

1. Сполука згідно з загальною формулою (1)

A-B-C-D(-E)<sub>p</sub> (1)

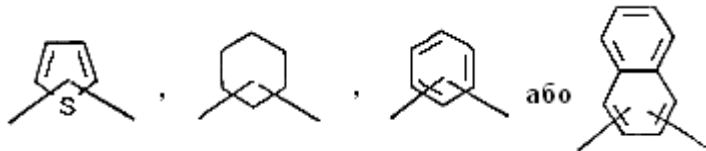
де p дорівнює 0 або 1,

A являє собою водень або R<sup>1</sup>-(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>-(X)-r-(CH<sub>2</sub>)<sub>s</sub>-CO-, де

q дорівнює 0 або цілому числу, вибраному з групи: 1,2,3,4,5, r дорівнює 0 або 1, s дорівнює 0 або цілому числу, вибраному з групи: 1,2,3,4,5,

R<sup>1</sup> являє собою водень, імідазоліл, гуанідино, піперазино, морфоліно, піперидино або N(R<sup>2</sup>)-R<sup>3</sup>, де кожний радикал R<sup>2</sup> та R<sup>3</sup> незалежно являє собою водень або нижчий алкіл, що як варіант заміщується однією чи кількома гідроксил-, піридиніл- або фуранілгрупами, і

X, якщо r дорівнює 1, являє собою -NH-, -CH<sub>2</sub>-, -CH=CH-, -C(R<sup>16</sup>)(R<sup>17</sup>)-,



де кожний з радикалів R<sup>16</sup> та R<sup>17</sup> незалежно є воднем або нижчим алкілом, B являє собою (G)<sub>r</sub>(H)<sub>u</sub>, де кожний з t та u незалежно дорівнює 0 або 1,

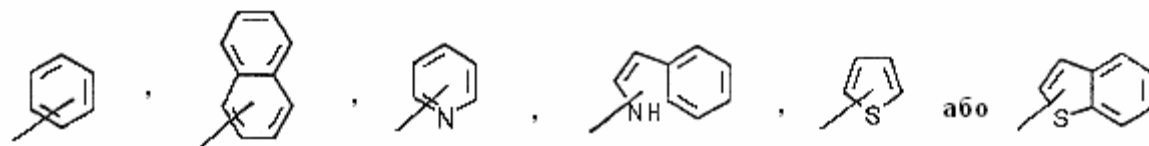
G і H являють собою амінокислотні залишки (радикали), вибрані з групи, до якої належать природні L-амінокислоти чи їх відповідні D-ізомери, або ненатуральні (штучні) амінокислоти, такі як 1,4-діамінобутирова кислота, аміноізобутирова кислота, 1,3-діамінопропіонова кислота, 4-амінофенілаланін, 3-піридилаланін, 1,2,3,4-тетрагідроізохінолін-3-карбонова кислота, 1,2,3,4-тетрагідроноргарман-3-карбонова кислота, N-метилантранілова кислота, антранілова кислота, N-бензилглїцин, 3-амінометилбензойна кислота, 3-аміно-3-метилбутанова кислота, саркозин, ніпекотова кислота або ізоніпекотова кислота,

і де, коли як t, так і u дорівнюють 1, амідний зв'язок між G та H варіативно може заміщуватись Y-NR<sup>18</sup>, де Y є -CO- або -CH<sub>2</sub>-, і R<sup>18</sup> являє собою водень, нижчий алкіл або нижчий аралкіл,

C являє собою D-амінокислоту з формулою -NH-CH((CH<sub>2</sub>)<sub>w</sub>-R<sup>4</sup>)-CO-, де

w дорівнює 0, 1 або 2, і

R<sup>4</sup> вибрано з групи, до якої належать



кожний з котрих як варіант заміщується галогеном, нижчим алкілом, нижчим алкілокси, нижчим алкіламіно, аміно або гідрокси,

D, якщо p дорівнює 1, являє собою D-амінокислоту з формулою -NR<sup>20</sup>-CH((CH<sub>2</sub>)<sub>k</sub>-R<sup>5</sup>)-CO- або, якщо p дорівнює 0, D являє собою -NR<sup>20</sup>-CH((CH<sub>2</sub>)<sub>l</sub>-R<sup>5</sup>)-CH<sub>2</sub>-R<sup>6</sup> або

-NR<sup>20</sup>-CH((CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-R<sup>5</sup>)-CR<sup>6</sup>,

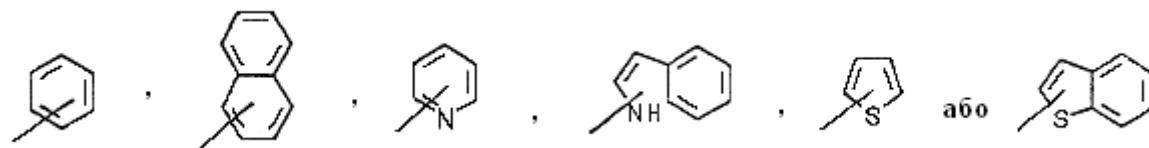
де

k дорівнює 0, 1 або 2,

l дорівнює 0, 1 або 2,

m дорівнює 0, 1 або 2, R<sup>20</sup> вибрано з групи, до якої належать нижчий алкіл або нижчий аралкіл;

R<sup>5</sup> вибрано з групи, до якої належать

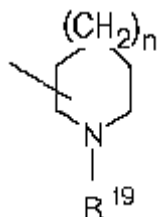


кожний з котрих як варіант заміщується галогеном, нижчим алкілом, нижчим алкілокси, аміно або гідрокси, і

R<sup>6</sup> являє собою піперазино, морфоліно, піперидино, -OH або -N(R<sup>7</sup>)-R<sup>8</sup>, де кожний з радикалів R<sup>7</sup> та R<sup>8</sup> незалежно являє собою водень або нижчий алкіл,

E, якщо p дорівнює 1, являє собою -NH-CH(R<sup>10</sup>)-(CH<sub>2</sub>)<sub>v</sub>-R<sup>9</sup>, де v дорівнює 0 або цілому числу, вибраному з групи: 1,2,3,4,5,6,7,8,

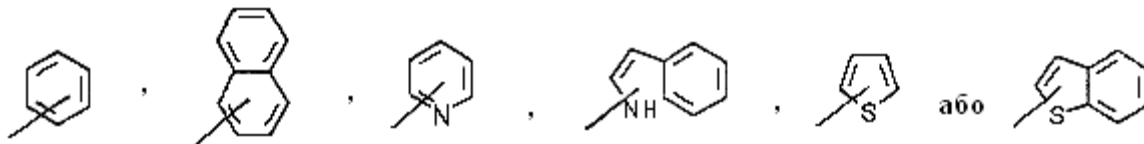
R<sup>9</sup> являє собою водень, імідазоліл, гуанідино, піперазино, морфоліно, піперидино, -N(R<sup>11</sup>)-R<sup>12</sup>,



де n дорівнює 0, 1 або 2, та R<sup>19</sup> являє собою водень або нижчий алкіл,



де о дорівнює цілому числу, вибраному з групи: 1, 2, 3, кожний з радикалів  $R^{11}$  та  $R^{12}$  незалежно являє собою водень або нижчий алкіл, або



кожний з котрих як варіант заміщується галогеном, нижчим алкілом, нижчим алкілокси, аміно, алкіламіно, гідрокси, або продуктом перегрупування Амадори з аміногрупи та гексапіранози або гексапіранозилгексапіранози і  $R^{10}$ , якщо  $p$  дорівнює 1, вибрано з групи, до якої належать H,  $-\text{COOH}$ ,  $-\text{CH}_2\text{-R}^{13}$ ,  $-\text{CO-R}^{13}$  або  $-\text{CH}_2\text{-OH}$ , де  $R^{13}$  являє собою піперазино, морфоліно, піперидино,  $-\text{OH}$  або  $-\text{N(R}^{14})\text{-R}^{15}$ , де кожний з  $R^{14}$  та  $R^{15}$  незалежно являють собою водень або нижчий алкіл, всі амідні зв'язки в формулі 1, за винятком зв'язку між C та D, можуть незалежно бути заміщеними  $-\text{Y-N R}^{18}$ , де Y являє собою  $-\text{CO-}$  або  $-\text{CH}_2-$ , і  $R^{18}$  являє собою водень, нижчий алкіл чи нижчий аралкіл, або її фармацевтично прийнятна сіль, за винятком сполук

(3-амінометилбензоїл)-D-2Nal-N-Me-D-Phe-Lys-NH<sub>2</sub>,

H-Aib-His-D-2Nal-N-Me-D-Phe-Lys-NH<sub>2</sub>,

H-Aib-His-N-Me-D-2Nal-N-Me-D-Phe-Lys-NH<sub>2</sub>,

3-(H-Aib-His-D-2Nal-N-Me-D-Phe-NH)-1-морфолінопропан,

2-(H-Aib-His-D-2Nal-N-Me-D-Phe-NH)-(1-метил-2-піролідиніл)етан,

((3R)-піперидинкарбоніл)-N-Me-D-2Nal-N-Me-D-Phe-Lys-NH<sub>2</sub>,

3-((3-амінометилбензоїл)-D-2Nal-N-Me-D-Phe-NH)-1-морфолінопропан,

2-(H-Aib-His-N-Me-D-2Nal-N-Me-D-Phe-NH)-(1-метил-2-піролідиніл)етан,

2-(((3R)-піперидинкарбоніл)-N-Me-D-2Nal-N-Me-D-Phe-NH)-(1-метил-2-піролідиніл)етан,

2-((3-амінометилбензоїл)-N-Me-D-2Nal-Me-D-Phe-NH)-(1-метил-2-піролідиніл)етан,

3-(H-Aib-His-N-Me-D-2Nal-N-Me-D-Phe-NH)-1-морфолінопропан,

3-(((3R)-піперидинкарбоніл)-N-Me-D-2Nal-N-Me-D-Phe-NH)-1-морфолінопропан,

3-((3-амінометилбензоїл)-N-Me-D-2Nal-N-Me-D-Phe-NH)-1-морфолінопропан,

2-((3-амінометилбензоїл)-D-2Nal-N-Me-D-Phe-NH)-(1-метил-2-піролідиніл)етан,

2-(((3R)-піперидинкарбоніл)-D-2Nal-N-Me-D-Phe-NH)-(1-метил-2-піролідиніл)етан.

2. Сполука по п.1, яка **відрізняється** тим, що A являє собою водень, 3-AMB, N-Me-3-AMB або Aib.

3. Сполука по п.1, яка **відрізняється** тим, що t дорівнює 1 та u дорівнює 0, і G вибрано з групи, до якої належать 3-амінометилбензоїл, ніпекотова кислота та ізоніпекотова кислота.

4. Сполука по п.1, яка **відрізняється** тим, що t дорівнює 1, u дорівнює 1, G являє собою Aib, і H вибрано з групи, до якої належать His, Phe та Ala.

5. Сполука по п.1, яка **відрізняється** тим, що C вибрано з групи, до якої належать D-2-Nal та D-Phe.

6. Сполука по п.1, яка **відрізняється** тим, що якщо p дорівнює 1, D являє собою D-Phe або D-2Nal.

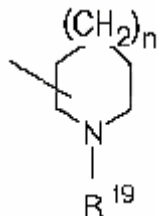
7. Сполука по п.1, яка **відрізняється** тим, що якщо p дорівнює 0, D являє собою D-Phe-NH<sub>2</sub> або D-2Nal- NH<sub>2</sub>.

8. Сполука по п.1, яка **відрізняється** тим, що E, якщо p дорівнює 1, являє собою -

NH-CH(R<sup>10</sup>)-(CH<sub>2</sub>)<sub>v</sub>-R<sup>9</sup>, де

v дорівнює 0 або цілому числу, вибраному з групи: 1,2,3,4,

R<sup>9</sup> являє собою водень, морфоліно, піперидино, N(R<sup>11</sup>)-R<sup>12</sup>



або

де n дорівнює 0, 1 або 2, та R<sup>19</sup> являє собою водень або нижчий алкіл, кожний з радикалів R<sup>11</sup> та R<sup>12</sup> незалежно являє собою водень або нижчий алкіл,

R<sup>10</sup>, якщо p дорівнює 1, вибрано з групи, до якої належать H,  $-\text{COOH}$ ,  $-\text{CH}_2\text{-R}^{13}$ ,  $-\text{CO-R}^{13}$  або  $-\text{CH}_2\text{-OH}$ , де R<sup>13</sup> являє собою піперазино, морфоліно, піперидино,  $-\text{OH}$  або  $-\text{N(R}^{14})\text{-R}^{15}$ , де кожний з радикалів R<sup>14</sup> та R<sup>15</sup> незалежно являє собою водень або нижчий алкіл.

9. Сполука по п.1, яка **відрізняється** тим, що принаймні один з амідних зв'язків між A та B, між B та C, між D та (E)p та між Г та H заміщується  $-\text{CO-N(CH}_3\text{)}-$ .

10. Сполука, що її вибрано з групи, до якої належать

(R)-2-((3-амінометилбензоїл)-N-Me-D-2Nal-N-Me)-3-фенілпропанол або його TFA-сіль;

3-((3-амінометилбензоїл))N-Me-D-2Nal-N-Me-D-Phe-NH)-1-1 N,N-диметиламінопропан або його TFA-сіль;

3-(((3R)-3-піперидинкарбоніл)-N-Me-D-2Nal-N-Me-D-Phe-NH)-1-N,N-диметиламінопропан або його TFA-сіль;

2-(((3R)-3-піперидинкарбоніл)-N-Me-D-2Nal-N-Me-D-Phe-NH)-(1-метил-2-піролідиніл)етан або його TFA-сіль;

H-Aib-His-D-2Nal-N-Me-D-Phe-Ser-NH<sub>2</sub> або його TFA-сіль;  
 (3-амінометилбензоїл)-D-2Nal-N-Me-D-Phe-Lys-NH<sub>2</sub> або його TFA-сіль;  
 (4-піперидинкарбоніл)-D-2Nal-N-Me-D-Phe-NH<sub>2</sub> або його TFA-сіль;  
 ((3R)-3-піперидинкарбоніл)-D-2Nal-N-Me-D-Phe-NH<sub>2</sub> або його TFA-сіль;  
 (3-амінометилбензоїл)-D-Phe-N-Me-D-Phe-NH<sub>2</sub> або його TFA-сіль;  
 (3-амінометилбензоїл)-N-Me-D-Phe-N-Me-D-Phe-Lys-NH<sub>2</sub> або його TFA-сіль;  
 ((3R)-3-піперидинкарбоніл)-N-Me-D-Phe-N-Me-D-Phe-Lys-NH<sub>2</sub> або його TFA-сіль;  
 H-Aib-His-N-Me-D-Phe-N-Me-D-Phe-Lys-NH<sub>2</sub> або його TFA-сіль;  
 ((3R)-3-піперидинкарбоніл)-N-Me-D-2Nal-N-Me-D-Phe-NH<sub>2</sub> або його TFA-сіль;  
 (2R)-2-((3-амінометилбензоїл)-N-Me-D-2Nal-N-Me)-3-(2-нафтил)пропанол або його TFA-сіль;  
 (3-амінометилбензоїл)-N-Me-D-2Nal-N-Me-D-Phe-NH<sub>2</sub> або його TFA-сіль;  
 3-((3-амінометилбензоїл)-N-Me-D-Phe-NH)-1-N,N-диметиламінопропан;  
 H-Aib-His-N-Me-D-2Nal-N-Me-D-Phe-NH<sub>2</sub>, або його TFA-сіль;  
 (3-амінометилбензоїл)-N-Me-D-2Nal-N-Me-D-Phe-Lys-NH<sub>2</sub>;  
 H-Aib-Ala-D-2Nal-N-Me-D-Phe-Lys-NH<sub>2</sub>, або його TFA-сіль;  
 H-Aib-His-D-2Nal-N-Me-D-Phe-NH<sub>2</sub>, або його TFA-сіль;  
 2-((3-амінометилбензоїл)-N-Me-D-2Nal-N-Me-D-Phe-NH)-1-морфоліноетан;  
 (3-амінометилбензоїл)-N-Me-D-2Nal-N-Me-D-Phe-NH-Me;  
 3-((3-метиламінометилбензоїл)-N-Me-D-2Nal-N-Me-D-Phe-NH)-1-N,N-диметиламінопропан,  
 (3-амінометилбензоїл)-N-Me-D-2Nal-N-Me-D-Phe-N-Me<sub>2</sub>,  
 H-Aib-His-N-Me-D-2Nal-N-Me-D-Phe-NH<sub>2</sub>;  
 3-амінометилбензоїл-N-Me-D-2Nal-N-Me-D-Phe-NH-CH<sub>3</sub> або його TFA-сіль;  
 3-метиламінометилбензоїл-N-Me-D-2Nal-N-Me-D-Phe-NH-CH<sub>3</sub> або його TFA-сіль;  
 H-Aib-His-N-Me-D-2Nal-N-Me-D-Phe-NHMe або його HClсіль; та  
 піперидин-4-карбонова кислота -N-((1R)-1-(N-((1R)-2-(4-йодофеніл)-1-(метилкарбамоїл) етил)-N-метилкарбамоїл)-2-(2-нафтил)етил)-N-метиламід, або її фармацевтично прийнятна сіль.

11. Фармацевтична композиція, яка містить в собі як активний компонент сполуку згідно з будь-яким з пунктів від 1 до 10 або її фармацевтично прийнятну сіль, разом із фармацевтично прийнятим носієм або розріджувачем.

12. Композиція по п.11, яка **відрізняється** тим, що у вигляді дозованих одиниць містить в собі від близько 10 до близько 200мг головної сполуки згідно з будь-яким з пунктів від 1 до 10 або фармацевтично прийнятну сіль цієї сполуки.

13. Фармацевтична композиція для стимулювання вивільнення гормону росту з гіпофіза, що як активний компонент містить у собі сполуку згідно з будь-яким з пунктів від 1 до 10 або її фармацевтично прийнятну сіль, разом із фармацевтично прийнятим носієм або розріджувачем.

14. Фармацевтична композиція по пп. 11, 12 або 13, яка **відрізняється** тим, що призначена для орального, трансдермального, назального, легеневого або парентерального введення в організм.

15. Спосіб стимулювання вивільнення гормону росту з гіпофіза, що за необхідністю передбачає введення ефективного об'єму сполуки згідно з будь-яким з пунктів від 1 до 10, або її фармацевтично прийнятої солі, або композиції згідно з будь-яким з пунктів 11, 12 або 14.

16. Спосіб по п.15, який відрізняється тим, що ефективний об'єм сполуки згідно з будь-яким з пунктів від 1 до 10, або її фармацевтично прийнятої солі, або її складного ефіру, може становити від близько 0,0001 до близько 100 мг/кг ваги тіла на добу, найоптимальніше від близько 0,001 до близько 50 мг/кг ваги тіла на добу.

17. Спосіб підвищення швидкості та інтенсивності росту тварин, збільшення надою молока або продуктивності здобуття вовни зі свійських тварин, або подолання недуг, який за необхідністю передбачає введення в організм ефективного об'єму сполуки згідно з будь-яким з пунктів від 1 до 10 або її фармацевтично прийнятої солі, або композиції згідно з будь-яким з пунктів 11, 12 або 14.

18. Сполука по будь-якому з пп. від 1 до 10 або її фармацевтично прийнятна сіль, яка **відрізняється** тим, що застосовується як ліки.

19. Сполука по будь-якому з пп. від 1 до 10 або її фармацевтично прийнятна сіль, яка **відрізняється** тим, що її застосовують для виготовлення медикаменту для стимулювання вивільнення гормону росту з гіпофіза.

20. Сполука по будь-якому з пунктів від 1 до 10 або її фармацевтично прийнятна сіль, яка **відрізняється** тим, що її застосовують для виготовлення медикаменту, призначеного для введення в організм тварин з метою підвищення швидкості та інтенсивності їх росту, збільшення надою молока та продуктивності здобуття вовни зі свійських тварин або подолання недуг.