



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2015106909, 31.07.2013

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
02.08.2012 CN PCT/CN2012/079558;
04.09.2012 US 61/696,572

(43) Дата публикации заявки: 27.09.2016 Бюл. № 27

(85) Дата начала рассмотрения заявки PCT на
национальной фазе: 02.03.2015(86) Заявка PCT:
US 2013/052961 (31.07.2013)(87) Публикация заявки PCT:
WO 2014/022528 (06.02.2014)Адрес для переписки:
129090, Москва, ул. Б. Спасская, 25, стр. 3, ООО
"Юридическая фирма Городисский и Партнеры"

(71) Заявитель(и):

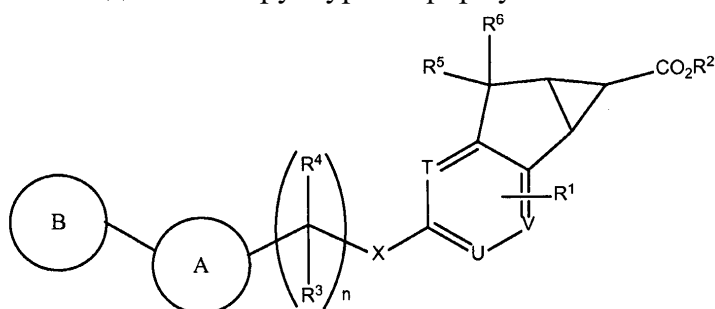
МЕРК ШАРП И ДОУМ КОРП. (US)

(72) Автор(ы):

**ХАДЖМАНН Уилльям К. (US),
НАРГУНД Рави П. (US),
БЛИЗАРД Тимоти А. (US),
ДЖОСИЕН Хуберт (US),
БИДЖУ Пураккаттле (US),
ПЛАММЕР Кристофер В. (US),
ДАН Цюнь (US),
ЛИ Бин (US),
ЛИН Линус С. (CN),
ЦУЙ Минсян (CN),
ХУ Бинь (CN),
ХАО Цзинлай (CN),
ЧЭНЬ Чжэнся (CN),
ЛИ Дэжунь (US)**(54) **АНТИДИАБЕТИЧЕСКИЕ ТРИЦИКЛИЧЕСКИЕ СОЕДИНЕНИЯ**

(57) Формула изобретения

1. Соединение структурной формулы I:



I

или его фармацевтически приемлемая соль; где

X выбран из группы, состоящей из:

(1) кислорода и

(2) NH;

T выбран из группы, состоящей из: CH, N и N-оксида;

U выбран из группы, состоящей из: CH, N и N-оксида;

V выбран из группы, состоящей из: CH, N и N-оксида;

при условии, что один или два из T, U и V обозначают N или N-оксид;

А выбран из группы, состоящей из:

(1) арила и

(2) гетероарила,

где А является незамещенным или замещен одним-пятью заместителями, выбранными

из R^a ;

В выбран из группы, состоящей из:

(1) арила,

(2) арил-О-,

(3) C_{3-6} циклоалкила-,

(4) C_{3-6} циклоалкил- C_{1-10} алкила-,

(5) C_{3-6} циклоалкил- C_{1-10} алкил-О-,

(6) C_{2-5} циклогетероалкила-,

(7) гетероарила,

(8) гетероарил-О-,

(9) арил- C_{1-10} алкила- и

(10) гетероарил- C_{1-10} алкила-;

где В является незамещенным или замещен одним-пятью заместителями, выбранными

из R^b ;

R^1 выбран из группы, состоящей из:

(1) галогена,

(2) $-OR^e$,

(3) $-CN$,

(4) $-C_{1-6}$ алкила и

(5) $-C_{3-6}$ циклоалкила,

где каждый $-C_{1-6}$ алкил и $-C_{3-6}$ циклоалкил является незамещенным или замещен

одним-тремя заместителями, выбранными из R^i ;

R^2 выбран из группы, состоящей из:

(1) водорода,

(2) $-C_{1-6}$ алкила и

(3) $-C_{3-6}$ циклоалкила,

где каждый $-C_{1-6}$ алкил и $-C_{3-6}$ циклоалкил является незамещенным или замещен

одним-тремя заместителями, выбранными из R^j ;

R^3 выбран из группы, состоящей из:

(1) водорода,

(2) галогена,

(3) $-OR^e$,

(4) $-C_{1-6}$ алкила,

(5) $-C_{2-6}$ алкенила,

(6) $-C_{2-6}$ алкинила и

(7) $-C_{3-6}$ циклоалкила,

где каждый C_{1-6} алкил, C_{2-6} алкенил, C_{2-6} алкинил и C_{3-6} циклоалкил является

незамещенным или замещен одним-тремя заместителями, выбранными из R^L ;

R^4 выбран из группы, состоящей из:

RU 2015106909 A

RU 2015106909 A

- (1) водорода,
- (2) галогена,
- (3) $-OR^e$,
- (4) $-C_{1-6}$ алкила,
- (5) $-C_{2-6}$ алкенила,
- (6) $-C_{2-6}$ алкинила и
- (7) $-C_{3-6}$ циклоалкила,

где каждый $-C_{1-6}$ алкил, $-C_{2-6}$ алкенил, $-C_{2-6}$ алкинил и $-C_{3-6}$ циклоалкил является

незамещенным или замещен одним-тремя заместителями, выбранными из R^L ;

R^5 выбран из группы, состоящей из:

- (1) водорода,
- (2) $-C_{1-3}$ алкила и
- (3) галогена;

R^6 выбран из группы, состоящей из:

- (1) водорода,
- (2) $-C_{1-3}$ алкила и
- (3) галогена, или

R^5 и R^6 могут вместе образовывать оксо;

R^a выбран из группы, состоящей из:

- (1) $-C_{1-6}$ алкила,
- (2) галогена,
- (3) $-OR^e$,
- (4) $-NR^cS(O)_mR^e$,
- (5) $-S(O)_mR^e$,
- (6) $-S(O)_mNR^cR^d$,
- (7) $-NR^cR^d$,
- (8) $-C(O)R^e$,
- (9) $-OC(O)R^e$,
- (10) $-CO_2R^e$,
- (11) $-CN$,
- (12) $-C(O)NR^cR^d$,
- (13) $-NR^cC(O)R^e$,
- (14) $-NR^cC(O)OR^e$,
- (15) $-NR^cC(O)NR^cR^d$,
- (16) $-CF_3$,
- (17) $-OCF_3$,
- (18) $-OCHF_2$,
- (19) $-C_{3-6}$ циклоалкила и
- (20) $-C_{2-5}$ циклогетероалкила;

R^b независимо выбран из группы, состоящей из:

- (1) -C₁₋₁₀алкила,
- (2) -C₂₋₁₀алкенила,
- (3) галогена,
- (4) -ОН,
- (5) -ОС₁₋₁₀алкила,
- (6) -ОС₂₋₁₀алкенила,
- (7) -O(CH₂)_pОС₁₋₁₀алкила,
- (8) -O(CH₂)_pС₃₋₆циклоалкила,
- (9) -O(CH₂)_pС₃₋₆циклоалкил-С₁₋₁₀алкила-,
- (10) -O(CH₂)_pС₂₋₁₀циклогетероалкила,
- (11) -O(CH₂)_pС₂₋₅циклогетероалкил-С₁₋₁₀алкила-,
- (12) -О-арила,
- (13) -О-гетероарила,
- (14) -О-арил-С₁₋₁₀алкила-,
- (15) -О-гетероарил-С₁₋₁₀алкила-,
- (16) -NR^cS(O)_mR^e,
- (17) -S(O)_mR^e,
- (18) -S(O)_mNR^cR^d,
- (19) -NR^cR^d,
- (20) -C(O)R^e,
- (21) -OC(O)R^e,
- (22) -CO₂R^e,
- (23) -CN,
- (24) -C(O)NR^cR^d,
- (25) -NR^cC(O)R^e,
- (26) -NR^cC(O)OR^e,
- (27) -NR^cC(O)NR^cR^d,
- (28) -O(CH₂)_pО-С₃₋₆циклоалкила,
- (29) -O(CH₂)_pО-С₂₋₁₀циклогетероалкила,
- (30) -CF₃,
- (31) -OCF₃,
- (32) -OCHF₂,
- (33) -(CH₂)_p-С₃₋₆циклоалкила,
- (34) -(CH₂)_p-С₂₋₁₀циклогетероалкила,
- (35) арила,
- (36) гетероарила,
- (37) арил-С₁₋₁₀алкила- и
- (38) гетероарил-С₁₋₁₀алкила-,

где каждый R^b является незамещенным или замещен одним-пятью заместителями, выбранными из R^k;

R^c и R^d , каждый независимо, выбран из группы, состоящей из:

- (1) водорода,
- (2) C_{1-10} алкила,
- (3) C_{2-10} алкенила,
- (4) C_{3-6} циклоалкила,
- (5) C_{3-6} циклоалкил- C_{1-10} алкила-,
- (6) циклогетероалкила,
- (7) циклогетероалкил- C_{1-10} алкила-,
- (8) арила,
- (9) гетероарила,
- (10) арил- C_{1-10} алкила- и
- (11) гетероарил- C_{1-10} алкила-, или

R^c и R^d вместе с атомом(ами), к которому(ым) они присоединены, образуют 4-7-членное циклогетероалкильное кольцо, содержащее 0-2 дополнительных гетероатома, независимо выбранных из кислорода, серы и $N-R^g$, и где каждый R^c и R^d является незамещенным или замещен одним-тремя заместителями, независимо выбранными из R^f ;

каждый R^e независимо выбран из группы, состоящей из:

- (1) водорода,
- (2) $-C_{1-10}$ алкила,
- (3) $-C_{2-10}$ алкенила,
- (4) $-C_{3-6}$ циклоалкила,
- (5) $-C_{3-6}$ циклоалкил- C_{1-10} алкила-,
- (6) $-C_{2-5}$ циклогетероалкила,
- (7) $-C_{2-5}$ циклогетероалкил- C_{1-10} алкила-,
- (8) арила,
- (9) гетероарила,
- (10) арил- C_{1-10} алкила- и
- (11) гетероарил- C_{1-10} алкила-,

где каждый R^e является незамещенным или замещен одним-тремя заместителями, выбранными из R^h ;

каждый R^f выбран из группы, состоящей из:

- (1) галогена,
- (2) C_{1-10} алкила,
- (3) -ОН,
- (4) -O- C_{1-4} алкила,
- (5) -S(O)_m- C_{1-4} алкила,
- (6) -CN,
- (7) -CF₃,
- (8) -OCHF₂ и
- (9) -OCF₃,

где каждый C_{1-10} алкил является незамещенным или замещен одним-тремя

заместителями, независимо выбранными из: -ОН, галогена, циано и -S(O)₂CH₃;

каждый R^g выбран из группы, состоящей из:

- (1) водорода,
- (2) -C(O)R^e и
- (3) -C₁₋₁₀алкила,

где -C₁₋₁₀алкил является незамещенным или замещен одним-пятью атомами фтора;

каждый R^h выбран из группы, состоящей из:

- (1) галогена,
- (2) C₁₋₁₀алкила,
- (3) -ОН,
- (4) -O-C₁₋₄алкила,
- (5) -S(O)_m-C₁₋₄алкила,
- (6) -CN,
- (7) -CF₃,
- (8) -OCHF₂ и
- (9) -OCF₃,

где каждый C₁₋₁₀алкил является незамещенным или замещен одним-тремя заместителями, независимо выбранными из: -ОН, галогена, циано и -S(O)₂CH₃;

Rⁱ независимо выбран из группы, состоящей из:

- (1) -C₁₋₆алкила,
- (2) -OR^e,
- (3) -NR^cS(O)_mR^e,
- (4) галогена,
- (5) -S(O)_mR^e,
- (6) -S(O)_mNR^cR^d,
- (7) -NR^cR^d,
- (8) -C(O)R^e,
- (9) -OC(O)R^e,
- (10) -CO₂R^e,
- (11) -CN,
- (12) -C(O)NR^cR^d,
- (13) -NR^cC(O)R^e,
- (14) NR^cC(O)OR^e,
- (15) -NR^cC(O)NR^cR^d,
- (16) -CF₃,
- (17) -OCF₃,
- (18) -OCHF₂,
- (19) -C₃₋₆циклоалкила и
- (20) -C₂₋₅циклогетероалкила;

R^j независимо выбран из группы, состоящей из:

- (1) -C₁₋₆алкила,
- (2) -OR^e,
- (3) -NR^cS(O)_mR^e,
- (4) галогена,
- (5) -S(O)_mR^e,
- (6) -S(O)_mNR^cR^d,
- (7) -NR^cR^d,
- (8) -C(O)R^e,
- (9) -OC(O)R^e,
- (10) -CO₂R^e,
- (11) -CN,
- (12) -C(O)NR^cR^d,
- (13) -NR^cC(O)R^e,
- (14) -NR^cC(O)OR^e,
- (15) -NR^cC(O)NR^cR^d,
- (16) -CF₃,
- (17) -OCF₃,
- (18) -OCHF₂,
- (19) -C₃₋₆циклоалкила и
- (20) -C₂₋₅циклогетероалкила;

каждый R^k независимо выбран из группы, состоящей из:

- (1) галогена,
- (2) -C₁₋₁₀алкила,
- (3) -ОН,
- (4) оксо,
- (5) галогена,
- (6) -О-C₁₋₄алкила,
- (7) -SO₂-C₁₋₆алкила,
- (8) -C₁₋₆алкил-SO₂C₁₋₆алкила,
- (9) -CN,
- (10) -CF₃,
- (11) -OCHF₂,
- (12) -OCF₃,
- (13) -NH₂,
- (14) -NHSO₂C₁₋₆алкила,
- (15) -NHCOC₁₋₆алкила,
- (16) =N(OCH₃),
- (17) -P(O)(OH)₂ и
- (18) -P(O)(OC₁₋₆алкил)₂,

где каждый C₁₋₁₀алкил является незамещенным или замещен одним-тремя

заместителями, независимо выбранными из: -ОН, -ОС₁₋₆алкила, галогена, циано и -S(O)₂C₁₋₆алкила;

R^L выбран из группы, состоящей из:

- (1) -C₁₋₆алкила,
- (2) галогена,
- (3) -OR^e,
- (4) -NR^cS(O)_mR^e,
- (5) -S(O)_mR^e,
- (6) -S(O)_mNR^cR^d,
- (7) -NR^cR^d,
- (8) -C(O)R^e,
- (9) -OC(O)R^e,
- (10) -CO₂R^e,
- (11) -CN,
- (12) -C(O)NR^cR^d,
- (13) -NR^cC(O)R^e,
- (14) -NR^cC(O)OR^e,
- (15) -NR^cC(O)NR^cR^d,
- (16) -CF₃,
- (17) -OCF₃,
- (18) -OCHF₂,
- (19) -C₃₋₆циклоалкила и
- (20) -C₂₋₅циклогетероалкила;

каждый n независимо выбран из: 0, 1, 2, 3 или 4;

каждый m независимо выбран из: 0, 1 или 2; и

каждый p независимо выбран из: 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 или 10.

2. Соединение по п. 1, в котором n=1; или его фармацевтически приемлемая соль.

3. Соединение по п. 2, в котором X обозначает кислород; или его фармацевтически приемлемая соль.

4. Соединение по п. 3, в котором T обозначает СН, U обозначает N или N-оксид, и V обозначает СН; или его фармацевтически приемлемая соль.

5. Соединение по п. 3, в котором T обозначает СН, U обозначает N, и V обозначает СН; или его фармацевтически приемлемая соль.

6. Соединение по п. 5, в котором A выбран из группы, состоящей из: фенила и пиридина, где A является незамещенным или замещен одним-пятью заместителями, выбранными из R^a; или его фармацевтически приемлемая соль.

7. Соединение по п. 5, в котором A обозначает фенил, где фенил является незамещенным или замещен одним-пятью заместителями, выбранными из R^a; или его фармацевтически приемлемая соль.

8. Соединение по п. 7, в котором B выбран из группы, состоящей из: арила и гетероарила, где B является незамещенным или замещен одним-пятью заместителями, выбранными из R^b; или его фармацевтически приемлемая соль.

9. Соединение по п. 7, в котором В выбран из группы, состоящей из: фенила, пиридина, пиримидина, тиазола, бензимидазола, бензотиазола, бензоксазола и бензизоксазола, где В является незамещенным или замещен одним-пятью заместителями, выбранными из R^b ; или его фармацевтически приемлемая соль.

10. Соединение по п. 7, в котором В выбран из группы, состоящей из: фенила и пиридина, где В является незамещенным или замещен одним-пятью заместителями, выбранными из R^b ; или его фармацевтически приемлемая соль.

11. Соединение по п. 10, в котором R^1 , R^2 , R^5 и R^6 обозначают водород; или его фармацевтически приемлемая соль.

12. Соединение по п. 11, в котором R^3 и R^4 выбраны из группы, состоящей из: водорода, галогена и $-C_{1-6}$ алкила, где каждый C_{1-6} алкил является незамещенным или замещен одним-тремя заместителями, выбранными из R^L ; или его фармацевтически приемлемая соль.

13. Соединение по п. 11, в котором R^3 и R^4 обозначают водород; или его фармацевтически приемлемая соль.

14. Соединение по п. 13, в котором R^a выбран из группы, состоящей из: $-C_{1-6}$ алкила, галогена и $-CF_3$, или его фармацевтически приемлемая соль.

15. Соединение по п. 14, в котором R^b независимо выбран из группы, состоящей из:

- (1) $-C_{1-10}$ алкила,
- (2) галогена,
- (3) $-OH$,
- (4) $-OC_{1-10}$ алкила,
- (5) $-O(CH_2)_pOC_{1-10}$ алкила,
- (6) $-O(CH_2)_pC_{3-6}$ циклоалкила,
- (7) $-O(CH_2)_pC_{2-10}$ циклогетероалкила,
- (8) $-O(CH_2)_pO-C_{3-6}$ циклоалкила,
- (9) $-O(CH_2)_pO-C_{2-10}$ циклогетероалкила,
- (10) $-CF_3$,
- (11) $-OCF_3$,
- (12) $-OCHF_2$,
- (13) $-(CH_2)_pC_{2-10}$ циклогетероалкила и
- (14) $-S(O)_2C_{1-10}$ алкила,

где каждый R^b является незамещенным или замещен одним-пятью заместителями, выбранными из R^k ; или его фармацевтически приемлемая соль.

16. Соединение по п. 14, в котором R^b независимо выбран из группы, состоящей из:

- (1) $-C_{1-10}$ алкила,
- (2) галогена,
- (3) $-OH$,
- (4) $-OC_{1-10}$ алкила,
- (5) $-O(CH_2)_pC_{2-10}$ циклогетероалкила,
- (6) $-CF_3$ и
- (7) $-(CH_2)_pC_{2-10}$ циклогетероалкила,

где каждый R^b является незамещенным или замещен одним-пятью заместителями, выбранными из R^k ; или его фармацевтически приемлемая соль.

17. Соединение по п. 16, в котором каждый R^k независимо выбран из группы, состоящей из:

- (1) $-C_{1-10}$ алкила,
- (2) $-O-C_{1-4}$ алкила,
- (3) $-OH$,
- (4) галогена,
- (5) $-SO_2-C_{1-6}$ алкила,
- (6) $-C_{1-6}$ алкил- $-SO_2-C_{1-6}$ алкила,
- (7) $-CN$,
- (8) $-NHSO_2-C_{1-6}$ алкила,
- (9) $=N(OCH_3)$ и
- (10) $-P(O)(OC_{1-6}алкил)_2$,

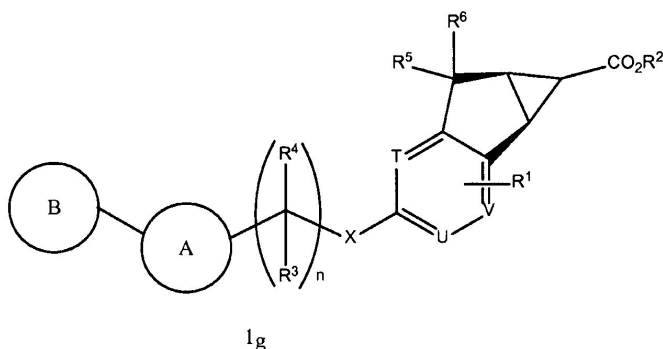
где каждый C_{1-10} алкил является незамещенным или замещен одним-тремя заместителями, независимо выбранными из: $-OH$, $-OC_{1-6}$ алкила, галогена, циано и $-S(O)_2C_{1-6}$ алкила; или его фармацевтически приемлемая соль.

18. Соединение по п. 16, в котором каждый R^k независимо выбран из группы, состоящей из:

- (1) $-C_{1-10}$ алкила,
- (2) $-OH$,
- (3) галогена,
- (4) $-SO_2-C_{1-6}$ алкила,
- (5) $-C_{1-6}$ алкил- $-SO_2-C_{1-6}$ алкила и
- (6) $-CN$,

где каждый C_{1-10} алкил является незамещенным или замещен одним-тремя заместителями, независимо выбранными из: $-OH$, $-OC_{1-6}$ алкила, галогена, циано и $-S(O)_2C_{1-6}$ алкила; или его фармацевтически приемлемая соль.

19. Соединение по п. 18, в котором абсолютная стереохимия в двух стереогенных углеродных центрах показана ниже:



или его фармацевтически приемлемая соль.

20. Соединение по п. 1, в котором:

$n=1$;

X обозначает кислород;

T обозначает CH ;

U обозначает N ;

V обозначает СН;

A выбран из группы, состоящей из: арила и гетероарила, где A является незамещенным или замещен одним-пятью заместителями, выбранными из R^a;

B выбран из группы, состоящей из: арила и гетероарила, где B является незамещенным или замещен одним-пятью заместителями, выбранными из R^b;

R¹, R², R⁵ и R⁶ обозначают водород; и

R³ и R⁴ выбраны из группы, состоящей из: водорода, галогена и -C₁₋₆алкила, где каждый C₁₋₆алкил является незамещенным или замещен одним-тремя заместителями, выбранными из R^L;

или его фармацевтически приемлемая соль.

21. Соединение по п. 1, в котором:

n=1;

X обозначает кислород;

T обозначает СН;

U обозначает N;

V обозначает СН;

A выбран из группы, состоящей из: фенила и пиридина, где A является незамещенным или замещен одним-пятью заместителями, выбранными из R^a;

B выбран из группы, состоящей из: фенила, пиридина, пиримидина, тиазола, бензимидазола, бензотиазола, бензоксазола и бензизоксазола, где B является незамещенным или замещен одним-пятью заместителями, выбранными из R^b;

R¹, R², R³, R⁴, R⁵ и R⁶ обозначают водород;

R^a выбран из группы, состоящей из: -C₁₋₆алкила, галогена и -CF₃;

R^b независимо выбран из группы, состоящей из:

- (1) -C₁₋₁₀алкила,
- (2) галогена,
- (3) -ОН,
- (4) -OC₁₋₁₀алкила,
- (5) -O(CH₂)_pOC₁₋₁₀алкила,
- (6) -O(CH₂)_pC₃₋₆циклоалкила,
- (7) -O(CH₂)_pC₂₋₁₀циклогетероалкила,
- (8) -O(CH₂)_pO-C₃₋₆циклоалкила,
- (9) -O(CH₂)_pO-C₂₋₁₀циклогетероалкила,
- (10) -CF₃,
- (11) -OCF₃,
- (12) -OCHF₂,
- (13) -(CH₂)_p-C₂₋₁₀циклогетероалкила и
- (14) -S(O)₂C₁₋₁₀алкила,

где каждый R^b является незамещенным или замещен одним-пятью заместителями, выбранными из R^k; и

каждый R^k независимо выбран из группы, состоящей из:

- (1) -C₁₋₁₀алкила,

- (2) -O-C₁₋₄алкила,
- (3) -ОН,
- (4) галогена,
- (5) -SO₂-C₁₋₆алкила,
- (6) -C₁₋₆алкил-SO₂C₁₋₆алкила,
- (7) -CN,
- (8) -NH-SO₂-C₁₋₆алкила,
- (9) =N(OCH₃) и
- (10) -P(O)(OC₁₋₆алкил)₂,

где каждый C₁₋₁₀алкил является незамещенным или замещен одним-тремя заместителями, независимо выбранными из: -ОН, -OC₁₋₆алкила, галогена, циано и -S(O)₂C₁₋₆алкила;

или его фармацевтически приемлемая соль.

22. Соединение по п. 1, в котором

n=1;

X обозначает кислород;

T обозначает СН;

U обозначает N;

V обозначает СН;

A обозначает фенил, где фенил является незамещенным или замещен одним-пятью заместителями, выбранными из R^a;

B выбран из группы, состоящей из: фенила и пиридина, где B является незамещенным или замещен одним-пятью заместителями, выбранными из R^b;

R¹, R², R³, R⁴, R⁵ и R⁶ обозначают водород;

R^a выбран из группы, состоящей из: -C₁₋₆алкила, галогена и -CF₃;

R^b независимо выбран из группы, состоящей из:

- (1) -C₁₋₁₀алкила,
- (2) галогена,
- (3) -ОН,
- (4) -OC₁₋₁₀алкила,
- (5) -O(CH₂)_p-C₂₋₁₀циклогетероалкила,
- (6) -CF₃ и
- (7) -(CH₂)_p-C₂₋₁₀циклогетероалкила,

где каждый R^b является незамещенным или замещен одним-пятью заместителями, выбранными из R^k; и

каждый R^k независимо выбран из группы, состоящей из:

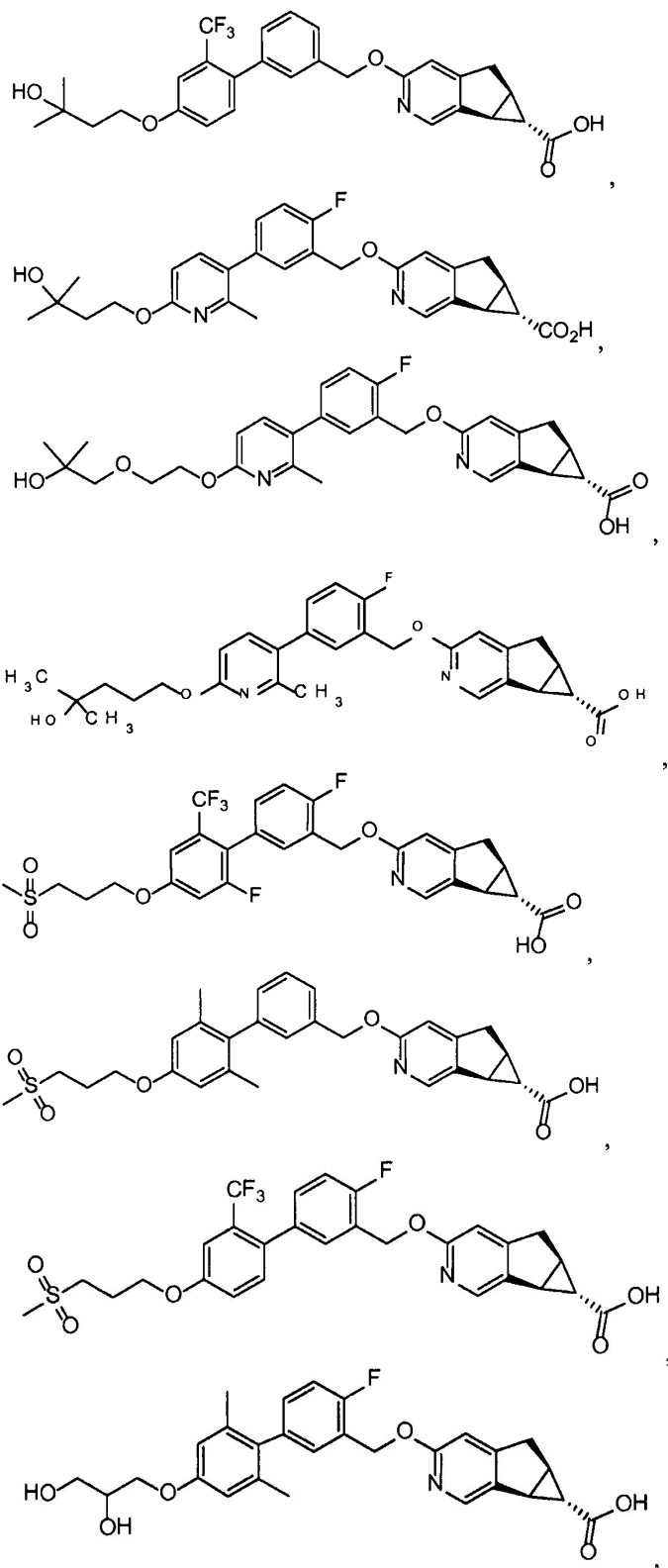
- (1) -C₁₋₁₀алкила,
- (2) -ОН,
- (3) галогена,
- (4) -SO₂-C₁₋₆алкила,
- (5) -C₁₋₆алкил-SO₂C₁₋₆алкила и
- (6) -CN,

где каждый C₁₋₁₀алкил является незамещенным или замещен одним-тремя

заместителями, независимо выбранными из: -ОН, -ОС₁₋₆алкила, галогена, циано и -S (O)₂C₁₋₆алкила;

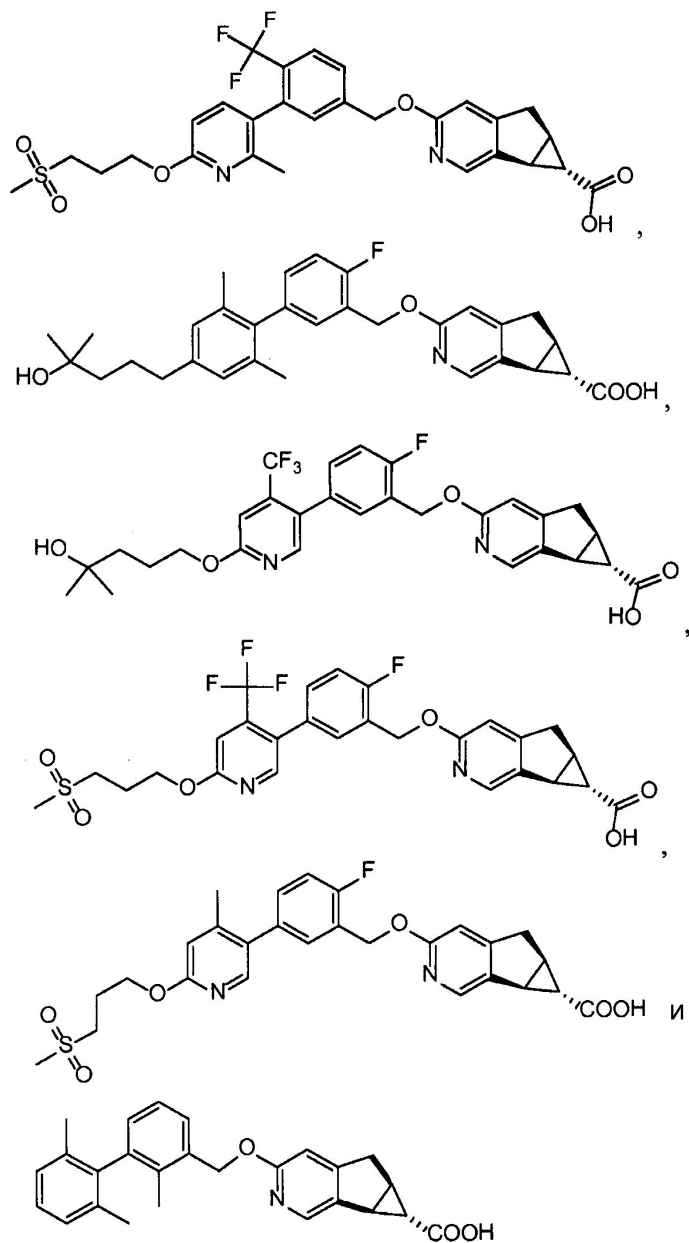
или его фармацевтически приемлемая соль.

23. Соединение по п. 22, выбранное из:



RU 2015106909 A

RU 2015106909 A



или его фармацевтически приемлемая соль.

24. Фармацевтическая композиция, содержащая соединение по п. 1 или его фармацевтически приемлемую соль и фармацевтически приемлемый носитель.

25. Применение соединения по п. 1 или его фармацевтически приемлемой соли, для получения лекарственного средства, пригодного для лечения у млекопитающего нарушения, состояния или заболевания, которое является чувствительным к агонизму связанного с G-белком рецептора 40.

26. Применение соединения по п. 1 или его фармацевтически приемлемой соли, для получения лекарственного средства для лечения диабета типа 2.

27. Соединение по п. 1 или его фармацевтически приемлемая соль, для применения в терапии.

28. Способ лечения или профилактики нарушения, состояния или заболевания, которое является чувствительным к агонизму связанного с G-белком рецептора 40 у пациента, включающей введение терапевтически эффективного количества соединения по п. 1 или его фармацевтически приемлемой соли.

29. Способ лечения сахарного диабета типа 2 у пациента, включающий введение пациенту терапевтически эффективного количества соединения по п. 1 или его фармацевтически приемлемой соли.

30. Фармацевтическая композиция, содержащая

- (1) соединение по п. 1 или его фармацевтически приемлемую соль;
- (2) одно или более соединений, выбранных из группы, состоящей из:
 - (a) агонистов и частичных агонистов PPAR гамма;
 - (b) бигуанидов;
 - (c) ингибиторов протеинтирозин-фосфатазы-1B (PTP-1B);
 - (d) ингибиторов дипептидил-пептидазы IV (DP-IV);
 - (e) инсулина или миметиков инсулина;
 - (f) сульфонилмочевины;

- (g) ингибиторов α -глюкозидазы;

(h) средств, которые улучшают липидный профиль пациента, где указанные средства выбраны из группы, состоящей из (i) ингибиторов HMG-CoA редуктазы, (ii) секвестрантов желчных кислот, (iii) никотинилового спирта, никотиновой кислоты или ее соли, (iv) агонистов PPAR α , (v) ингибиторов абсорбции холестерина, (vi) ингибиторов ацил CoA:холестерин ацилтрансферазы (ACAT), (vii) ингибиторов CETP и (viii) фенольных антиоксидантов;

- (i) двойных агонистов PPAR α/γ ;
- (j) агонистов PPAR δ ;
- (k) соединений против ожирения;
- (l) ингибиторов транспортера илеальных желчных кислот;
- (m) противовоспалительных средств;
- (n) антагонистов рецептора глюкагона;
- (o) GLP-1;
- (p) GIP-1;
- (q) аналогов GLP-1;
- (r) ингибиторов HSD-1;
- (s) ингибиторов SGLT 1 и
- (t) ингибиторов SGLT 2; и
- (3) фармацевтически приемлемый носитель.

31. Фармацевтическая композиция, содержащая соединение по п. 1 или его фармацевтически приемлемую соль и соединение, выбранное из симвастатина, эзетимиба и ситаглиптина; и фармацевтически приемлемый носитель.