



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2015123738, 18.11.2013

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
20.11.2012 US 61/728,373

(43) Дата публикации заявки: 10.01.2017 Бюл. № 01

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 22.06.2015(86) Заявка РСТ:
US 2013/070556 (18.11.2013)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2014/081660 (30.05.2014)

Адрес для переписки:

129090, Москва, ул. Б. Спасская, 25, строение 3,
ООО "Юридическая фирма Городисский и
Партнеры"

(71) Заявитель(и):

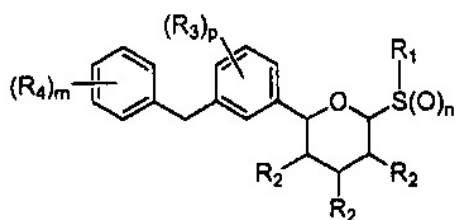
**ЛЕКСИКОН ФАРМАСЬЮТИКАЛЗ,
ИНК. (US)**

(72) Автор(ы):

**КАРСОН Кеннет Гордон (US),
ГУДВИН Николь Кэтлин (US),
ХАРРИСОН Брайс Олден (US),
РОУЛИНС Дэвид Брент (US),
СТРОБЕЛ Эрик (US),
ЗАМБРОВИЧ Брайан (US)**(54) **ИНГИБИТОРЫ КОТРАНСПОРТЕРА НАТРИЙ-ГЛЮКОЗЫ 1**

(57) Формула изобретения

1. Соединение формулы:



или его фармацевтически приемлемая соль, димер или тример, где:

R_1 представляет собой водород или необязательно замещенные C_{1-10} алкил, C_{1-5} циклоалкил или 5-членный гетероцикл, необязательные заместители которых представляют собой один или несколько фрагментов R_{1A} ;

каждый из фрагментов R_{1A} независимо представляет собой amino, сложный эфир, амид, тиол, карбоновую кислоту, циано, галоген, гидроксил или необязательно замещенные C_{1-4} алкокси, C_{1-5} циклоалкил или 5-членный гетероцикл, необязательные заместители которых представляют собой один или несколько фрагментов R_{1B} ; каждый из фрагментов R_{1B} независимо представляет собой C_{1-4} алкил, галоген или гидроксил;

n означает 0, 1 или 2;

каждый из заместителей R_2 независимо представляет собой F или OR_{2A} , где каждый из заместителей R_{2A} независимо представляет собой водород, C_{1-4} алкил или ацил;

каждый из заместителей R_3 независимо представляет собой галоген, гидроксил, или необязательно замещенные C_{1-10} алкил или C_{1-10} алкокси, необязательные заместители которых представляют собой один или несколько фрагментов R_{3A} ;

каждый из фрагментов R_{3A} независимо представляет собой амино, сложный эфир, амид, тиол, карбоновую кислоту, циано, галоген, гидроксил или необязательно замещенные C_{1-4} алкокси, C_{1-5} циклоалкил или 5-членный гетероцикл, необязательными заместителями которых являются один или несколько фрагментов R_{3B} ; каждый из фрагментов R_{3B} независимо представляет собой C_{1-4} алкил, амино, циано, галоген или гидроксил;

r означает 0, 1 или 2;

каждый из заместителей R_4 независимо представляет собой R_{4A} , $-N(R_{4A})(R_{4B})$, $-OR_{4A}$, $-SR_{4A}$, $-S(O)R_{4A}$ или $-S(O)_2R_{4A}$;

R_{4A} представляет собой необязательно замещенные C_{4-20} алкил или 4-20-звенный гетероалкил, необязательными заместителями которых являются один или несколько фрагментов R_{4C} , и которые необязательно соединены с другим фрагментом R_{4A} с образованием димера или тримера;

фрагмент R_{4B} представляет собой водород или R_{4A} ;

каждый из фрагментов R_{4C} независимо представляет собой амино, амидо, азо, карбонил, карбоксил, циано, формил, гуанидино, галоген, гидроксил, имидо, имино, изотиоцианат, нитрил, нитро, нитрозо, нитроксид, оксо, сульфанил, сульфинил, сульфонил, тиал, тиоцианат, тион, тиомочевину, мочевины или X_1 , $X_1-L_1-X_2$ или $X_1-L_1-X_2-L_2-X_3$, где каждый из фрагментов X_1 , X_2 и X_3 независимо представляет собой необязательно замещенные C_{1-4} алкил, C_{1-6} циклоалкил, 5- или 6-членный гетероцикл или арил, необязательные заместители которых представляют собой один или несколько фрагментов R_{4D} , и каждый из фрагментов L_1 и L_2 независимо представляет собой необязательно замещенные C_{1-6} алкил или 1-10-членный гетероалкил, необязательные заместители которых представляют собой один или несколько фрагментов R_{4E} ;

каждый из фрагментов R_{4D} независимо представляет собой R_{4E} или C_{1-6} алкил, необязательно замещенный одним или несколькими фрагментами R_{4E} ;

каждый из фрагментов R_{4E} независимо представляет собой амино, амидо, азо, карбонил, карбоксил, циано, формил, гуанидино, галоген, гидроксил, имидо, имино, изотиоцианат, нитрил, нитро, нитрозо, нитроксид, оксо, сульфанил, сульфинил, сульфонил, тиал, тиоцианат, тион или мочевины; и

m означает 1, 2 или 3.

2. Соединение по п. 1, где R_1 представляет собой необязательно замещенный C_{1-4} алкил.

3. Соединение по п. 1, где n означает 0.

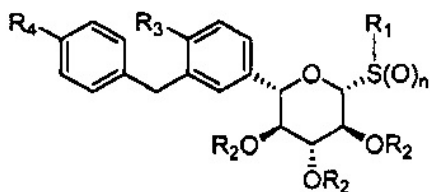
4. Соединение по п. 1, где R_2 означает OR_{2A} .

5. Соединение по п. 4, где как минимум один заместитель R_{2A} представляет собой водород.

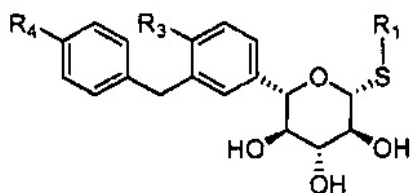
6. Соединение по п. 1, где R_3 означает необязательно замещенный C_{1-4} алкил.

7. Соединение по п. 1, где R_3 означает галоген.

8. Соединение по п. 1, где R_3 означает необязательно замещенную C_{1-4} алкоксигруппу.
 9. Соединение по п. 1, где p означает 1.
 10. Соединение по п. 1, где R_4 означает R_{4A} .
 11. Соединение по п. 1, где R_4 означает $-OR_{4A}$.
 12. Соединение по п. 1, которое соответствует формуле:



13. Соединение по п. 12, которое соответствует формуле:



14. Соединение по п. 13, где R_1 представляет собой C_{1-4} алкил.
 15. Соединение по п. 13, где R_3 представляет собой метил.
 16. Соединение по п. 13, где R_4 представляет собой R_{4A} .
 17. Соединение по п. 13, где R_4 представляет собой $-OR_{4A}$.
 18. Соединение по пп. 16 или 17, где R_{4A} представляет собой:

- C_{1-10} алкил- $N(R_{4C})_2$;
- C_{1-10} алкил- $N(R_{4C})C(O)R_{4C}$;
- C_{1-10} алкил- $C(O)N(R_{4C})_2$;
- C_{1-10} алкил- $C(O)N(R_{4C})-C_{0-6}$ алкил- $C(O)R_{4C}$;
- C_{1-10} алкил- $C(O)N(R_{4C})-C_{0-6}$ алкил- $C(O)N(R_{4C})_2$;
- C_{1-10} алкил- $N(R_{4C})C(O)-C_{0-6}$ алкил- $N(R_{4C})_2$; или
- C_{1-10} алкил- $N(R_{4C})C(O)-C_{0-6}$ алкил- $N(R_{4C})C(O)R_{4C}$.

19. Фармацевтическая композиция, включающая соединение по любому из предшествующих пунктов, а также фармацевтически приемлемый эксципиент или разбавитель.

20. Способ лечения или сдерживания заболевания или расстройства, который включает введение пациенту, которому это

необходимо, терапевтически эффективного количества соединения или композиции по любому из предшествующих пунктов, где упомянутое заболевание или расстройство является сердечно-сосудистым или метаболическим заболеванием или расстройством.