

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

(21)(22) Заявка: 2012112943/04, 07.09.2010

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
04.09.2009 US 61/240,014

(43) Дата публикации заявки: 10.10.2013 Бюл. № 28

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 04.04.2012(86) Заявка РСТ:
US 2010/048006 (07.09.2010)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2011/029099 (10.03.2011)Адрес для переписки:
129090, Москва, ул. Б. Спасская, 25, стр.3, ООО
"Юридическая фирма Городиский и Партнеры"

(71) Заявитель(и):

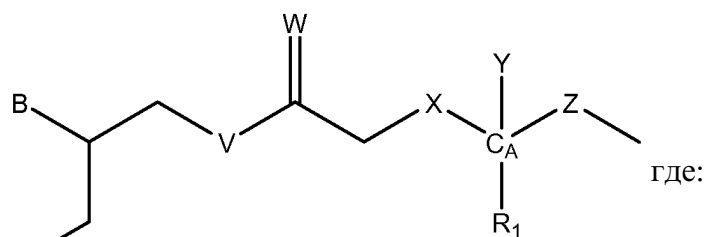
**ЮНАЙТЕД ПАРАГОН ЭССОУШИЭЙТС
ИНК. (СА)**

(72) Автор(ы):

**БЭН Жераль (СА),
САДАВУА Жоэль (СА),
ЧЭНЬ Хао (US),
ШЭНЬ Сяюй (US)**(54) **СОЕДИНЕНИЯ ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ РАССТРОЙСТВА ИЛИ ЗАБОЛЕВАНИЯ, СВЯЗАННОГО С
АКТИВНОСТЬЮ НЕЙРОКИНИНОВОГО 2 РЕЦЕПТОРА**

(57) Формула изобретения

1. Соединение, представленное следующей структурной формулой:



где:

(1)

А и В независимо представляют собой -ОН или -SH,

V и W независимо представляют собой кислород или серу, и, по меньшей мере, один
из V и W представляет собой кислород,R₁ представляет собой -(CH₂)_pCH₃ или представляет собой -H, и

p равен целому числу от 0 до 3, и:

X представляет собой -(CH₂)_m-,

Y представляет собой -H,

Z представляет собой -(CH₂)_n-,

m и n являются целыми числами,

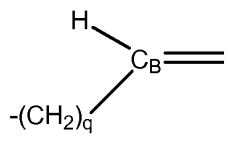
m=1-5,

n=4-14,

$6 \leq m+n \leq 14$ для всех m и n, и

где необязательно имеется до двух двойных углерод-углеродных связей, каждая из которых образована между соседними метиленовыми группами формулы (1), при этом, если имеются две указанные двойные связи, к каждому атому углерода присоединен, по меньшей мере, один атом водорода;

или X представляет собой



Y отсутствует, и C_A и C_B вместе образуют двойную связь,

Z представляет собой $-(CH_2)_r-$,

q и r являются целыми числами,

q=0-4,

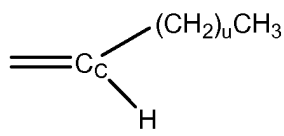
r=1-13,

$5 \leq q+r \leq 13$ для всех q и r, и

где необязательно имеется вторая двойная связь, образованная между соседними метиленовыми группами формулы (1), в которой к каждому атому углерода присоединен, по меньшей мере, один атом водорода;

или X представляет собой $-(CH_2)_r-$,

Z представляет собой



Y отсутствует, и C_A и C_C вместе образуют двойную связь,

R_1 представляет собой $-(CH_2)_uCH_3$ или представляет собой -H,

t и u являются целыми числами,

t=1-5,

u=0-12,

$5 \leq t+u \leq 13$ для всех t и u, и

где необязательно имеется вторая двойная связь, образованная между соседними метиленовыми группами формулы (1), в которой к каждому атому углерода присоединен, по меньшей мере, один атом водорода;

включая фармацевтически приемлемую соль соединения.

2. Соединение по п.1, где оба A и B представляют собой -ОН.

3. Соединение по п.1 или 2, где оба V и W представляют собой кислород.

4. Соединение по п.1, где R_1 представляет собой $-(CH_2)_pCH_3$.

5. Соединение по п.1, где p равен от 0 до 2.

6. Соединение по п.1, где r равен 0 или 1.

7. Соединение по п.1, где p равен 0.

8. Соединение по п.1, где n=2-12 и $7 \leq m+n \leq 13$.

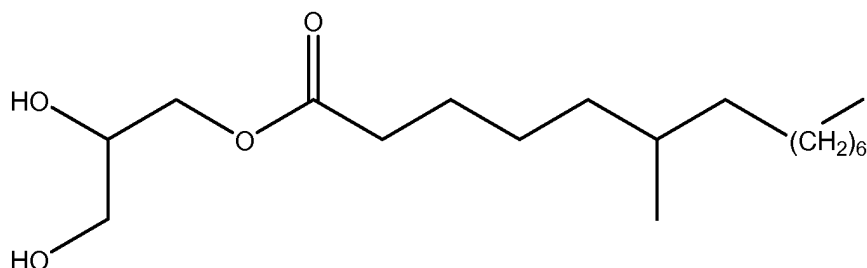
9. Соединение по п.1, где n=3-11 и $8 \leq m+n \leq 12$.

10. Соединение по п.1, где n=4-10 и $9 \leq m+n \leq 11$.

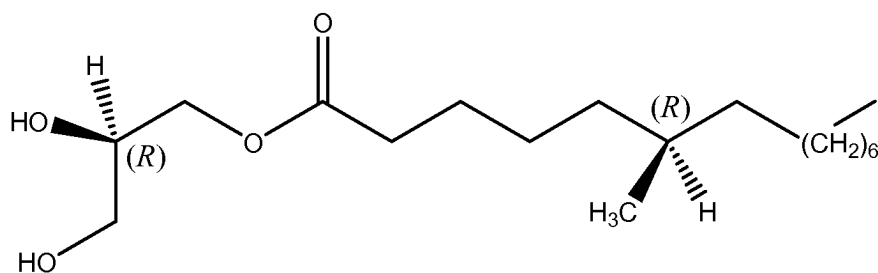
11. Соединение по п.1, где n=5-9 и m+n=10.

12. Соединение по п.1, где m=2-4.

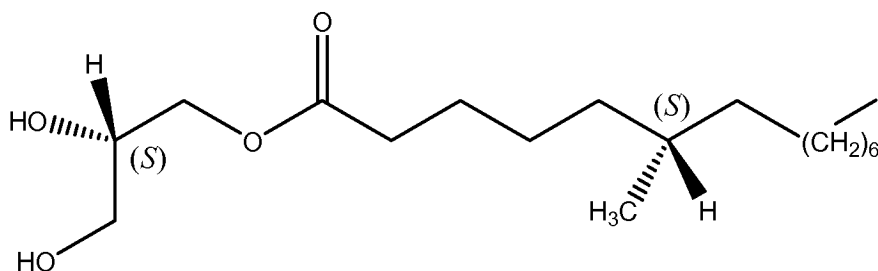
13. Соединение по п.1, где $m=3$.
14. Соединение по п.1, где $r=2-12$ и $6 \leq q+r \leq 12$.
15. Соединение по п.1, где $r=3-11$ и $7 \leq q+r \leq 11$.
16. Соединение по п.1, где $r=4-10$ и $8 \leq q+r \leq 10$.
17. Соединение по п.1, где $r=5-9$ и $q+r=9$.
18. Соединение по п.1, где $q=1-3$.
19. Соединение по п.1, где $q=2$.
20. Соединение по п.1, где $u=1-11$ и $6 \leq t+u \leq 12$.
21. Соединение по п.1, где $u=2-10$ и $7 \leq t+u \leq 11$.
22. Соединение по п.1, где $u=3-9$ и $8 \leq t+u \leq 10$.
23. Соединение по п.1, где $u=4-8$ и $t+u=9$.
24. Соединение по п.1, где $t=2-4$.
25. Соединение по п.1, где $t=3$.
26. Соединение по п.1, где, если имеются указанные выше до двух двойных связей углерод-углерод, тогда каждая указанная связь образована между метиленовыми группами Z.
27. Соединение по п.26, где указанные выше до двух двойных связей углерод-углерод представляют собой одну такую связь.
28. Соединение по п.1, где, если имеется указанная вторая двойная связь, тогда указанная связь образована между метиленовыми группами Z.
29. Соединение по п.1, где указанные выше до двух двойных связей углерод-углерод и указанная вторая двойная связь отсутствуют.
30. Соединение по п.1, имеющее следующую формулу:



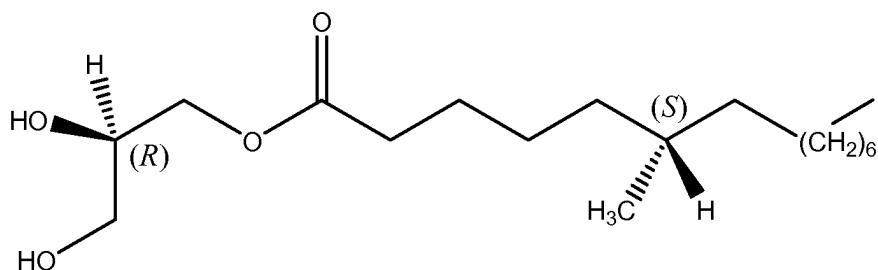
31. По существу, стереохимически чистое соединение по п.1, имеющее формулу:



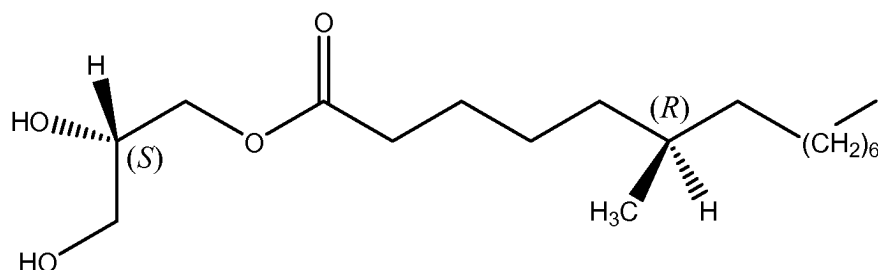
32. По существу, стереохимически чистое соединение по п.1, имеющее формулу:



33. По существу, стереохимически чистое соединение по п.1, имеющее формулу:



34. По существу, стереохимически чистое соединение по п.1, имеющее формулу:



35. Фармацевтическая композиция, содержащая соединение по п.1 и фармацевтически приемлемый носитель.

36. Дозированная форма, содержащая соединение по п.1.

37. Способ лечения расстройства или заболевания, связанного с активностью нейрокининового 2 (NK₂) рецептора, где указанный способ включает стадию введения терапевтически эффективного количества соединения или его фармацевтически приемлемой соли по п.1 субъекту, нуждающемуся в этом.

38. Способ по п.37, где каждый А и В представляет собой -ОН, V и W представляют собой кислород, R₁ представляет собой Н, Х представляет собой -(CH₂)_m-, Z представляет собой -(CH₂)_n-, m равен 3, n равен 7, и соединение не содержит двойной связи C=C.

39. Способ по п.38, где указанным расстройством или заболеванием, связанным с активностью указанного NK₂-рецептора, является депрессивное расстройство настроения, тревожное расстройство, синдром раздраженного кишечника, воспалительная болезнь кишечника, воспалительное заболевание дыхательных путей или недержание мочи.

40. Способ по п.37, где соединение входит в состав фармацевтического препарата, содержащего фармацевтически приемлемый носитель.

41. Способ лечения заболевания или синдрома, связанного с депрессивным расстройством настроения, где указанный способ включает стадию введения терапевтически эффективного количества соединения или его фармацевтически приемлемой соли по п.1 субъекту, нуждающемуся в этом.

42. Способ по п.41, где каждый А и В представляет собой -ОН, V и W представляют собой кислород, R₁ представляет собой Н, Х представляет собой -(CH₂)_m-, Z представляет собой -(CH₂)_n-, m равен 3, n равен 7, и соединение не содержит двойной связи C=C.

43. Способ по п.41, где заболеванием или синдромом является расстройство мозга или нервной системы, тревожное расстройство, сексуальное расстройство, наркотическая зависимость и токсикомания, пищевое расстройство или гормональное расстройство.

44. Способ лечения заболевания или состояния, поддающегося лечению с помощью антидепрессанта, где указанный способ включает стадию введения терапевтически эффективного количества соединения или его фармацевтически приемлемой соли по п.1 субъекту, нуждающемуся в этом.

45. Способ по п.44, где каждый А и В представляет собой -ОН, V и W представляют

собой кислород, R_1 представляет собой Н, Х представляет собой $-(CH_2)_m-$, Z представляет собой $-(CH_2)_n-$, m равен 3, n равен 7, и соединение не содержит двойной связи $C=C$.

46. Способ модулирования активности NK_2 -рецептора, включающий контактирование NK_2 -рецептора с эффективным количеством соединения или его фармацевтически приемлемой соли по п.1.

47. Способ по п.46, где каждый А и В представляет собой -ОН, V и W представляют собой кислород, R_1 представляет собой Н, Х представляет собой $-(CH_2)_m-$, Z представляет собой $-(CH_2)_n-$, m равен 3, n равен 7, и соединение не содержит двойной связи $C=C$.

RU 2012112103 A

RU 2012112943 A