



(51) МПК
C07D 471/04 (2006.01)
C07D 487/04 (2006.01)
A61K 31/437 (2006.01)
A61K 31/519 (2006.01)
A61P 31/06 (2006.01)
A01N 43/50 (2006.01)
A01P 3/00 (2006.01)

(12) ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

(21)(22) Заявка: 2012122653, 05.11.2010

(24) Дата начала отсчета срока действия патента:
05.11.2010Дата регистрации:
23.01.2017

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
05.11.2009 US 61/258,549

(43) Дата публикации заявки: 10.12.2013 Бюл. № 34

(45) Опубликовано: 23.01.2017 Бюл. № 3

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 05.06.2012(86) Заявка РСТ:
US 2010/055728 (05.11.2010)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2011/057145 (12.05.2011)Адрес для переписки:
191002, Санкт-Петербург а/я 5, ООО "Ляпунов
и партнеры"

(72) Автор(ы):

МИЛЛЕР Марвин Дж. (US),
МОРАСКИ Гаррет К. (US),
МАРКЛИ Лоувелл Д. (US),
ДЭВИС Джордж Э. (US)

(73) Патентообладатель(и):

ЮНИВЕРСИТИ ОФ НОТР ДАМ ДЮ
ЛАК (US)(56) Список документов, цитированных в отчете
о поиске: Luke R.Odell et al: "Functionalized
3-amino-imidazo[1,2-a]pyridines: A novel class
of drug-like *Mycobacterium tuberculosis*
glutamine synthetase inhibitors", *Bioorganic &*
Medicinal Chemistry Letters, 19, 2009,
pp.4790-4793. RU 2193036 C2, 20.11.2002. SU
1255052 A3, 30.08.1986.

C2

1

9 8 6 1 2

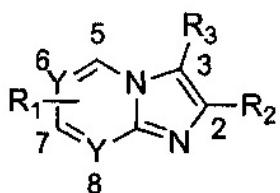
RU

R U
2 6 0 8 6 1 1
C 2

(54) СОЕДИНЕНИЯ ИМИДАЗО[1,2-а]ПИРИДИНА, ИХ СИНТЕЗ И СПОСОБЫ ПРИМЕНЕНИЯ

(57) Формула изобретения

1. Соединение формулы



или его фармацевтически приемлемая соль, где

Y представляет собой CH или N;

R1 представляет собой:

- алкил, содержащий 1-2 атома углерода;

- замещенный алкил, содержащий 1-3 атома углерода, который включает 1-3
заместителя, выбранных из гетероарила (выбранного из пиридина, тиазола, фурана),
фенила, галогена, при этом указанные гетероарил и фенил замещены 1-3 заместителями,

R U 2 6 0 8 6 1 1 C 2

выбранными из галогена, -OQ₁₀, метилсульфонильной группы, фторфенокси-группы и Q₁₅; причем Q₁₀ представляет собой алкил, содержащий 1-3 атома углерода, и Q₁₅ представляет собой водород, алкил, содержащий 1-2 атома углерода, который может быть замещен тремя атомами галогена;

- циклоалкил, содержащий 3-6 атомов углерода;
- амид (-CONH₂) или алкин, содержащий 2-4 атома углерода;
- галоген;
- фенил;
- замещенный фенил, содержащий 1-2 заместителя, выбранных из трифторметилфенокси-группы, -OQ₁₀, галогена, тиоморфолина; при этом Q₁₀ представляет собой алкил, содержащий один атом углерода;
- бензотриазола;

R₂ представляет собой:

- алкил, содержащий один атом углерода;
- замещенный алкил, содержащий один атом углерода, содержащий 1-3 заместителя, выбранных из галогена и фенила;
- фенил;

R₃ представляет собой - COW,
где W представляет собой OR₁, NHR₁ или NR₁R₂.

2. Соединение по п.1, где

- (a) R₁ является 7-CH₃, R₂ является CH₃, R₃ представляет собой (2,4-диметил)бензилкарбокси (ND-8448); или
- (b) R₁ является 7-CH₃, R₂ является CH₃, R₃ представляет собой (3-трифторметил)бензилкарбокси (ND-8451); или
- (c) R₁ является 8-CH₃; R₂ является CH₃, и R₃ представляет собой (4-метокси)бензилкарбокси (ND-9432); или
- (d) R₁ является 8-CH₃; R₂ является CH₃, и R₃ представляет собой (2-этил)бензилкарбокси (ND-9433); или
- (e) R₁ является 7-CH₃, R₂ является CH₃, R₃ представляет собой (4-метокси)бензиламинокарбонил (ND-8668); или
- (f) R₁ является 7-CH₃, R₂ является CH₃, R₃ представляет собой (3-этокси)бензиламинокарбонил (ND-9906); или
- (g) R₁ является 7-CH₃, R₂ является CH₃, R₃ представляет собой (3-изопропокси)бензиламинокарбонил (ND-9872); или
- (h) R₁ является 7-CH₃, R₂ является CH₃, R₃ представляет собой (3-хлор-5-(трифторметил)пиридин-2-ил)метанаминокарбонил (ND-9902); или
- (i) R₁ является 6-CH₃, R₂ является CH₃, R₃ представляет собой (4-(метилсульфонил)бензиламинокарбонил (ND-9965); или
- (j) R₁ является 7-CH₃, R₂ является CH₃, R₃ представляет собой 4-(4-(трифторметил)фенокси)анилинокарбонил (ND-9903); или
- (k) R₁ является 7-CH₃, R₂ является CH₃, R₃ представляет собой 4-(4-фторфенокси)бензиламинокарбонил (ND-9758).

3. Соединение по п.1, где соединение обладает противогрибковой активностью.

4. Фармацевтическая композиция для лечения, улучшения состояния, предотвращения или борьбы с туберкулезом, включающая соединение по п.1 и фармацевтически приемлемый носитель.

R U
2 6 0 8 6 1 1
C 2

R U
2 6 0 8 6 1 1
C 2

5. Применение соединения по п.1 для лечения или предотвращения туберкулеза у пациента.

6. Применение по п.5, где пациентом является человек.

7. Применение по п.5, где инфекция является активной или латентной инфекцией *M. tuberculosis*.

8. Применение по п.5, где введение включает пероральное, ингаляционное, парентеральное, внутривенное, внутримышечное или подкожное введение.

9. Применение по п.5, дополнительно включающее введение одного или нескольких дополнительных агентов, эффективных в лечении туберкулеза.

10. Применение по п.9, где один или несколько дополнительных агентов представляют собой изониазид или рифампицин.

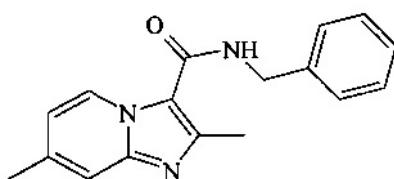
11. Соединение по п.1, где R_2 представляет собой CH_3 или CF_3 .

12. Соединение по п.1, где W представляет собой OR_1 .

13. Соединение по п.1, где W представляет собой NHR_1 .

14. Соединение по п.1, где W представляет собой NR_1R_2 .

15. Соединение по п.1, где соединение имеет одну из следующих формул
ND-8454



16. Соединение по п.1, где R_1 представляет собой CH_3 или CF_3 .

17. Соединение по п.1, где R_1 представляет собой:

- алкил, содержащий 1-2 атома углерода;

- замещенный алкил, содержащий 1-3 атома углерода и 1-3 заместителя, выбранных из гетероарила (выбранного из пиридина, тиазола, фурана), фенила, галогена, при этом указанные гетероарил и фенил замещены 1-3 заместителями, выбранными из галогена и Q_{15} ; причем Q_{15} представляет собой водород, алкил, содержащий 1-2 атома углерода, который может быть замещен тремя атомами галогена.

18. Соединение по п.1, где R_1 представляет собой:

- алкил, содержащий один атом углерода;

- замещенный алкил, содержащий один атом углерода и один заместитель, выбранный из фенила, где указанный фенил замещен один заместителем, выбранным из галогена и Q_{15} ; причем Q_{15} представляет собой водород, алкил, содержащий 1-2 атома углерода, который может быть замещен тремя атомами галогена.

19. Соединение по п.1, где Y представляет собой CH .