

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21)(22) Заявка: 2018114529, 19.09.2016

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
20.09.2015 US 62/221,030;
06.10.2015 US 62/237,699

(43) Дата публикации заявки: 22.10.2019 Бюл. № 30

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 20.04.2018(86) Заявка РСТ:
US 2016/052529 (19.09.2016)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2017/049305 (23.03.2017)Адрес для переписки:
125476, Москва, а/я 21, для Григорьевой А.В.(71) Заявитель(и):
АИР КРОСС, ИНК. (US)(72) Автор(ы):
ДУКЕ Кристофер (US)

A

(54) ОЗОНОЛИЗ ДЛЯ АКТИВАЦИИ СОЕДИНЕНИЙ И ДЕГРАДАЦИИ ОЗОНА

(57) Формула изобретения

1. Неактивное соединение, которое активируют реакцией с озоном, превращая в активное соединение, имеющее карбонильный кислород.

2. Неактивное соединение по п. 1, отличающееся тем, что карбонильный кислород в активном соединении является частью альдегида, кетона, карбоновой кислоты, сложного эфира, амида, енона, ацилгалогенида, имида, ангидрида кислоты, 1,3-дикарбонила, карbamата, карбазида, карбазона, карбоксилата, циклического имида, формиата, фуразона, гидразина, гидроксамата, изоцианата, лактама, лактона, полукарбазона, мочевины, тиокарбамата или дитиокарбамата.

3. Соединение по п. 1, которое является летучим.

4. Соединение по п. 1, которое является нелетучим.

5. Соединение по п. 1, имеющее структуру соединения I

где после реакции с озоном $-R^1$ замещен кислородом с образованием карбонильного кислорода, образуя активное соединение $X=O$,

R U 2018114529 A

R U 2018114529 A

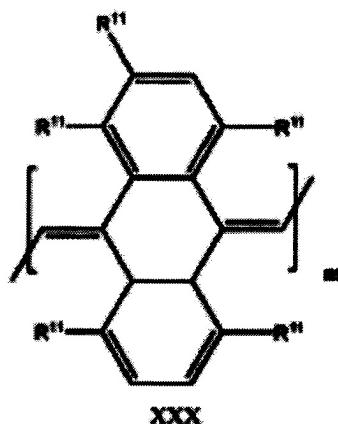
где R¹ представляет собой замещенный или незамещенный алкил, замещенный или незамещенный гетероалкил, замещенный или незамещенный циклоалкил, замещенный или незамещенный гетероциклоалкил, замещенный или незамещенный арил, замещенный или незамещенный гетероарил, замещенный или незамещенный арилалкил или замещенный или незамещенный гетероарилалкил.

6. Соединение по п. 5, где X представляет собой соединение с планарной конформацией, содержащее по меньшей мере три ароматических кольца.

7. Соединение по п. 6, где X представляет собой антрахинон.

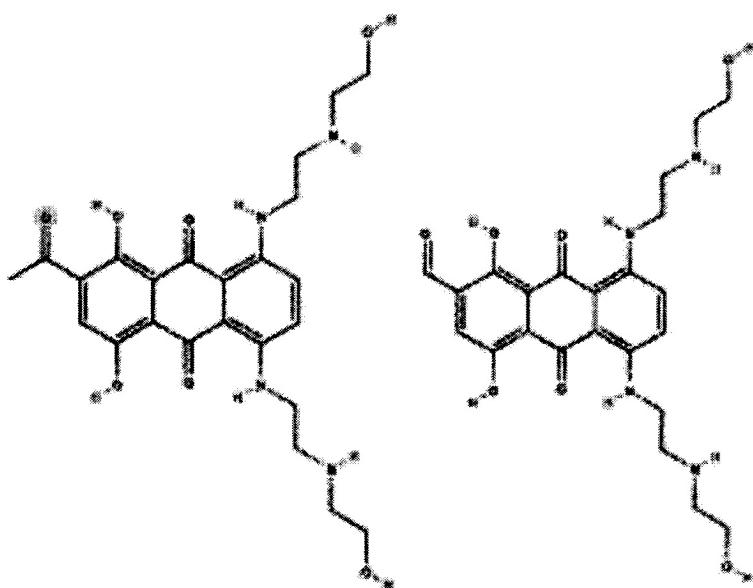
8. Соединение по п. 7, где X представляет собой краситель.

9. Соединение по п. 8, имеющее структуру соединения XXX



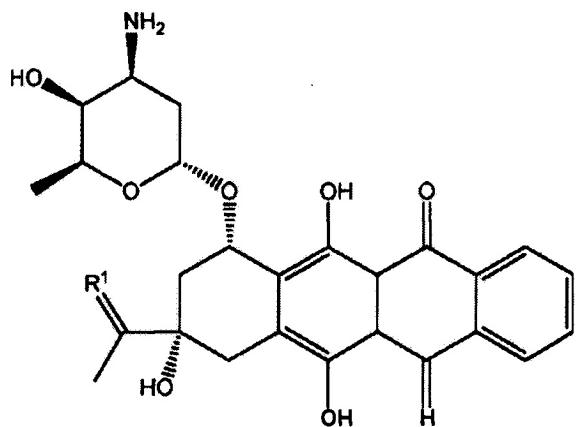
10. Соединение по п. 7, где X является лекарственным средством.

11. Соединение по п. 10, где X представляет собой метилкетон или альдегид митоксантрона, имеющий структуры соединений XXXI или XXXII



12. Соединение по п. 5, где X представляет собой антрациклин.

13. Соединение по п. 12, имеющее структуру соединения XXXIV

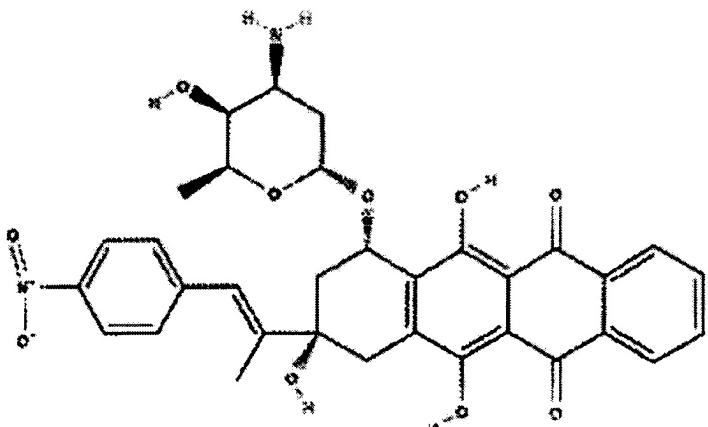


XXXIV.

14. Соединение по п. 13, где R^1 содержит специфический связывающий агент для антигена рака.

15. Соединение по п. 14, где специфический связывающий агент содержит сайт связывания антитела.

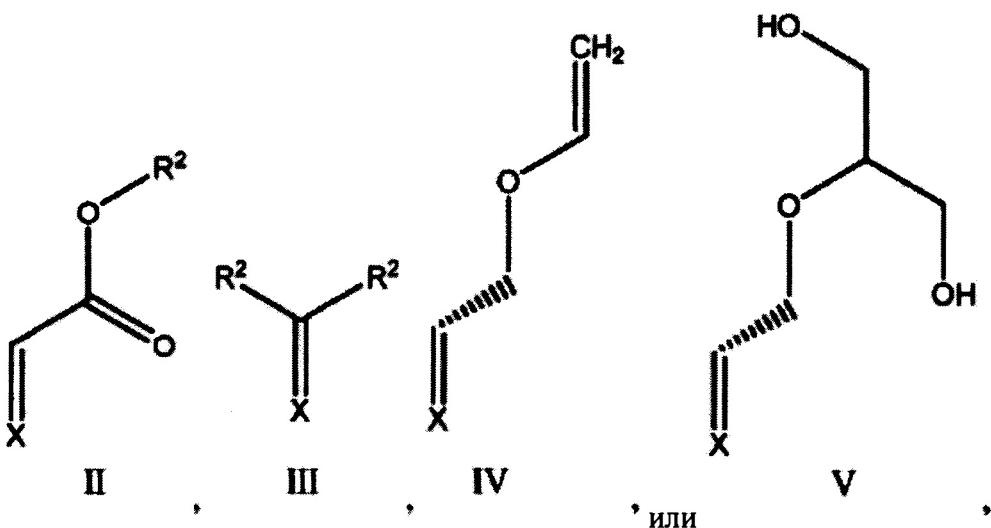
16. Соединение по п. 13, имеющее структуру соединения XXXV



XXXV.

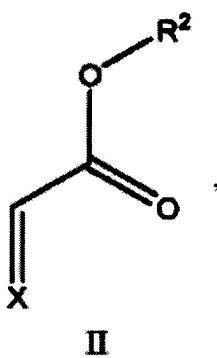
17. Соединение по п. 6, где R^1 представляет собой NR^2 или CR^2 , причем R^2 представляет собой H , замещенный или незамещенный алкил, замещенный или незамещенный гетероалкил, замещенный или незамещенный циклоалкил, замещенный или незамещенный гетероциклоалкил, замещенный или незамещенный арил, замещенный или незамещенный гетероарил, замещенный или незамещенный арилалкил или замещенный или незамещенный гетероарилалкил.

18. Соединение по п. 6, имеющее структуру



где каждый R^2 независимо представляет собой водород, замещенный или незамещенный алкил, замещенный или незамещенный гетероалкил, замещенный или незамещенный циклоалкил, замещенный или незамещенный гетероциклоалкил, замещенный или незамещенный арил, замещенный или незамещенный гетероарил, замещенный или незамещенный арилалкил, или замещенный или незамещенный гетероарилалкил.

19. Соединение по п. 6, имеющее структуру соединения II

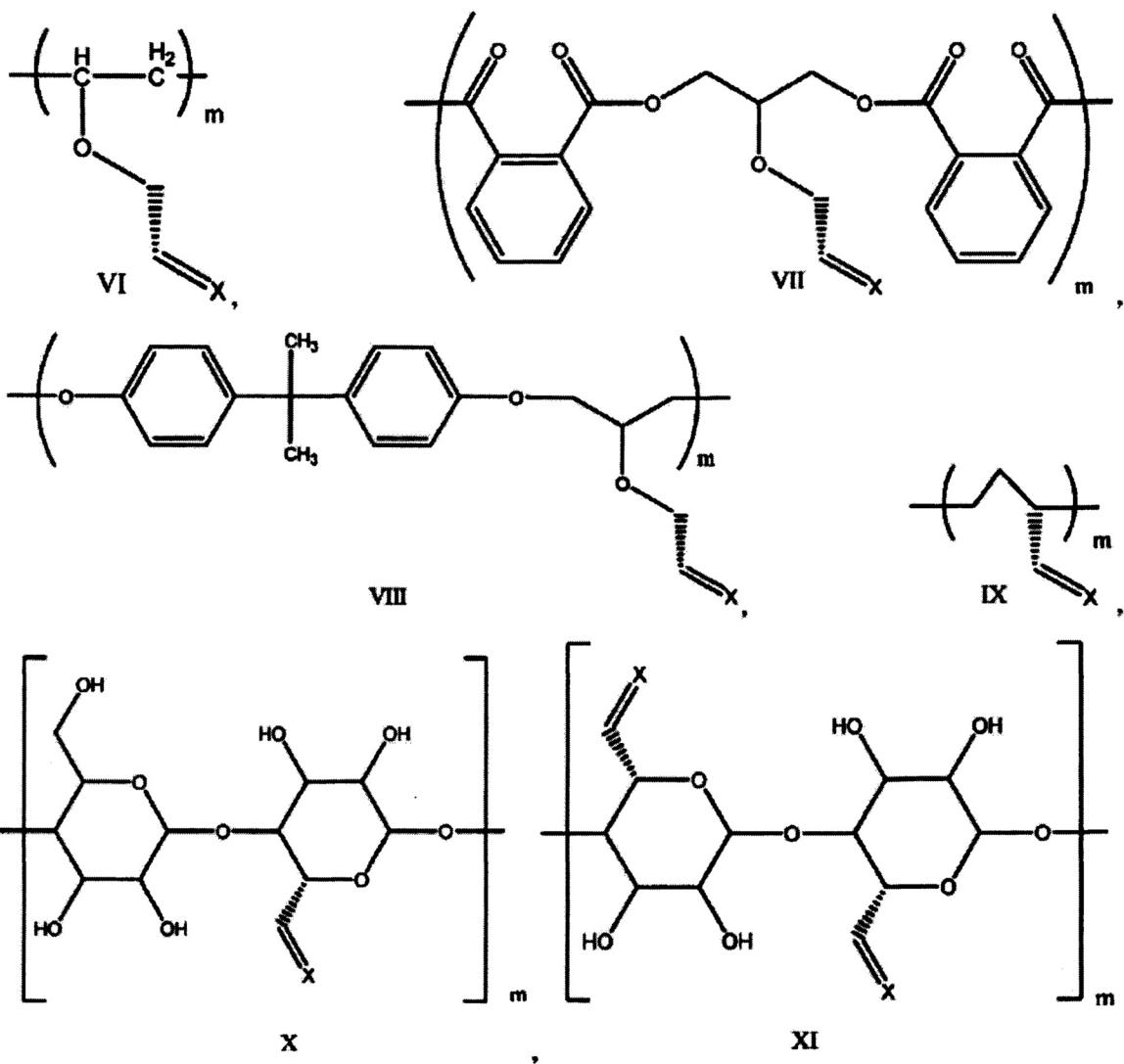


где R^2 представляет собой замещенный или незамещенный алкил, замещенный или незамещенный гетероалкил, замещенный или незамещенный циклоалкил, замещенный или незамещенный гетероциклоалкил, замещенный или незамещенный арил, замещенный или незамещенный гетероарил, замещенный или незамещенный арилалкил или замещенный или незамещенный гетероарилалкил.

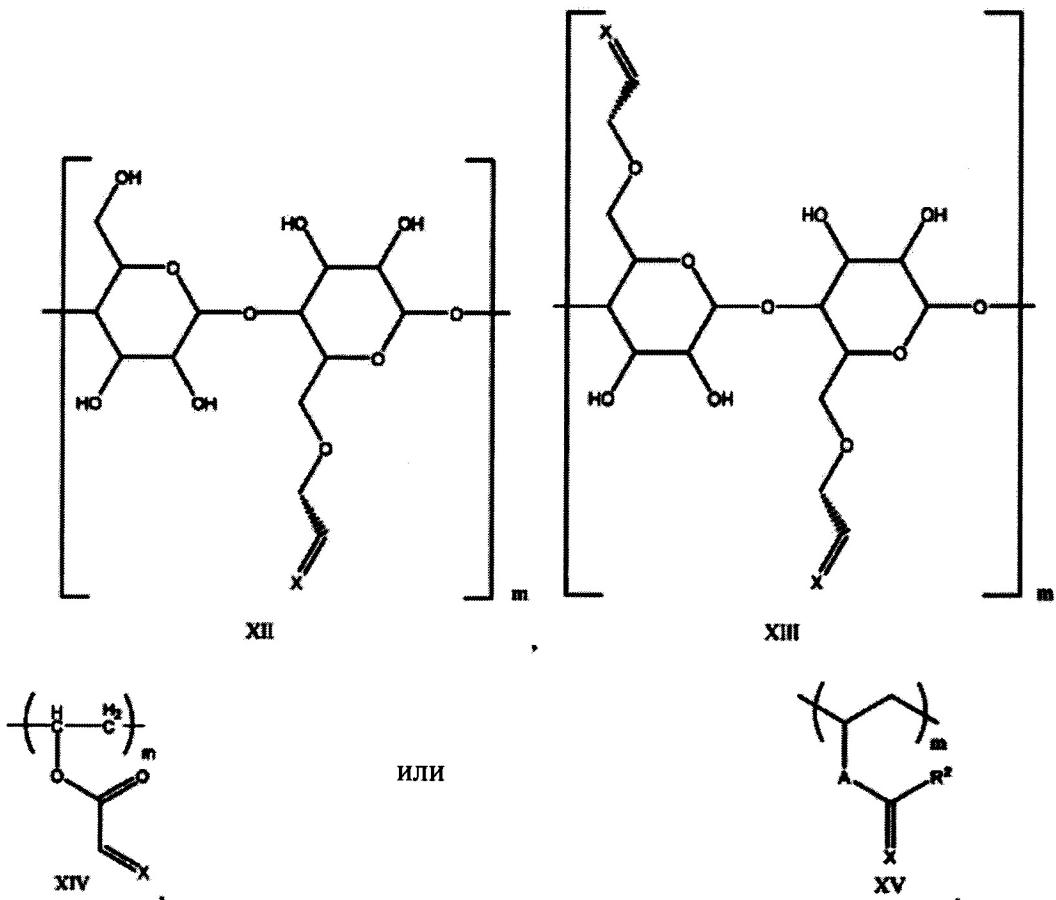
20. Соединение по п. 6, где R^1 содержит олигомерный или полимерный повторяющийся фрагмент, содержащий более, чем один X.

21. Соединение по п. 6, имеющее структуру

R U 2018114529 A



R U 2018114529 A



где m равно целому числу от 2 до 100000000,

А отсутствует или является линкером, выбранным из группы, состоящей из замещенного или незамещенного алкила, замещенного или незамещенного гетероалкила, замещенного или незамещенного циклоалкила, замещенного или незамещенного гетероциклоалкила, замещенного или незамещенного арила, замещенного или незамещенного гетероарила, замещенного или незамещенного арилалкила или замещенного или незамещенного гетероарилалкила и

R^2 независимо представляет собой водород, замещенный или незамещенный алкил, замещенный или незамещенный гетероалкил, замещенный или незамещенный циклоалкил, замещенный или незамещенный гетероциклоалкил, замещенный или незамещенный арил, замещенный или незамещенный гетероарил, замещенный или незамещенный арилалкил или замещенный или незамещенный гетероарилалкил.

22. Соединение по п. 5, где R^1 содержит специфический связывающий агент.

23. Соединение по п. 22, отличающееся тем, что специфический связывающий агент представляет собой сайт связывания антитела.

24. Соединение по п. 1, отличающееся тем, что активное соединение представляет собой биоцид.

25. Соединение по п. 24, отличающееся тем, что биоцид представляет собой пестицид.

26. Соединение по п. 25, отличающееся тем, что пестицид представляет собой фунгицид, гербицид, инсектицид, альгицид, моллюскицид, митицид, репелленты или родентицид.

27. Соединение по п. 24, отличающееся тем, что биоцид является антимикробным агентом.

28. Соединение по п. 27, отличающееся тем, что антимикробным агентом является

бактерицид, антибиотик, антибактериальный, противовирусный, противогрибковый, антипротозойный или противопаразитарный агент.

29. Соединение по п. 27, отличающееся тем, что антимикробный агент применяют в окружающей среде.

30. Соединение по п. 27, отличающееся тем, что антимикробный агент приготавливают для фармацевтического введения.

31. Соединение по п. 1, отличающееся тем, что активное соединение является лекарственным средством.

32. Соединение по п. 31, отличающееся тем, что лекарственное средство пригодно для лечения заболевания или расстройства легких, глаз, кожи, носа, полости рта, кожи головы или ногтей.

33. Соединение по п. 31, отличающееся тем, что лекарственное средство представляет собой олигопептид, полипептид или стероид.

34. Соединение по п. 33, отличающееся тем, что активное соединение представляет собой эстрон, кортизол, кортикостерон, альдостерон, прогестерон, тестостерон или дигидротестостерон.

35. Способ лечения пациента больного раком, включающий введение соединения по п. 24 пациенту в количестве, достаточном для лечения пациента.

36. Способ по п. 35, дополнительно включающий введение озона пациенту.

37. Способ по п. 36, где R¹ представляет собой специфический связывающий агент, который специфически связывается с раком.

38. Способ по п. 37, отличающийся тем, что специфическим связывающим агентом является сайт связывания антитела.

39. Способ активации неактивного соединения по п. 1, включающий воздействие озона на неактивное соединение в течение времени, достаточного для активации соединения.

40. Способ по п. 39, отличающийся тем, что активное соединение представляет собой биоцид.

41. Способ по п. 39, отличающийся тем, что активное соединение является лекарственным средством.

42. Способ по п. 41, отличающийся тем, что неактивное соединение вдыхают или наносят на кожу или другую часть тела, которая подвергается воздействию воздуха.

43. Способ по п. 41, отличающийся тем, что лекарственное средство применяют для лечения заболевания или расстройства легких, а неактивное соединение вдыхают.

44. Способ по п. 41, отличающийся тем, что лекарственное средство применяют для лечения заболевания или расстройства кожи, или раны, причем неактивное соединение наносят на кожу.

45. Способ по п. 41, отличающийся тем, что лекарственное средство является питательным веществом, антибиотиком, противогрибковым средством, противовирусным или противопаразитарным.

46. Способ по п. 41, отличающийся тем, что лекарственное средство применяют для лечения любого заболевания или расстройства, в котором неактивное соединение наносят в области глаза.

47. Способ по п. 40, отличающийся тем, что активное соединение приготавливают для применения в окружающей среде.

48. Способ по п. 47, отличающийся тем, что неактивное соединение приготавливают в виде краски или аэрозоля, или интегрируют в твердый материал или наносят на поверхность твердого материала.

49. Способ лечения заболевания или патологического состояния у субъекта, включающий введение лекарственного соединения по п. 31 субъекту на участок, который

R U 2018114529 A

не подвергают воздействию атмосферного озона.

50. Способ по п. 49, отличающийся тем, что в данном участке присутствует миелопероксидаза.

51. Способ по п. 49, отличающийся тем, что в данном участке присутствует нейтрофил.

52. Способ по п. 49, отличающийся тем, что данный участок является кровотоком субъекта.

53. Способ по п. 49, отличающийся тем, что участок является воспаленным.

54. Способ по п. 49, отличающийся тем, что лекарственное средство является противовоспалительным.

55. Способ по п. 49, отличающийся тем, что лекарственное средство применяют для лечения или профилактики атеросклероза.

56. Способ определения внутреннего озонолиза у субъекта, включающий введение пациенту соединения по п. 5, ожидая время, достаточное для внутреннего озонолиза, с последующим измерением активного соединения X=O.

57. Способ по п. 56, отличающийся тем, что соединение вводят в кровоток субъекта.

58. Способ по п. 56, отличающийся тем, что соединение вводят в ткань.

59. Способ по п. 56, отличающийся тем, что у субъекта подозревают воспаление.

60. Способ по п. 56, отличающийся тем, что активным соединением является ацетон.

61. Соединение с молекулярной массой менее 9000, имеющее двойную связь, которая вступает в реакцию с озоном и образует нетоксичное соединение после введения в реакцию с озоном.

62. Соединение по п. 61, отличающееся тем, что соединение имеет молекулярную массу менее чем 2000.

63. Соединение по п. 61, отличающееся тем, что соединение имеет молекулярную массу менее чем 1000.

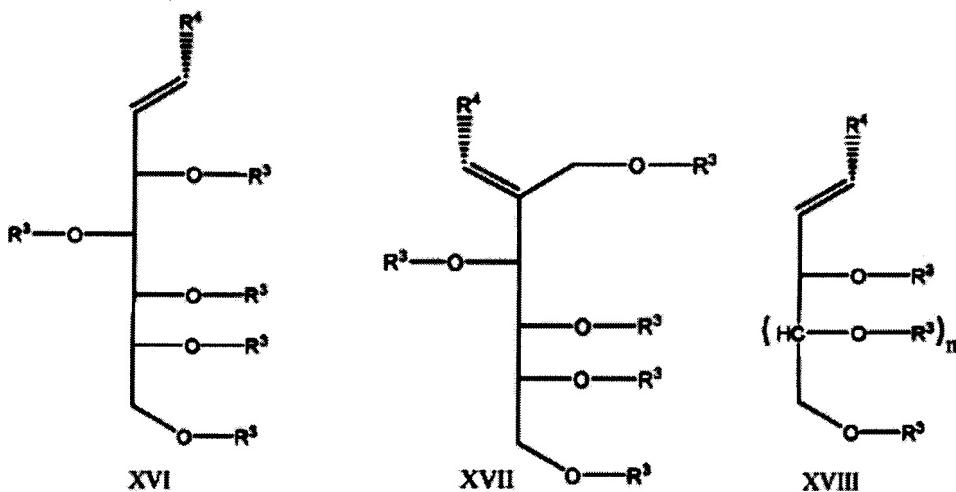
64. Соединение по п. 61, отличающееся тем, что соединение имеет молекулярную массу менее чем 500.

65. Соединение по п. 61, отличающееся тем, что соединение не является олигомером или полимером.

66. Соединение по п. 61, отличающееся тем, что соединение обладает высокой растворимостью в воде.

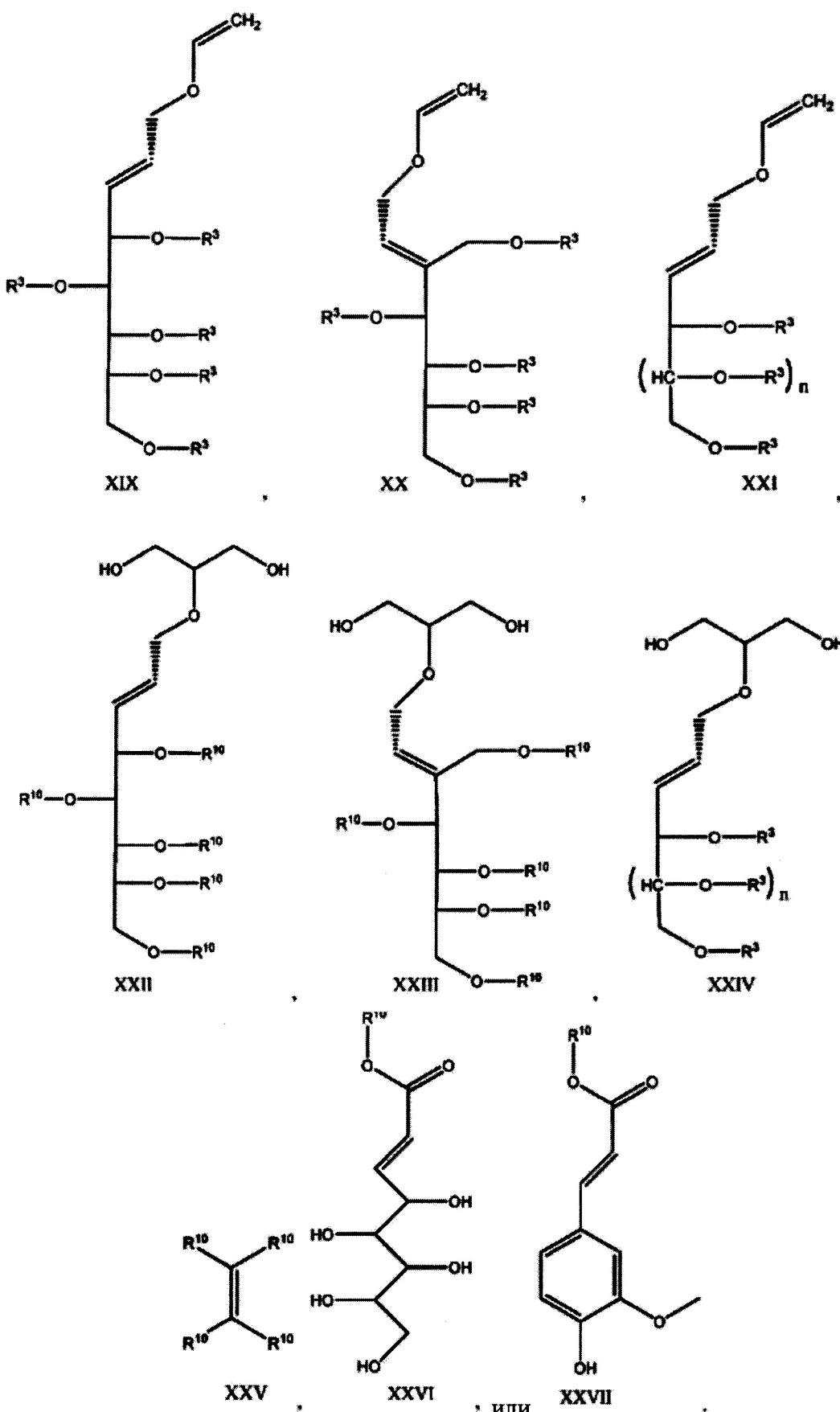
67. Соединение по п. 61, отличающееся тем, что соединение имеет низкую растворимость в воде.

68. Соединение по п. 61, отличающееся тем, что соединение представляет собой



R U 2018114529 A

R U 2018114529 A



или его соль или сольват,

где равно целому числу от 0 до 6,

каждый R^3 и R^4 независимо представляет собой водород, замещенный или незамещенный алкил, замещенный или незамещенный перфторалкил, замещенный или

незамещенный циклоалкил, замещенный или незамещенный гетероциклоалкил, замещенный или незамещенный арил, замещенный или незамещенный гетероарил, замещенный или незамещенный арилалкил, замещенный или незамещенный гетероарилалкил, замещенный или незамещенный - $(\text{CH}_2)_j\text{CN}$, замещенный или незамещенный - $(\text{CH}_2)_j\text{OR}^5$, замещенный или незамещенный - $(\text{CH}_2)_j\text{C(O)R}_5$, замещенный или незамещенный - $(\text{CH}_2)_j\text{OC(O)R}^6$, замещенный или незамещенный - $(\text{CH}_2)_j\text{C(O)OR}^5$, замещенный или незамещенный - $(\text{CH}_2)_j\text{OC(O)OR}^5$, замещенный или незамещенный - $(\text{CH}_2)_j\text{NR}^7\text{R}^8$, замещенный или незамещенный - $(\text{CH}_2)_j\text{C(O)NR}^7\text{R}^8$, замещенный или незамещенный - $(\text{CH}_2)_j\text{OC(O)NR}^7\text{R}^8$, замещенный или незамещенный - $(\text{CH}_2)_j\text{NR}^7\text{C(O)R}^6$, замещенный или незамещенный - $(\text{CH}_2)_j\text{NR}^7\text{C(O)NR}^7\text{R}^8$, замещенный или незамещенный - $(\text{CH}_2)_j\text{S(O)mR}^9$, замещенный или незамещенный - $(\text{CH}_2)_j\text{NR}^6\text{S(O)mR}^9$ или замещенный или незамещенный - $(\text{CH}_2)_j\text{S(O)mNR}^7\text{R}^8$, где каждый j независимо равен целому числу от 0 до 6; каждый m независимо равен целому числу от 0 до 2; каждый n независимо равен целому числу от 0 до 4;

каждый R^4 может дополнительно независимо представлять собой акриловый мономер или полимер, алкильный мономер или полимер, эпокси мономер или полимер, виниловый мономер или полимер или мономер или полимер целлюлозы;

каждый R^5 независимо представляет собой водород или замещенный или незамещенный алкил; каждый R^6 и R^9 независимо представляют собой водород или замещенный или незамещенный алкил;

каждый R^7 и R^8 независимо представляют собой водород, замещенный или незамещенный алкил или R^7 и R^8 вместе с атомом N, к которому они присоединены, образуют 5- или 6-членное гетероциклическое кольцо или 5-членное гетероарильное кольцо; а также

каждый R^{10} независимо представляет собой водород, замещенный или незамещенный алкил, замещенный или незамещенный гетероалкил, замещенный или незамещенный циклоалкил, замещенный или незамещенный гетероциклоалкил, замещенный или незамещенный арил, замещенный или незамещенный гетероарил, замещенный или незамещенный арилалкил или замещенный или незамещенный гетероарилалкил,

где каждая группа R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 и R^9 необязательно независимо замещена 1-3 заместителями, каждый независимо представляет собой алкил, алкенил, алкинил, алкокси, циклоалкил, перфторалкил, амид, амино, алкиламино, карбоксилат, циано, дикарбонильные альдегиды, диалкиламино, галоген, гидроксил, имино, нитро, оксо, сульфид или тиол.

69. Соединение по п. 61, отличающееся тем, что соединение является нелетучим.

70. Соединение по п. 61, отличающееся тем, что соединение представляет собой сахар.

71. Соединение по п. 61, отличающееся тем, что соединение является летучим и оставляет запах.

72. Соединение по п. 61, отличающееся тем, что соединение представляет собой ванилин.

73. Соединение по п. 61, приготовленное в виде краски или спрея, или интегрированное в твердый материал или покрытие на поверхность твердого материала.

74. Способ деградации озона, включающий воздействие озона на соединение по п. 60 в течение времени, достаточного для деградации озона.