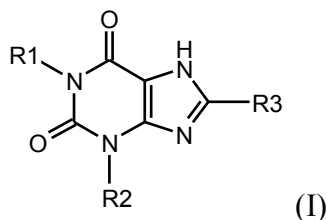


# 1. Сполука формули (I)



та її фармацевтично прийнятні солі або сольвати, де

$R^1$  являє собою  $-(\text{алкілен})_m-X-(\text{алкілен})_n-Y$ ;

де  $m$  і  $n$  рівні числу атомів вуглецю в алкіленовому ланцюзі;

де  $X$  являє собою групу, вибрану з гетероарилу й гетероциклілу;

де  $Y$  являє собою групу, вибрану з арилу, гетероарилу і О-арилу; яка може бути необов'язково заміщена однією або декількома групами, незалежно вибраними з  $C_{1-6}$ алкілу,  $C_{2-6}$ алкенілу,  $C_{2-6}$ алкінілу, галогену,  $-NH_2$ ,  $-(CH_2)_q-(O)_p-(CH_2)_q-N(R^5)C(O)OR^8$ ,  $-(CH_2)_q-N(R^5)C(O)R^8$ ,  $-(CH_2)_q-(O)_p-(CH_2)_q-C(O)NR^5R^6$ ,  $-(CH_2)_q-N(R^5)C(O)N(R^5)R^6$ ,  $-(CH_2)_q-C(O)N((CH_2)_mOH)R^5$ ,  $-(CH_2)_q-N(R^5)-S(O)_2R^8$ ,  $-CH_2-S(O)_2N(R^5)R^6$ ,  $-C_{1-6}$ галогеналкілу,  $-OCF_3$ ,  $-OCH(F)_2$ ,  $-OCH_2F$ ,  $-C(O)OR^5$ ,  $-OR^5$ ,  $-R^8CN$ ,  $CN-SO_2R^9$ ,  $-(CH_2)_n$ гетероарилу,  $-(CH_2)_n$ гетероциклілу,  $-(CH_2)_n$ циклоалкілу,  $-(CH_2)_n$ циклоалкенілу,  $-(CH_2)_n$ арилу;

$R^2$  являє собою  $C_{3-6}$ алкіл;

$R^3$  являє собою галоген;

$R^5$  і  $R^6$  незалежно вибрані з водню і  $C_{1-4}$ алкілу;

$R^7$  являє собою групу, вибрану з  $C_{1-6}$ алкілу,  $C_{2-6}$ алкенілу,  $C_{2-6}$ алкінілу,  $-(CH_2)_n$ циклоалкілу,  $-(CH_2)_n$ циклоалкенілу,  $-(CH_2)_n$ гетероциклілу,  $-(CH_2)_t$ арилу і  $-(CH_2)_t$ гетероарилу;

$R^8$  являє собою  $C_{1-4}$ алкіл;

$R^9$  являє собою групу, вибрану з  $C_{1-6}$ алкіл,  $C_{2-6}$ алкенілу,  $C_{2-6}$ алкінілу,  $-(CH_2)_n$ циклоалкілу,  $-(CH_2)_n$ циклоалкенілу,  $-(CH_2)_n$ гетероциклілу,  $-(CH_2)_n$ арилу,  $-(CH_2)_n$ гетероарилу і  $CN$ ;

$m$  являє собою ціле число, вибране з 3 і 4;

$n$  являє собою ціле число, вибране з 0 і 1;

$p$  являє собою ціле число, вибране з 0 і 1;

$q$  являє собою ціле число, вибране з 0, 1 і 2; і

$t$  являє собою ціле число, вибране з 1 і 2.

2. Сполука формули (I) за п. 1, де  $X$  являє собою групу, вибрану з гетероарилу.

3. Сполука формули (I) за п. 1 або 2, де  $X$  являє собою групу, вибрану з гетероарилу, що містить гетероатом азоту.

4. Сполука формули (I) за п. 3, де  $X$  являє собою оксадіазоліл або тетразол.

5. Сполука формули (I) за будь-яким з вищевказаних пунктів, де  $Y$  являє собою групу, вибрану з арилу та гетероарилу.

6. Сполука формули (I) за будь-яким з вищевказаних пунктів, де  $Y$  необов'язково заміщений одним або декількома галогеном(ами) і  $C_{1-6}$ галогеналкілом(ами).

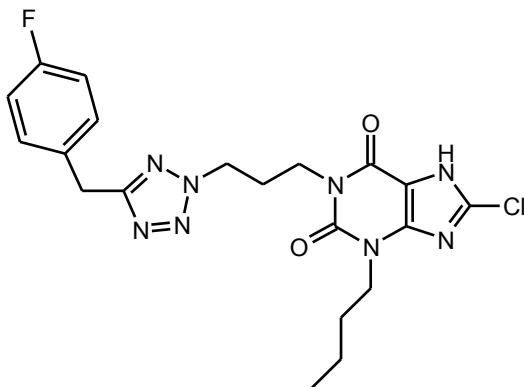
7. Сполука формули (I) за будь-яким з вищевказаних пунктів, де  $R^3$  являє собою хлор.

8. Сполука формули (I) за будь-яким з вищевказаних пунктів, де  $Y$  являє собою феніл, і  $m$  дорівнює 3, і  $n$  дорівнює 1.

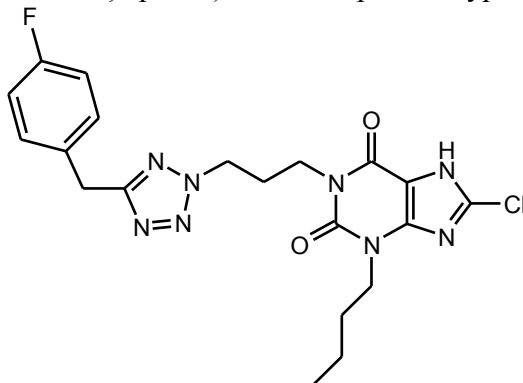
9. Сполука формули (I) за п. 1, де  $X$  являє собою тетразоліл,  $R^2$  являє собою бутіл і  $R^3$  являє собою хлор.

10. Сполука формули (I) за п. 1, де  $X$  являє собою оксадіазоліл,  $Y$  являє собою піридиніл,  $R^2$  являє собою бутіл,  $R^3$  являє собою хлор,  $m$  дорівнює 4, і  $n$  дорівнює 0.

11. Сполука формули (I) за п. 1, яка являє собою 3-бутил-8-хлор-1-(3-{5-[(4-фторфеніл)метил]-2Н-тетразол-2-іл}пропіл)-3,7-дигідро-1Н-пурин-2,6-діон



12. Сполука формули (I) за п. 1, яка являє собою 3-бутил-8-хлор-1-(3-{5-[(4-фторфеніл)метил]-2Н-тетразол-2-іл}пропіл)-3,7-дигідро-1Н-пурин-2,6-діон



або його фармацевтично прийнятну сіль.

13. Сполука формули (I) за будь-яким з вищевказаних пунктів для застосування при лікуванні людини або у ветеринарії.

14. Сполука формули (I) за будь-яким з пп. 1-12 для застосування при лікуванні діабетичної дисліпідемії та змішаної дисліпідемії та гіперліпопротеїнемії і/або запальних захворювань або станів.

15. Сполука формули (I) за будь-яким з пп. 1-12 для застосування в лікуванні діабетичної дисліпідемії, змішаної дисліпідемії, серцевої недостатності, гіперхолестеринемії, серцево-судинного захворювання, включаючи атеросклероз, артеріосклероз, гіпертригліцеридемію, цукрового діабету типу II, діабету типу I, резистентності до інсуліну, гіперліпідемії, нервової анорексії, ожиріння, захворювання коронарних артерій, тромбозу, стенокардії, хронічної ниркової недостатності, захворювання периферичних судин або інсульту.

16. Сполука формули (I) за будь-яким з пп. 1-12 для застосування в одержанні лікарського засобу для лікування діабетичної дисліпідемії, змішаної дисліпідемії, серцевої недостатності, гіперхолестеринемії, серцево-судинного захворювання, включаючи атеросклероз, артеріосклероз, гіпертригліцеридемію, цукрового діабету типу II, діабету типу I, резистентності до інсуліну, гіперліпідемії, нервової анорексії, ожиріння, захворювання коронарних артерій, тромбозу, стенокардії, хронічної ниркової недостатності або інсульту.

17. Спосіб лікування стану людини або тварини, при якому передактивація рецептора НМ74А могла б мати ефект у відношенні захворювання або при якому активація рецептора буде ефективною, де вводять зазначеній хворій людині або тварині ефективну кількість сполуки формули (I) за будь-яким з пп. 1-12.

18. Спосіб за п. 17, де людина або тварина має діабетичну дисліпідемію, змішану дисліпідемію і гіперліпопротеїнемію або запальне захворювання чи стан.

19. Фармацевтична композиція, що містить сполуку формули (I) за будь-яким з пп. 1-12 і щонайменше один фармацевтично прийнятний розріджувач, наповнювач або носій.

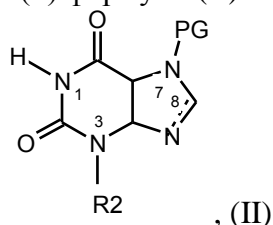
20. Комбінація для спільного або роздільного введення, послідовно або одночасно, в

роздільних або комбінованих фармацевтичних композиціях, де зазначена комбінація містить сполуку формули (I) за будь-яким з пп. 1-12 разом із щонайменше одним терапевтично активним засобом.

21. Фармацевтична композиція, що містить:

- (i) сполуку формули (I) за будь-яким з пп. 1-12;
- (ii) один або декілька терапевтично активних засобів, вибраних зі статинів, фібрів, смол, що зв'язують жовчну кислоту, і нікотинової кислоти; і
- (iii) один або декілька фармацевтично прийнятних розріджувачів, наповнювачів або носіїв.

22. Спосіб одержання сполуки формули (I) за будь-яким з пп. 1-12 з відповідної вихідної речовини, наприклад, сполук(и) формули (II):



де PG=захисна група, де здійснюють:

- (i) алкілювання в N1 N7 захищеного ксантину;
- (ii) алкілювання в N3 N7 захищеного ксантину;
- (iii) галогенування в C8; і
- (iv) видалення захисної групи N7; у будь-якому порядку, за умови, що видалення захисної групи виконують після алкілювання.