

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21)(22) Заявка: 2018117499, 14.10.2016

Приоритет(ы):

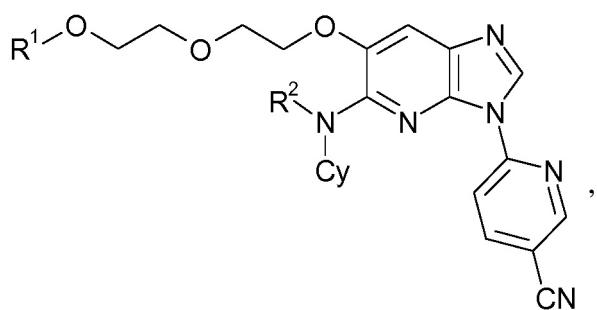
(30) Конвенционный приоритет:
19.10.2015 GB 1518456.7

(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 (ВЕ)(72) Автор(ы):
БРИС Режиналь Кристоф Ксавье (ВЕ),
ЖЕНЕЙ Рафаэль Жан Жоэль (FR),
ЖОНКУР Аньес Мари (FR),
ДОЙОН Жюльен Жорж Пьер-Оливье (ВЕ),
ЛЯБЕГЕР Фредерик Жильбер (FR),
ЛЕФРАНСУА Жан-Мишель (FR),
МАММОЛИТИ Оскар (ВЕ),
ШМИТ Бенуа Антуан (ВЕ),
ВАН ДЕР ПЛА Стивен Эмиель (ВЕ),
МЕНЕ Кристель Жанн Мари (ВЕ)(54) ПРОИЗВОДНЫЕ 6-[5-АМИНО-6-(2-ЭТОКСИЭТОКСИ)-ИМИДАЗО[4,5-В]ПИРИДИН-3-ИЛ
ДИНИКОТИНОНИТРИЛА И ИХ ПРИМЕНЕНИЕ В КАЧЕСТВЕ IRAK ИНГИБИТОРОВ

(57) Формула изобретения

1. Соединение формулы I:



где

Су представляет собой

- моноциклический C₃₋₇ циклоалкил, необязательно замещенный одним или несколькими 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;

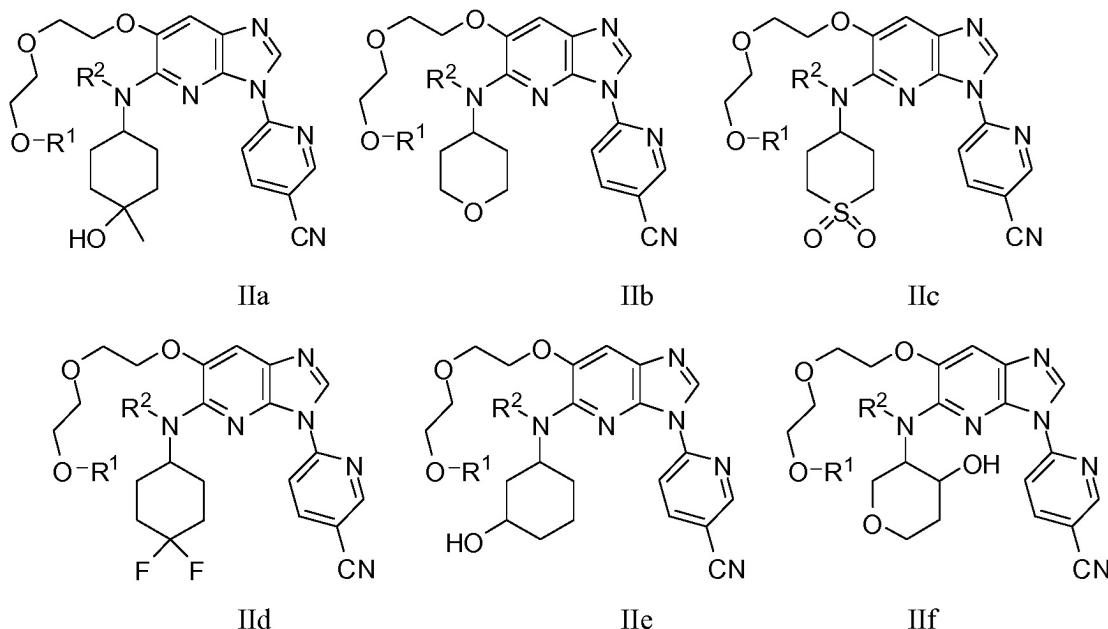
или его фармацевтически приемлемая соль или сольват или соль его сольвата.

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 тетрагидротиопиранил, 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, IIe или IIIf:



6. Соединение или его фармацевтически приемлемая соль по любому из пп. 1-5, где R¹ представляет собой H, -CH₃, -SO₃H или -P(=O)(OH)₂.

7. Соединение или его фармацевтически приемлемая соль по любому из пп. 1-5, где R¹ представляет собой -C(=O)C₁₋₆ алкил, при этом C₁₋₆ алкил замещен одним или двумя независимо выбранными R⁴.

8. Соединение или его фармацевтически приемлемая соль по любому из пп. 1-5, где R¹ представляет собой -C(=O)C₁₋₆ алкил, при этом C₁₋₆ алкил замещен одним или двумя независимо выбранными -C(=O)OH, -NH₂, -NHC₆H₅ или -N(CH₃)₂.

A
9
9
11
17
4
9
9
A
R
U
2
0
1
8
1
1
7
4
9
9
A

9. Соединение или его фармацевтически приемлемая соль по любому из пп. 1-8, где R² представляет собой H или -CH₃.

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

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

2-{2-[3-(5-циано-пиридин-2-ил)-5-(тетрагидропиран-4-иламино)-3H-имиазо[4,5-b]пиридин-6-илокси]-этокси}-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.