

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

(21)(22) Заявка: 2012157072/04, 30.05.2011

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
31.05.2010 JP 2010-123727

(43) Дата публикации заявки: 20.07.2014 Бюл. № 20

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 09.01.2013(86) Заявка РСТ:
JP 2011/062377 (30.05.2011)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2011/152351 (08.12.2011)Адрес для переписки:
109012, Москва, ул. Ильинка, 5/2, ООО
"Союзпатент"

(71) Заявитель(и):

ОНО ФАРМАСЬЮТИКАЛ КО., ЛТД. (JP)

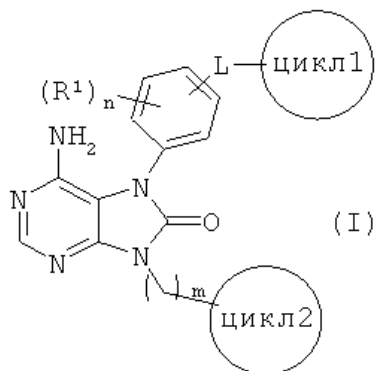
(72) Автор(ы):

ЯМАМОТО Синго (JP),

ЁСИЗАВА Тосио (JP)

(54) **ПРОИЗВОДНОЕ ПУРИНОНА**(57) **Формула изобретения**

1. Соединение, представленное общей формулой (I)



в данной формуле

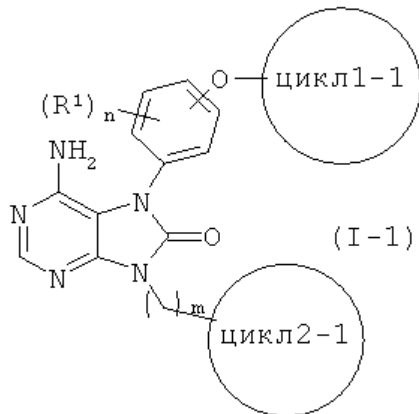
L представляет собой (1) -O-, (2) -S-, (3) -SO-, (4) -SO₂-, (5) -NH-, (6) -C(O)-, (7) -CH₂-O-, (8) -O-CH₂-, (9) -CH₂- или (10) -CH(OH)-;R¹ представляет собой (1) атом галогена, (2) C₁₋₄ алкильную группу, (3) C₁₋₄ алкокси группу, (4) C₁₋₄ галогеналкильную группу или (5) C₁₋₄ галогеналкокси группу;

цикл 1 представляет собой 4-7-членную циклическую группу, которая может быть замещена 1-5 заместителями, каждый из которых независимо выбран из группы,

заместителей -K-R².

5. Соединение по п.4, в котором 4-7-членный азотсодержащий насыщенный гетероцикл представляет собой азетидиновый, пирролидиновый или пиперидиновый цикл.

6. Соединение по п.1, представленное общей формулой (I-1)



(в данной формуле, цикл 1-1 представляет собой бензольный, циклогексановый или пиридиновый цикл, каждый из которых может быть замещен 1-5 заместителями, каждый из которых независимо выбран из группы, состоящей из (1) атомов галогена, (2) C₁₋₄ алкильных групп, (3) C₁₋₄ алкокси групп, (4) нитрильной группы и (5) CF₃, и цикл 2-1 представляет собой 4-7-членный азотсодержащий насыщенный гетероцикл, который может иметь от одного до трех заместителей -K-R², где остальные символы соответствуют вышеприведенным определениям).

7. Соединение по п.6, в котором R² представляет собой C₂₋₄ алкенильную группу или C₂₋₄ алкинильную группу, каждая из которых может быть замещена 1-5 заместителями, каждый из которых независимо выбран из группы, состоящей из (1) NR³R⁴, (2) атомов галогена, (3) CONR⁵R⁶, (4) CO₂R⁷ и (5) OR⁸.

8. Соединение по п.1, которое представляет собой (1) 9-(1-акрилоил-3-азетидинил)-6-амино-7-(4-феноксифенил)-7,9-дигидро-8Н-пурин-8-он, (2) 6-амино-9-[(3R)-1-[(2E)-4-(диметиламино)-2-бутеноил]-3-пирролидинил]-7-(4-феноксифенил)-7,9-дигидро-8Н-пурин-8-он, (3) 9-[(1-акрилоил-4-пиперидинил)метил]-6-амино-7-(4-феноксифенил)-7,9-дигидро-8Н-пурин-8-он, (4) 6-амино-9-[(3R)-1-(2-бутиноил)-3-пирролидинил]-7-(4-феноксифенил)-7,9-дигидро-8Н-пурин-8-он, (5) 6-амино-9-[(3S)-1-[(2E)-4-(диметиламино)-2-бутеноил]-3-пирролидинил]-7-(4-феноксифенил)-7,9-дигидро-8Н-пурин-8-он, (6) 6-амино-7-[4-(3-хлорфеноксифенил)]-9-[(3R)-1-[(2E)-4-(диметиламино)-2-бутеноил]-3-пирролидинил]-7,9-дигидро-8Н-пурин-8-он, (7) 6-амино-9-[1-(2-бутиноил)-3-пирролидинил]-7-(4-феноксифенил)-7,9-дигидро-8Н-пурин-8-он, или (8) 6-амино-9-[1-[(2E)-4-(диметиламино)-2-бутеноил]-3-пирролидинил]-7-(4-феноксифенил)-7,9-дигидро-8Н-пурин-8-он, или его оптический изомер или их смесь.

9. Фармацевтическая композиция, содержащая соединение, представленное общей формулой (I) по п.1, его оптический изомер или их смесь, его соль, сольват, N-оксид или пролекарство.

10. Фармацевтическая композиция по п.9, которая представляет собой Vtk ингибитор.

11. Фармацевтическая композиция по п.9, которая представляет собой средство для профилактики и/или средство для лечения заболевания, связанного с Vtk.

12. Фармацевтическая композиция по п.11, где заболевание, связанное с Vtk, представляет собой аллергическое заболевание, аутоиммунное заболевание, воспалительное заболевание, тромбоэмболическое заболевание или рак.

13. Фармацевтическая композиция по п.12, где рак представляет собой неходжкинскую лимфому.

14. Фармацевтическая композиция по п.9, которая представляет собой ингибитор В-клеточной активации.

15. Способ профилактики и/или лечения заболевания, связанного с Vtk, включающий введение млекопитающему эффективного количества соединения, представленного общей формулой (I) по п.1, его оптического изомера или их смеси, его соли, сольвата, N-оксида или пролекарства.

1.6. Соединение, представленное общей формулой (I) по п.1, его оптический изомер или их смесь, его соль, сольват, N-оксид или пролекарство для профилактики и/или лечения заболевания, связанного с Vtk.

17. Применение соединения, представленного общей формулой (I) по п.1, его оптического изомера или их смеси, его соли, сольвата, N-оксида или пролекарства для получения средства для профилактики и/или лечения заболевания, связанного с Vtk.

RU 2012157072 A

RU 2012157072 A