

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

(21)(22) Заявка: 2018117499, 14.10.2016

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
19.10.2015 GB 1518456.7

(43) Дата публикации заявки: 21.11.2019 Бюл. № 33

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 21.05.2018(86) Заявка РСТ:
EP 2016/074662 (14.10.2016)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2017/067848 (27.04.2017)

Адрес для переписки:

129090, Москва, ул. Б. Спасская, 25, стр. 3, ООО
"Юридическая фирма Городисский и
Партнеры"

(71) Заявитель(и):

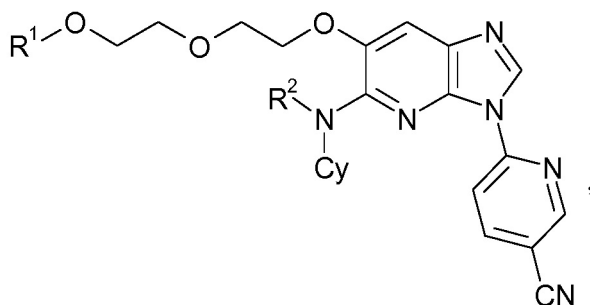
ГАЛАПАГОС НВ (BE)

(72) Автор(ы):

БРИС Режиаль Кристоф Ксавье (BE),
ЖЕНЕЙ Рафаэль Жан Жоэль (FR),
ЖОНКУР Аньес Мари (FR),
ДОЙОН Жюльен Жорж Пьер-Оливье (BE),
ЛЯБЕГЕР Фредерик Жильбер (FR),
ЛЕФРАНСУА Жан-Мишель (FR),
МАММОЛИТИ Оскар (BE),
ШМИТ Бенуа Антуан (BE),
ВАН ДЕР ПЛА Стивен Эмиель (BE),
МЕНЕ Кристель Жанн Мари (BE)(54) ПРОИЗВОДНЫЕ 6-[5-АМИНО-6-(2-ЭТОКСИЭТОКСИ)-ИМИДАЗО[4,5-В]ПИРИДИН-3-ИЛ
]НИКОТИНОНИТРИЛА И ИХ ПРИМЕНЕНИЕ В КАЧЕСТВЕ ИРАК ИНГИБИТОРОВ

(57) Формула изобретения

1. Соединение формулы I:



I

где

Су представляет собой

- моноциклический C₃₋₇ циклоалкил, необязательно замещенный одним илинесколькими независимо выбранными R³, или

- 4-7-членный моноциклический гетероциклоалкил, содержащий один или два

гетероатома, независимо выбранных из N, S и O, необязательно замещенный одним или несколькими независимо выбранными R³;

R¹ представляет собой

- H,
- -SO₃H,
- -P(=O)(OH)₂,
- C₁₋₄ алкил,
- -C(=O)-(4-7-членный моноциклический гетероциклоалкил, содержащий один или два гетероатома, независимо выбранных из N, S и O), или
- -C(=O)C₁₋₆ алкил, при этом C₁₋₆ алкил необязательно замещен одним или

несколькими независимо выбранными группами R⁴;

R² представляет собой H или C₁₋₄ алкил;

каждый R³ независимо выбран из:

- OH,
- =O,
- галогена и
- C₁₋₄ алкила;

каждый R⁴ независимо выбран из:

- -NR^{5a}R^{5b},
- -C(=O)OH,
- 4-7-членного моноциклического гетероциклоалкила, содержащего один или два гетероатома, независимо выбранных из N, S и O, необязательно замещенного одним или несколькими независимо выбранными C₁₋₄ алкилами, и
- -NHC(=O)-C₁₋₄ алкил-NH₂; и

R^{5a} и R^{5b} независимо представляют собой H или C₁₋₄ алкил;

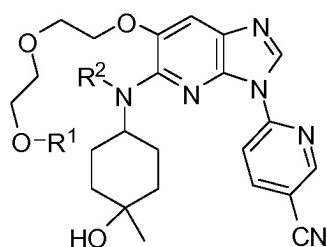
или его фармацевтически приемлемая соль или сольват или соль его сольвата.

2. Соединение или его фармацевтически приемлемая соль по п.1, где Су представляет собой моноциклический C₃₋₇ циклоалкил, замещенный одним или двумя независимо выбранными R³.

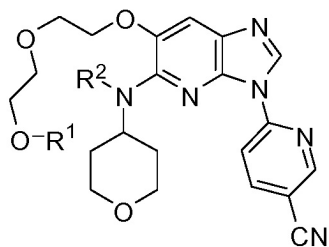
3. Соединение или его фармацевтически приемлемая соль по п.1 или 2, где Су представляет собой тетрагидропиранил или тетрагидротииопиранил, каждый из которых необязательно замещен одним или двумя независимо выбранными R³.

4. Соединение или его фармацевтически приемлемая соль по любому из пп. 1-3, где R³ выбран из OH, =O, F и -CH₃.

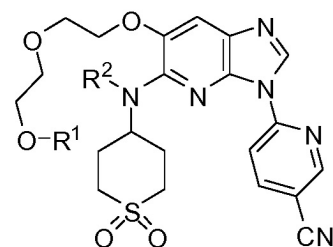
5. Соединение или его фармацевтически приемлемая соль по п.1, где соединение соответствует формуле IIa, IIb, IIc, IId, IIf или IIg:



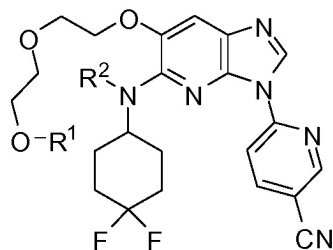
IIa



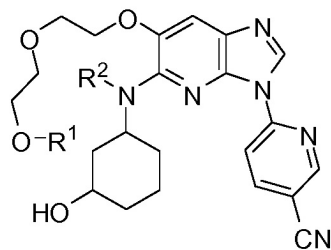
IIb



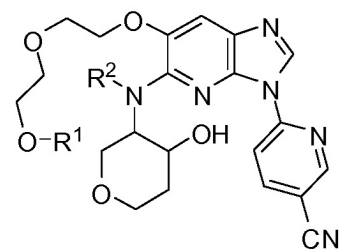
IIc



IIд



IIe



IIф

6. Соединение или его фармацевтически приемлемая соль по любому из пп. 1-5, где R^1 представляет собой H, $-CH_3$, $-SO_3H$ или $-P(=O)(OH)_2$.

7. Соединение или его фармацевтически приемлемая соль по любому из пп. 1-5, где R^1 представляет собой $-C(=O)C_{1-6}$ алкил, при этом C_{1-6} алкил замещен одним или двумя независимо выбранными R^4 .

8. Соединение или его фармацевтически приемлемая соль по любому из пп. 1-5, где R^1 представляет собой $-C(=O)C_{1-6}$ алкил, при этом C_{1-6} алкил замещен одним или двумя независимо выбранными $-C(=O)OH$, $-NH_2$, $-NHCH_3$ или $-N(CH_3)_2$.

9. Соединение или его фармацевтически приемлемая соль по любому из пп. 1-8, где R^2 представляет собой H или $-CH_3$.

10. Соединение или его фармацевтически приемлемая соль по п.1, где соединение выбрано из:

6-[6-[2-(2-гидрокси-этокс)-этокс]-5-(тетрагидропиран-4-иламино)-имидазо[4,5-b]пиридин-3-ил]-никотинонитрила, и

2-{2-[3-(5-циано-пиридин-2-ил)-5-(тетрагидропиран-4-иламино)-3H-имидазо[4,5-b]пиридин-6-илокси]-этокс}-этилового эфира (S)-2-амино-3-метил-масляной кислоты.

11. Фармацевтическая композиция, содержащая фармацевтически приемлемый носитель и фармацевтически эффективное количество соединения или его фармацевтически приемлемой соли по любому из пп.1-10.

12. Фармацевтическая композиция по п.11, содержащая дополнительное терапевтическое средство.

13. Фармацевтическая композиция по п.12, где дополнительное терапевтическое средство является средством для профилактики и/или лечения воспалительных заболеваний, аутоиммунных заболеваний и/или пролиферативных заболеваний.

14. Соединение или его фармацевтически приемлемая соль по любому из пп.1-10 или фармацевтическая композиция по любому из пп.11-13 для применения в медицине.

15. Соединение или его фармацевтически приемлемая соль по любому из пп.1-10 или фармацевтическая композиция по любому из пп.11-13 для применения в профилактике и/или лечении воспалительных заболеваний, аутоиммунных заболеваний и/или пролиферативных заболеваний.