



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(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)

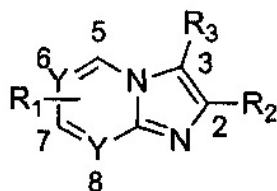
(73) Патентообладатель(и):

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.

(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,

выбранными из галогена, $-OQ_{10}$, метилсульфонильной группы, фторфенокси-группы и Q_{15} ; причем Q_{10} представляет собой алкил, содержащий 1-3 атома углерода, и Q_{15} представляет собой водород, алкил, содержащий 1-2 атома углерода, который может быть замещен тремя атомами галогена;

- циклоалкил, содержащий 3-6 атомов углерода;
- амид ($-CONH_2$) или алкин, содержащий 2-4 атома углерода;

- галоген;

- фенил;

- замещенный фенил, содержащий 1-2 заместителя, выбранных из трифторметилфенокси-группы, $-OQ_{10}$, галогена, тиоморфолина; при этом Q_{10} представляет собой алкил, содержащий один атом углерода;

- бензотриазола;

R_2 представляет собой:

- алкил, содержащий один атом углерода;

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

- фенил;

R_3 представляет собой - COW,

где W представляет собой OR_1 , NHR_1 или NR_1R_2 .

2. Соединение по п.1, где

(a) R_1 является 7- CH_3 , R_2 является CH_3 , R_3 представляет собой (2,4-диметил) бензилкарбоксы (ND-8448); или

(b) R_1 является 7- CH_3 , R_2 является CH_3 , R_3 представляет собой (3-трифторметил) бензилкарбоксы (ND-8451); или

(c) R_1 является 8- CH_3 , R_2 является CH_3 , и R_3 представляет собой (4-метокси) бензилкарбоксы (ND-9432); или

(d) R_1 является 8- CH_3 , R_2 является CH_3 , и R_3 представляет собой (2-этил) бензилкарбоксы (ND-9433); или

(e) R_1 является 7- CH_3 , R_2 является CH_3 , R_3 представляет собой (4-метокси) бензиламинокарбонил (ND-8668); или

(f) R_1 является 7- CH_3 , R_2 является CH_3 , R_3 представляет собой (3-этокси) бензиламинокарбонил (ND-9906); или

(g) R_1 является 7- CH_3 , R_2 является CH_3 , R_3 представляет собой (3-изопропокси) бензиламинокарбонил (ND-9872); или

(h) R_1 является 7- CH_3 , R_2 является CH_3 , R_3 представляет собой (3-хлор-5-(трифторметил)пиридин-2-ил)метанаминокарбонил (ND-9902); или

(i) R_1 является 6- CH_3 , R_2 является CH_3 , R_3 представляет собой (4-(метилсульфонил) бензиламинокарбонил (ND-9965); или

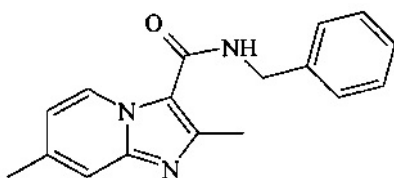
(j) R_1 является 7- CH_3 , R_2 является CH_3 , R_3 представляет собой 4-(4-(трифторметил) фенокси)анилинокарбонил (ND-9903); или

(k) R_1 является 7- CH_3 , R_2 является CH_3 , R_3 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.

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 .