^u або дизаміщений на сусідніх атомах вуглецю $-OC_{1-4}$ алкілен O -, $-(CH_2)_{2-3}NH-$, $-(CH_2)_{1-2}NH(CH_2)-$, $-(CH_2)_{2-3}N(C_{1-4}$ алкіл)- або $-(CH_2)_{1-2}N(C_{1-4}$ алкіл) $(CH_2)-$;

R^u вибраний з групи, що включає C_{1-7} алкіл, $-C_{3-7}$ циклоалкіл, феніл, бензил, галоген, $-CF_3$, $-OH$, $-OC_{1-7}$ алкіл, $-OC_{3-7}$ циклоалкіл, $-O$ феніл, $-O$ бензил, $-OCF_3$, $-N(R^v)R^w$ (де R^v та R^w незалежно являють собою $-H$ або $-C_{1-7}$ алкіл, або R^v та R^w , взяті разом з азотом приєднання, утворюють піперидиніл, піролідиніл, морфолініл, тіоморфолініл або піперазиніл, де кожний R^v та R^w необов'язково та незалежно заміщений $-OH$ або $-C_{1-7}$ алкілом), $-C(O)N(R^v)R^w$, $-N(R^x)C(O)R^x$, $-N(R^x)SO_2C_{1-6}$ алкіл (де R^x являє собою $-H$ або $-C_{1-7}$ алкіл, або два R^x в одному заміснику, взяті разом з амідом приєднання, утворюють інше аліфатичне 4-6-членне кільце), $-N(SO_2C_{1-6}$ алкіл) $_2$, $-S(O)_{0-2}C_{1-6}$ алкіл, $-SO_2N(R^v)R^w$, $-SCF_3$, $-C(O)C_{1-6}$ алкіл, $-NO_2$, $-CN$, $-COOH$ та $-COOC_{1-7}$ алкіл;

ii) моноциклічну ароматичну вуглеводневу групу, що містить п'ять кільцевих атомів, містить атом вуглецю, який є точкою приєднання, містить один атом вуглецю, замінений на $>O$, $>S$, $>NH$ або $>N(C_{1-4}$ алкіл), містить до одного додаткового атома вуглецю, необов'язково

заміненого на $-N=$, необов'язково моно- або дизаміщену R^u ;

iii) моноциклічну ароматичну вуглеводневу групу, що містить шість кільцевих атомів, містить атом вуглецю, який є точкою приєднання, містить один або два атоми вуглецю, замінені на $-N=$, необов'язково моно- або дизаміщену R^u ; та

iv) неароматичне гетероциклічне кільце, що містить 4-8 членів, зазначене кільце містить 0, 1 або 2 несуміжні гетероатомні члени, вибрані з групи, що включає O, S, $-N=$, $>NH$ та $>N(C_{1-4} \text{алкіл})$, містить 0, 1 або 2 подвійні зв'язки, містить 0, 1 або 2 вуглецеві члени, які є карбонілом, необов'язково містить один вуглецевий член, який утворює місток, містить 0-5 замісників R^u , та де, коли q означає 0, зазначене кільце містить атом вуглецю, який є точкою приєднання;

та її енантіомерів, діастереомерів, гідратів, сольватів та фармацевтично прийнятних солей, ефірів та амідів;

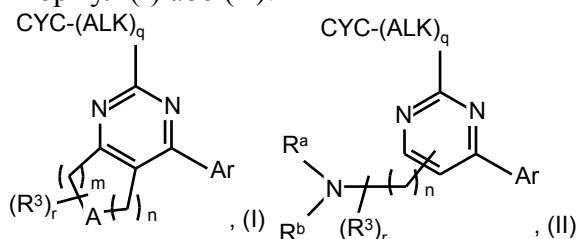
за умови, що у Формулі (I):

(a) коли ALK являє собою метилен, етилен, пропілен або ізопропілен, CYC являє собою $-H$, Ar являє собою феніл або монозаміщений феніл, m означає 2, n означає 1, та A являє собою $>NR^1$, тоді R^1 не являє собою $-C_{1-4} \text{алкіл}$ або бензил;

(b) коли q означає 0, CYC являє собою феніл, Ar являє собою феніл або 3-хлорфеніл, m означає 2, та n означає 1, тоді A не являє собою незаміщений $-CH_2-$; та

(c) коли q означає 0, CYC являє собою 2-піридил, Ar являє собою 2-піридил, m означає 2, та n означає 1, тоді A не являє собою незаміщений $-CH_2-$.

34. Спосіб лікування або попередження розладу ЦНС, вибраного з групи, що включає: розлади сну, депресію/тривогу, генералізований тривожний розлад, шизофренію, біполярний психоз, психотичні розлади, obsесивно-компульсивний розлад, розлади настрою, розлади, пов'язані з посттравматичним стресом та іншими стресами, мігрень, біль, розлади харчування, ожиріння, сексуальну дисфункцію, порушення обміну речовин, гормональний дисбаланс, зловживання алкоголем, розлади, викликані залежністю, нудоту, запалення, підвищений кров'яний тиск, опосередкований центральною нервовою системою, порушення циклу сон/неспанья, порушення добового ритму організму та порушення циркадного ритму, у ссавців, який включає введення ссавцю, що цього потребує, ефективної кількості принаймні однієї сполуки Формул (I) або (II):



де

m означає 1, 2 або 3;

n означає 1, 2 або 3;

де, коли m та n обидва присутні, сума m+n є більшою ніж або дорівнює 2 та є меншою ніж або дорівнює 4;

R^a та R^b незалежно являють собою $-H$, $-C_{1-7} \text{алкіл}$ або $-C_{3-7} \text{циклоалкіл}$, або R^a та R^b , взяті разом з азотом приєднання, утворюють піперидиніл, піролідиніл, морфолініл, тіоморфолініл або піперазиніл, де кожний R^a та R^b необов'язково та незалежно заміщений $-C_{1-4} \text{алкілом}$;

q означає 0 або 1;

A являє собою $>NR^1$, $>CHNR^d$, $>CHOH$ або $-CH_2-$, де

R^1 вибраний з групи, що включає $-H$, $-C_{1-7} \text{алкіл}$, $-C_{3-7} \text{циклоалкіл}$ та бензил, де кожний алкіл, циклоалкіл або бензил є необов'язково моно-, ди- або тризаміщений R^e ;

R^e вибраний з групи, що включає $-C_{1-4} \text{алкіл}$, $-C_{2-4} \text{алкеніл}$, $-C_{2-4} \text{алкініл}$, $-C_{3-6} \text{циклоалкіл}$, галоген, $-CF_3$, $-OH$, $-OC_{1-4} \text{алкіл}$, $-OCF_3$, $-N(R^f)R^g$ (де R^f та R^g незалежно являють собою $-H$ або

-C₁₋₄алкіл, або R^f та R^g, взяті разом з азотом приєднання, утворюють піперидиніл, піролідиніл, морфолініл, тіоморфолініл або піперазиніл), -C(O)N(R^f)R^g, -N(R^h)C(O)R^h, -N(R^h)SO₂C₁₋₇алкіл (де R^h являє собою -H або -C₁₋₄алкіл, або два R^h в одному заміснику, взяті разом з амідом приєднання, утворюють інше аліфатичне 4-6-членне кільце), -S(O)₀₋₂-C₁₋₄алкіл, -SO₂N(R^f)R^e, -SCF₃, -C(O)C₁₋₄алкіл, -CN, -COOH та -COOC₁₋₄алкіл;

R^c та R^d незалежно вибрані з групи, що включає -H, -C₁₋₇алкіл, -C₃₋₇алкеніл, -C₃₋₇алкініл, -C₃₋₇циклоалкіл, -C₁₋₇алкіл C₃₋₇циклоалкіл та -C₃₋₇циклоалкілC₁₋₇алкіл, або R^c та R^d, взяті разом з азотом приєднання, утворюють піперидиніл, піролідиніл, морфолініл, тіоморфолініл або піперазиніл, де кожний R^c та R^d необов'язково та незалежно заміщений R^e;

R³ являє собою -C₁₋₄алкіл, -C₁₋₄алкеніл або бензил, кожний необов'язково заміщений -C₁₋₃алкілом, -OH або галогеном, або два замісники R³, взяті разом, утворюють C₂₋₅алкілен, необов'язково заміщений -C₁₋₃алкілом, -OH або галогеном;

г означає 0 або ціле число, яке менше ніж або дорівнює сумі m+n+1;

Ag являє собою арильне або гетероарильне кільце, вибране з групи, що включає:

а) феніл, необов'язково моно-, ди- або тризаміщений Rⁱ або дизаміщений на сусідніх атомах вуглецю -OC₁₋₄алкіленO-, -(CH₂)₂₋₃NH-, -(CH₂)₁₋₂NH(CH₂)-, -(CH₂)₂-NH(C₁₋₄алкіл)- або -(CH₂)₁₋₂N(C₁₋₄алкіл)(CH₂)-;

Rⁱ вибраний з групи, що включає -C₁₋₇алкіл, -C₂₋₇алкеніл, -C₂₋₇алкініл, -C₃₋₇циклоалкіл, галоген, -CF₃, -OH, -OC₃₋₇алкіл, -OCF₃, -OC₃₋₇алкеніл, -OC₃₋₇алкініл, -N(R^j)R^k (де R^j та R^k незалежно являють собою -H або -C₁₋₄алкіл), -C(O)N(R^j)R^k, -N(R^j)C(O)R^k, -N(R^j)SO₂C₁₋₆алкіл, -S(O)₀₋₂C₁₋₆алкіл, -SO₂N(R^j)R^k, -SCF₃, -C(O)C₁₋₆алкіл, -NO₂, -CN, -COOH та -COOC₁₋₇алкіл;

б) моноциклічну ароматичну вуглеводневу групу, що містить п'ять кільцевих атомів, містить атом вуглецю, який є точкою приєднання, містить один атом вуглецю, замінений на >O, >S, >NH або >N(C₁₋₄алкіл), містить до двох додаткових атомів вуглецю, необов'язково замінені на -N=, необов'язково моно- або дизаміщену Rⁱ;

(с) моноциклічну ароматичну вуглеводневу групу, що містить шість кільцевих атомів, містить атом вуглецю, який є точкою приєднання, містить один або два атоми вуглецю, замінені на -N=, необов'язково моно- або дизаміщену Rⁱ; та

(d) феніл або піридил, заміщений замісником, вибраним з групи, що включає феніл, фенокси, піридил, тіофеніл, оксазоліл та тетразоліл, де одержаний заміщений компонент необов'язково додатково моно-, ди- або тризаміщений Rⁱ;

ALK являє собою розгалужений або нерозгалужений C₁₋₇алкілен, C₂₋₇алкенілен, C₂₋₇алкінілен, C₃₋₇циклоалкілен або C₃₋₇циклоалкенілен, необов'язково моно-, ди- або тризаміщений R^m;

R^m вибраний з групи, що включає галоген, -CF₃, -OH, -OC₁₋₇алкіл, -OC₃₋₇циклоалкіл, -OCF₃, -N(R^p)R^s (де R^p та R^s незалежно являють собою -H або -C₁₋₇алкіл), -C(O)N(R^p)R^s, -N(R^t)C(O)R^t, -N(R^t)SO₂C₁₋₆алкіл (де R^t являє собою -H або -C₁₋₇алкіл), -S(O)₀₋₂C₁₋₄алкіл, -SO₂N(R^p)R^s, -SCF₃, -CN, -NO₂, -C(O)C₁₋₇алкіл, -COOH та -COOC₁₋₇алкіл;

CYS являє собою -H або кільцеву систему, вибрану з групи, що включає:

і) феніл, необов'язково моно-, ди- або тризаміщений R["] або дизаміщений на сусідніх атомах вуглецю -OC₁₋₄алкіленO-, -(CH₂)₂₋₃NH-, -(CH₂)₁₋₂NH(CH₂)-, -(CH₂)₂₋₃N(C₁₋₄алкіл)- або -(CH₂)₁₋₂N(C₁₋₄алкіл)(CH₂)-;

R^u вибраний з групи, що включає C₁₋₇алкіл, -C₃₋₇циклоалкіл, феніл, бензил, галоген, -CF, -OH, -OC₁₋₇алкіл, -OC₃₋₇циклоалкіл, -Ofеніл, -Obензил, -OCF₃, -N(R^v)R^w (де R^v та R^w незалежно являють собою -H або -C₁₋₇алкіл, або R^v та R^w, взяті разом з азотом приєднання, утворюють піперидиніл, піролідиніл, морфолініл, тіоморфолініл або піперазиніл, де кожний R^v та R^w необов'язково та незалежно заміщений -OH або -C₁₋₇алкілом), -C(O)N(R^v)R^w, -N(R^x)C(O)R^x, -N(R^x)SO₂C₁₋₆алкіл (де R^x являє собою -H або -C₁₋₇алкіл, або два R^x в одному заміснику, взяті разом з амідом приєднання, утворюють інше аліфатичне 4-6-членне кільце), -N-(SO₂C₁₋₆алкіл)₂, -S(O)₀₋₂C₁₋₆алкіл, -SO₂N(R^v)R^w, -SCF₃, -C(O)C₁₋₆алкіл, -NO₂, -CN, -COOH та -COOC₁₋₇алкіл;

ii) моноциклічну ароматичну вуглеводневу групу, що містить п'ять кільцевих атомів, містить атом вуглецю, який є точкою приєднання, містить один атом вуглецю, замінений на $>O$, $>S$, $>NH$ або $>N(C_{1-4}алкіл)$, містить до одного додаткового атома вуглецю, необов'язково заміненого на $-N=$, необов'язково моно- або дизаміщену R^u ;

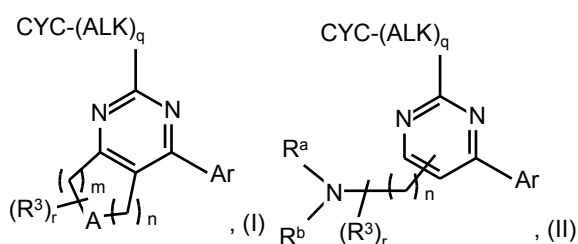
iii) моноциклічну ароматичну вуглеводневу групу, що містить шість кільцевих атомів, містить атом вуглецю, який є точкою приєднання, містить один або два атоми вуглецю, замінені на $-N=$, необов'язково моно- або дизаміщену R^u ; та

iv) неароматичне гетероциклічне кільце, що містить 4-8 членів, зазначене кільце містить 0, 1 або 2 несуміжні гетероатомні члени, вибрані з групи, що включає O , S , $-N=$, $>NH$ та $>N(C_{1-4}алкіл)$, містить 0, 1 або 2 подвійні зв'язки, містить 0, 1 або 2 вуглецеві члени, які є карбонілом, необов'язково містить один вуглецевий член, який утворює місток, містить 0-5 замісників R^u , та де, коли q означає 0, зазначене кільце містить атом вуглецю, який є точкою приєднання;

та її енантіомерів, діастереомерів, гідратів, сольватів та фармацевтично прийнятних солей, ефірів та амідів.

35. Спосіб за пунктом 34, де зазначений розлад ЦНС вибраний з групи, що включає: депресію/тривогу, розлади сну та порушення циркадного ритму.

36. Спосіб лікування або попередження хвороби або стану, вибраного з групи, що включає: гіпотонію, розлади периферійних кровоносних судин, серцево-судинний шок, розлади нирок, розлад перистальтики шлунка, діарею, спастичний коліт, синдром подразненої товстої кишки, ішемію, септичний шок, нетримання сечі та інші розлади, пов'язані з шлунково-кишковою та судинною системами, у ссавців, який включає введення ссавцю, що цього потребує, ефективної кількості принаймні однієї сполуки Формули (I) або (II):



де

m означає 1, 2 або 3;

n означає 1, 2 або 3;

де, коли m та n обидва присутні, сума $m+n$ є більшою ніж або дорівнює 2 та є меншою ніж або дорівнює 4;

R^a та R^b незалежно являють собою $-H$, $-C_{1-7}алкіл$ або $-C_{3-7}циклоалкіл$, або R^a та R^b , взяті разом з азотом приєднання, утворюють піперидиніл, піролідиніл, морфолініл, тіоморфолініл або піперазиніл, де кожний R^a та R^b необов'язково та незалежно заміщений $-C_{1-4}алкілом$;

q означає 0 або 1;

A являє собою $>NR^1$, $>CHNR^cR^d$, $>CHOH$ або $-CH_2-$, де

R^1 вибраний з групи, що включає $-H$, $-C_{1-7}алкіл$, $-C_{3-7}циклоалкіл$ та бензил, де кожний алкіл, циклоалкіл або бензил є необов'язково моно-, ди- або тризаміщений R^e ;

R^e вибраний з групи, що включає $-C_{1-4}алкіл$, $-C_{2-4}алкеніл$, $-C_{2-4}алкініл$, $-C_{3-6}циклоалкіл$, галоген, $-CF_3$, $-OH$, $-OC_{1-4}алкіл$, $-OCF_3$, $-N(R^f)R^g$ (де R^f та R^g незалежно являють собою $-H$ або $-C_{1-4}алкіл$, або R^f та R^g , взяті разом з азотом приєднання, утворюють піперидиніл, піролідиніл, морфолініл, тіоморфолініл або піперазиніл), $-C(O)N(R^f)R^g$, $-N(R^h)C(O)R^h$, $-N(R^h)SO_2C_{1-7}алкіл$ (де R^h являє собою $-H$ або $-C_{1-4}алкіл$, або два R^1 в одному заміснику, взяті разом з амідом приєднання, утворюють інше аліфатичне 4-6-членне кільце), $-S(O)_{0-2}C_{1-4}алкіл$, $-SO_2N(R^f)R^g$, $-SCF_3$, $-C(O)C_{1-4}алкіл$, $-CN$, $-COOH$ та $-COOC_{1-4}алкіл$;

R^c та R^d незалежно вибрані з групи, що включає $-H$, $-C_{1-7}алкіл$, $-C_{3-7}алкеніл$, $-C_3-$

7алкініл, -C₃₋₇циклоалкіл, -C₁₋₇алкіл C₃₋₇циклоалкіл та -C₃₋₇циклоалкілC₁₋₇алкіл, або R^c та R^d, взяті разом з азотом приєднання, утворюють піперидиніл, піролідиніл, морфолініл, тіоморфолініл або піперазиніл, де кожний R^c та R^d необов'язково та незалежно заміщений R^e;

R³ являє собою -C₁₋₄алкіл, -C₁₋₄алкеніл або бензил, кожний необов'язково заміщений -C₁₋₃алкілом, -ОН або галогеном, або два замісники R³, взяті разом, утворюють C₂₋₅алкілен, необов'язково заміщений -C₁₋₃алкілом, -ОН або галогеном;

г означає 0 або ціле число, яке менше ніж або дорівнює сумі m+n+1;

Аг являє собою арильне або гетероарильне кільце, вибране з групи, що включає:

а) феніл, необов'язково моно-, ди- або тризаміщений R¹ або дизаміщений на сусідніх атомах вуглецю -OC₁₋₄алкіленО-, -(CH₂)₂₋₃NH-, -(CH₂)₁₋₂NH(CH₂)-, -(CH₂)₂₋₃N(C₁₋₄алкіл)- або -(CH₂)₁₋₂N(C₁₋₄алкіл)(CH₂)-

Rⁱ вибраний з групи, що включає -C₁₋₇алкіл, -C₂₋₇алкеніл, -C₂₋₇алкініл, -C₃₋₇циклоалкіл, галоген, -CF₃, -ОН, -OC₁₋₇алкіл, -OCF₃, -OC₃₋₇алкеніл, -OC₃₋₇алкініл, -N(R^j)R^k (де R^j та R^k незалежно являють собою -Н або -C₁₋₄алкіл), -C(O)N(R^j)R^k, -N(R^j)C(O)R^k, -N(R^j)SO₂C₁₋₆алкіл, -S(O)₀₋₂C₁₋₆алкіл, -SO₂N(R^j)R^k, -SCF₃, -C(O)C₁₋₆алкіл, -NO₂, -CN, -COOH та -COOC₁₋₇алкіл;

б) моноциклічну ароматичну вуглеводневу групу, що містить п'ять кільцевих атомів, містить атом вуглецю, який є точкою приєднання, містить один атом вуглецю, замінений на >O, >S, >NH або >N(C₁₋₄алкіл), містить до двох додаткових атомів вуглецю, необов'язково замінених на -N=, необов'язково моно- або дизаміщену Rⁱ;

(с) моноциклічну ароматичну вуглеводневу групу, що містить шість кільцевих атомів, містить атом вуглецю, який є точкою приєднання, містить один або два атоми вуглецю, замінені на -N=, необов'язково моно- або дизаміщену Rⁱ; та

(d) феніл або піридил, заміщений замісником, вибраним з групи, що включає феніл, фенокси, піридил, тіофеніл, оксазоліл та тетразоліл, де одержаний заміщений компонент необов'язково додатково моно-, ди- або тризаміщений Rⁱ;

ALK являє собою розгалужений або нерозгалужений C₁₋₇алкілен, C₂₋₇алкенілен, C₂₋₇алкінілен, C₃₋₇циклоалкілен або C₃₋₇циклоалкенілен, необов'язково моно-, ди- або тризаміщений R^m;

R^m вибраний з групи, що включає галоген, -CF₃, -ОН, -OC₁₋₇алкіл, -OC₃₋₇циклоалкіл, -OCF₃, -N(R^p)R^s (де R^p та R^s незалежно являють собою -Н або -C₁₋₇алкіл), -C(O)N(R^p)R^s, -N(R^t)C(O)R^t, -N(R^t)SO₂C₁₋₆алкіл (де R^t являє собою -Н або -C₁₋₇алкіл), -S(O)₀₋₂C₁₋₆алкіл, -SO₂N(R^p)R^s, -SCF₃, -CN, -NO₂, -C(O)C₁₋₇алкіл, -COOH та -COOC₁₋₇алкіл;

СҮС являє собою -Н або кільцеву систему, вибрану з групи, що включає:

і) феніл, необов'язково моно-, ди- або тризаміщений R^u або дизаміщений на сусідніх атомах вуглецю -OC₁₋₄алкіленО-, -(CH₂)₂₋₃NH-, -(CH₂)₁₋₂NH(CH₂)-, -(CH₂)₂₋₃N(C₁₋₄алкіл)- або -(CH₂)₁₋₂N(C₁₋₄алкіл)(CH₂)-

R^u вибраний з групи, що включає C₁₋₇алкіл, -C₃₋₇циклоалкіл, феніл, бензил, галоген, -CF₃, -ОН, -OC₁₋₇алкіл, -OC₃₋₇циклоалкіл, -Офеніл, -Обензил, -OCF₃, -N(R^v)R^w (де R^v та R^w незалежно являють собою -Н або -C₁₋₇алкіл, або R^v та R^w, взяті разом з азотом приєднання, утворюють піперидиніл, піролідиніл, морфолініл, тіоморфолініл або піперазиніл, де кожний R^v та R^w необов'язково та незалежно заміщений -ОН або -C₁₋₇алкілом), -C(O)N(R^v)R^w, -N(R^x)C(O)R^x, -N(R^x)SO₂C₁₋₆алкіл (де R^x являє собою -Н або -C₁₋₇алкіл, або два R^x в одному заміснику, взяті разом з амідом приєднання, утворюють інше аліфатичне 4-6-членне кільце), -N-(SO₂C₁₋₆алкіл)₂, -S(O)₀₋₂-C₁₋₆алкіл, -SO₂N(R^v)R^w, -SCF₃, -C(O)C₁₋₆алкіл, -NO₂, -CN, -COOH та -COOC₁₋₇алкіл;

ii) моноциклічну ароматичну вуглеводневу групу, що містить п'ять кільцевих атомів, містить атом вуглецю, який є точкою приєднання, містить один атом вуглецю, замінений на >O, >S, >NH або >N(C₁₋₄алкіл), містить до одного додаткового атома вуглецю, необов'язково заміненого на -N=, необов'язково моно- або дизаміщену R^u;

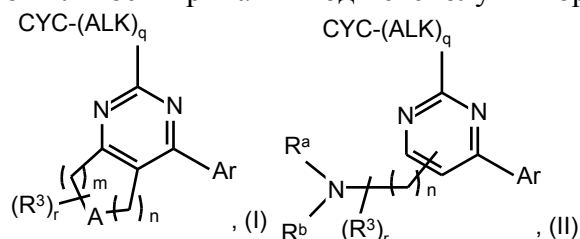
iii) моноциклічну ароматичну вуглеводневу групу, що містить шість кільцевих атомів, містить атом вуглецю, який є точкою приєднання, містить один або два атоми вуглецю,

замінені на $-N=$, необов'язково моно- або дизаміщену R^u ; та

iv) неароматичне гетероциклічне кільце, що містить 4-8 членів, зазначене кільце містить 0, 1 або 2 несуміжні гетероатомні члени, вибрані з групи, що включає O, S, $-N=$, $>NH$ та $>N(C_{1-4} \text{алкіл})$, містить 0, 1 або 2 подвійні зв'язки, містить 0, 1 або 2 вуглецеві члени, які є карбонілом, необов'язково містить один вуглецевий член, який утворює місток, містить 0-5 замісників R^u , та де, коли q означає 0, зазначене кільце містить атом вуглецю, який є точкою приєднання;

та її енантіомерів, діастереомерів, гідратів, сольватів та фармацевтично прийнятних солей, ефірів та амідів.

37. Спосіб лікування або попередження очного розладу, вибраного з групи, що включає: глаукому, ретробульбарний неврит, діабетичну ретинопатію, набряк сітківки та пов'язану з віком макулярну дегенерацію, у ссавців, який включає введення ссавцю, що цього потребує, ефективної кількості принаймні однієї сполуки Формули (I) або (II):



де

m означає 1, 2 або 3;

n означає 1, 2 або 3;

де, коли m та n обидва присутні, сума $m+n$ є більшою ніж або дорівнює 2 та є меншою ніж або дорівнює 4;

R^a та R^b незалежно являють собою $-H$, $-C_{1-7}$ алкіл або $-C_{3-7}$ циклоалкіл, або R^a та R^b , взяті разом з азотом приєднання, утворюють піперидиніл, піролідиніл, морфолініл, тіоморфолініл або піперазиніл, де кожний R^a та R^b необов'язково та незалежно заміщений $-C_{1-4}$ алкілом;

q означає 0 або 1;

A являє собою $>NR^1$, $>CHNR^cR^d$, $>CHOH$ або $-CH_2-$, де

R^1 вибраний з групи, що включає $-H$, $-C_{1-7}$ алкіл, $-C_{3-7}$ циклоалкіл та бензил, де кожний алкіл, циклоалкіл або бензил є необов'язково моно-, ди- або тризаміщений R^e ;

R^e вибраний з групи, що включає $-C_{1-4}$ алкіл, $-C_{2-4}$ алкеніл, $-C_{2-4}$ алкініл, $-C_{3-6}$ циклоалкіл, галоген, $-CF_3$, $-OH$, $-OC_{1-4}$ алкіл, $-OCF_3$, $-N(R^f)R^g$ (де R^f та R^g незалежно являють собою $-H$ або $-C_{1-4}$ алкіл, або R^f та R^g , взяті разом з азотом приєднання, утворюють піперидиніл, піролідиніл, морфолініл, тіоморфолініл або піперазиніл), $-C(O)N(R^f)R^g$, $-N(R^h)C(O)R^h$, $-N(R^h)SO_2C_{1-7}$ алкіл (де R^h являє собою $-H$ або $-C_{1-4}$ алкіл, або два R^h в одному заміснику, взяті разом з амідом приєднання, утворюють інше аліфатичне 4-6-членне кільце), $-S(O)_{0-2}C_{1-4}$ алкіл, $-SO_2N(R^f)R^g$, $-SCF_3$, $-C(O)C_{1-4}$ алкіл, $-CN$, $-COOH$ та $-COOC_{1-4}$ алкіл;

R^c та R^d незалежно вибрані з групи, що включає $-H$, $-C_{1-7}$ алкіл, $-C_{3-7}$ алкеніл, $-C_{3-7}$ алкініл, $-C_{3-7}$ циклоалкіл, $-C_{1-7}$ алкіл $-C_{3-7}$ циклоалкіл та $-C_{3-7}$ циклоалкіл $-C_{1-7}$ алкіл, або R^c та R^d , взяті разом з азотом приєднання, утворюють піперидиніл, піролідиніл, морфолініл, тіоморфолініл або піперазиніл, де кожний R^c та R^d необов'язково та незалежно заміщений R^e ;

R^3 являє собою $-C_{1-4}$ алкіл, $-C_{1-4}$ алкеніл або бензил, кожний необов'язково заміщений $-C_{1-3}$ алкілом, $-OH$ або галогеном, або два замісники R^3 , взяті разом, утворюють C_{2-5} алкілен, необов'язково заміщений $-C_{1-3}$ алкілом, $-OH$ або галогеном;

r означає 0 або ціле число, яке менше ніж або дорівнює сумі $m+n+1$;

Ar являє собою арильне або гетероарильне кільце, вибране з групи, що включає:

a) феніл, необов'язково моно-, ди- або тризаміщений R^1 або дизаміщений на сусідніх атомах вуглецю $-OC_{1-4}$ алкіленO-, $-(CH_2)_{2-3}NH-$, $-(CH_2)_{1-2}NH(CH_2)-$, $-(CH_2)_{2-3}N(C_{1-4} \text{алкіл})-$ або $-(CH_2)_{1-2}N(C_{1-4} \text{алкіл})(CH_2)-$;

R^i вибраний з групи, що включає $-C_{1-7}$ алкіл, $-C_{2-7}$ алкеніл, $-C_{2-7}$ алкініл, $-C_{3-7}$ циклоалкіл, галоген, $-CF_3$, $-OH$, $-OC_{1-7}$ алкіл, $-OCF_3$, $-OC_{3-7}$ алкеніл, $-OC_{3-7}$ алкініл, $-N(R^j)R^k$ (де R^j та R^k незалежно являють собою $-H$ або $-C_{1-4}$ алкіл), $-C(O)N(R^j)R^k$, $-N(R^j)C(O)R^k$, $-N(R^j)SO_2C_{1-6}$ алкіл, $-S(O)_{0-2}C_{1-6}$ алкіл, $-SO_2N(R^j)R^k$, $-SCF_3$, $-C(O)C_{1-6}$ алкіл, $-NO_2$, $-CN$, $-COOH$ та $-COOC_{1-7}$ алкіл;

b) моноциклічну ароматичну вуглеводневу групу, що містить п'ять кільцевих атомів, містить атом вуглецю, який є точкою приєднання, містить один атом вуглецю, замінений на $>O$, $>S$, $>NH$ або $>N(C_{1-4}$ алкіл), містить до двох додаткових атомів вуглецю, необов'язково замінені на $-N=$, необов'язково моно- або дизаміщену R^i ;

(c) моноциклічну ароматичну вуглеводневу групу, що містить шість кільцевих атомів, містить атом вуглецю, який є точкою приєднання, містить один або два атоми вуглецю, замінені на $-N=$, необов'язково моно- або дизаміщену R^i ; та

(d) феніл або піридил, заміщений замісником, вибраним з групи, що включає феніл, фенокси, піридил, тіофеніл, оксазоліл та тетразоліл, де одержаний заміщений компонент необов'язково додатково моно-, ди- або тризаміщений R^i ;

ALK являє собою розгалужений або нерозгалужений C_{1-7} алкілен, C_{2-7} алкенілен, C_{2-7} алкінілен, C_{3-7} циклоалкілен або C_{3-7} циклоалкенілен, необов'язково моно-, ди- або тризаміщений R^m ;

R^m вибраний з групи, що включає галоген, $-CF_3$, $-OH$, $-OC_{1-7}$ алкіл, $-OC_{3-7}$ циклоалкіл, $-OCF_3$, $-N(R^p)R^s$ (де R^p та R^s незалежно являють собою $-H$ або $-C_{1-7}$ алкіл), $-C(O)N(R^p)R^s$, $-N(R^t)C(O)R^t$, $-N(R^t)SO_2C_{1-6}$ алкіл (де R^t являє собою $-H$ або $-C_{1-7}$ алкіл), $-S(O)_{0-2}C_{1-6}$ алкіл, $-SO_2N(R^p)R^s$, $-SCF_3$, $-CN$, $-NO_2$, $-C(O)C_{1-7}$ алкіл, $-COOH$ та $-COOC_{1-7}$ алкіл;

CYC являє собою $-H$ або кільцеву систему, вибрану з групи, що включає:

i) феніл, необов'язково моно-, ди- або тризаміщений R^u або дизаміщений на сусідніх атомах вуглецю $-OC_{1-4}$ алкілен $O-$, $-(CH_2)_{2-3}NH-$, $-(CH_2)_{1-2}NH(CH_2)-$, $-(CH_2)_{2-3}N(C_{1-4}$ алкіл)- або $-(CH_2)_{1-2}N(C_{1-4}$ алкіл) $(CH_2)-$;

R^u вибраний з групи, що включає C_{1-7} алкіл, $-C_{3-7}$ циклоалкіл, феніл, бензил, галоген, $-CF_3$, $-OH$, $-OC_{1-7}$ алкіл, $-OC_{3-7}$ циклоалкіл, $-O$ феніл, $-O$ бензил, $-OCF_3$, $-N(R^v)R^w$ (де R^v та R^w незалежно являють собою $-H$ або $-C_{1-7}$ алкіл, або R^v та R^w , взяті разом з азотом приєднання, утворюють піперидиніл, піролідиніл, морфолініл, тіоморфолініл або піперазиніл, де кожний R^v та R^w необов'язково та незалежно заміщений $-OH$ або $-C_{1-7}$ алкілом), $-C(O)N(R^v)R^w$, $-N(R^x)C(O)R^x$, $-N(R^x)SO_2C_{1-6}$ алкіл (де R^x являє собою $-H$ або $-C_{1-7}$ алкіл, або два R^x в одному заміснику, взяті разом з амідом приєднання, утворюють інше аліфатичне 4-6-членне кільце), $-N(SO_2C_{1-6}$ алкіл) $_2$, $-S(O)_{0-2}C_{1-6}$ алкіл, $-SO_2N(R^v)R^w$, $-SCF_3$, $-C(O)C_{1-6}$ алкіл, $-NO_2$, $-CN$, $-COOH$ та $-COOC_{1-7}$ алкіл;

ii) моноциклічну ароматичну вуглеводневу групу, що містить п'ять кільцевих атомів, містить атом вуглецю, який є точкою приєднання, містить один атом вуглецю, замінений на $>O$, $>S$, $>NH$ або $>N(C_{1-4}$ алкіл), містить до одного додаткового атома вуглецю, необов'язково заміненого на $-N=$, необов'язково моно- або дизаміщену R^u ;

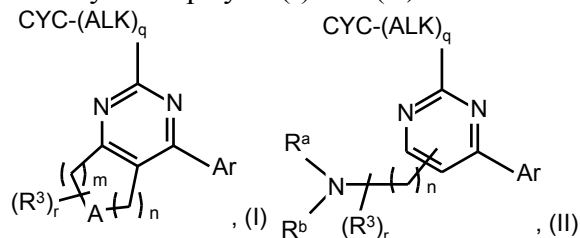
iii) моноциклічну ароматичну вуглеводневу групу, що містить шість кільцевих атомів, містить атом вуглецю, який є точкою приєднання, містить один або два атоми вуглецю, замінені на $-N=$, необов'язково моно- або дизаміщену R^u ; та

iv) неароматичне гетероциклічне кільце, що містить 4-8 членів, зазначене кільце містить 0, 1 або 2 несуміжні гетероатомні члени, вибрані з групи, що включає O , S , $-N=$, $>NH$ та $>N(C_{1-4}$ алкіл), містить 0, 1 або 2 подвійні зв'язки, містить 0, 1 або 2 вуглецеві члени, які є карбонілом, необов'язково містить один вуглецевий член, який утворює місток, містить 0-5 замісників R^u , та де, коли q означає 0, зазначене кільце містить атом вуглецю, який є точкою приєднання;

та ii) енантіомерів, діастереомерів, гідратів, сольватів та фармацевтично прийнятних солей, ефірів та амідів.

38. Спосіб лікування або попередження хвороби або стану, вибраного з групи, що включає: депресію/тривогу, порушення циклу сон/неспанья, порушення добового ритму

організму, мігрень, нетримання сечі, розлад перистальтики шлунка та синдром подразненої товстої кишки, у ссавців, який включає введення ссавцю, що цього потребує, ефективної кількості принаймні однієї сполуки Формули (I) або (II):



де

m означає 1, 2 або 3;

n означає 1, 2 або 3;

де, коли m та n обидва присутні, сума m+n є більшою ніж або дорівнює 2 та є меншою ніж або дорівнює 4;

R^a та R^b незалежно являють собою -H, -C₁₋₇алкіл або -C₁₋₇циклоалкіл, або R^a та R^b , взяті разом з азотом приєднання, утворюють піперидиніл, піролідиніл, морфолініл, тіоморфолініл або піперазиніл, де кожний R^a та R^b необов'язково та незалежно заміщений -C₁₋₄алкілом;

q означає 0 або 1;

A являє собою $>NR^1$, $>CHNR^cR^d$, $>CHOH$ або $-CH_2-$, де

R^1 вибраний з групи, що включає -H, -C₁₋₇алкіл, -C₃₋₇циклоалкіл та бензил, де кожний алкіл, циклоалкіл або бензил є необов'язково моно-, ди- або тризаміщений R^e ;

R^e вибраний з групи, що включає -C₁₋₄алкіл, -C₂₋₄алкеніл, -C₂₋₄алкініл, -C₃₋₆циклоалкіл, галоген, -CF₃, -OH, -OC₁₋₄алкіл, -OCF₃, -N(R^f)R^g (де R^f та R^g незалежно являють собою -H або -C₁₋₄алкіл, або R^f та R^g , взяті разом з азотом приєднання, утворюють піперидиніл, піролідиніл, морфолініл, тіоморфолініл або піперазиніл), -C(O)N(R^f)R^g, -N(R^h)C(O)R^h, -N(R^h)SO₂C₁₋₇алкіл (де R^h являє собою -H або -C₁₋₄алкіл, або два R^h в одному заміснику, взяті разом з амідом приєднання, утворюють інше аліфатичне 4-6-членне кільце), -S(O)₀₋₂C₁₋₄алкіл, -SO₂N(R^f)R^g, -SCF₃, -C(O)C₁₋₄алкіл, -CN, -COOH та -COOC₁₋₄алкіл;

R^c та R^d незалежно вибрані з групи, що включає -H, -C₁₋₇алкіл, -C₃₋₇алкеніл, -C₃₋₇алкініл, -C₃₋₇циклоалкіл, -C₁₋₇алкілC₃₋₇циклоалкіл та -C₃₋₇циклоалкілC₁₋₇алкіл, або R^c та R^d , взяті разом з азотом приєднання, утворюють піперидиніл, піролідиніл, морфолініл, тіоморфолініл або піперазиніл, де кожний R^c та R^d необов'язково та незалежно заміщений R^e ;

R^3 являє собою -C₁₋₄алкіл, -C₁₋₄алкеніл або бензил, кожний необов'язково заміщений -C₁₋₃алкілом, -OH або галогеном, або два замісники R^3 , взяті разом, утворюють C₂₋₅алкілен, необов'язково заміщений -C₁₋₃алкілом, -OH або галогеном;

r означає 0 або ціле число, яке менше ніж або дорівнює сумі m+n+1;

Ar являє собою арильне або гетероарильне кільце, вибране з групи, що включає:

а) феніл, необов'язково моно-, ди- або тризаміщений R^i або дизаміщений на сусідніх атомах вуглецю -OC₁₋₄алкіленO-, -(CH₂)₂₋₃NH-, -(CH₂)₁₋₂NH(CH₂)-, -(CH₂)₂₋₃N(C₁₋₄алкіл)- або -(CH₂)₁₋₂N(C₁₋₄алкіл)(CH₂)-

R^i вибраний з групи, що включає -C₁₋₇алкіл, -C₂₋₇алкеніл, -C₂₋₇алкініл, -C₃₋₇циклоалкіл, галоген, -CF₃, -OH, -OC₁₋₇алкіл, -OCF₃, -OC₃₋₇алкеніл, -OC₃₋₇алкініл, -N(R^j)R^k (де R^j та R^k незалежно являють собою -H або -C₁₋₄алкіл), -C(O)N(R^j)R^k, -N(R^j)C(O)R^k, -N(R^j)SO₂C₁₋₆алкіл, -S(O)₀₋₂C₁₋₆алкіл, -SO₂N(R^j)R^k, -SCF₃, -C(O)C₁₋₆алкіл, -NO₂, -CN, -COOH та -COOC₁₋₇алкіл;

б) моноциклічну ароматичну вуглеводневу групу, що містить п'ять кільцевих атомів, містить атом вуглецю, який є точкою приєднання, містить один атом вуглецю, замінений на >O, >S, >NH або >N(C₁₋₄алкіл), містить до двох додаткових атомів вуглецю, необов'язково замічених на -N=, необов'язково моно- або дизаміщену R^i ;

(с) моноциклічну ароматичну вуглеводневу групу, що містить шість кільцевих атомів, містить атом вуглецю, який є точкою приєднання, містить один або два атоми вуглецю,

замінені на $-N=$, необов'язково моно- або дизаміщену R^i ; та

(d) феніл або піридил, заміщений замісником, вибраним з групи, що включає феніл, фенокси, піридил, тіофеніл, оксазоліл та тетразоліл, де одержаний заміщений компонент необов'язково додатково моно-, ди- або тризаміщений R^i ;

ALK являє собою розгалужений або нерозгалужений C_{1-7} алкілен, C_{2-7} алкенілен, C_{2-7} алкінілен, C_{3-7} циклоалкілен або C_{3-7} циклоалкенілен, необов'язково моно-, ди- або тризаміщений R^m ;

R^m вибраний з групи, що включає галоген, $-CF_3$, $-OH$, $-OC_{1-7}$ алкіл, $-OC_{3-7}$ циклоалкіл, $-OCF_3$, $-N(R^p)R^s$ (де R^p та R^s незалежно являють собою $-H$ або $-C_{1-7}$ алкіл), $-C(O)N(R^p)R^s$, $-N(R^t)C(O)R^t$, $-N(R^t)SO_2C_{1-6}$ алкіл (де R^t являє собою $-H$ або $-C_{1-7}$ алкіл), $-S(O)_{0-2}C_{1-6}$ алкіл, $-SO_2N(R^p)R^s$, $-SCF_3$, $-CN$, $-NO_2$, $-C(O)C_{1-7}$ алкіл, $-COOH$ та $-COOC_{1-7}$ алкіл;

CYC являє собою $-H$ або кільцеву систему, вибрану з групи, що включає:

i) феніл, необов'язково моно-, ди- або тризаміщений R^u або дизаміщений на сусідніх атомах вуглецю $-OC_{1-4}$ алкіленО-, $-(CH_2)_{2-3}NH-$, $-(CH_2)_{1-2}NH(CH_2)-$, $-(CH_2)_{2-3}N(C_{1-4}$ алкіл)- або $-(CH_2)_{1-2}N(C_{1-4}$ алкіл) $(CH_2)-$;

R^u вибраний з групи, що включає C_{1-7} алкіл, $-C_{3-7}$ циклоалкіл, феніл, бензил, галоген, $-CF_3$, $-OH$, $-OC_{1-7}$ алкіл, $-OC_{3-7}$ циклоалкіл, $-Ofеніл$, $-Обензил$, $-OCF_3$, $-N(R^v)R^w$ (де R^v та R^w незалежно являють собою $-H$ або $-C_{1-7}$ алкіл, або R^v та R^w , взяті разом з азотом приєднання, утворюють піперидиніл, піролідиніл, морфолініл, тіоморфолініл або піперазиніл, де кожний R^v та R^w необов'язково та незалежно заміщений $-OH$ або $-C_{1-7}$ алкілом), $-C(O)N(R^v)R^w$, $-N(R^x)C(O)R^x$, $-N(R^x)SO_2C_{1-6}$ алкіл (де R^x являє собою $-H$ або $-C_{1-7}$ алкіл, або два R^x в одному заміснику, взяті разом з амідом приєднання, утворюють інше аліфатичне 4-6-членне кільце), $-N(SO_2C_{1-6}$ алкіл) $_2$, $-S(O)_{0-2}C_{1-6}$ алкіл, $-SO_2N(R^v)R^w$, $-SCF_3$, $-C(O)C_{1-6}$ алкіл, $-NO_2$, $-CN$, $-COOH$ та $-COOC_{1-7}$ алкіл;

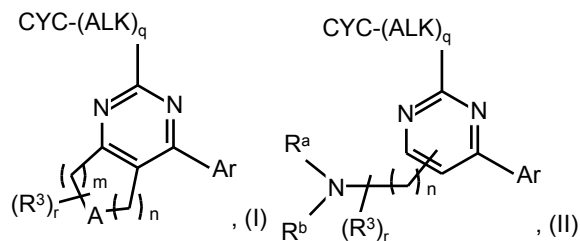
ii) моноциклічну ароматичну вуглеводневу групу, що містить п'ять кільцевих атомів, містить атом вуглецю, який є точкою приєднання, містить один атом вуглецю, замінений на $>O$, $>S$, $>NH$ або $>N(C_{1-4}$ алкіл), містить до одного додаткового атома вуглецю, необов'язково заміненого на $-N=$, необов'язково моно- або дизаміщену R^u ;

iii) моноциклічну ароматичну вуглеводневу групу, що містить шість кільцевих атомів, містить атом вуглецю, який є точкою приєднання, містить один або два атоми вуглецю, замінені на $-N=$, необов'язково моно- або дизаміщену R^u ; та

iv) неароматичне гетероциклічне кільце, що містить 4-8 членів, зазначене кільце містить 0, 1 або 2 несуміжні гетероатомні члени, вибрані з групи, що включає O , S , $-N=$, $>NH$ та $>N(C_{1-4}$ алкіл), містить 0, 1 або 2 подвійні зв'язки, містить 0, 1 або 2 вуглецеві члени, які є карбонілом, необов'язково містить один вуглецевий член, який утворює місток, містить 0-5 замісників R^u , та де, коли q означає 0, зазначене кільце містить атом вуглецю, який є точкою приєднання;

та її енантіомерів, діастереомерів, гідратів, сольватів та фармацевтично прийнятних солей, ефірів та амідів.

39. Спосіб лікування або попередження хвороби або стану, вибраного з групи, що включає: депресію/тривогу, генералізований тривожний розлад, шизофренію, біполярний психоз, психотичні розлади, obsесивно-компульсивний розлад, розлади настрою, розлади, пов'язані з посттравматичним стресом, порушення сну, сексуальну дисфункцію, розлади харчування, мігрень, розлади, викликані залежністю, та розлади периферійних кровоносних судин, у ссавців, який включає введення ссавцю, що цього потребує, ефективної кількості принаймні однієї сполуки Формули (I) або (II):



де

m означає 1, 2 або 3;

n означає 1, 2 або 3;

де, коли m та n обидва присутні, сума m+n є більшою ніж або дорівнює 2 та є меншою ніж або дорівнює 4;

R^a та R^b незалежно являють собою -H, - C_{1-7} алкіл або - C_{3-7} циклоалкіл, або R^a та R^b , взяті разом з азотом приєднання, утворюють піперидиніл, піролідиніл, морфолініл, тіоморфолініл або піперазиніл, де кожний R^a та R^b необов'язково та незалежно заміщений - C_{1-4} алкілом;

q означає 0 або 1;

A являє собою $>NR^1$, $>CHNR^cR^d$, $>CHOH$ або $-CH_2-$, де

R^1 вибраний з групи, що включає -H, - C_{1-7} алкіл, - C_{3-7} циклоалкіл та бензил, де кожний алкіл, циклоалкіл або бензил є необов'язково моно-, ди- або тризаміщений R^e ;

R^e вибраний з групи, що включає - C_{1-4} алкіл, - C_{2-4} алкеніл, - C_{2-4} алкініл, - C_{3-6} циклоалкіл, галоген, $-CF_3$, -OH, $-OC_{1-4}$ алкіл, $-OCF_3$, $-N(R^f)R^g$ (де R^f та R^g незалежно являють собою -H або - C_{1-4} алкіл, або R^f та R^g , взяті разом з азотом приєднання, утворюють піперидиніл, піролідиніл, морфолініл, тіоморфолініл або піперазиніл), $-C(O)N(R^f)R^g$, $-N(R^h)C(O)R^h$, $-N(R^h)SO_2C_{1-7}$ алкіл (де R^h являє собою -H або - C_{1-4} алкіл, або два R^h в одному заміснику, взяті разом з амідом приєднання, утворюють інше аліфатичне 4-6-членне кільце), $-S(O)_{0-2}C_{1-4}$ алкіл, $-SO_2N(R^f)R^g$, $-SCF_3$, $-C(O)C_{1-4}$ алкіл, -CN, -COOH та $-COOC_{1-4}$ алкіл;

R^c та R^d незалежно вибрані з групи, що включає -H, - C_{1-7} алкіл, - C_{3-7} алкеніл, - C_{3-7} алкініл, - C_{3-7} циклоалкіл, - C_{1-7} алкіл- C_{3-7} циклоалкіл та - C_{3-7} циклоалкіл- C_{1-7} алкіл, або R^c та R^d , взяті разом з азотом приєднання, утворюють піперидиніл, піролідиніл, морфолініл, тіоморфолініл або піперазиніл, де кожний R^c та R^d необов'язково та незалежно заміщений R^e ;

R^3 являє собою - C_{1-4} алкіл, - C_{1-4} алкеніл або бензил, кожний необов'язково заміщений - C_{1-3} алкілом, -OH або галогеном, або два замісники R^3 , взяті разом, утворюють C_{2-5} алкілен, необов'язково заміщений - C_{1-3} алкілом, -OH або галогеном;

r означає 0 або ціле число, яке менше ніж або дорівнює сумі m+n+1;

Ar являє собою арильне або гетероарильне кільце, вибране з групи, що включає:

а) феніл, необов'язково моно-, ди- або тризаміщений R^1 або дизаміщений на сусідніх атомах вуглецю $-OC_{1-4}$ алкіленO-, $-(CH_2)_{2-3}NH-$, $-(CH_2)_{1-2}NH(CH_2)-$, $-(CH_2)_{2-3}N(C_{1-4}алкіл)-$ або $-(CH_2)_{1-2}N(C_{1-4}алкіл)(CH_2)-$;

R^1 вибраний з групи, що включає - C_{1-7} алкіл, - C_{2-7} алкеніл, - C_{2-7} алкініл, - C_{3-7} циклоалкіл, галоген, $-CF_3$, -OH, $-OC_{1-7}$ алкіл, $-OCF_3$, $-OC_{3-7}$ алкеніл, $-OC_{3-7}$ алкініл, $-N(R^j)R^k$ (де R^j та R^k незалежно являють собою -H або - C_{1-4} алкіл), $-C(O)N(R^j)R^k$, $-N(R^j)C(O)R^k$, $-N(R^j)SO_2C_{1-6}$ алкіл, $-S(O)_{0-2}C_{1-6}$ алкіл, $-SO_2N(R^j)R^k$, $-SCF_3$, $-C(O)C_{1-6}$ алкіл, $-NO_2$, -CN, -COOH та $-COOC_{1-7}$ алкіл;

б) моноциклічну ароматичну вуглеводневу групу, що містить п'ять кільцевих атомів, містить атом вуглецю, який є точкою приєднання, містить один атом вуглецю, замінений на $>O$, $>S$, $>NH$ або $>N(C_{1-4}алкіл)$, містить до двох додаткових атомів вуглецю, необов'язково замічених на $-N=$, необов'язково моно- або дизаміщену R^i ;

(с) моноциклічну ароматичну вуглеводневу групу, що містить шість кільцевих атомів, містить атом вуглецю, який є точкою приєднання, містить один або два атоми вуглецю, замінені на $-N=$, необов'язково моно- або дизаміщену R^i ; та

(d) феніл або піридил, заміщений замісником, вибраним з групи, що включає феніл, фенокси, піридил, тіофеніл, оксазоліл та тетразоліл, де одержаний заміщений компонент

необов'язково додатково моно-, ди- або тризаміщений R^i ;

ALK являє собою розгалужений або нерозгалужений C_{1-7} алкілен, C_{2-7} алкенілен, C_{2-7} алкінілен, C_{3-7} циклоалкілен або C_{3-7} циклоалкенілен, необов'язково моно-, ди- або тризаміщений R^m ;

R^m вибраний з групи, що включає галоген, $-CF_3$, $-OH$, $-OC_{1-7}$ алкіл, $-OC_{3-7}$ циклоалкіл, $-OCF_3$, $-N(R^p)R^s$ (де R^p та R^s незалежно являють собою $-H$ або $-C_{1-7}$ алкіл), $-C(O)N(R^p)R^s$, $-N(R^t)C(O)R^t$, $-N(R^t)SO_2C_{1-6}$ алкіл (де R^t являє собою $-H$ або $-C_{1-7}$ алкіл), $-S(O)_{0-2}C_{1-6}$ алкіл, $-SO_2N(R^p)R^s$, $-SCF_3$, $-CN$, $-NO_2$, $-C(O)C_{1-7}$ алкіл, $-COOH$ та $-COOC_{1-7}$ алкіл;

CYC являє собою $-H$ або кільцеву систему, вибрану з групи, що включає:

i) феніл, необов'язково моно-, ди- або тризаміщений R^u або дизаміщений на сусідніх атомах вуглецю $-OC_{1-4}$ алкіленO-, $-(CH_2)_{2-3}NH-$, $-(CH_2)_{1-2}NH(CH_2)-$, $-(CH_2)_{2-3}N(C_{1-4}$ алкіл)- або $-(CH_2)_{1-2}N(C_{1-4}$ алкіл) $(CH_2)-$;

R^u вибраний з групи, що включає C_{1-7} алкіл, $-C_{3-7}$ циклоалкіл, феніл, бензил, галоген, $-CF_3$, $-OH$, $-OC_{1-7}$ алкіл, $-OC_{3-7}$ циклоалкіл, $-O$ феніл, $-O$ бензил, $-OCF_3$, $-N(R^v)R^w$ (де R^v та R^w незалежно являють собою $-H$ або $-C_{1-7}$ алкіл, або R^v та R^w , взяті разом з азотом приєднання, утворюють піперидиніл, піролідиніл, морфолініл, тіоморфолініл або піперазиніл, де кожний R^v та R^w необов'язково та незалежно заміщений $-OH$ або $-C_{1-7}$ алкілом), $-C(O)N(R^v)R^w$, $-N(R^x)C(O)R^x$, $-N(R^x)SO_2C_{1-6}$ алкіл (де R^x являє собою $-H$ або $-C_{1-7}$ алкіл, або два R^x в одному заміснику, взяті разом з амідом приєднання, утворюють інше аліфатичне 4-6-членне кільце), $-N(SO_2C_{1-6}$ алкіл) $_2$, $-S(O)_{0-2}C_{1-6}$ алкіл, $-SO_2N(R^v)R^w$, $-SCF_3$, $-C(O)C_{1-6}$ алкіл, $-NO_2$, $-CN$, $-COOH$ та $-COOC_{1-7}$ алкіл;

ii) моноциклічну ароматичну вуглеводневу групу, що містить п'ять кільцевих атомів, містить атом вуглецю, який є точкою приєднання, містить один атом вуглецю, замінений на $>O$, $>S$, $>NH$ або $>N(C_{1-4}$ алкіл), містить до одного додаткового атома вуглецю, необов'язково заміненого на $-N=$, необов'язково моно- або дизаміщену R^u ;

iii) моноциклічну ароматичну вуглеводневу групу, що містить шість кільцевих атомів, містить атом вуглецю, який є точкою приєднання, містить один або два атоми вуглецю, замінені на $-N=$, необов'язково моно- або дизаміщену R^u ; та

iv) неароматичне гетероциклічне кільце, що містить 4-8 членів, зазначене кільце містить 0, 1 або 2 несуміжні гетероатомні члени, вибрані з групи, що включає O , S , $-N=$, $>NH$ та $>N(C_{1-4}$ алкіл), містить 0, 1 або 2 подвійні зв'язки, містить 0, 1 або 2 вуглецеві члени, які є карбонілом, необов'язково містить один вуглецевий член, який утворює місток, містить 0-5 замісників R^u , та де, коли q означає 0, зазначене кільце містить атом вуглецю, який є точкою приєднання;

та її енантіомерів, діастереомерів, гідратів, сольватів та фармацевтично прийнятних солей, ефірів та амідів.

40. Сполука за пунктом 1, яка є ізотопічно міченою для виявлення за допомогою PET або SPECT.

41. Спосіб дослідження розладів, опосередкованих серотоніном, який включає використання ^{18}F -міченої або ^{11}C -міченої сполуки за пунктом 1 як молекулярного зонду в позитронній емісійній томографії (SPECT).

42. Сполука, вибрана з групи, що включає {2-[2-трет-бутил-6-(4-фторфеніл)-піримідин-4-іл]-етил}-метиламін та {2-[2-трет-бутил-6-(4-фторфеніл)-піримідин-4-іл]-етил}-диметиламін.

43. Сполука, яка являє собою 4-(4-фторфеніл)-2-ізопропіл-5,6,7,8-тетрагідропіридо[4,3-d]піримідин або його фармацевтично прийнятну сіль.