



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2012109220/04, 17.09.2010

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
18.09.2009 US 61/243.549

(43) Дата публикации заявки: 27.10.2013 Бюл. № 30

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 18.04.2012(86) Заявка РСТ:
US 2010/049199 (17.09.2010)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2011/035077 (24.03.2011)Адрес для переписки:
123007, Москва, а/я 104, патентному поверенному
Соколову А.Б.

(71) Заявитель(и):

ВУ Зхэнжжуи (US)

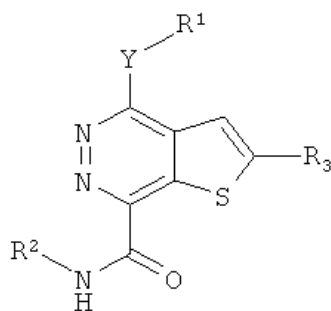
(72) Автор(ы):

ВУ Зхэнжжуи (US)

(54) **НОВЫЕ СОЕДИНЕНИЯ И ИХ ТЕРАПЕВТИЧЕСКОЕ ИСПОЛЬЗОВАНИЕ ДЛЯ
ИНГИБИРОВАНИЯ ПРОТЕИНКИНАЗЫ**

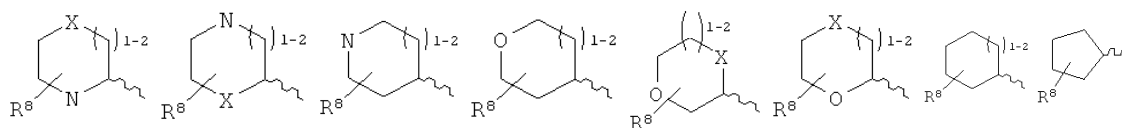
(57) Формула изобретения

1. Соединение формулы I:



(I)

где Y = NH, O, или S,

R¹ = выбран из следующих групп:

из группы, состоящей из алкилов (C_1-C_8), циклоалкилов (C_3-C_8), арилов, гетероариллов; $-OR^{19}$; $-SR^{19}$; $-NR^{19}R^{20}$; $-S(O)R^{19}$; $-S(O)_2R^{19}$; $-S(O)_2NR^{19}R^{20}$; $-C(O)NR^{19}R^{20}$; $-N(R^{19})C(O)R^{20}$; $-N(R^{19})S(O)_2R^{20}$; $-N(R^{19})C(O)N(R^{20}R^{21})$; $N(R^{19})C(O)OR^{20}$; арила с или без замещения, гетероарила с или без замещения, ариалкила с или без замещения, гетероциклила с или без замещения, гететероциклилалкила с или без замещения; алкенила с или без замещения, и алкинил с или без замещения;

где R^{19} , R^{20} , и R^{21} независимо выбраны из H, алкила (C_1-C_8), циклоалкилов (C_3-C_8), арила с или без замещения, алкиларила с или без замещения, гетероарила с или без замещения,

или R^{16} , R^{17} , и R^{21} могут быть частью сплавного кольца, содержащего 0-3 гетероатома, выбранных из N, O, и S.

2. Соединение по п.1, где $Y=N$.

3. Соединение по п.1, где $Y=S$.

4. Соединение по п.1, где $Y=O$.

5. Соединение по п.1, выбранное из группы, включающей:

2-(4-фторфенил)-4-(3-пиперидинамино)-тиено[2,3-d]пиридазин-7-карбоновая кислота амид

2-(4-хлорфенил)-4-(3-пиперидинамино)-тиено[2,3-d]пиридазин-7-карбоновая кислота амид

2-(4-бромфенил)-4-(3-пиперидинамино)-тиено[2,3-d]пиридазин-7-карбоновая кислота амид

2-(4-фторфенил)-4-(3-тетрагидропирани-амино)-тиено[2,3-d]пиридазин-7-карбоновая кислота амид

2-(4-хлорфенил)-4-(3-тетрагидропирани-амино)-тиено[2,3-d]пиридазин-7-карбоновая кислота амид

2-(4-бромфенил)-4-(3-тетрагидропирани-амино)-тиено[2,3-d]пиридазин-7-карбоновая кислота амид

2-(4-фторфенил)-4-(3-тетрагидротиапирани-амино)-тиено[2,3-d]пиридазин-7-карбоновая кислота амид

2-(4-хлорфенил)-4-(3-тетрагидротиапирани-амино)-тиено[2,3-d]пиридазин-7-карбоновая кислота амид

2-(4-бромфенил)-4-(3-тетрагидротиапирани-амино)-тиено[2,3-d]пиридазин-7-карбоновая кислота амид

2-(4-хлорфенил)-4-(2-пиперидин-амино)-тиено[2,3-d]пиридазин-7-карбоновая кислота амид

2-(4-хлорфенил)-4-(2-пиперидин-амино)-тиено[2,3-d]пиридазин-7-карбоновая кислота амид

2-(4-хлорфенил)-4-(S-3-пиперидин-амино)-тиено[2,3-d]пиридазин-7-карбоновая кислота амид

2-(4-хлорфенил)-4-(R-3-пиперидин-амино)-тиено[2,3-d]пиридазин-7-карбоновая кислота амид

2-(4-хлорфенил)-4-(3-пиперидин-амино)-тиено[2,3-d]пиридазин-7-N-метил-карбоновая кислота амид

2-(4-хлорфенил)-4-(3-пиперидин-амино)-тиено[2,3-d]пиридазин-7-N,N-диметил-карбоновая кислота амид

2-(4-хлорфенил)-4-(3-тетрагидротиапирани-амино)-тиено[2,3-d]пиридазин-7-N-метил-карбоновая кислота амид

2-(4-хлорфенил)-4-(3-тетрагидротиапирани-амино)-тиено[2,3-d]пиридазин-7-N,N-

RU 2012109220 A

RU 2012109220 A

2012109220

A

A

A

A

A

A

A

A

A

A

A

A

A

A

A

A

A

A

A

A

A

A

A

RU 2012109220 A

RU 2012109220 A

2-(4-фторфенил)-4-(3- α -тиапиран-амино)-тиено[2,3-*d*]пиридазин-7-карбоновая кислота

2-(4-хлорфенил)-4-(3- α -тиапиран-амино)-тиено[2,3-d]пиридазин-7-карбоновая кислота

2-(4-бромфенил)-4-(3- α -тиапиран-амино)-тиено[2,3-d]пиридазин-7-карбоновая кислота

ИИД

ИД

ИИД

ИД

ИД

кислота амид

рбоновая кислота амид

кислота амид

рбоновая кислота амид

кислота амид

кислота амид

МИД

ИИД

ИД

ИД

ИД

9 (1.5)	1	> 4 (2.1)		[2.2.17]	7	5
---------	---	-----------	--	----------	---	---

ИИД

ИИД

ИИД

ИД

МИД

2-(4-хлорфенил)-4-(3-5-пиррол-амино)-гисно[2,5-с]пиридазин-7-карбоновая кислота

RU 2012109220 A

RU 2012109220 A

A

кислота амид

кислота амид

кислота амид

кислота амид

кислота амид

кислота амид

амид

амид

амид

кислота амид

кислота амид

кислота амид

кислота амид

кислота амид

карбоновая кислота амид

амид

амил

кислота амид

кислота амид

кислота амид

карбоновая кислота амид

карбоновая кислота амид

диметил-карбоновая кислота амид

Стр.: 6

RU 2012109220 A

RU 2012109220 A

2012109220

A

A

A

A

A

A

A

A

A

A

A

A

A

A

A

A

A

A

A

A

A

A

A

A

2-(3-хлорфенил)-4-(R-3-пиррол-амино)-тиено[2,3-d]пиридазин-7-карбоновая кислота

RU 2012109220 A

амид

2-(3-хлорфенил)-4-(3-пиррол-амино)-тиено[2,3-d]пиридазин-7-N-метил-карбоновая кислота амид

2-(3-хлорфенил)-4-(3-пиррол-амино)-тиено[2,3-d]пиридазин-7-N,N-диметил-карбоновая кислота амид

2-(3-хлорфенил)-4-(3-тиено-амино)-тиено[2,3-d]пиридазин-7-N-метил-карбоновая кислота амид

2-(3-хлорфенил)-4-(3-тиено-амино)-тиено[2,3-d]пиридазин-7-N,N-диметил-карбоновая кислота амид

2-(3-хлорфенил)-4-(3-фуран-амино)-тиено[2,3-d]пиридазин-7-N-метил-карбоновая кислота амид, и

2-(3-хлорфенил)-4-(3-фуран-амино)-тиено[2,3-d]пиридазин-7-N,N-диметил-карбоновая кислота амид.

6. Фармацевтическая композиция, включающая терапевтически эффективное количество соединения по п.1 и фармацевтически приемлемый наполнитель.

7. Метод лечения рака, включающий введение пациенту, нуждающемуся в лечении, терапевтически эффективного количества фармацевтической композиции по п.5.

RU 2012109220 A

RU 2012109220 A