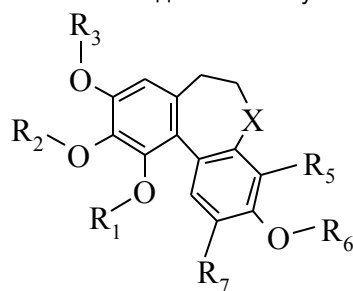


1. Спосіб лікування захворювань, пов'язаних з ангіогенезом, який включає введення похідної колхінолу, де названа похідна колхінолу має формулу:



I

де

R₁, R₂, R₃ та R₆ незалежно являють собою H, необов'язково заміщений алкіл, циклоалкіл, алкеніл, алкініл, аралкіл, алканойл, PO₃H₂;

X являє собою карбоніл (CO), тіокарбоніл (CS), метилен (CH₂) або групу CHR₄;

R₄ являє собою OH, O-алкіл або NR₈R₉;

R₅ і R₇ незалежно являють собою H, алкіл, галоген, гідрокси-, алкокси-, нітро- або аміногрупу;

R₈ являє собою H, необов'язково заміщений алкіл, циклоалкіл, алканойл, тіоалканойл, арил, гетероарил, арилкарбоніл, гетероарилкарбоніл, алкоксикарбоніл, арилоксикарбоніл, амінокарбоніл, алкіламінокарбоніл, діалкіламінокарбоніл, ариламінокарбоніл, алкілсульфоніл, арилсульфоніл, аміносульфоніл, алкіламіносульфоніл, діалкіламіносульфоніл або ариламіносульфоніл;

R₉ являє собою H, алкіл або циклоалкіл;

та їх фармацевтично прийнятних солей, сольватів і гідратів.

2. Спосіб за пунктом 1, де принаймні один з R₁, R₂, R₃ і R₆ являє собою PO₃H₂.

3. Спосіб за пунктом 2, де R₆ являє собою PO₃H₂.

4. Спосіб за будь-яким з пунктів 1-3, де R₁, R₂ та R₃ являють собою алкіл.

5. Спосіб за будь-яким з пунктів 1-4, де R₄ являє собою ациламіногрупу.

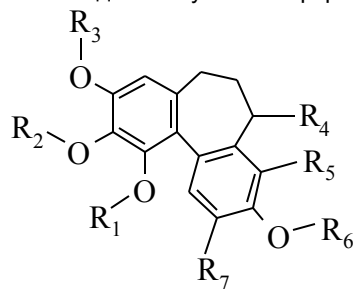
6. Спосіб за пунктом 1, де R₆ являє собою PO₃H₂, R₁, R₂ та R₃ являють собою алкіл, і R₄ являє собою ациламіногрупу.

7. Похідна колхінолу, яка має формулу I, визначена як зазначено в п.1, де принаймні один з R₁, R₂, R₃ і R₆ являє собою PO₃H₂.

8. Похідна за пунктом 7, де R₆ являє собою PO₃H₂.

9. Похідна за пунктом 8, де R₁, R₂ та R₃ являють собою алкіл, а R₄ являє собою ациламіногрупу.

10. Похідна за пунктом 7 формули:



II

де

R₁, R₂ і R₃ незалежно являють собою H, необов'язково заміщений алкіл, циклоалкіл, алкеніл, алкініл, алканойл або PO₃H₂;

R₆ являє собою PO₃H₂;

R₄ - являє собою H або NR₈R₉;

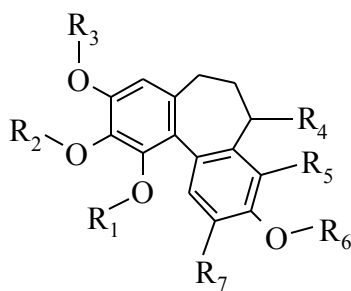
R₅ і R₇ незалежно являють собою H, алкіл, галоген, алкокси-, нітро- або аміногрупу;

R₈ являє собою H, необов'язково заміщений алкіл, циклоалкіл, алканойл, тіоалканойл, арил, гетероарил, арилкарбоніл, гетероарилкарбоніл, алкоксикарбоніл, арилоксикарбоніл, амінокарбоніл, алкіламінокарбоніл, діалкіламінокарбоніл, ариламінокарбоніл, алкілсульфоніл, арилсульфоніл, аміносульфоніл, алкіламіносульфоніл, діалкіламіносульфоніл або ариламіносульфоніл;

і R₉ являє собою H, алкіл або циклоалкіл,

та її фармацевтично прийнятні солі, сольвати і гідрати.

11. Сполука формули:



Ia

де

R₁, R₂ і R₃ незалежно являють собою H, необов'язково заміщений алкіл, циклоалкіл, алкеніл, алкініл, алканол або PO₃H₂;

R₆ являє собою H, необов'язково заміщений алкіл, циклоалкіл, алкеніл, алкініл або PO₃H₂;

R₄ являє собою H або NR₈R₉;

R₅ і R₇ незалежно являють собою H, алкіл, галоген, нітро- або аміногрупу;

R₈ являє собою H, необов'язково заміщений алкіл, циклоалкіл, алканол, піалканол, арил, гетероарил, арилкарбоніл, гетероарилкарбоніл, алкоксикарбоніл, арилоксикарбоніл амінокарбоніл, алкіламінокарбоніл, діалкіламінокарбоніл, ариламінокарбоніл, алкілсульфоніл, арилсульфоніл, аміносурьфоніл, алкіламіносурьфоніл, діалкіламіносурьфоніл або ариламіносурьфоніл;

і R₉ являє собою H, алкіл або циклоалкіл, за умови, що коли R₁, R₂ і R₃ всі являють собою метильні групи та R₄ являє собою водень, ацетиламіно-, ацетилметиламіно-, аміно, метиламіно- або диметиламіногрупу, тоді R₆ не є воднем, метилом, гідроксетилом або ацетоксетилом, та її фармацевтично прийнятні солі, сольвати і гідрати.

12. Сполука за пунктом 11, в якій R₁, R₂ і R₃ являють собою алкіл, і R₄ являє собою ациламіногрупу.

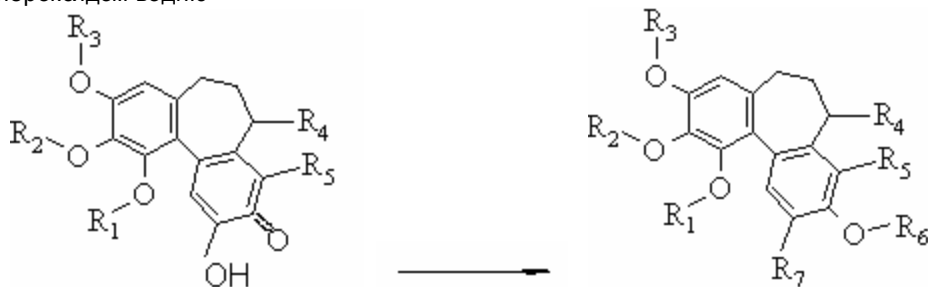
13. Сполука за п. 7, яка являє собою N-ацетилколінол-О-фосфат, та її солі, сольвати і гідрати.

14. Спосіб лікування захворювань, пов'язаних з ангіогенезом, який включає введення похідної сполуки за п.13 або її фармацевтично прийнятної солі, сольвату або гідрату.

15. Фармацевтична композиція, яка включає сполуку за будь-яким з пп. 7-12 і ексципієнт.

16. Фармацевтична композиція за п. 15, де сполука являє собою N-ацетилколінол-О-фосфат або її фармацевтично прийнятну сіль, сольват або гідрат.

17. Спосіб одержання сполук за будь-яким з пп. 7-13, який включає обробку сполук формули (2) лужним пероксидом водню



(2)

II або IIa

де R₁, R₂, R₄, R₅, R₆ і R₇ визначені як зазначено в будь-якому з пп. 7, 10, 11.

18. Спосіб одержання сполук за будь-яким з пп. 7-13, який включає хімічну модифікацію іншої сполуки формули I, II або IIa, як вони визначені в п. 1, 10 і 11 відповідно.