



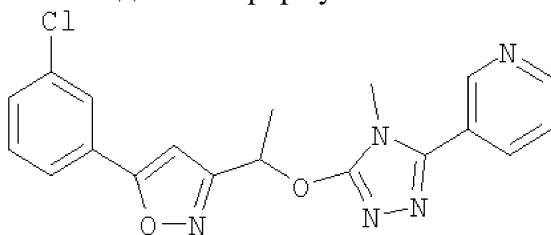
ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**(21), (22) Заявка: **2008108219/04**, 20.09.2006(30) Конвенционный приоритет:
29.09.2005 US 60/721,527(43) Дата публикации заявки: **10.11.2009** Бюл. № 31(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную
фазу: **29.04.2008**(86) Заявка РСТ:
US 2006/036423 (20.09.2006)(87) Публикация РСТ:
WO 2007/040982 (12.04.2007)Адрес для переписки:
**191036, Санкт-Петербург, а/я 24,
"НЕВИНПАТ", пат.пов. А.В.Поликарпову**(71) Заявитель(и):
АстраЗенека АБ (SE)(72) Автор(ы):
**МИНИДИС Александр (SE),
ВЕНСБО Давид (SE),
СЛАССИ Абдельмалик (СА),
АЙЗЕК Метвин (СА),
ЭРИКССОН Каролин (SE),
ПРОФИР Вероника (SE),
БЕРГСТРОМ Пер-Олов (SE),
ЭДВАРДС Луиза (СА),
АРОРА Джалай (СА),
КСИН Тао (СА)**

(54) **СОЕДИНЕНИЯ, ПРЕДСТАВЛЯЮЩИЕ СОБОЙ
5-(ФЕНИЛИЗОКСАЗОЛИЛЭТОКСИ)-ТРИАЗОЛ-3-ИЛ-ЗАМЕЩЕННЫЙ ПИРИДИН, ДЛЯ
ЛЕЧЕНИЯ НЕВРОЛОГИЧЕСКИХ, ПСИХИАТРИЧЕСКИХ ИЛИ БОЛЕВЫХ РАССТРОЙСТВ**

(57) Формула изобретения

1. Соединение формулы I



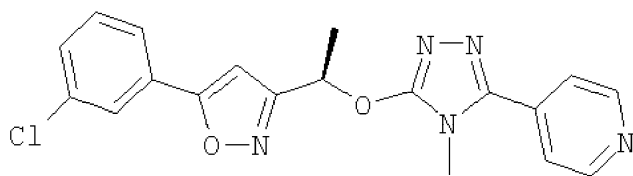
(I)

и его фармацевтически приемлемые соли, гидраты, изоформы и/или энантиомеры.

2. Соединение по п.1, представляющее собой S-энантиомер.

3. Соединение по п.1, представляющее собой R-энантиомер.

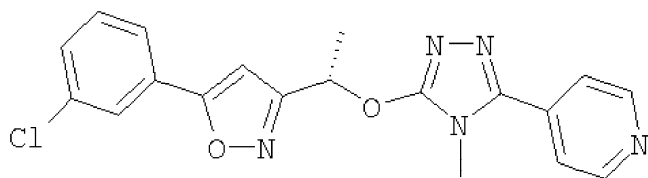
4. Соединение формулы II



(II)

и его фармацевтически приемлемые соли, гидраты и/или изоформы.

5. Соединение формулы III



(III)

и его фармацевтически приемлемые соли, гидраты и/или изоформы.

6. Соединение по любому из пп.1, 4 и 5 в кристаллической форме.

7. Гидрохлоридная соль соединения по любому из пп.1, 4 и 5.

8. Сульфатная соль соединения по любому из пп.1, 4 и 5.

9. Соль, выбранная из гидрохлорида

4-(5-((1R)-1-[5-(3-хлорфенил)изоксазол-3-ил]этокси)-

4-метил-4Н-1,2,4-триазол-3-ил)пиридина и сульфата

4-(5-((1R)-1-[5-(3-хлорфенил)изоксазол-3-ил]этокси)-4-метил-4Н-1,2,4-триазол-3-ил)пиридина.

10. Соединение по любому из пп.1, 4, 5 и 9 для применения в терапии.

11. Фармацевтическая композиция, содержащая соединение по любому из пп.1-9 в качестве активного ингредиента вместе с фармакологически и фармацевтически приемлемым носителем.

12. Применение соединения по любому из пп.1-9 или его фармацевтически приемлемой соли или оптического изомера для изготовления лекарственного средства для лечения расстройства, опосредованного рецепторами mGluR5.

13. Применение по п.12, где указанное расстройство представляет собой неврологическое расстройство.

14. Применение по п.12, где указанное расстройство представляет собой психиатрическое расстройство.

15. Применение по п.12, где указанное расстройство представляет собой желудочно-кишечное расстройство.

16. Применение по п.12, где указанное расстройство представляет собой любое расстройство из следующих: гастроэзофагальное рефлюксное заболевание, IBS (синдром раздраженного кишечника), функциональная диспепсия, кашель, ожирение, болезнь Альцгеймера, сенильная деменция, СПИД-индуцированная деменция, болезнь Паркинсона, амиотрофический боковой склероз, хорей Хантингтона, мигрень, эпилепсия, шизофрения, депрессия, тревога, острая тревога, обсессивно-компульсивное расстройство, офтальмологические расстройства, такие как ретинопатии, диабетические ретинопатии, глаукома, слуховые невропатические расстройства, такие как звон в ушах, индуцированные химиотерапией невропатии, постгерпетическая невралгия и невралгия тройничного нерва, толерантность, зависимость, расстройства, представляющие собой аддикцию и тягу, расстройства развития нервной системы, в том числе синдром ломкой X-хромосомы, аутизм,

умственную отсталость, шизофрению и синдром Дауна, боль, связанная с мигренью, воспалительная боль, невропатические болевые расстройства, такие как диабетические невропатии, артрит и ревматоидные заболевания, поясничная боль, послеоперационная боль, боль, ассоциированная с различными состояниями, включая стенокардию, почечные или желчные колики, менструацию, мигрень и подагру; инсульт, травма головы, аноксические и ишемические повреждения, гипогликемия, сердечно-сосудистые заболевания и эпилепсия.

17. Применение по п.16, где указанное расстройство представляет собой хроническое болевое расстройство.

18. Применение по п.16, где указанное расстройство представляет собой острое болевое расстройство.

19. Применение по п.16, где указанное расстройство представляет собой тревогу.

20. Применение по п.16, где указанное расстройство представляет собой депрессию.

21. Применение по п.16, где указанное расстройство представляет собой болезнь Паркинсона.

22. Применение по п.16, где указанное болевое расстройство представляет собой невропатическое болевое расстройство.

23. Применение по п.16, где указанное болевое расстройство представляет собой мигрень.

24. Применение по п.16, где указанное болевое расстройство представляет собой воспалительную боль.

25. Применение по п.16, где указанное расстройство представляет собой гастро-эзофагальное рефлюксное заболевание.

26. Применение по п.16, где указанное расстройство представляет собой кашель.

27. Способ лечения или предупреждения расстройства, опосредованного рецепторами mGluRS, при котором эффективное количество соединения по любому из пп.1-9 вводят субъекту, который нуждается в таком лечении или предупреждении.

28. Способ по п.27, где указанное расстройство представляет собой неврологическое расстройство.

29. Способ по п.27, где указанное расстройство представляет собой психиатрическое расстройство.

30. Способ по п.27, где указанное расстройство представляет собой любое из нижеследующего: гастро-эзофагальное рефлюксное заболевание, IBS (синдром раздраженного кишечника), функциональная диспепсия, кашель, ожирение, болезнь Альцгеймера, сенильная деменция, СПИД-индуцированная деменция, болезнь Паркинсона, амиотрофический боковой склероз, хорей Хантингтона, мигрень, эпилепсия, шизофрения, депрессия, тревога, острая тревога, обсессивно-компульсивное расстройство, офтальмологические расстройства, такие как ретинопатии, диабетические ретинопатии, глаукома, слуховые невропатические расстройства, такие как звон в ушах, индуцированные химиотерапией невропатии, постгерпетическая невралгия и невралгия тройничного нерва, толерантность, зависимость, расстройства, представляющие собой аддикцию и тягу, расстройства развития нервной системы, в том числе синдром ломкой X-хромосомы, аутизм, умственную отсталость, шизофрению и синдром Дауна, боль, связанная с мигренью, воспалительная боль, невропатические болевые расстройства, такие как диабетические невропатии, артрит и ревматоидные заболевания, поясничная боль, послеоперационная боль, боль, ассоциированная с различными состояниями, включая стенокардию, почечные или желчные колики, менструацию, мигрень и подагру; инсульт, травма головы, аноксические и ишемические повреждения, гипогликемия, сердечно-сосудистые заболевания и эпилепсия.

31. Способ по п.30, где указанное расстройство представляет собой хроническое болевое расстройство.

32. Способ по п.30, где указанное расстройство представляет собой острое болевое расстройство.

33. Способ по п.30, где указанное расстройство представляет собой тревогу.

34. Способ по п.30, где указанное расстройство представляет собой депрессию.

35. Способ по п.30, где указанное расстройство представляет собой болезнь Паркинсона.

36. Способ по п.30, где указанное болевое расстройство представляет собой невропатическое болевое расстройство.

37. Способ по п.30, где указанное болевое расстройство представляет собой мигрень.

38. Способ по п.30, где указанное болевое расстройство представляет собой воспалительную боль.

39. Способ по п.30, где указанное расстройство представляет собой гастроэзофагальное рефлюксное заболевание.

40. Способ по п.30, где указанное расстройство представляет собой кашель.