

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21)(22) Заявка: 2016124136, 17.08.2011

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
18.08.2010 US 61/374,687;
29.12.2010 US 61/427,974(62) Номер и дата подачи первоначальной заявки,
из которой данная заявка выделена:
2013111835 15.03.2013(43) Дата публикации заявки: 03.12.2018 Бюл. №
34Адрес для переписки:
129090, Москва, ул. Б.Спасская, 25, строение 3,
ООО "Юридическая фирма Городисский и
Партнеры"(71) Заявитель(и):
СЭМЬЮМЕД, ЭлЭлСи (US)(72) Автор(ы):
КС Сунил Кумар (US),
УОЛЛЭЙС Дэвид Марк (US),
ХУД Джон (US),
БАРРОГА Шарлин Ф. (US)

A

2016124136

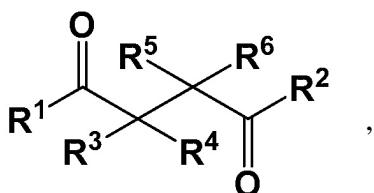
RU

R U 2 0 1 6 1 2 4 1 3 6 A

(54) ДИКЕТОНЫ И ГИДРОКСИКЕТОНЫ В КАЧЕСТВЕ АКТИВАТОРА СИГНАЛЬНОГО ПУТИ
КАТЕНИНА

(57) Формула изобретения

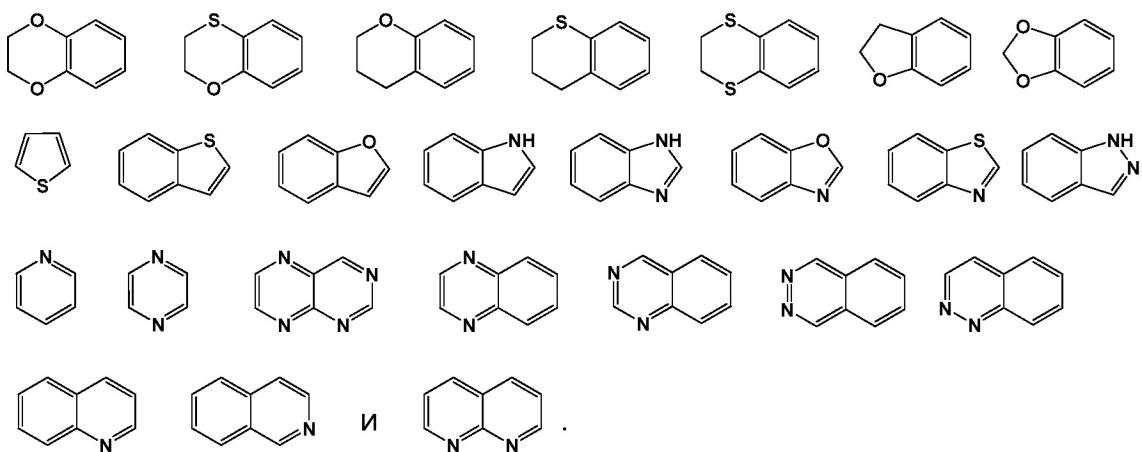
1. Соединение или его фармацевтически приемлемая соль или пролекарство, имеющее структуру формулы I:



I

где R¹ выбирают из группы, состоящей из замещенного или незамещенного гетероарила и замещенного или незамещенного гетероциклила, при условии, что углеродный атом присоединен к карбонилу;R² выбирают из группы, состоящей из замещенного или незамещенного арила, замещенного или незамещенного гетероарила, замещенного или незамещенного карбоциклила и замещенного или незамещенного гетероциклила, при условии, что углеродный атом присоединен к карбонилу; иR³, R⁴, R⁵ и R⁶ независимо выбирают из группы, состоящей из H, -C₁₋₉алкила, -C₁₋₉алкиларила и -C₁₋₉алкилгетероарила.

2. Соединение по п.1, где R¹ выбирают из группы, состоящей из

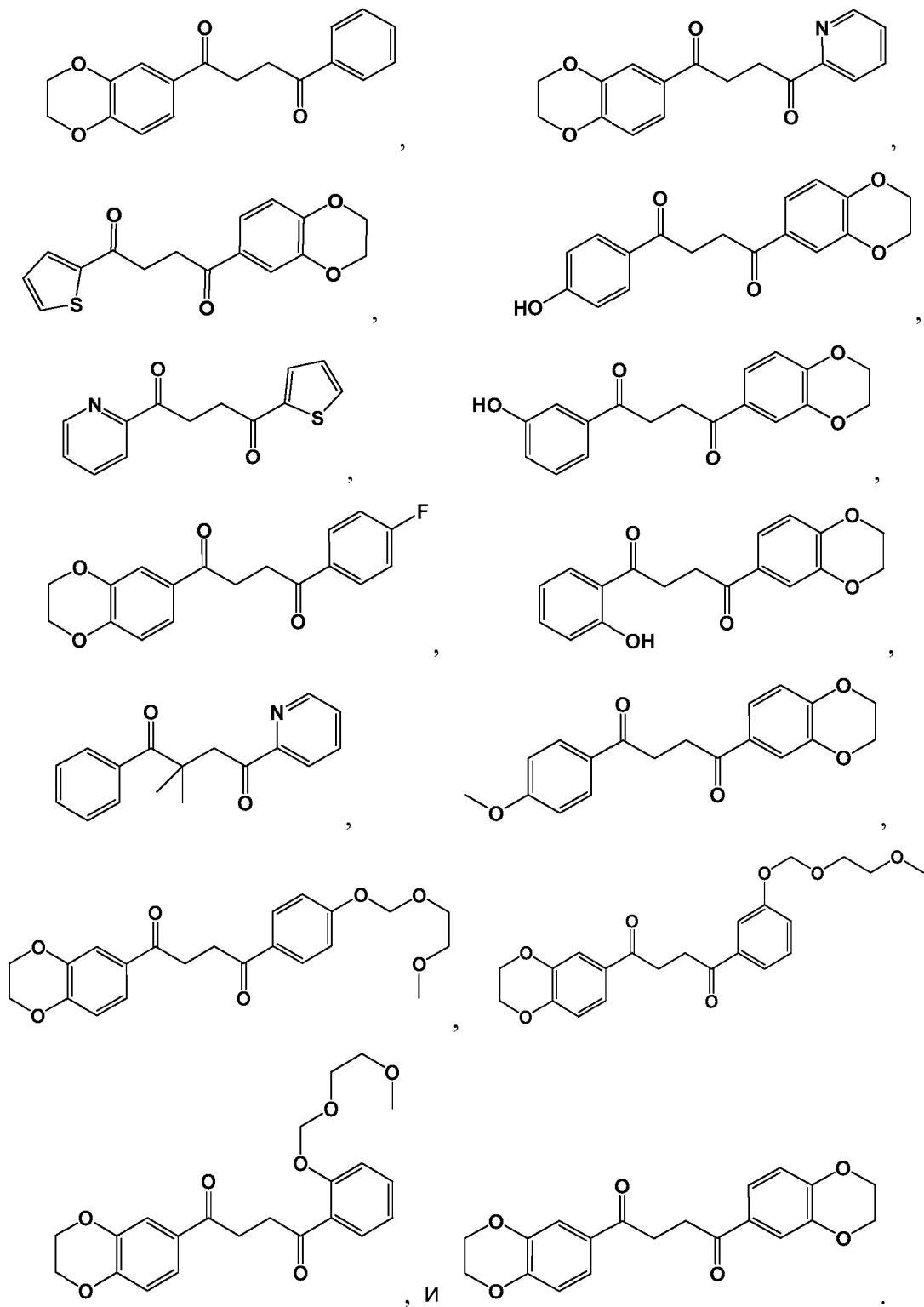


3. Соединение по п.1, где R² выбирают из группы, состоящей из замещенного или

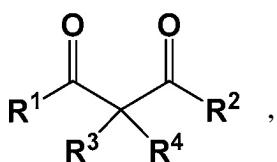
незамещенного арила, и .

4. Соединение по п.1, где R³, R⁴, R⁵ и R⁶ представляют собой H.

5. Соединение по п.1, имеющее структуру, выбранную из группы, состоящей из:



6. Соединение или его фармацевтически приемлемая соль или пролекарство, имеющее структуру формулы II:



II

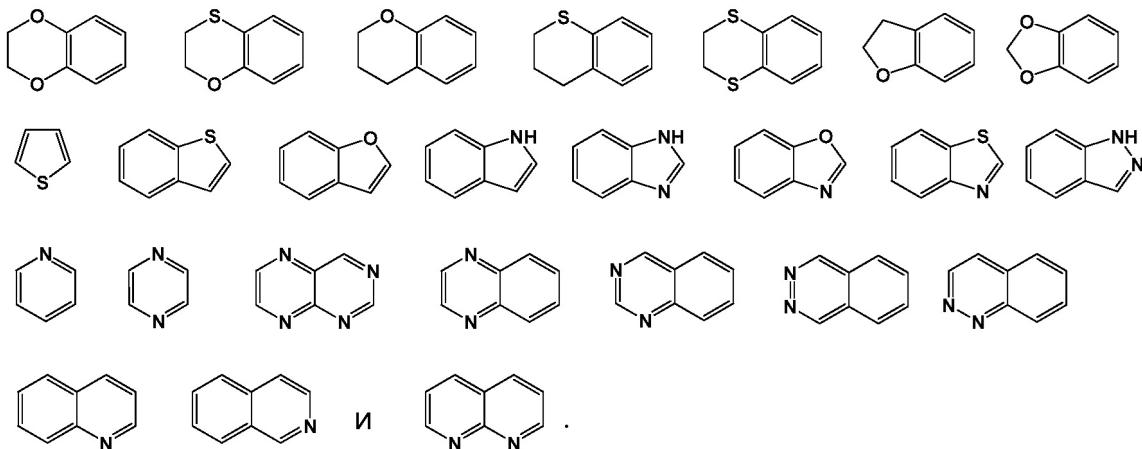
где R^1 выбирают из группы, состоящей из замещенного или незамещенного гетероарила и замещенного или незамещенного гетероциклила, при условии, что

углеродный атом присоединен к карбонилу;

R^2 выбирают из группы, состоящей из замещенного или незамещенного арила, замещенного или незамещенного гетероарила, замещенного или незамещенного карбоциклила и замещенного или незамещенного гетероциклила, при условии, что углеродный атом присоединен к карбонилу; и

R^3 и R^4 независимо выбирают из группы, состоящей из H, - C_{1-9} алкила, - C_{1-9} алкиларила и - C_{1-9} алкилгетероарила.

7. Соединение по п.6, где R^1 выбирают из группы, состоящей из

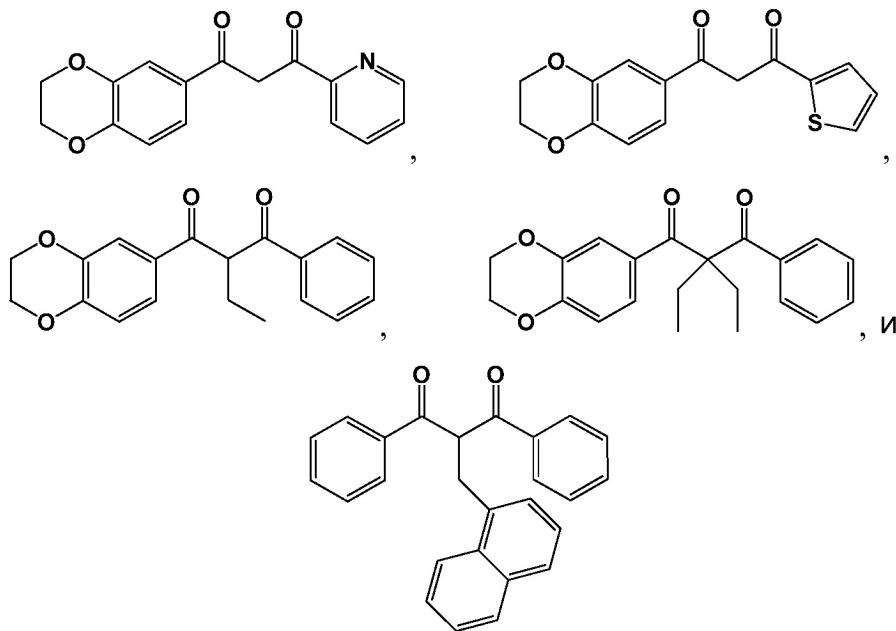


8. Соединение по п.6, где R^2 выбирают из группы, состоящей из замещенного или

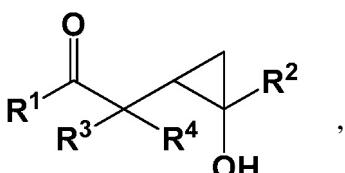
незамещенного арила, и .

9. Соединение по п.6, где R^3 и R^4 представляют собой H.

10. Соединение по п.6, имеющее структуру, выбранную из группы, состоящей из:



11. Соединение или его фармацевтически приемлемая соль или пролекарство, имеющее структуру формулы III

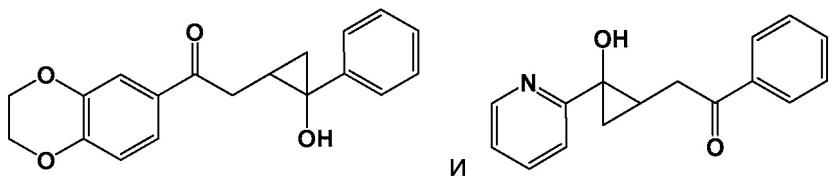


где R¹ выбирают из группы, состоящей из замещенного или незамещенного арила, замещенного или незамещенного гетероарила, замещенного или незамещенного карбоциклила и замещенного или незамещенного гетероциклила, при условии, что углеродный атом присоединен к карбонилу;

R² выбирают из группы, состоящей из замещенного или незамещенного арила, замещенного или незамещенного гетероарила, замещенного или незамещенного карбоциклила и замещенного или незамещенного гетероциклила, при условии, что углеродный атом присоединен к карбонилу; и

R³ и R⁴ независимо выбирают из группы, состоящей из H, -C₁₋₉алкила, -C₁₋₉алкиларила и -C₁₋₉алкилгетероарила.

12. Соединение по п.11, имеющее структуру, выбранную из группы, состоящей из:



13. Фармацевтическая композиция, включающая терапевтически эффективное количество соединения по любому одному из пп.1, 6 или 11, или его фармацевтически приемлемой соли, и фармацевтически приемлемое вспомогательное вещество.

14. Фармацевтическая композиция по п.13, где композиция может применяться в качестве вводимого лекарственного средства в покрытие, высвобождающее лекарственное средство, для медицинского устройства.

15. Способ активации передачи сигнала Wnt с целью лечения расстройства или заболевания у пациента, где способ включает введение пациенту терапевтически эффективного количества соединения по любому одному из пп.1, 6 или 11, или его фармацевтически приемлемой соли.

16. Способ по п.15, где расстройство или заболевание представляет собой нейродегенеративное заболевание.

17. Способ по п.16, где нейродегенеративное заболевание представляет собой болезнь Паркинсона, удары, ишемическое церебральное заболевание, эпилепсию, болезнь Альцгеймера, депрессивное состояние, биполярное расстройство или шизофрению.

18. Способ по п.15, где расстройство или заболевание представляет собой глазное заболевание.

19. Способ по п.18, где глазное заболевание представляет собой возрастную макулярную дегенерацию, диабетический макулярный отек, наследственную эксудативную витреоретинопатию или пигментный ретинит.

20. Способ по п.15, где расстройство или заболевание относится к дифференцировке и росту стволовых клеток, такое как выпадение волос, заболевания, относящиеся к гемопоэзу, заболевания, относящиеся к регенерации тканей, и другие заболевания, связанные с нарушениями развития, дифференцировки стволовых клеток и пролиферации клеток.

21. Способ по п.15, где расстройство или заболевание представляет собой остеопороз, остеоартропатию, несовершенный остеогенез, дефекты костей, переломы костей, пародонтоз, отосклероз, заживление раны, черепно-лицевые дефекты и онкологическое заболевание костей.

22. Способ по п.15, где пациентом является человек.

23. Способ по п.15, где соединение активирует один или более белков в сигнальном пути Wnt.

24. Способ по п.23, где соединение активирует передачу сигнала, индуцируемую одним или более Wnt белками.

25. Способ по п.24, где Wnt белки выбирают из: WNT1, WNT2, WNT2B, WNT3, WNT3A, WNT4, WNT5A, WNT5B, WNT6, WNT7A, WNT7B, WNT8A, WNT8B, WNT9A, WNT9B, WNT10A, WNT10B, WNT11 и WNT16.

26. Покрытие, высвобождающее лекарственное средство, включающее соединение по пп.1, 6, или 11, или его фармацевтически приемлемую соль.

27. Медицинское устройство, включающее соединение по пп.1, 6, или 11, или его фармацевтически приемлемую соль.

28. Имплантат, губка, полимер, или гелеобразная композиция, применяемые для *in vivo* использования, включающие соединение по пп.1, 6, или 11, или его фармацевтически приемлемую соль.