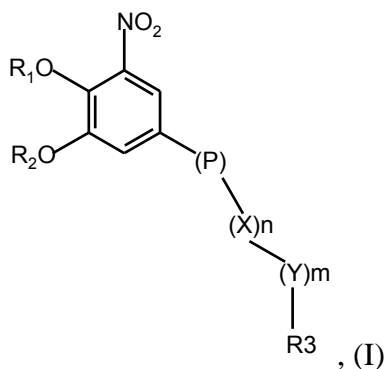


1. Сполука формули (I):



де R_1 і R_2 є незалежно одна від одної воднем або групою, що здатна гідролізуватись при фізіологічних умовах, необов'язково заміщеними нижчим алканойлом або ароїлом;

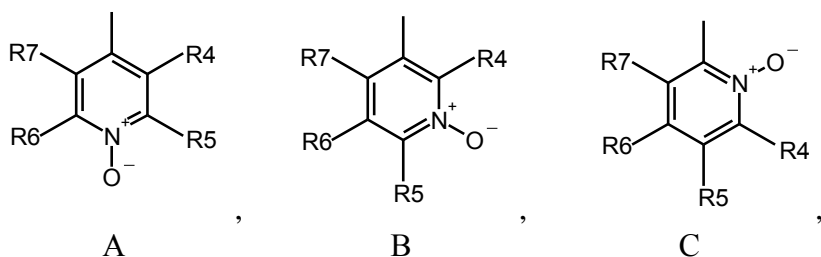
X представляє метиленову групу;

Y представляє атом кисню, нітрогену або сульфуру;

n представляє число 0, 1, 2 або 3, а

m представляє число 0 або 1;

R_3 представляє групу піридин N-оксиду згідно з формулою А, В або С, яка сполучена як позначено невідміченим зв'язком:



де R_4 , R_5 , R_6 і R_7 незалежно одна від одної представляють водень, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -тіоалкіл, C_1 - C_6 -алкокси, C_6 - C_{12} -арилокси або C_6 - C_{12} -тіоарилову групу, C_1 - C_6 -алканойл або C_7 - C_{13} -аройлову групу, аміно, C_1 - C_6 -алкіламіно, C_1 - C_6 -діалкіламіно, C_3 - C_{12} -циклоалкіламіно або C_3 - C_{12} -гетероциклоалкіламіно, C_1 - C_6 -алкілсульфоніл або C_6 - C_{12} -арилсульфоніл, галоген, C_1 - C_6 -галоалкіл, трифторметил, ціано, нітро або гетероарильну групу;

або де два або більше залишків R_4 , R_5 , R_6 і R_7 взяті разом, представляють аліфатичні або гетероаліфатичні кільця або ароматичні або гетероароматичні кільця, і де P представляє центральний блок, переважно вибраний з регіоізомерів 1,3,4-оксадіазол-2,5-діїлу, 1,2,4-оксадіазол-3,5-діїлу, 4-метил-4Н-1,2,4-триазол-3,5-діїлу, 1,3,5-триазин-2,4-діїлу, 1,2,4-триазин-3,5-діїлу, 2Н-тетразол-2,5-діїлу, 1,2,3-тіадіазол-4,5-діїлу, 1-алкіл-3-(алкоксикарбоніл)-1Н-пірол-2,5-діїлу, де алкіл представлений метилом, етилом, n-пропілом і n-бутилом, і де алкокси представлений метокси, етоксис, n-пропокси і ізопропокси, 1-алкіл-1Н-пірол-2,5-діїлом, де алкіл представлений метилом, етилом, n-пропілом і n-бутилом, тіазол-2,4-діїлом, 1-Н-піразол-1,5-діїлом, піримідин-2,4-діїлом, оксазол-2,4-діїлом, карбонілом, 1Н-імідазол-1,5-діїлом, ізоксазол-3,5-діїлом, фуран-2,4-діїлом, 3-алкоксикарбонілфуран-2,4-діїлом, де алкокси представлений метокси, етоксис, n-пропокси і ізопропокси, бензол-1,3-діїлом і (Z)-1-ціаноетен-1,2-діїлом, і де регіоізомери центрального блока включають обидва регіоізомери, отримані обміном частини нітрокатехолу і частини - $(X)_n$ -(Y) $_m$ - R_3 .

2. Сполука за п. 1, вибрана з групи, що включає

- 5-[3-(3,5-дихлор-1-оксипіридин-4-іл)-[1,2,4]оксадіазол-5-іл]-3-нітробензол-1,2-діол,
- 5-[3-(2-хлор-1-оксипіридин-4-іл)-[1,2,4]оксадіазол-5-іл]-3-нітробензол-1,2-діол,
- 5-[3-(2-морфолін-4-іл-1-оксипіридин-4-іл)-[1,2,4]оксадіазол-5-іл]-3-нітробензол-1,2-діол,
- 3-нітро-5-[3-(1-окси-4-трифторметилпіридин-3-іл)-[1,2,4]оксадіазол-5-іл]-бензол-1,2-діол,
- 5-[3-(4-бром-1-оксипіридин-3-іл)-[1,2,4]оксадіазол-5-іл]-3-нітробензол-1,2-діол,
- 5-[3-(2-хлор-6-метил-1-оксипіридин-3-іл)-[1,2,4]оксадіазол-5-іл]-3-нітробензол-1,2-діол,
- 5-[3-(2-морфолін-4-іл-1-оксипіридин-3-іл)-[1,2,4]оксадіазол-5-іл]-3-нітробензол-1,2-діол,
- 3-нітро-5-[3-(1-окси-6-трифторметилпіридин-3-іл)-[1,2,4]оксадіазол-5-іл]-бензол-1,2-діол,

5-[3-(2-метил-1-окси-6-трифторметилпіридин-3-іл)-[1,2,4]оксадіазол-5-іл]-3-нітробензол-1,2-діол,
 5-[3-(6-метил-1-окси-4-трифторметилпіридин-3-іл)-[1,2,4]оксадіазол-5-іл]-3-нітробензол-1,2-діол,
 5-[3-(2,6-диметил-1-окси-4-трифторметилпіридин-3-іл)-[1,2,4]оксадіазол-5-іл]-3-нітробензол-1,2-діол,
 5-[3-(2-метил-1-окси-6-феніл-4-трифторметилпіридин-3-іл)-[1,2,4]оксадіазол-5-іл]-3-нітробензол-1,2-діол,
 5-[3-(6-метил-1-окси-2-феніл-4-трифторметилпіридин-3-іл)-[1,2,4]оксадіазол-5-іл]-3-нітробензол-1,2-діол,
 5-[3-(2-бром-6-метил-1-оксипіридин-3-іл)-[1,2,4]оксадіазол-5-іл]-3-нітробензол-1,2-діол,
 5-[3-(2-хлор-4,6-диметил-1-оксипіридин-3-іл)-[1,2,4]оксадіазол-5-іл]-3-нітробензол-1,2-діол,
 5-[3-(2-бром-4,6-диметил-1-оксипіридин-3-іл)-[1,2,4]оксадіазол-5-іл]-3-нітробензол-1,2-діол,
 5-[3-(2-бром-4,5,6-триметил-1-оксипіридин-3-іл)-[1,2,4]оксадіазол-5-іл]-3-нітробензол-1,2-діол,
 5-[3-(2-хлор-4,5,6-триметил-1-оксипіридин-3-іл)-[1,2,4]оксадіазол-5-іл]-3-нітробензол-1,2-діол,
 5-[3-(2,5-дихлор-4,6-диметил-1-оксипіридин-3-іл)-[1,2,4]оксадіазол-5-іл]-3-нітробензол-1,2-діол,
 5-[3-(2-бром-5-хлор-4,6-диметил-1-оксипіридин-3-іл)-[1,2,4]оксадіазол-5-іл]-3-нітробензол-1,2-діол і
 3-нітро-5-[3-(1-окси-2-трифторметилпіридин-3-іл)-[1,2,4]оксадіазол-5-іл]-бензол-1,2-діол.

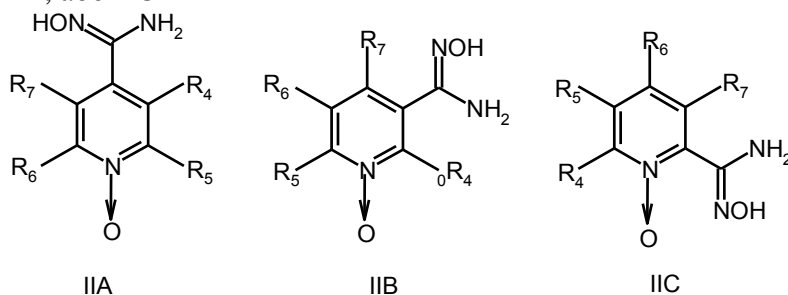
3. Фармацевтична композиція, що містить терапевтично ефективну кількість сполуки за п. 1 або п. 2 у комбінації з фармацевтично прийнятним носієм.

4. Спосіб лікування суб'єкта, ураженого порушеннями центральної або периферичної нервової системи, причому при зазначеному способі суб'єкту вводять ефективну кількість сполуки за п. 1 або п. 2 або фармацевтичної композиції за п. 3.

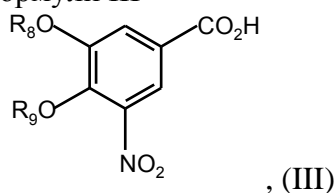
5. Спосіб за п. 4, де порушення вибрано з порушень настрою, хвороби Паркінсона і паркінсонівських порушень, синдрому втомлених ніг, шлунково-кишкових розладів, станів, що супроводжуються утворенням едеми, і гіпертензії.

6. Сполука за п. 1 або п. 2 для виготовлення лікарського засобу для застосування як КОМТ (катехол-О-метилтрансфераза) інгібітора.

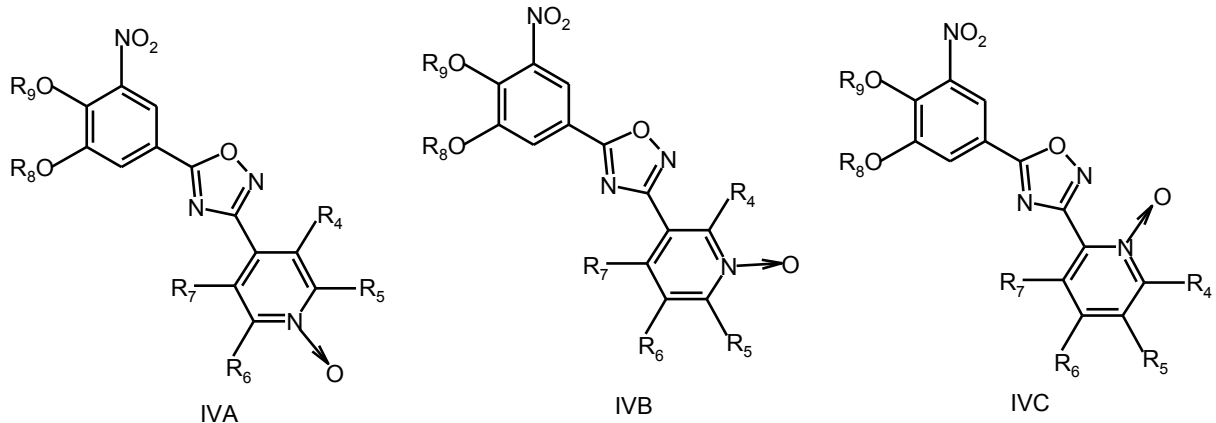
7. Спосіб отримання сполук згідно з формулою I, що включає етапи, де сполуку формули IIА або IIВ, або IIС



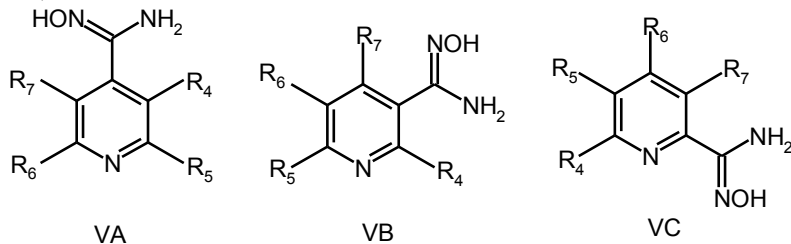
де R₄, R₅, R₆ і R₇ визначені, як у загальній формулі I за п. 1, піддають циклізації зі сполукою формули III



де R₈ і R₉ незалежно одна від одної представляють водень або придатні захисні групи для ароматичних гідроксильних груп, при умовах, придатних для отримання похідних оксадіазолу формули IVA, IVB або IVC



необов'язково з наступним видаленням захисних груп R_8 і/або R_9 .



де R₄, R₅, R₆ і R₇ визначені, як у загальній формулі I за п. 1,
піддають циклізації зі сполукою формули III при умовах, придатних для отримання похідних
оксадіазолу формули VIA, VIB або VIC

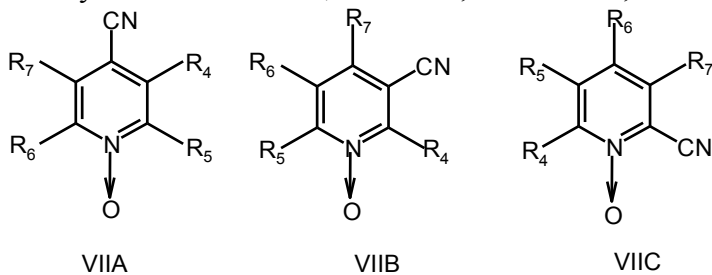
з наступним окисненням атома нітрогену піридилу для отримання сполуки згідно з формулою IVA або IVB, або IVC, необов'язково з наступним видаленням захисних груп R₈ і/або R₉.

16. Спосіб за будь-яким з пп. 7-15, де конденсацію і дегідратацію здійснюють у диполярному апротонному розчиннику.

17. Спосіб за п. 16, де конденсацію і дегідратацію здійснюють у диметилацетаміді, N-метилпіролідіноні або диметилсульфоксиді.

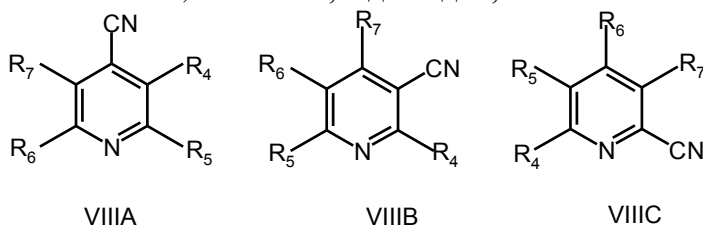
18. Спосіб за будь-яким з пп. 8-17, де атом нітрогену піридилу сполуки оксадіазолілу формули VIA або VIB, або VIC окислюють пероксидом водню, надоцтовою кислотою, трифторнадоцтовою кислотою або комплексом перекису водню з сечовиною і трифтороцтовим ангідридом.

19. Спосіб за будь-яким з пп. 7 і 9-17, де сполуку формули IIA або IIB, або IIC отримують реакцією сполуки VIIA або VIIB, або VIIC, відповідно,



де R₄, R₅, R₆ і R₇ визначені, як у загальній формулі I за п. 1, з гідроксиламіном у присутності хелатного агента при умовах, придатних для отримання похідних амідоксиму.

20. Спосіб за будь-яким з пп. 8-17, де сполуку формули VA, VB або VC отримують реакцією сполуки VIIIA або VIIB, або VIIC, відповідно,



де R₄, R₅, R₆ і R₇ визначені як у загальній формулі I за п. 1, з гідроксиламіном у присутності хелатного агента при умовах, придатних для отримання похідних амідоксиму.

21. Спосіб за п. 17 або 18, де хелатний агент вибирають з групи, що складається з 8-гідроксихіноліну, орто-фенантроліну і їх гідратів або похідних.

22. Спосіб отримання сполук за формулою I, при якому виконують окислення відповідної сполуки піридину до сполуки піридин N-оксиду.