

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)

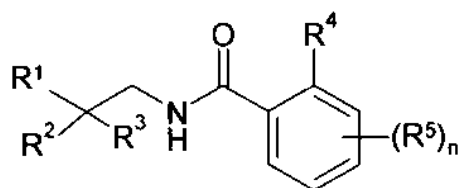
(72) Автор(ы):

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

(54) Бензамиды

(57) Формула изобретения

1. Соединение формулы I



где  $R^1$  представляет собой фенил, пиридил, пиразинил, пиридазинил, пиримидил или 5-членный гетероарил, каждый из которых необязательно замещен одним или несколькими  $C_{1-6}$ алкилами, галогенами, гидроксигруппами,  $C_{1-6}$ гидроксиалкилами,

$C_{1-4}$ фторалкилами,  $C_{3-6}$ циклоалкилами,  $C_{1-4}$ алкокси,  $C_{1-4}$ фторалкокси, циано или  $-SO_2R^8$ ;

где  $R^2$  представляет собой  $C_{3-6}$ циклоалкил,  $C_{3-6}$ циклогетероалкил,  $C_{1-4}$ фторалкил,  $C_{1-4}$ фторалкоксигруппу,  $C_{1-4}$ алкокси,  $C_{1-6}$ алкенил,  $C_{1-6}$ алкинил, 6-членный гетероарил, фенил или  $C_{1-4}$ алкил, необязательно замещенный одним или несколькими  $R^9$ ;

где  $R^3$  представляет собой водород, фтор,  $C_{1-4}$ алкил или  $C_{1-4}$ фторалкил; или

где  $R^2$  и  $R^3$  объединяются с углеродом, к которому они присоединены, образуя

циклогексил, тетрагидропиранил, пиперазинил, пиреридинил, морфолинил, пирролидинил, азетидинил, гомоморфолинил, гомопиперидинил или гомопиперазинил, каждый из которых необязательно замещен одним или несколькими C<sub>1-6</sub>алкилами,

C<sub>1-6</sub>алкенилами, C<sub>3-6</sub>-циклоалкилами, C<sub>1-6</sub>алкокси, оксо, NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup> или фтором;

где R<sup>4</sup> представляет собой галоген, C<sub>1-4</sub>фторалкил, циано, циклопропил,

C<sub>1-4</sub>алкилокси, C<sub>1-4</sub>фторалкилокси, -SO<sub>2</sub>R<sup>8</sup>, -NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup> или C<sub>1-6</sub>алкил;

где R<sup>5</sup> представляет собой галоген, C<sub>1-6</sub>алкил, C<sub>1-4</sub>фторалкил, циано, -SO<sub>2</sub>R<sup>8</sup>, -NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, C<sub>1-6</sub>алкокси, C<sub>1-4</sub>фторалкокси или C<sub>3-6</sub>-циклоалкил;

где R<sup>6</sup> и R<sup>7</sup> независимо друг от друга представляют собой водород или C<sub>1-6</sub>алкил;

где R<sup>8</sup> представляет собой C<sub>1-6</sub>алкил, C<sub>3-6</sub>циклоалкил или C<sub>1-4</sub>фторалкил;

где R<sup>9</sup> представляет собой C<sub>1-6</sub>алкил, C<sub>3-6</sub>циклоалкил, -NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>, C<sub>1-4</sub>фторалкил или 3-7-членный гетероцикл, который необязательно замещен одним или несколькими C<sub>1-6</sub>алкилами, галогенами, гидрокси, C<sub>1-4</sub>фторалкилами, C<sub>3-6</sub>циклоалкилами, C<sub>1-4</sub>алкокси, C<sub>1-4</sub>фторалкокси или циано;

где R<sup>10</sup> и R<sup>11</sup> независимо друг от друга представляют собой водород или C<sub>1-6</sub>алкил; или

где R<sup>10</sup> и R<sup>11</sup> 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<sub>1-6</sub>алкилами, C<sub>1-6</sub>алкокси, оксо, или фтором; и

где n равно 0-3; или его фармацевтически приемлемая соль.

2. Соединение по п. 1, где R<sup>1</sup> представляет собой необязательно замещенный фенил.

3. Соединение по п. 1, где R<sup>1</sup> представляет собой необязательно замещенный пиридил.

4. Соединение по п. 1, где R<sup>1</sup> представляет собой необязательно замещенный пиперазинил.

5. Соединение по п. 1, где R<sup>1</sup> представляет собой необязательно замещенный пиримидил.

6. Соединение по п. 1, где R<sup>1</sup> представляет собой необязательно замещенный 5-членный гетероарил.

7. Соединение по любому из пп. 1-6, где R<sup>2</sup> и R<sup>3</sup> объединяются с азотом, к которому они присоединены, образуя необязательно замещенный пиперазинил.

8. Соединение по любому из пп. 1-6, где R<sup>2</sup> и R<sup>3</sup> объединяются с азотом, к которому они присоединены, образуя необязательно замещенный пиперидинил.

9. Соединение по любому из пп. 1-6, где R<sup>2</sup> и R<sup>3</sup> объединяются с азотом, к которому они присоединены, образуя необязательно замещенный морфолинил.

10. Соединение по любому из пп. 1-6, где R<sup>2</sup> и R<sup>3</sup> объединяются с азотом, к которому они присоединены, образуя необязательно замещенный пирролидинил.

11. Соединение по любому из пп. 1-6, где R<sup>2</sup> и R<sup>3</sup> объединяются с азотом, к которому они присоединены, образуя необязательно замещенный пиррольный фрагмент.

12. Соединение по любому из пп. 1-6, где R<sup>2</sup> и R<sup>3</sup> 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.