

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

## (12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21)(22) Заявка: 2015113320, 11.10.2013

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:  
12.10.2012 US 61/713,113

(43) Дата публикации заявки: 27.11.2016 Бюл. № 33

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на  
национальной фазе: 12.05.2015(86) Заявка РСТ:  
EP 2013/071247 (11.10.2013)(87) Публикация заявки РСТ:  
WO /2014/057078 (17.04.2014)Адрес для переписки:  
119019, Москва, Гоголевский б-р, 11, этаж 3,  
"Гоулингз Интернэшнл Инк.", Карпенко Оксана  
Юрьевна

(71) Заявитель(и):

Х. ЛУНДБЕКК А/С (DK)

(72) Автор(ы):

КИЛБУРН Джон Пол (DK),  
РАСМУССЕН Ларс Кин (DK),  
ЛЭССИНГ Микель (DK),  
ЭЛДЕМЕНКИ Эман Мохаммед (US),  
ЧЕН Бин (US),  
ДЖИАНГ Ию (US),  
ХОППЕР Аллен Т. (US)

A

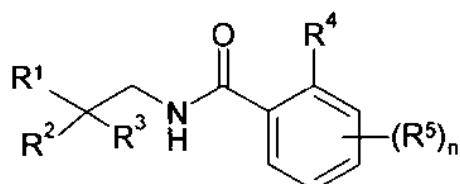
2015113320

R U  
2 0 1 5 1 1 3 3 2 0  
A

(54) Бензамиды

(57) Формула изобретения

1. Соединение формулы I



где R<sup>1</sup> представляет собой фенил, пиридинил, пиразинил, пириазинил, пиримидил или 5-членный гетероарил, каждый из которых необязательно замещен одним или несколькими C<sub>1-6</sub>алкилами, галогенами, гидроксигруппами, C<sub>1-6</sub>гидроксиалкилами, C<sub>1-4</sub>фторалкилами, C<sub>3-6</sub>циклоалкилами, C<sub>1-4</sub>алкокси, C<sub>1-4</sub>фторалкокси, циано или -SO<sub>2</sub>R<sup>8</sup>;

где R<sup>2</sup> представляет собой C<sub>3-6</sub>циклоалкил, C<sub>3-6</sub>циклогетероалкил, C<sub>1-4</sub>фторалкил, C<sub>1-4</sub>фторалкоксигруппу, C<sub>1-4</sub>алкокси, C<sub>1-6</sub>алкенил, C<sub>1-6</sub>алкинил, 6-членный гетероарил, фенил или C<sub>1-4</sub>алкил, необязательно замещенный одним или несколькими R<sup>9</sup>;

где R<sup>3</sup> представляет собой водород, фтор, C<sub>1-4</sub>алкил или C<sub>1-4</sub>фторалкил; или

где R<sup>2</sup> и R<sup>3</sup> объединяются с углеродом, к которому они присоединены, образуя

циклогексил, тетрагидропиридинил, пиперазинил, пиреридинил, морфолинил, пирролидинил, азетидинил, гомоморфолинил, гомопиперидинил или гомопиперазинил, каждый из которых необязательно замещен одним или несколькими  $C_{1-6}$ алкилами,  $C_{1-6}$ алкенилами,  $C_{3-6}$ -циклоалкилами,  $C_{1-6}$ алкокси, оксо,  $NR^6R^7$  или фтором; где  $R^4$  представляет собой галоген,  $C_{1-4}$ фторалкил, циано, циклопропил,  $C_{1-4}$ алкилокси,  $C_{1-4}$ фторалкилокси,  $-SO_2R^8$ ,  $-NR^6R^7$  или  $C_{1-6}$ алкил; где  $R^5$  представляет собой галоген,  $C_{1-6}$ алкил,  $C_{1-4}$ фторалкил, циано,  $-SO_2R^8$ ,  $-NR^6R^7$ ,  $C_{1-6}$ алкокси,  $C_{1-4}$ фторалкокси или  $C_{3-6}$ -циклоалкил; где  $R^6$  и  $R^7$  независимо друг от друга представляют собой водород или  $C_{1-6}$ алкил; где  $R^8$  представляет собой  $C_{1-6}$ алкил,  $C_{3-6}$ циклоалкил или  $C_{1-4}$ фторалкил; где  $R^9$  представляет собой  $C_{1-6}$ алкил,  $C_{3-6}$ циклоалкил,  $-NR^{10}R^{11}$ ,  $C_{1-4}$ фторалкил или 3-7-членный гетероциклик, который необязательно замещен одним или несколькими  $C_{1-6}$ алкилами, галогенами, гидрокси,  $C_{1-4}$ фторалкилами,  $C_{3-6}$ циклоалкилами,  $C_{1-4}$ алкокси,  $C_{1-4}$ фторалкокси или циано; где  $R^{10}$  и  $R^{11}$  независимо друг от друга представляют собой водород или  $C_{1-6}$ алкил; или где  $R^{10}$  и  $R^{11}$  объединяются с азотом, к которому они присоединены, образуя пиперазинил, пиреридинил, морфолинил, пирролидинил, азетидинил, гомоморфолинил, гомопиперидинил или гомопиперазинил, каждый из которых необязательно замещен одним или несколькими  $C_{1-6}$ алкилами,  $C_{1-6}$ алкокси, оксо, или фтором; и где  $n$  равно 0-3; или его фармацевтически приемлемая соль.

2. Соединение по п. 1, где  $R^1$  представляет собой необязательно замещенный фенил.
3. Соединение по п. 1, где  $R^1$  представляет собой необязательно замещенный пиридинил.
4. Соединение по п. 1, где  $R^1$  представляет собой необязательно замещенный пиразинил.
5. Соединение по п. 1, где  $R^1$  представляет собой необязательно замещенный пиридинил.
6. Соединение по п. 1, где  $R^1$  представляет собой необязательно замещенный 5-членный гетероарил.
7. Соединение по любому из пп. 1-6, где  $R^2$  и  $R^3$  объединяются с азотом, к которому они присоединены, образуя необязательно замещенный пиперазинил.
8. Соединение по любому из пп. 1-6, где  $R^2$  и  $R^3$  объединяются с азотом, к которому они присоединены, образуя необязательно замещенный пиперидинил.
9. Соединение по любому из пп. 1-6, где  $R^2$  и  $R^3$  объединяются с азотом, к которому они присоединены, образуя необязательно замещенный морфолинил.
10. Соединение по любому из пп. 1-6, где  $R^2$  и  $R^3$  объединяются с азотом, к которому они присоединены, образуя необязательно замещенный пирролидинил.
11. Соединение по любому из пп. 1-6, где  $R^2$  и  $R^3$  объединяются с азотом, к которому они присоединены, образуя необязательно замещенный пиррольный фрагмент.
12. Соединение по любому из пп. 1-6, где  $R^2$  и  $R^3$  объединяются с азотом, к которому они присоединены, образуя необязательно замещенный имидазольный фрагмент.

13. Соединение по любому из пп. 1-6, где  $R^2$  и  $R^3$  объединяются с азотом, к которому они присоединены, образуя необязательно замещенный гомоморфолинил.
14. Соединение по любому из пп. 1-6, где  $R^2$  и  $R^3$  объединяются с азотом, к которому они присоединены, образуя необязательно замещенный гомопиперидинил.
15. Соединение по любому из пп. 1-6, где  $R^2$  и  $R^3$  объединяются с азотом, к которому они присоединены, образуя необязательно замещенный гомопиперазинил.
16. Соединение по любому из пп. 1-6, где  $R^2$  и  $R^3$  объединяются с азотом, к которому они присоединены, образуя необязательно замещенный азетидинил.
17. Соединение по любому из пп. 1-6, где  $R^4$  представляет собой хлор, метил или трифторметил.
18. Соединение по любому из пп. 1-6, где  $n$  равно 0.
19. Соединение по любому из пп. 1-6, где  $n$  равно 1.
20. Соединение по любому из пп. 1-6, где  $n$  равно 2.
21. Соединение по любому из пп. 1-6, где  $R^5$  представляет собой фтор, хлор,  $C_{1-3}$ алкил,  $C_{1-4}$ фторалкил, циано,  $C_{1-3}$ алкокси или  $C_{1-4}$ фторалкокси.
22. Соединение, представленное в Таблице 1.
23. Фармацевтическая композиция, содержащая соединение по любому из пп. 1-22.