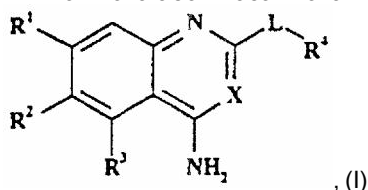


1. Хінолінова або хіназолінова похідна формули I



, (I)

де

R<sup>1</sup> являє собою C<sub>1-4</sub>-алкокси, необов'язково заміщену одним чи декількома атомами фтору;

R<sup>2</sup> являє собою H чи C<sub>1-6</sub>-алкокси, необов'язково заміщену одним чи декількома атомами фтору;

R<sup>3</sup> являє собою 5- чи 6-членне гетероциклічне кільце, що містить, принаймні, один гетероатом, вибраний з N, O і S, причому цей цикл необов'язково заміщений одною чи декількома групами, вибраними з галогену, C<sub>1-4</sub>-алкокси, C<sub>1-4</sub>-алкілу і CF<sub>3</sub>;

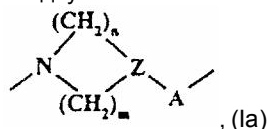
R<sup>4</sup> являє собою 4-, 5-, 6- чи 7-членне гетероциклічне кільце, що містить, принаймні, один гетероатом, вибраний з N, O і S, причому цей цикл необов'язково конденсований з бензольним кільцем, або з 5- чи 6-членним гетероциклічним кільцем, що містить, принаймні, один гетероатом, вибраний з N, O і S, ця циклічна система в цілому необов'язково заміщена одною чи декількома групами, незалежно вибраними з OH, C<sub>1-4</sub>-алкілу, C<sub>1-4</sub>-алкокси, галогену, CONR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>, SO<sub>2</sub>NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>, (CH<sub>2</sub>)<sub>6</sub>NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup> і NHSO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub>-алкілу), і якщо S є членом циклічної системи, він може бути заміщений одним чи двома атомами кисню;

R<sup>8</sup> і R<sup>9</sup> незалежно являють собою H або C<sub>1-4</sub>-алкіл, або разом з атомом N, до якого вони приєднані, можуть являти собою 5- чи 6-членне гетероциклічне кільце, що містить, принаймні, один гетероатом, вибраний з N, O і S;

b дорівнює 0, 1, 2 чи 3;

X являє собою CH або N; і

L відсутнє чи являє собою циклічну групу формули Ia



, (Ia)

у якій N приєднаний до другої позиції хінолінового чи хіназолінового циклу;

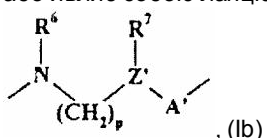
A відсутнє чи являє собою CO або SO<sub>2</sub>;

Z являє собою CH або N;

m дорівнює 1 чи 2, і, крім того, якщо Z являє собою CH, воно може бути рівним 0; і

n дорівнює 1, 2 чи 3, за умови, що сума m і n дорівнює 2, 3, 4 чи 5;

або являє собою ланцюг формули Ib



, (Ib)

в якій N приєднаний до 2 позиції хінолінового чи хіназолінового циклу;

A' і Z' мають, відповідно, такі ж значення, як A і Z, описані вище;

R<sup>6</sup> і R<sup>7</sup> незалежно являють собою H або C<sub>1-4</sub>-алкіл;

і

r дорівнює 1, 2 чи 3, і, крім того, якщо Z являє собою CH, воно може дорівнювати 0;

або її фармацевтично придатні солі.

2. Сполука за п. 1, де кожний з R<sup>1</sup> і R<sup>2</sup> являє собою метоксильну групу.

3. Сполука за п. 1 або п.2, де R<sup>3</sup> являє собою 2-піридиніл або 2-піримідиніл.

4. Сполука за будь-яким з попередніх пунктів, де X являє собою N.

5. Сполука за будь-яким з попередніх пунктів, де L відсутнє.

6. Сполука за будь-яким з попередніх пунктів, де R<sup>4</sup> включає в себе насичений 6-членний N-вмісний цикл, що конденсований з бензольним чи піридиновим кільцем.

7. Сполука за п. 6, де бензольне кільце заміщене NHSO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub>-алкілом).

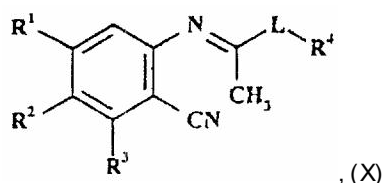
8. Сполука за п. 1 або її фармацевтично прийнятна сіль для використання як лікарського засобу.

9. Сполука за п. 1 або її фармацевтично прийнятна сіль як активний інгредієнт лікарського засобу для лікування доброякісної гіперплазії простати.

10. Фармацевтична композиція, що включає в себе сполуку формули I, як визначено в п. 1, або її фармацевтично прийнятну сіль, в суміші з фармацевтично прийнятим ад'ювантом, розріджувачем або носієм.

11. Спосіб лікування доброякісної гіперплазії простати, при якому вводять сполуку формули I, як визначено в п. 1, або її фармацевтично прийнятну сіль, пацієнту, який потребує такого лікування.

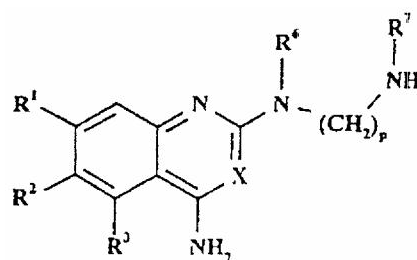
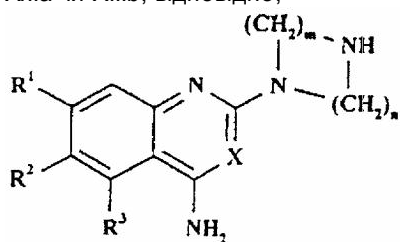
12. Спосіб одержання сполуки формули I, як визначено в п. 1, або її фармацевтично прийнятої солі, при якому у випадку, якщо X являє собою CH, проводять циклізацію сполуки формули X



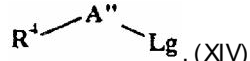
у якій  $R^1$ - $R^4$  і  $L$  - такі, як визначені в п. 1;

і, якщо бажано або необхідно, перетворення одержаної сполуки формули I на фармацевтично прийнятну сіль або навпаки.

13. Спосіб одержання сполуки формули I, як визначено в п. 1, або її фармацевтично прийнятної солі, при якому у випадку, якщо присутні  $A$  чи  $A'$ , а  $Z$  чи  $Z'$  являють собою  $N$ , проводять взаємодію сполуки формули XIIIa чи XIIIb, відповідно,

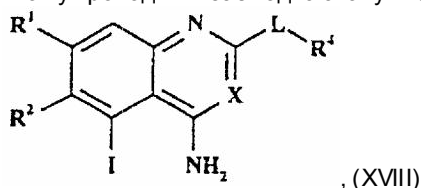


де  $R^1$ - $R^3$ ,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $X$ ,  $m$ ,  $n$  і  $p$  такі, як визначено у п. 1, зі сполукою формули XIV



в якій  $R^4$  - такий, як визначено в п. 1,  $A''$  являє собою  $CO$  чи  $SO_2$  і  $Lg$  являє собою групу, що відходить, і, якщо бажано або необхідно, перетворення одержаної сполуки формули I на фармацевтично прийнятну сіль або навпаки.

14. Спосіб одержання сполуки формули I, як визначено в п. 1, або її фармацевтично прийнятної солі, при якому проводять взаємодію сполуки формули XVIII



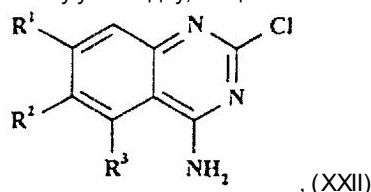
де  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^4$ ,  $X$  і  $L$  - такі, як визначено в п. 1, зі сполукою формули XIX

$R^3$ - $M$ , (XIX),

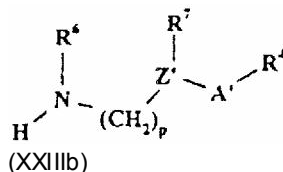
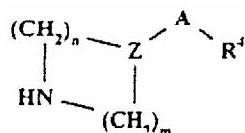
в якій  $R^3$  - такий, як визначено в п. 1, а  $M$  являє собою заміщений бор, цинк або олово, у присутності паладієвого каталізатора;

і, якщо бажано або необхідно, перетворення одержаної сполуки формули I на фармацевтично прийнятну сіль або навпаки.

15. Спосіб одержання сполуки формули I, як визначено в п. 1, або її фармацевтично прийнятної солі, при якому у випадку, якщо  $X$  являє собою  $N$ , проводять взаємодію сполуки формули XXII



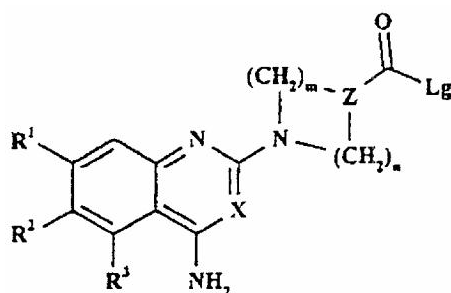
де  $R^1$ - $R^3$  - такі, як визначено в п. 1, зі сполукою формули XXIIIa чи XXIIIb, відповідно,



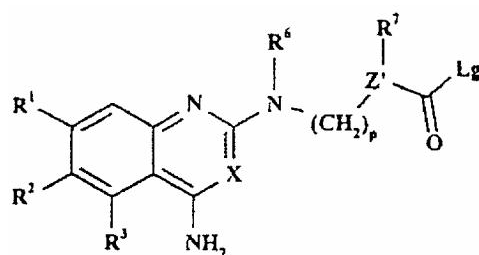
де  $R^4$ ,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $A$ ,  $A'$ ,  $Z$ ,  $Z'$ ,  $m$ ,  $n$  і  $p$  - такі, як визначено у п. 1;

і, якщо бажано або необхідно, перетворення одержаної сполуки формули I на фармацевтично прийнятну сіль або навпаки.

16. Спосіб одержання сполуки формули I, як визначено в п. 1, або її фармацевтично прийнятної солі, при якому у випадку, якщо  $A$  або  $A'$  являє собою  $CO$ , а  $R^4$  включає нуклеофільний атом азоту в гетероциклічному кільці, приєднаному до  $L$ , проводять взаємодію сполуки формули XXVIIIa або XXVIIIb, відповідно,



(XXVIIa)



(XXVIIb)

де  $R^1$ - $R^3$ ,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $X$ ,  $Z$ ,  $Z'$ ,  $m$ ,  $n$  і  $p$  - такі, як визначено у п. 1, і  $Lg$  являє собою групу, що відходить, зі сполукою формули XXIX

$HR^{4a}$  (XXIX)

де  $R^{4a}$  являє собою групи, визначені у п. 1 за допомогою  $R^4$ , які містять нуклеофільний атом азоту в циклі, причому цей атом азоту з'єднаний з  $H$ ;

і, якщо бажано або необхідно, перетворення одержаної сполуки формули I на фармацевтично прийнятну сіль або навпаки.

17. Спосіб одержання сполуки формули I, як визначено в п. 1, або її фармацевтично прийнятної солі, при якому проводять перетворення сполуки формули I, де  $L$  являє собою циклічну групу формули Ia, на відповідну сполуку формули I, де  $L$  являє собою ланцюг формули Ib, в якій кожен з  $R^6$  і  $R^7$  являють собою  $H$ , шляхом впливу сильної основи;

і, якщо бажано або необхідно, перетворення одержаної сполуки формули I на фармацевтично прийнятну сіль або навпаки.

18. Спосіб одержання сполуки формули I, як визначено в п. 1, або її фармацевтично прийнятної солі, при якому у випадку, якщо  $A$  або  $A'$  відсутні, а  $Z$  або  $Z'$  являють собою  $N$ , проводять взаємодію сполуки формули XIIIa або XIIIb, як визначено вище, зі сполукою формули XXX

$R^4-Hal$ , (XXX)

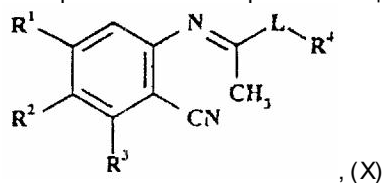
де  $R^4$  - такий, як визначено в п. 1, і  $Hal$  являє собою атом галогену, приєднаний до циклу;

і, якщо бажано або необхідно, перетворення одержаної сполуки формули I на фармацевтично прийнятну сіль або навпаки.

19. Спосіб одержання сполуки формули I, як визначено в п. 1, або її фармацевтично прийнятної солі, при якому у випадку, якщо  $X$  являє собою  $N$ ,  $L$  відсутній, а  $R^4$  містить нуклеофільний атом азоту в гетероциклічному кільці, приєднаному до хінолінового або хіназолінового циклу, проводять взаємодію сполуки формули XXII, як визначено вище, зі сполукою формули XXIX, як визначено вище;

і, якщо бажано або необхідно, перетворення одержаної сполуки формули I на фармацевтично прийнятну сіль або навпаки.

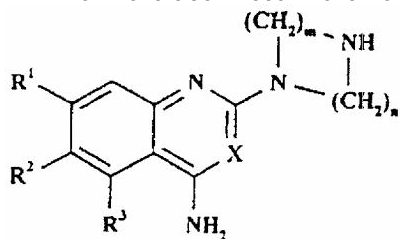
20. Ортоімінобензонітрильна похідна формули X



(X)

де  $R^1$ - $R^4$  і  $L$  - такі, як визначено в п. 1, яка є проміжною сполукою для одержання сполук формули I за пунктом 1.

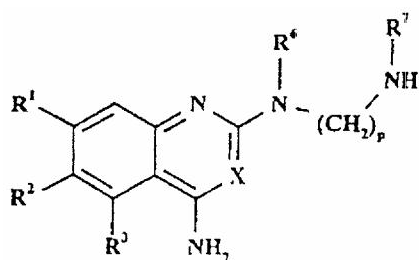
21. Хінолінова або хіназолінова похідна формули XIIIa



(XIIIa)

де  $R^1$ - $R^3$ ,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $X$ ,  $m$ ,  $n$  і  $p$  - такі, як визначено в п. 1, яка є проміжною сполукою для одержання сполук формули I за пунктом 1.

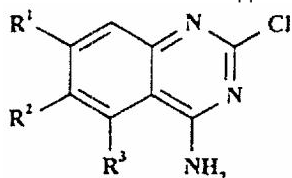
22. Хінолінова або хіназолінова похідна формули XIIIb



, (XIIIb)

де  $R^1$ - $R^3$ ,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $X$ ,  $m$ ,  $n$  і  $p$  - такі, як визначено в п. 1, яка є проміжною сполукою для одержання сполук формули I за пунктом 1.

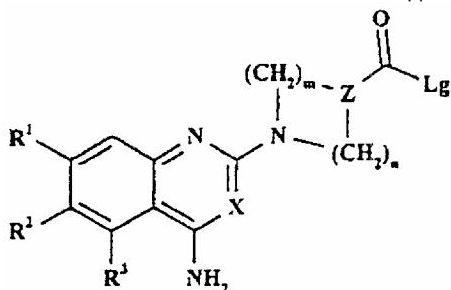
23. Хіназолінова похідна формули XXII



, (XXII)

де  $R^1$ - $R^3$  - такі, як визначено в п. 1, яка є проміжною сполукою для одержання сполук формули I за пунктом 1.

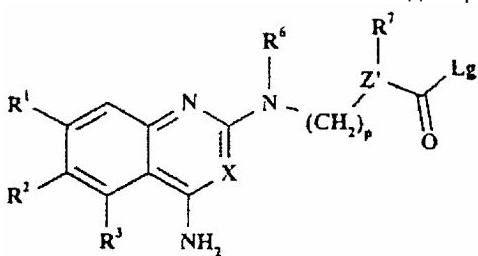
24. Хінолінова або хіназолінова похідна формули XXVIIa



, (XXVIIa)

де  $R^1$ - $R^3$ ,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $X$ ,  $Z$ ,  $Z'$ ,  $m$ ,  $n$  і  $p$  - такі, як визначено в п. 1, яка є проміжною сполукою для одержання сполук формули I за пунктом 1.

25. Хінолінова або хіназолінова похідна формули XXVIIb



, (XXVIIb)

де  $R^1$ - $R^3$ ,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $X$ ,  $m$ ,  $n$  і  $p$  - такі, як визначено в п. 1, яка є проміжною сполукою для одержання сполук формули I за пунктом 1.