

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2012110007/15, 15.03.2012

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
20.02.2007 US 60/890,641(62) Номер и дата подачи первоначальной заявки,
из которой данная заявка выделена: 2009135080
21.09.2009

(43) Дата публикации заявки: 20.11.2013 Бюл. № 32

Адрес для переписки:

105082, Москва, Спартаковский пер., 2, стр. 1,
секция 1, этаж 3, "ЕВРОМАРКПАТ"

(71) Заявитель(и):

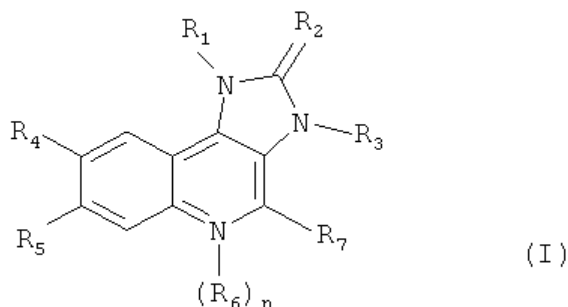
НОВАРТИС АГ (СН)

(72) Автор(ы):

**БРАХМАНН Заскиа Мария (СН),
ФИНАН Питер (US),
ФРИЧ Кристине (FR),
ГАРСИЯ-ЭЧЕВЕРРИЯ Карлос (СН),
МЕРА Совёр-Мишель (FR),
МЕРФИ Леон (US),
НИКЛИН Пол Лесли (GB)**(54) **ИМИДАЗОХИНОЛИНЫ В КАЧЕСТВЕ ДВОЙНЫХ ИНГИБИТОРОВ ЛИПИДКИНАЗЫ И МТОР**

(57) Формула изобретения

1. Применение соединения формулы I,



в котором

R_1 обозначает нафтил или фенил, где указанный фенил замещен одним или двумя заместителями, независимо выбранными из группы, включающей галоген,

(низш.)алкил, незамещенный или замещенный галогеном, цианогруппой, имидазолилом или триазолилом,

обозначает циклоалкил, аминогруппу, замещенную одним или двумя заместителями, независимо выбранными из группы, включающей (низш.)алкил, (низш.)алкилсульфонил, (низш.)алкоксигруппу и (низш.)алкокси(низш.)алкиламиногруппу,

обозначает пиперазинил, незамещенный или замещенный одним или двумя заместителями, независимо выбранными из группы, включающей (низш.)алкил и (низш.)алкилсульфонил,

обозначает 2-оксопирролидинил, (низш.)алкокси(низш.)алкил, имидазолил, пиразолил

и триазилил,

R₂ обозначает O или S,

R₃ обозначает (низш.)алкил,

R₄ обозначает пиридил, незамещенный или замещенный галогеном, цианогруппой, (низш.)алкилом, (низш.)алкоксигруппой или пиперазинилом, незамещенным или замещенным (низш.)алкилом, обозначает пиридинил, незамещенный или замещенный (низш.)алкоксигруппой, обозначает хинолинил, незамещенный или замещенный галогеном, обозначает хиноксалинил или фенил, замещенный алкоксигруппой,

R₅ обозначает водород или галоген,

n равно 0 или 1,

R₆ обозначает оксидо. при условии, что если n равно 1, то атом N, содержащийся в радикале R₆, заряжен положительно,

R₇ обозначает водород или аминогруппу,

или его таутомера, или фармацевтически приемлемой соли. или его гидрата или сольвата для получения фармацевтического препарата, предназначенного для лечения заболеваний, зависимых от киназы mTOR.

2. Применение по п.1, где соединением формулы I является 2-метил-2-[4-(3-метил-2-оксо-8-хинолин-3-ил-2,3-дигидроимидазо[4,5-с]хинолин-1-ил)фенил]пропионитрил.

3. Применение по п.1, где соединением формулы I является 8-(6-метоксипиридин-3-ил)-3-метил-1-(4-пиперазин-1-ил-3-трифторметилфенил)-1,3-дигидроимидазо[4,5-с]хинолин-2-он.

4. Применение по одному из п.п.1-3, где заболеванием, предназначенным для лечения, является

- отторжение трансплантата органа или ткани, например, для лечения реципиентов, например, после трансплантации сердца, легкого, сердца-легкого, печени, почки, поджелудочной железы, кожи или роговицы, болезни трансплантат-против-хозяина, например после трансплантации костного мозга,

- рестеноз,
- туберозный склероз,
- лимфангиолейомиоматоз,
- пигментный ретинит,
- аутоиммунные заболевания, включая энцефаломиелит, инсулинзависимый сахарный диабет, волчанку, дерматомиозиты, артрит и ревматоидные заболевания,
- устойчивый к стероидам острый лимфобластный лейкоз,
- фиброзные заболевания, включая склеродерму, легочный фиброз, почечный фиброз, кистозный фиброз,

- легочная гипертензия,
- иммуномодуляция,
- рассеянный склероз,
- синдром Гиппеля-Линдау,
- синдром Карни,
- семейный аденоматозный полипоз,
- синдром юношеского полипоза,
- синдром Бирт-Хогг-Дюка,
- семейная гипертрофическая кардиомиопатия,
- синдром Вольфа-Паркинсона-Уайта,
- нейродегенеративные заболевания, такие как болезнь Паркинсона, болезнь

Гентингтона, болезнь Альцгеймера и деменции, вызванные тау-мутациями, спинально-церебеллярная атаксия типа 3, боковой амиотрофический склероз, вызванный мутациями

SOD1, неврональный цероид-липофусциноз/болезнь Баттена (нейродегенеративное заболевание у детей),

- влажная и сухая дегенерация желтого пятна,
 - истощение мышечной ткани (атрофия, кахексия) и миопатии, такие как болезнь Данона,
 - бактериальные и вирусные инфекции, включая милиарный туберкулез, стрептококк группы А, вирус простого герпеса типа I, ВИЧ-инфекция,
 - нейрофиброматоз, включая нейрофиброматоз типа 1,
 - синдром Пейтца-Егерса,
- или любые их комбинации.

5. Способ лечения заболевания, зависящего от киназы mTOR, включающий введение терапевтически эффективного количества соединения формулы I по одному из п.п.1-3 теплокровному животному, нуждающемуся в таком лечении.

6. Способ по п.5, в котором заболеванием, предназначенным для лечения, является заболевание по п.4.

7. Фармацевтический препарат для лечения заболевания, зависящего от киназы mTOR, включающий соединение формулы I по любому из п.п.1-3 или его фармацевтически приемлемую соль и фармацевтически приемлемый носитель.

8. Фармацевтический препарат по п.7, где заболеванием, предназначенным для лечения, является заболевание по п.4.

9. Применение соединения формулы I по любому из п.п.1-3 или его фармацевтически приемлемой соли для лечения заболевания, зависящего от киназы mTOR.

10. Применение по п.9, в котором заболеванием, предназначенным для лечения, является заболевание по п.4.

RU 20121121010007 A

RU 201211210007 A