



(51) МПК
C07D 233/02 (2006.01)
C07D 403/12 (2006.01)
C07D 405/12 (2006.01)
C07D 407/12 (2006.01)
C07D 409/12 (2006.01)
C07D 411/12 (2006.01)
C07D 413/12 (2006.01)
A61K 31/404 (2006.01)
A61K 31/4166 (2006.01)
A61P 31/12 (2006.01)

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21)(22) Заявка: 2023128511, 03.11.2023

Приоритет(ы):

(22) Дата подачи заявки: 03.11.2023

(43) Дата публикации заявки: 05.05.2025 Бюл. № 13

Адрес для переписки:

117997, Москва, ул. Миклухо-Маклая, 16/10,
ИБХ РАН, Григоряну А.Г.

(71) Заявитель(и):

Федеральное государственное бюджетное
учреждение науки Государственный
научный центр Российской Федерации
Институт биоорганической химии им.
академиков М.М. Шемякина и Ю.А.
Овчинникова Российской академии наук
(ГНЦ ИБХ РАН) (RU),
Федеральное государственное бюджетное
учреждение науки Институт химической
биологии и фундаментальной медицины
Сибирского отделения Российской академии
наук (ИХБФМ СО РАН) (RU)

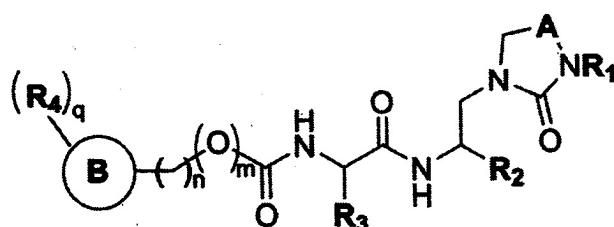
(72) Автор(ы):

Кузнецова Александра Александровна (RU),
Булыгин Анатолий Алексеевич (RU),
Осипова Зинаида Михайловна (RU),
Ямпольский Илья Викторович (RU),
Кузнецов Никита Александрович (RU)

(54) Ингибитор основной протеазы коронавируса SARS-CoV2

(57) Формула изобретения

1. Соединение общей формулы:



(I)

представляющее собой синтетический олигопептид или его фармацевтически приемлемую соль, пригодный в качестве ингибитора основной протеазы коронавируса SARS-CoV2, где:

R₁ представляет собой H или C₁-C₃ алкил;R₂ представляет собой -CH(SO₃H)OH, -CN или -XYR₅, где

X представляет собой -C(O)- или -CHCH-,

A 1 1 2 8 5 1 2 3 1 2 0 2 3 1 2 8 5 1 1

R U 2 0 2 3 1 2 8 5 1 1

Y отсутствует или представляет собой -O-, -C(O)- или -CH₂O-, R₅ представляет собой водород, C₁-C₆ алкил, мезил, алкинил, C₃-C₁₀ циклоалкил, -PO₃H₂, O-(C₁-C₆ алкил), незамещенный или C₁-C₆ алкил или C₃-C₆ циклоалкил замещенный амин, тиазолил, бензотиазолил, фенил, пиридил, фурил, причем R₅ необязательно замещен одним или более гидроксилами или галогенами или O-(C₁-C₆ алкил), или незамещенной или C₁-C₆ алкил или C₃-C₆ циклоалкил замещенным амином, выбранными независимо;

R₃ представляет собой C₁-C₆ алкил, 2-метил-1-пропил, 2-метил-2-пропил, 2,2-диметил-1-пропил, C₃-C₆ циклоалкил, бензил, причем R₃ необязательно замещен одним и более гидроксилами или галогенами или O-(C₁-C₆ алкил), выбранными независимо;

m равно 0 или 1;

n равно 0,1 или 2;

A представляет собой -CH₂- или -C(O)-;

кольцо B или отсутствует, или представляет собой фенил, индолил, 5-членный гетероарил, содержащий 1 или 2 гетероатома, независимо выбранных из N, O и S;

q равно от 1 до 5;

каждый R₄ - независимо выбраны из водорода, галогена, гидроксила, C₁-C₆ алкила, O-(C₁-C₆ алкила), незамещенного или C₁-C₆ алкил или C₃-C₆ циклоалкил замещенного амина, фенила, пиридина, фурила, причем R₄ необязательно замещен одним или более гидроксилами или галогенами или O-(C₁-C₆ алкил), или незамещенной или C₁-C₆ алкил или C₃-C₆ циклоалкил замещенным амином, выбранными независимо.

2. Применение соединения по п. 1 для ингибиования основной протеазы M^{pro} коронавируса SARS-CoV2.