

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21)(22) Заявка: 2017141561, 29.04.2016

Приоритет(ы):

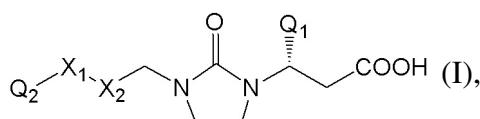
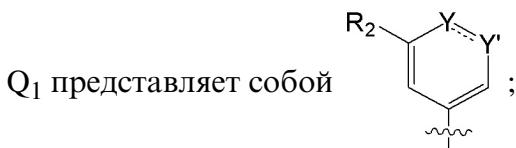
(30) Конвенционный приоритет:
30.04.2015 US 62/154,894

(43) Дата публикации заявки: 31.05.2019 Бюл. № 16

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 30.11.2017(86) Заявка РСТ:
US 2016/029962 (29.04.2016)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2016/176532 (03.11.2016)Адрес для переписки:
129090, Москва, ул. Б.Спасская, 25, строение 3,
ООО "Юридическая фирма Городисский и
Партнеры"(71) Заявитель(и):
САЙФЛУОР ЛАЙФ САЙЕНСИЗ, ИНК.
(US)(72) Автор(ы):
АСКЬЮ, Бен С. (US),
ЭДВАРДС, Д. Скотт (US)(54) ПРОИЗВОДНЫЕ ТЕТРАГИДРОАФИРИДИНИЛПРОПИОНОВОЙ КИСЛОТЫ И ИХ
ПРИМЕНЕНИЕ

(57) Формула изобретения

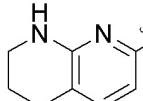
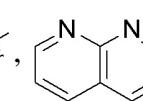
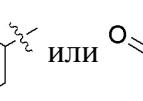
1. Применение соединения формулы I:

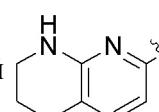
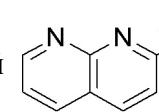
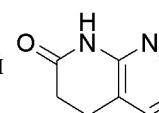
или его фармацевтически приемлемой соли или сольвата в лечении или профилактике
фиброза у субъекта, где:X₁-X₂ представляет собой CHR₁-CH₂, CH=CH или C(O)-CH₂;R₁ представляет собой H или OH;Y=Y' представляет собой CR₃=N, CR₄=CR₄ или C(O)-NH;R₃ представляет собой C₁-C₃ алcoxи, F, или R₃ вместе с R₂ и атомами углерода, к
которым они присоединены, образуют фенильное кольцо;A
2017141561 A

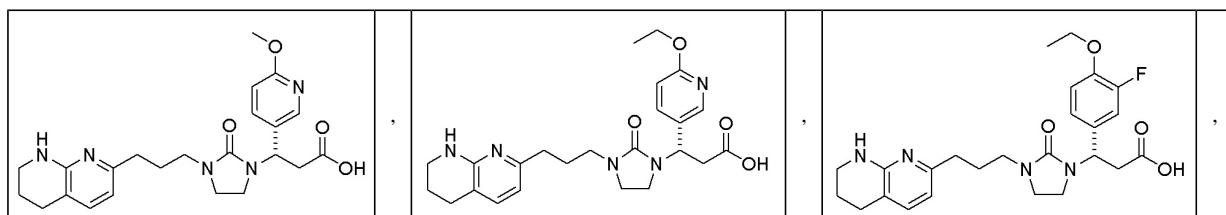
RU 2017141561 A

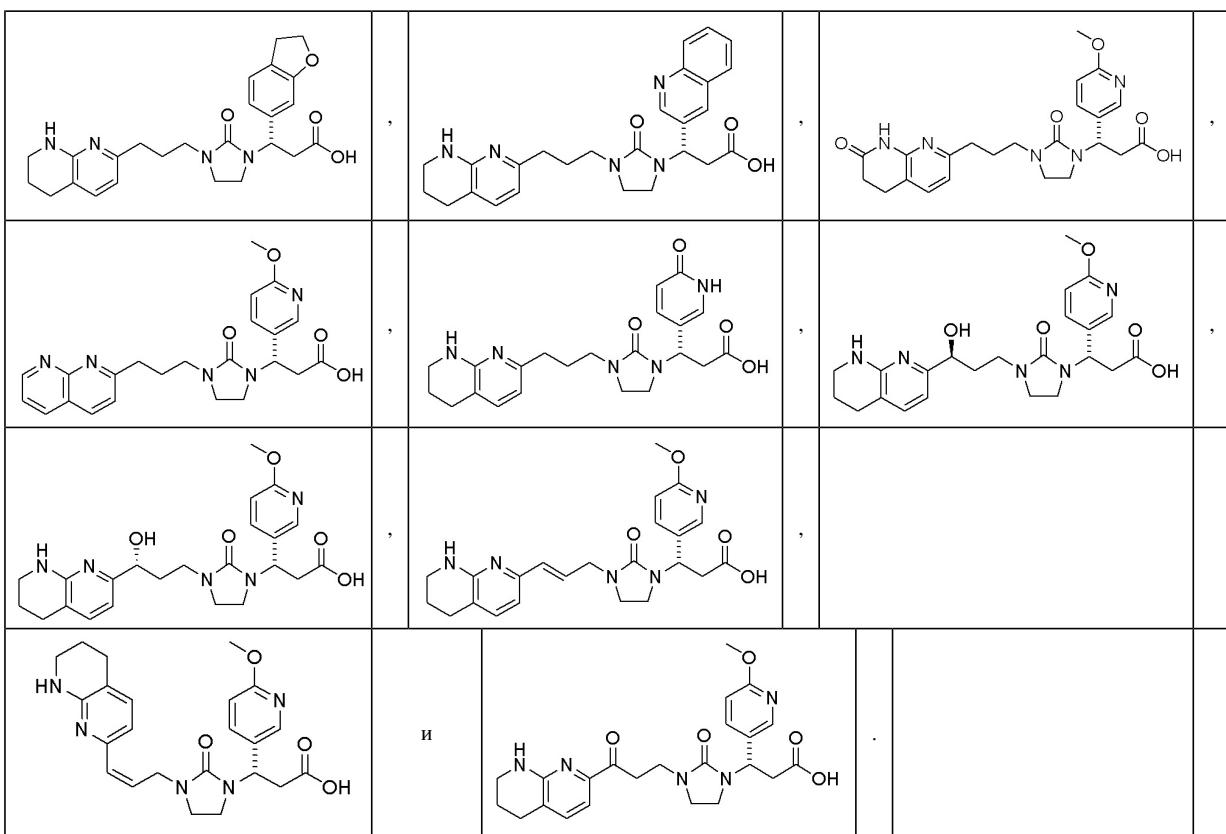
каждый R₄ независимо представляет собой C₁-C₃ алcoxи, F, или два R₄ вместе с атомами углерода, к которым они присоединены, образуют 5- или 6-членное гетероциклическое кольцо, содержащее один или два гетероатома, выбранных из N и O;

R₂ представляет собой H, или вместе с R₃ и атомами углерода, к которым они присоединены, образуют фенильное кольцо; и

Q₂ представляет собой  ,  или .

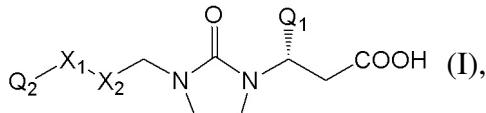
2. Применение по п.1, где X₁-X₂ представляет собой CHR₁-CH₂.
3. Применение по п.2, где R₁ представляет собой H.
4. Применение по п.2, где R₁ представляет собой OH.
5. Применение по п.1, где X₁-X₂ представляет собой CH=CH.
6. Применение по п.1, где X₁-X₂ представляет собой C(O)-CH₂.
7. Применение по п.1, где Y=Y' представляет собой CR₃=N.
8. Применение по п.7, где R₃ представляет собой метокси, этокси или пропокси.
9. Применение по п.7, где R₃ вместе с R₂ и атомами углерода, к которым они присоединены, образуют фенильное кольцо.
10. Применение по п.1, где Y=Y' представляет собой CR₄=CR₄.
11. Применение по п.10, где один из R₄ представляет собой метокси, этокси или пропокси.
12. Применение по п.10, где два R₄ вместе с атомами углерода, к которым они присоединены, образуют 5- или 6-членное гетероциклическое кольцо, содержащее один или два гетероатома, выбранных из N и O.
13. Применение по п.1, где Y=Y' представляет собой C(O)-NH.
14. Применение по п.1, где Q₂ представляет собой .
15. Применение по п.1, где Q₂ представляет собой .
16. Применение по п.1, где Q₂ представляет собой .
17. Применение по п.1, где соединение выбрано из:





18. Применение по п.1, где фиброз представляет собой фиброз печени, легочный фиброз, фиброз сердца или фиброз сердца.

19. Применение соединения формулы I:



или его фармацевтически приемлемой соли или сольватата в лечении или профилактике фиброза у субъекта, где:

X_1-X_2 представляет собой CHR_1-CH_2 , $\text{CH}=\text{CH}$ или $\text{C}(\text{O})-\text{CH}_2$;

R_1 представляет собой Н или ОН;

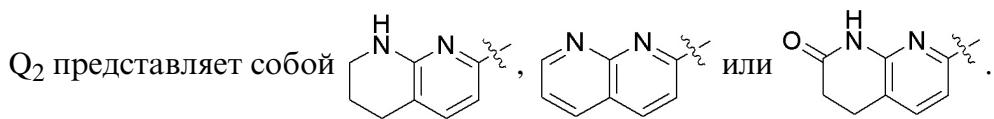


$\text{Y}=\text{Y}'$ представляет собой $\text{CR}_3=\text{N}$, $\text{CR}_4=\text{CR}_4$ или $\text{C}(\text{O})-\text{NH}$;

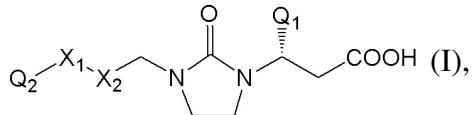
R_3 представляет собой C_1 - C_3 алcoxи, F, или R_3 вместе с R_2 и атомами углерода, к которым они присоединены, образуют фенильное кольцо;

каждый R_4 независимо представляет собой C_1 - C_3 алкокси, F, или два R_4 вместе с атомами углерода, к которым они присоединены, образуют 5- или 6-членное гетероциклическое кольцо, содержащее один или два гетероатома, выбранных из N и O;

R_2 представляет собой Н, или вместе с R_3 и атомами углерода, к которым они присоединены, образуют фенильное кольцо; и



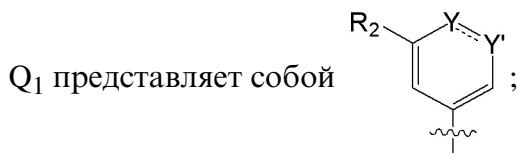
20. Способ лечения или профилактики фиброза, включающий введение субъекту, нуждающемуся в этом, терапевтически эффективного количества соединения формулы I:



или его фармацевтически приемлемой соли или сольваты, где:

X₁-X₂ представляет собой CHR₁-CH₂, CH=CH или C(O)-CH₂;

R₁ представляет собой H или OH;



Y=Y' представляет собой CR₃=N, CR₄=CR₄ или C(O)-NH;

R₃ представляет собой C₁-C₃ аллокси, F, или R₃ вместе с R₂ и атомами углерода, к которым они присоединены, образуют фенильное кольцо;

каждый R₄ независимо представляет собой C₁-C₃ аллокси, F, или два R₄ вместе с атомами углерода, к которым они присоединены, образуют 5- или 6-членное гетероциклическое кольцо, содержащее один или два гетероатома, выбранных из N и O;

R₂ представляет собой H, или вместе с R₃ и атомами углерода, к которым они присоединены, образуют фенильное кольцо; и

