

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2017107715, 25.08.2015

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
27.08.2014 US 62/042,300

(43) Дата публикации заявки: 27.09.2018 Бюл. № 27

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на национальной фазе: 27.03.2017

(86) Заявка РСТ:
US 2015/046648 (25.08.2015)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2016/033009 (03.03.2016)

Адрес для переписки:

191036, Санкт-Петербург, а/я 24,
"НЕВИНПАТ"

(71) Заявитель(и):

ВАЙВ ХЕЛТКЕР ЮКей (N5) ЛИМИТЕД (GB)

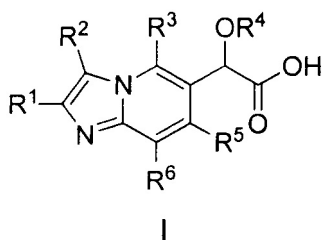
(72) Автор(ы):

**НАИДУ Б. Нарасимхулу (US),
КОННОЛЛИ Тимоти П. (US),
ИСТМАН Кайл Дж. (US),
ПИЗ Кевин (US)**

(54) Производные имидазо[1,2-а]пиридина для применения в качестве ингибиторов репликации вируса иммунодефицита человека

(57) Формула изобретения

1. Соединение Формулы I



где:

R^1 представляет собой фенил, замещенный одним заместителем Ar^1 , а также замещенный 0-3 заместителями, выбранными из галогено, циано, алкила, галогеналкила, алкокси, галогеналкокси и алкенилокси;

R^2 представляет собой водород или алкил;

R^3 представляет собой азетидинил, пирролидинил, пиперидинил, пиперазинил, морфолинил, гомопиперидинил, гомопиперазинил или гомоморфолинил и замещен 0-3 заместителями, выбранными из галогено, алкила, галогеналкила, гидроксильного алкила, алкоксиалкила, алкенила, циклоалкила, гидрокси, алкокси, галогеналкокси, алкенилокси

и фенила;

или R^3 представляет собой циклоалкил, циклоалкенил, фенил, хроманил, оксазинил или дигидропиранохинолинил и замещен 0-3 заместителями, выбранными из галогено, алкила, галогеналкила, гидроксиалкила, алкоксиалкила, алкенила, циклоалкила, гидрокси, алкокси, галогеналкокси, алкенилокси и фенила;

R^4 представляет собой алкил или галогеналкил;

R^5 представляет собой водород или алкил;

R^6 представляет собой водород или алкил;

Ar^1 представляет собой фенил, пиридинил, пиридазинил, пиримидинил, пиразинил, пирролил, фуранил, тиенил, пиразолил, изоксазолил, изотиазолил, имидазолил, оксазолил, тиазолил, триазолил, оксадиазолил, тиадиазолил или тетразолил и замещен 0-3 заместителями, выбранными из галогено, циано, алкила, галогеналкила, бензила, алкокси, галогеналкокси, алкенилокси и бензилокси;

или его фармацевтически приемлемая соль.

2. Соединение по п. 1, где:

R^1 представляет собой фенил, замещенный 1 заместителем Ar^1 ;

R^2 представляет собой водород;

R^3 представляет собой пиперидинил, замещенный 0-3 заместителями, выбранными из галогено, алкила, галогеналкила, гидроксиалкила, алкоксиалкила, алкенила, циклоалкила, гидрокси, алкокси, галогеналкокси, алкенилокси и фенила;

или R^3 представляет собой фенил, хроманил или дигидропиранохинолинил и замещен 0-3 заместителями, выбранными из галогено, алкила, галогеналкила, гидроксиалкила, алкоксиалкила, алкенила, циклоалкила, гидрокси, алкокси, галогеналкокси, алкенилокси и фенила;

R^4 представляет собой алкил;

R^5 представляет собой алкил;

R^6 представляет собой водород;

Ar^1 представляет собой фенил или пиразолил и замещен 0-3 заместителями, выбранными из галогено, циано, алкила, галогеналкила, бензила, алкокси, галогеналкокси, алкенилокси и бензилокси; или его фармацевтически приемлемая соль.

3. Соединение по п. 1, где R^1 представляет собой фенил, замещенный одним заместителем Ar^1 .

4. Соединение по п. 1, где R^2 представляет собой водород, R^4 представляет собой алкил, R^5 представляет собой алкил, и R^6 представляет собой водород.

5. Соединение по п. 1, где R^3 представляет собой пиперидинил, замещенный 0-3 заместителями, выбранными из галогено, алкила, галогеналкила, гидроксиалкила, алкоксиалкила, алкенила, циклоалкила, гидрокси, алкокси, галогеналкокси, алкенилокси и фенила.

6. Соединение по п. 1, где R^3 представляет собой фенил, хроманил или дигидропиранохинолинил и замещен 0-3 заместителями, выбранными из галогено, алкила, галогеналкила, гидроксиалкила, алкоксиалкила, алкенила, циклоалкила, гидрокси, алкокси, галогеналкокси, алкенилокси и фенила.

7. Соединение по п. 1, где Ar^1 представляет собой фенил, пиридинил, пиридазинил, пиримидинил или пиразинил и замещен 0-3 заместителями, выбранными из галогено,

циано, алкила, галогеналкила, бензила, алкокси, галогеналкокси, алкенилокси и бензилокси.

8. Соединение по п. 1, где Ar^1 представляет собой фенил, замещенный 0-3 заместителями, выбранными из галогено, циано, алкила, галогеналкила, алкокси, галогеналкокси, алкенилокси и бензилокси.

9. Соединение по п. 1, где Ar^1 представляет собой пирролил, фуранил, тиенил, пиразолил, изоксазолил, изотиазолил, имидазолил, оксазолил, тиазолил, триазолил, оксадиазолил, тиадиазолил или тетразолил и замещен 0-3 заместителями, выбранными из галогено, циано, алкила, галогеналкила, бензила, алкокси, галогеналкокси, алкенилокси и бензилокси.

10. Соединение по п. 1, где Ar^1 представляет собой пиразолил, замещенный 0-3 заместителями, выбранными из галогено, циано, алкила, галогеналкила, бензила, алкокси, галогеналкокси, алкенилокси и бензилокси.

11. Композиция, полезная для лечения ВИЧ-инфекции, содержащая терапевтическое количество соединения по п. 1 и фармацевтически приемлемый носитель.

12. Композиция по п. 11, дополнительно содержащая терапевтически эффективное количество по меньшей мере одного другого агента, применяемого для лечения СПИД или ВИЧ-инфекции, выбранного из группы, состоящей из нуклеозидных ингибиторов обратной транскриптазы ВИЧ, ненуклеозидных ингибиторов обратной транскриптазы ВИЧ, ингибиторов протеазы ВИЧ, ингибиторов слияния ВИЧ, ингибиторов присоединения ВИЧ, ингибиторов CCR5, ингибиторов CXCR4, ингибиторов баддинга или созревания ВИЧ и ингибиторов интегразы ВИЧ, и фармацевтически приемлемый носитель.

13. Способ лечения ВИЧ-инфекции, включающий введение терапевтически эффективного количества соединения по п. 1 или его фармацевтически приемлемой соли пациенту, нуждающемуся в этом.

14. Способ по п. 13, дополнительно включающий введение терапевтически эффективного количества по меньшей мере одного другого агента, применяемого для лечения СПИД или ВИЧ-инфекции, выбранного из группы, состоящей из нуклеозидных ингибиторов обратной транскриптазы ВИЧ, ненуклеозидных ингибиторов обратной транскриптазы ВИЧ, ингибиторов протеазы ВИЧ, ингибиторов слияния ВИЧ, ингибиторов присоединения ВИЧ, ингибиторов CCR5, ингибиторов CXCR4, ингибиторов баддинга или созревания ВИЧ и ингибиторов интегразы ВИЧ.

RU 2017107715 A

RU 2017107715 A