



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(51) МПК
C07D 257/00 (2006.01)

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21), (22) Заявка: 2007139634/04, 25.10.2007

(43) Дата публикации заявки: 27.04.2009 Бюл. № 12

Адрес для переписки:

129090, Москва, ул.Б.Спасская, 25, стр.3,
ООО "Юридическая фирма Городиский и
Партнеры"

(71) Заявитель(и):

Бачурин Сергей Олегович (RU),
Устинов Анатолий Константинович (RU),
Безноско Богдан Константинович (RU),
Шевцова Елена Феофановна (RU),
Григорьев Владимир Викторович (RU)

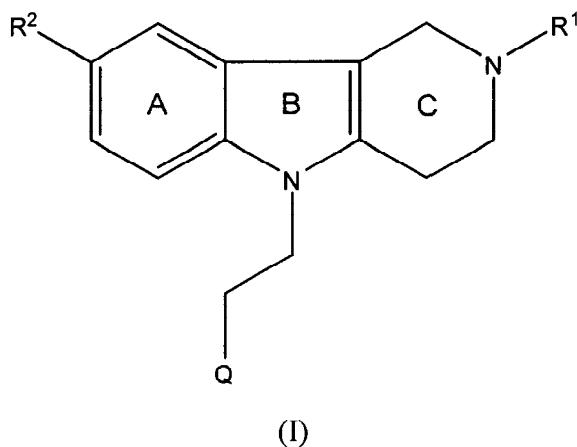
(72) Автор(ы):

Бачурин Сергей Олегович (RU),
Устинов Анатолий Константинович (RU),
Безноско Богдан Константинович (RU),
Шевцова Елена Феофановна (RU),
Григорьев Владимир Викторович (RU)

(54) **НОВЫЕ ТИАЗОЛ-, ТРИАЗОЛ- ИЛИ ОКСАДИАЗОЛ-СОДЕРЖАЩИЕ
ТЕТРАЦИКЛИЧЕСКИЕ СОЕДИНЕНИЯ**

(57) Формула изобретения

1. Соединение формулы I:



где R¹ выбран из незамещенного алкила и незамещенного аралкила или гетероаралкила;

R² выбран из водорода, незамещенного алкила, незамещенного алкокси и галогена;
и Q выбран из замещенного тиазолила, триазолила и оксадиазолила,
или его фармацевтически приемлемая соль.

2. Соединение по п.1, в котором R² выбран из водорода, незамещенного C₁-C₈ алкила, незамещенного C₁-C₈ алкокси и галогена.

3. Соединение по п.2, в котором R² выбран из водорода, незамещенного

C_1-C_4 алкила, незамещенного C_1-C_4 алкокси и галогена.

4. Соединение по п.3, в котором R^2 выбран из водорода, метила, метокси, фтора и хлора.

5. Соединение по любому из пп.1-4, в котором R^1 выбран из незамещенного C_1-C_8 алкила и незамещенного C_1-C_8 аралкила или гетероаралкила.

6. Соединение по п.5, в котором R^1 выбран из незамещенного C_1-C_4 алкила и незамещенного C_1-C_4 аралкила или гетероаралкила.

7. Соединение по п.6, в котором R^1 выбран из метила и бензила.

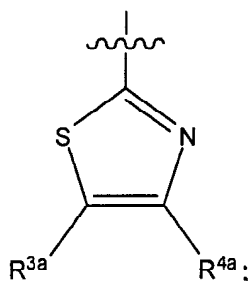
8. Соединение по любому из пп.1-7, в котором Q выбран из тиазол-2-ила, 1,2,4-триазол-3-ила, 5-тиоксо-4,5-дигидро-1H-1,2,4-триазол-3-ила и 1,2,4-оксадиазол-3-ила.

9. Соединение по п.8, в котором Q представляет собой тиазол-2-ил, 1,2,4-триазол-3-ил, 5-тиоксо-4,5-дигидро-1H-1,2,4-триазол-3-ил или 1,2,4-оксадиазол-3-ил, замещенные группой, выбранной из незамещенного C_1-C_8 алкила и незамещенного арила или гетероарила.

10. Соединение по п.9, в котором Q представляет собой тиазол-2-ил, 1,2,4-триазол-3-ил, 5-тиоксо-4,5-дигидро-1H-1,2,4-триазол-3-ил или 1,2,4-оксадиазол-3-ил, замещенные группой, выбранной из незамещенного C_1-C_4 алкила и незамещенного арила или гетероарила.

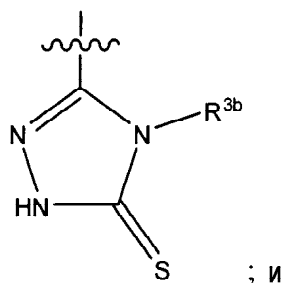
11. Соединение по п.10, в котором Q представляет собой тиазол-2-ил, 1,2,4-триазол-3-ил, 5-тиоксо-4,5-дигидро-1H-1,2,4-триазол-3-ил или 1,2,4-оксадиазол-3-ил, замещенные группой, выбранной из метила, фенила и пиридин-4-ила.

12. Соединение по п.1, в котором R^1 выбран из метила и бензила; R^2 выбран из водорода, метила, метокси, хлора и фтора; Q представляет собой



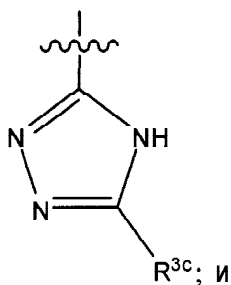
R^{3a} выбран из водорода и метила; и R^{4a} выбран из фенила и пиридин-4-ила.

13. Соединение по п.1, в котором R^1 выбран из метила и бензила; R^2 выбран из водорода, метила, метокси, хлора и фтора; Q представляет собой



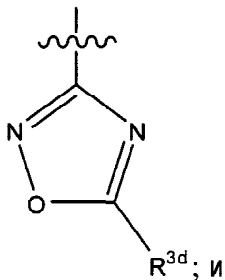
R^{3b} представляет собой метил.

14. Соединение по п.1, в котором R^1 выбран из метила и бензила; R^2 выбран из водорода, метила, метокси, хлора и фтора; Q представляет собой



R^{3c} выбран из метила, фенила и пиридин-4-ила.

15. Соединение по п.1, в котором R^1 выбран из метила и бензила; R^2 выбран из водорода, метила, метокси, хлора и фтора; Q представляет собой



R^{3d} выбран из фенила и пиридин-4-ила.

16. Способ модулирования гистаминового рецептора у лиц, включающий назначение лицам, имеющим такую потребность, соединения по любому из пп.1-15.

17. Фармацевтическая композиция, включающая соединение по любому из пп.1-15 и фармацевтически приемлемый носитель.

18. Набор, включающий соединение по любому из пп.1-15 и инструкции для применения.