

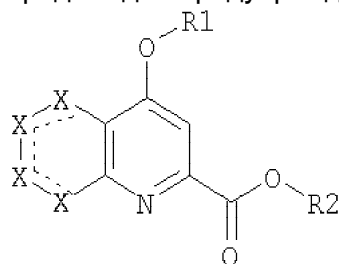


ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**(21), (22) Заявка: **2006126781/15**, 01.12.2004(30) Конвенционный приоритет:
24.12.2003 FR 03/15402(43) Дата публикации заявки: **27.01.2008 Бюл. № 3**(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную фазу:
24.07.2006(86) Заявка РСТ:
EP 2004/013662 (01.12.2004)(87) Публикация РСТ:
WO 2005/063244 (14.07.2005)Адрес для переписки:
**101000, Москва, М.Златоустинский пер., 10,
кв.15, ЕВРОМАРКПАТ, пат.пов. И.А.Веселицкой,
рег. № 11**(71) Заявитель(и):
МЕРК ПАТЕНТ ГМБХ (FR)(72) Автор(ы):
**МУАНЕ Жерар (FR),
КОРРЕ Жан-Клод (FR),
АРБЕЛЛО-ДЕ ВАККЕ Анник (FR)**(54) **КИСЛОТНЫЕ ПРОИЗВОДНЫЕ ХИНОЛИНА И ИХ ПРИМЕНЕНИЕ ДЛЯ ПРЕДУПРЕЖДЕНИЯ И/ИЛИ ЛЕЧЕНИЯ ПАТОЛОГИЙ, СВЯЗАННЫХ С ГИПЕРГЛИКЕМИЕЙ**

(57) Формула изобретения

1. Применение производных общей формулы (I) для приготовления лекарственных средств для предупреждения и/или лечения патологий, связанных с гипергликемией:



(I),

в которой X обозначает, независимо друг от друга, атом углерода, необязательно замещенный группой, выбранной из алкильной, алкенильной, алкинильной, циклоалкильной, гетероциклоалкильной, арильной, алкиларильной, гетероарильной, -CN, галогено, -O-арильной, -O-гетероарильной, циклоалкильной, гетероциклильной, -CO₂H, -C(=O)-алкильной, -C(=O)-арильной, -C(=O)-циклоалкильной, -C(=O)O-алкильной, -C(=O)NRR', -OH, -O-алкильной, -O-алкиларильной, -C(=O)O-арильной, -NRR', -S(O)_pR, в которой p представляет собой 0, 1 или 2; или два смежных атома углерода могут образовывать ароматическое кольцо, связанное с арильным ядром, или атом азота, кислорода или серы;

R1 и R2, которые могут быть одинаковыми или разными, независимо представляют собой группу, выбранную из водорода, алкильной, алкенильной, алкинильной групп, каждая необязательно и независимо замещенная одной или более из следующих групп: -CN, галогено, арильной, биарильной, -О-арильной, -О-гетероарильной, -О-гетероциклоалкильной, циклоалкильной, гетероциклоалкильной, -CO₂H, -C(=O)-алкильной, -C(=O)-арильной, -C(=O)-циклоалкильной, -C(=O)O-алкильной, -C(=O)NRR', -ОН, -О-алкильной, -О-алкиларильной, -C(=O)O-арильной, -NRR', -S(O)_pR, в которой p представляет собой 0, 1 или 2;

где арил является необязательно и независимо замещенным одной или более группами выбранных из -CN, галогено, арильной, алкильной, -О-алкильной, -алкил-C(=O)O-алкильной, -алкил-C(=O)ОН, -О-алкиларильной, гетероциклоалкильной, -NRR', -ОН, -S(O)_pR, в которой p представляет собой 0, 1 или 2; -О-арильной, пергаллоалкильной, -COOH, COOR;

гетероарил является необязательно и независимо замещенным одной или более группами, выбранными из галогена, -COOH, COOR и гетероциклоалкильной; гетероциклоалкил является необязательно и независимо замещенным одной или более алкильной группой или =O;

циклоалкильной или гетероциклоалкильной группы, каждой необязательно и независимо замещенной алкильной или алкоксигруппой;

арильной или гетероарильной группы, каждой необязательно и независимо замещенной одной или более группами, выбранными из -CN, галогено, арильной, алкильной, -О-алкильной, -алкил-C(=O)O-алкильной, -О-алкиларильной, гетероциклоалкильной; -NRR', -ОН, -S(O)_pR, в которой p представляет собой 0, 1 или 2; -О-арильной, пергаллоалкильной, -COOH, COOR;

R и R' выбирают из H и алкильной группы;

— обозначает простую или двойную связь, а также таутомерных форм, энантиомеров, диастереоизомеров и эпимеров, и фармацевтически приемлемых солей.

2. Применение по п.1, в котором в формуле (I) каждый из X представляет собой атом углерода, необязательно замещенный атомом галогена.

3. Применение по п.1 или 2, в котором атом углерода в 6 положении хинолинового кольца замещен атомом галогена.

4. Применение по любому из п.1 или 2, в котором галогеновый заместитель X представляет собой атом фтора.

5. Применение по любому из п.1 или 2, в котором R1 и/или R2 независимо представляет(ют) собой атом водорода, алкил, алкенил, алкинил, необязательно замещенный при помощи -CN, галогена, -О-арила, -о-гетероарила, циклоалкила, гетероциклоалкила, -COOH, -C(=O)-арила, -C(=O)-циклоалкила, -C(=O)O-алкила, -C(O)NRR', биарила или арила, где арил является необязательно замещенным при помощи -CN, галогена, арила, алкила, -О-алкила, -алкил-C(=O)O-алкила, алкилCOOH, -О-алкиларила или гетероциклоалкила.

6. Применение по любому из п.1 или 2, в котором R1 представляет собой алкил, алкенил, алкинил, циклоалкил, гетероциклоалкил, алкиларил, арил или гетероарил, которые являются необязательно замещенными, как указано в любом из предыдущих пунктов.

7. Применение по любому из п.1 или 2, в котором R1 представляет собой алкил или алкенил, необязательно замещенный, как указано в любом из предыдущих пунктов.

8. Применение по любому из п.1 или 2, в котором R1 представляет собой алкил, необязательно и независимо замещенный одной или более группами, выбранными из -CN, арильной, гетероциклоалкильной, биарильной, галогено, -C(=O)-арильной, -О-арильной, -C(=O)-алкильной, циклоалкильной, -C(=O)-алкильной, -COOH, -О-гетероарильной, -C(=O)NRR', -C(=O)-циклоалкильной, -О-гетероциклоалкильной; где арил является необязательно и независимо замещенным при помощи одной или более групп галогено, -CN, -О-алкиларил, арил, алкил, -О-алкил, гетероциклоалкил, -алкил-C(=O)-ОН, или -алкил-C(=O)O-алкил; гетероарил является необязательно замещенным при помощи гетероциклоалкила, галогена или -COOH, гетероциклоалкил является

необязательно и независимо замещенным при помощи одной или более групп, выбранных из =O и алкила.

9. Применение по любому п.1 или 2, в котором R1 представляет собой алкильную или алкенильную группу, в которой α углерод по отношению к атому кислорода замещен при помощи -COOH, -C(=O)-алкила, -C(=O)-арила, -C(=O)-циклоалкила, -C(=O)O-алкила или -C(=O)NRR', в которых алкильная и арильная группы являются необязательно замещенными, как указано в любом из предыдущих пунктов, и RR' являются такими, как указано в любом из предыдущих пунктов.

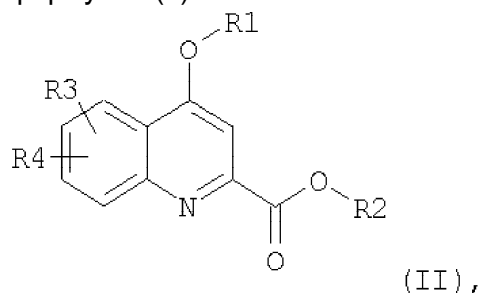
10. Применение по любому из пп.1 или 2, в котором R1 представляет собой алкил или алкенил, каждый необязательно замещенный при помощи одного или более заместителя, выбранного из галогена, -O-гетероарила или -C(=O)-арила, в которых арил является необязательно замещенным одним или более -O-алкилом и гетероарил является необязательно замещенным одной или более группой -COOH или галогеном.

11. Применение по любому из пп.1 или 2, в котором R2 представляет собой атом водорода или алкильную группу.

12. Применение по любому из пп.1 или 2, в котором R2 представляет собой радикал метил.

13. Применение по любому из пп.1 или 2, в котором R и R' представляют собой атом водорода или метильный или этильный радикал.

14. Применение по п.1, в котором соединения формулы (I) представлены общей формулой (II) ниже:



в которой R1 и R2 принимают значения, как указано в любом из предыдущих пунктов; R3 и R4, которые могут быть одинаковыми или разными, независимо представляют собой группы, выбранные из алкильной, алкенильной, алкинильной, циклоалкильной, гетероциклоалкильной, арильной, алкиларильной, гетероарильной, -CN, галогено, -O-арильной, -O-гетероарильной, циклоалкильной, гетероциклильной, -CO₂H, -C(=O)-алкильной, -C(=O)-арильной, -C(=O)-циклоалкильной, -C(=O)O-алкильной, -C(=O)NRR', -OH, -O-алкильной, -O-алкиларильной, -C(=O)O-арильной, -NRR' и -S(O)_pR, в которой p представляет собой 0, 1 или 2, или R3 и R4 могут вместе также образовывать гетероцикл, смежный с фенильным кольцом,

а также таутомерные формы, энантиомеры, диастереоизомеры и эписмеры, и фармацевтически приемлемые соли.

15. Применение по п.14, в котором R3 и R4 представляют собой H, -O-алкил и/или атом галогена или R3 и R4 вместе образуют гетероцикл, смежный с фенильным кольцом.

16. Применение по п.14 или 15, в котором R3 и R4 представляют цикл -O-(CH₂)_n-O-, где n является целым числом от 1 до 4.

17. Применение по любому из пп.14 или 15, в котором R3 и R4 представляют соответственно атом фтора в 6 положении и атом водорода.

18. Применение по п.1, в котором соединения общей формулы (I) выбраны из метил 4-(1,3-бензотиазол-2-илметокси)-6-фторхинолин-2-карбоксилата
метил 4-[(4-бром-2-фторбензил)окси]-6-фторхинолин-2-карбоксилата
метил 4-этокси-6-фторхинолин-2-карбоксилата
метил 4-[(4-бром-2-фторбензил)окси]-6-метоксихинолин-2-карбоксилата
метил 6-фтор-4-[(3-метилбут-2-ен-1-ил)окси]хинолин-2-карбоксилата
метил 4-[(2'-цианобифенил-4-ил)метокси]-6-фторхинолин-2-карбоксилата
метил 4-(цианометокси)-6-фторхинолин-2-карбоксилата
метил 4-(2-хлорэтокси)-6-фторхинолин-2-карбоксилата

метил 4-(2-амино-2-оксоэтокси)-6-фторхинолин-2-карбоксилата
метил 4-(аллилокси)-6-фторхинолин-2-карбоксилата
метил 6-фтор-4-(пентилокси)хинолин-2-карбоксилата
метил 4-[2-(4-хлорфенил)-2-оксоэтокси]-6-фторхинолин-2-карбоксилата
метил 6-фтор-4-(2-оксо-2-фенилэтокси)хинолин-2-карбоксилата
метил 6-фтор-4-[2-(4-фторфенокси)этокси]хинолин-2-карбоксилата
метил 6-фтор-4-(2-фенилэтокси)хинолин-2-карбоксилата
метил 6-фтор-4-(2-феноксиэтокси)хинолин-2-карбоксилата
метил 6-фтор-4-(3-фенилпропокси)хинолин-2-карбоксилата
метил 4-(2-бифенил-4-ил-2-оксоэтокси)-6-фторхинолин-2-карбоксилата
метил 6-фтор-4-[2-(4-метилфенил)-2-оксоэтокси]хинолин-2-карбоксилата
метил 6-фтор-4-[2-(4-метоксифенил)-2-оксоэтокси]хинолин-2-карбоксилата
метил 4-[2-(1-адамантил)-2-оксоэтокси]-6-фторхинолин-2-карбоксилата
метил 6-фтор-4-[2-(4-фторфенил)-2-оксоэтокси]хинолин-2-карбоксилата
метил 4-[2-(3,4-дихлорфенил)-2-оксоэтокси]-6-фторхинолин-2-карбоксилата
метил 6-фтор-4-[2-(3-метоксифенил)-2-оксоэтокси]хинолин-2-карбоксилата
метил 4-[4-(4-хлорфенокси)бутокси]-6-фторхинолин-2-карбоксилата
метил 6-фтор-4-[2-(3-фторфенокси)этокси]хинолин-2-карбоксилата
метил 4-[2-(4-бромфенокси)этокси]-6-фторхинолин-2-карбоксилата
метил 6-фтор-4-{[5-(4-фторфенокси)пентил]окси}хинолин-2-карбоксилата
метил 4-[2-(4-цианофенокси)этокси]-6-фторхинолин-2-карбоксилата
метил 6-фтор-4-{2-[(4-морфолин-4-ил-1,2,5-тиадиазол-3-ил)окси]этокси}хинолин-2-карбоксилата
метил 6-фтор-4-{2-[4-(3-метокси-3-оксопропил)фенокси]этокси}хинолин-2-карбоксилата
метил 6-фтор-4-[2-(1-нафтилокси)этокси]хинолин-2-карбоксилата
метил 6-фтор-4-[2-(2-метоксифенокси)этокси]хинолин-2-карбоксилата
метил 4-[2-[2-(бензилокси)фенил]-2-оксоэтокси]-6-фторхинолин-2-карбоксилата
метил 6-фтор-4-[2-(2-нафтилокси)этокси]хинолин-2-карбоксилата
метил 4-[2-(1,3-диоксо-1,3-дигидро-2H-изоиндол-2-ил)этокси]-6-фторхинолин-2-карбоксилата
метил 4-[1-(этоксикарбонил)-3-фенилпропокси]-6-фторхинолин-2-карбоксилата
метил 4-[2-(2,3-диметилфенокси)этокси]-6-фторхинолин-2-карбоксилата
метил 6-фтор-4-{2-[4-(2-метил-1,3-диоксолан-2-ил)фенил]этокси}хинолин-2-карбоксилата
метил 4-[2-[4-(бензилокси)фенил]-2-оксоэтокси]-6-фторхинолин-2-карбоксилата
метил 4-[2-(3,4-диметоксифенил)-2-оксоэтокси]-6-фторхинолин-2-карбоксилата
метил 4-(3-хлорпропокси)-6-фторхинолин-2-карбоксилата
метил 4-(3-хлор-2-метилпропокси)-6-фторхинолин-2-карбоксилата
метил 4-(1-этилпропокси)-6-фторхинолин-2-карбоксилата
метил 6-фтор-4-[(1-метилгексил)окси]хинолин-2-карбоксилата
метил 4-[2-(2,4-диметоксифенил)-2-оксоэтокси]-6-фторхинолин-2-карбоксилата
метил 4-(3,3-диметил-2-оксобутокси)-6-фторхинолин-2-карбоксилата
метил 6-фтор-4-(3-феноксипропокси)хинолин-2-карбоксилата
метил 4-[(4-бром-2-фторбензил)окси]-6-фторхинолин-2-карбоновой кислоты
метил 4-(1,3-бензотиазол-2-илметокси)-6-фторхинолин-2-карбоновой кислоты
4-этокси-6-фторхинолин-2-карбоновой кислоты
4,4'-[(2E)-бут-2-ен-1,4-диилбис(окси)]бис(6-фторхинолин-2-карбоновой кислоты)
6-фтор-4-[(3-метилбут-2-ен-1-ил)окси]хинолин-2-карбоновой кислоты
4-[(2'-цианобифенил-4-ил)метокси]-6-фторхинолин-2-карбоновой кислоты
4-[(4-бром-2-фторбензил)окси]-6-метоксихинолин-2-карбоксилата натрия
4-(цианометокси)-6-фторхинолин-2-карбоновой кислоты
4-(2-хлорэтокси)-6-фторхинолин-2-карбоновой кислоты
4-(2-амино-2-оксоэтокси)-6-фторхинолин-2-карбоновой кислоты
4-(аллилокси)-6-фторхинолин-2-карбоновой кислоты
4-(3-хлорпропокси)-6-фторхинолин-2-карбоновой кислоты
4-(3-хлор-2-метилпропокси)-6-фторхинолин-2-карбоновой кислоты

6-фтор-4-(пентилокси)хинолин-2-карбоновой кислоты
4-(циклогексилметокси)-6-фторхинолин-2-карбоновой кислоты
6-фтор-4-[2-(4-фторфенокси)этокси]хинолин-2-карбоновой кислоты
6-фтор-4-(2-фенилэтокси)хинолин-2-карбоновой кислоты
6-фтор-4-(3-фенилпропокси)хинолин-2-карбоновой кислоты
4-[2-(1-адамантил)-2-оксоэтокси]-6-фторхинолин-2-карбоновой кислоты
6-фтор-4-[2-(4-фторфенил)-2-оксоэтокси]хинолин-2-карбоновой кислоты
6-фтор-4-[2-(3-метоксифенил)-2-оксоэтокси]хинолин-2-карбоновой кислоты
4-[4-(4-хлорфенокси)бутокси]-6-фторхинолин-2-карбоновой кислоты
6-фтор-4-[2-(3-фторфенокси)этокси]хинолин-2-карбоновой кислоты
4-[2-(4-бромфенокси)этокси]-6-фторхинолин-2-карбоновой кислоты
6-фтор-4-[[5-(4-фторфенокси)пентил]окси]хинолин-2-карбоновой кислоты
4-[2-(4-цианофенокси)этокси]-6-фторхинолин-2-карбоновой кислоты
6-фтор-4-{2-[(4-морфолин-4-ил-1,2,5-тиадиазол-3-ил)окси]этокси}хинолин-2-карбоновой

кислоты
4-{2-[4-(2-карбок시에тил)фенокси]этокси}-6-фторхинолин-2-карбоновой кислоты
6-фтор-4-[2-(2-метоксифенокси)этокси]хинолин-2-карбоновой кислоты
4-(1-карбоксии-3-фенилпропокси)-6-фторхинолин-2-карбоновой кислоты
4-[2-(2,3-диметилфенокси)этокси]-6-фторхинолин-2-карбоновой кислоты
4-[2-(3,4-диметоксифенил)-2-оксоэтокси]-6-фторхинолин-2-карбоновой кислоты,
а также таутомерных форм, энантиомеров, диастереоизомеров и эпимеров, и
фармацевтически приемлемых солей.

19. Применение по п.1, в котором соединения общей формулы (I) выбраны из
4-(4-бром-2-фторбензилокси)-6-фторхинолин-2-карбоновой кислоты
4-(бензотиазол-2-илметокси)-6-фторхинолин-2-карбоновой кислоты
4-этокси-6-фторхинолин-2-карбоновой кислоты
4-(4-бром-2-фторбензилокси)-6-метоксихинолин-2-карбоновой кислоты (натриевая соль)
4-({(E)-4-[(2-карбоксии-6-фтор-4-хинолинил)окси]-2-бутенил}окси)-6-фтор-хинолин-2-

карбоновой кислоты
6-фтор-4-(3-метилбут-2-енилокси)хинолин-2-карбоновой кислоты
4-(2'-цианобифенил-4-илметокси)-6-фторхинолин-2-карбоновой кислоты
4-[2-(3,4-диметоксифенил)-2-оксо-этокси]-6-фторхинолин-2-карбоновой кислоты
метил 4-(3-хлорпропокси)-6-фторхинолин-2-карбоксилата
метил 4-(3-хлор-2-метилпропокси)-6-фторхинолин-2-карбоксилата,
а также таутомерных форм, энантиомеров, диастереоизомеров и эпимеров, и
фармацевтически приемлемых солей.

20. Применение по п.1, в котором указанная фармацевтическая композиция является
пригодной для лечения диабета.

21. Применение по п.1, в котором указанная фармацевтическая композиция является
пригодной для лечения диабета II типа.

22. Применение по п.1, в котором указанная фармацевтическая композиция является
пригодной для лечения заболеваний, выбранных из дислипидемии и ожирения.

23. Применение по п.1, в котором указанная фармацевтическая композиция является
пригодной для лечения заболеваний, выбранных из микроваскулярных и макроваскулярных
усложнений, связанных с диабетом.

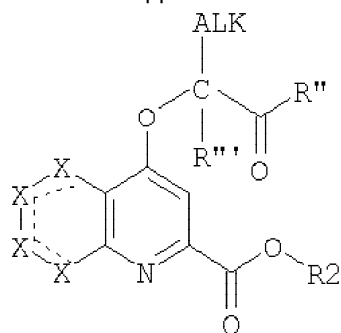
24. Применение по п.1, в котором указанные осложнения включают артериальную
гипертензию, атеросклероз, воспалительные процессы, микроангиопатию,
макроангиопатию, ретинопатию и невропатию.

25. Применение по п.1, в котором фармацевтическая композиция является пригодной
для уменьшения гипергликемии.

26. Соединения общей формулы (I), как определены в любом из предыдущих пунктов, в
которых R1 представляет собой алкил, в котором α углерод по отношению к атому
кислорода замещен при помощи -COOH, -C(=O)-алкила, -C(=O)-арила, -C(=O)-
циклоалкила, -C(=O)O-алкила или -C(=O)NRR', в которых алкил и/или арил являются
необязательно замещенными как указано в любом из предыдущих пунктов, а также

таутомерные формы, энантиомеры, диастереоизомеры и эпимеры, и фармацевтически приемлемые соли.

27. Соединения по п.26, представленные общей формулой (III)



(III)

в которой X, R₂, R, R' и --- принимают значения, как указаны в любом из предыдущих пунктов;

ALK представляет собой алкильный или алкенильный радикал, необязательно замещенный при помощи одной или более из следующих групп: -CN, галоген, арил, биарил, -О-арил, -О-гетероарил, -О-гетероциклоалкил, циклоалкил, гетероциклоалкил, -CO₂H, -C(=O)-алкил, -C(=O)-арил, -C(=O)-циклоалкил, -C(=O)О-алкил, -C(=O)NRR', -ОН, -О-алкил, -О-алкиларил, -C(=O)О-арил, -NRR', -S(O)_pR, в которой р представляет собой 0, 1 или 2;

R'' выбран из -ОН, алкила, арила, циклоалкила, -О-алкила и -NRR', в которых алкил является необязательно замещенным при помощи одной или более из следующих групп: -CN, галоген, арил, биарил, -О-арил, -О-гетероарил, -О-гетероциклоалкил, циклоалкил, гетероциклоалкил, -CO₂H, -C(=O)-алкил, -C(=O)-арил, -C(=O)-циклоалкил, -C(=O)О-алкил, -C(=O)NRR', -ОН, -О-алкил, -О-алкиларил, -C(=O)О-арил, -NRR', -S(O)_pR, в которой р представляет собой 0, 1 или 2; арил является необязательно замещенным при помощи одной или более групп, выбранных из -CN, галогено, арильной, алкильной, -О-алкильной, -алкил-C(=O)О-алкильной, -алкил-C(=O)ОН, -О-алкиларильной, гетероциклоалкильной, -NRR', -ОН, -S(O)_pR, в которой р представляет собой 0, 1 или 2, -О-арильной, пергалоалкильной, -COOH, COOR; гетероарил является необязательно и независимо замещенный при помощи одной или более групп, выбранных из галогено, -COOH и гетероциклоалкильной; гетероциклоалкил является необязательно и независимо замещенный при помощи одной или более арильной группы или =O;

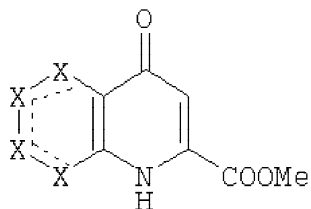
R''' представляет собой H, алкил или алкенил, необязательно замещенный при помощи одной или более из следующих групп: -CN, галоген, арил, биарил, -О-арил, -О-гетероарил, -О-гетероциклоалкил, циклоалкил, гетероциклоалкил, -CO₂H, -C(=O)-алкил, -C(=O)-арил, -C(=O)-циклоалкил, -C(=O)О-алкил, -C(=O)NRR', -ОН, -О-алкил, -О-алкиларил, -C(=O)О-арил, -NRR', -S(O)_pR, в которой р представляет собой 0, 1 или 2;

а также таутомерные формы, энантиомеры, диастереоизомеры и эпимеры, и фармацевтически приемлемые соли.

28. Соединения по п.26 или 27, в которой R'' представляет собой -ОН, алкил, арил, циклоалкил, -О-алкил или -NRR', в которых арил является необязательно замещенным при помощи -О-алкиларила, -О-алкила, алкила, арила или галогена; ALK представляет собой алкил, необязательно замещенный при помощи арила; R''' представляет собой H; X каждый представляет собой атом углерода, необязательно замещенный при помощи атома галогена, R₂ представляет собой H или алкильный радикал, R и R' представляют собой атом водорода или алкильный радикал.

29. Соединения по п.26, в которых X представляет собой атом углерода, необязательно замещенный в положении 6 хинолиновой циклической системы при помощи атома фтора.

30. Способ получения соединений формулы (I) или (III), определенных согласно любому из пп.26-29, который включает стадию введения в реакцию соединения формулы (3):



(3),

в которой X и ---- принимают значения, указанные в любом из предыдущих пунктов,

с соединением формулы R1-Hal, в которой Hal представляет собой атом галогена, а R1 принимает значения, указанные в любом из пп.26-29, в подходящем органическом растворителе, в щелочной среде, при температуре от комнатной и до температуры кипения растворителя, и необязательно стадию омыления полученного продукта в спиртовом растворителе в присутствии основания, необязательно с последующей стадией эстерификации полученного продукта с соответствующим спиртом формулы R2-OH, в которой R2 принимает значения, указанные в любом из предыдущих пунктов, в спиртовом растворителе в кислотной среде.

31. Способ по п.30, который включает стадию выделения полученного продукта.

32. Фармацевтические композиции, которые включают в качестве активного ингредиента, по крайней мере, одно производное общей формулы I или III, как определено в любом из пп.26-29.

RU 2006126781 A

RU 2006126781 A