

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 Городиский и  
Партнеры"

(71) Заявитель(и):

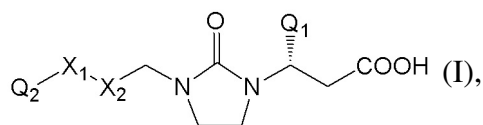
**САЙФЛУОР ЛАЙФ САЙЕНСИЗ, ИНК.**  
(US)

(72) Автор(ы):

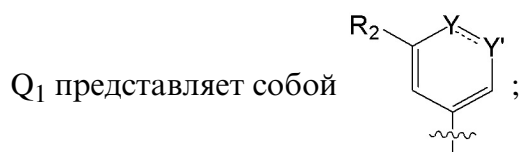
**АСКЬЮ, Бен С. (US),**  
**ЭДВАРДС, Д. Скотт (US)**(54) **ПРОИЗВОДНЫЕ ТЕТРАГИДРОНАФИРИДИНИЛПРОПИОНОВОЙ КИСЛОТЫ И ИХ ПРИМЕНЕНИЕ**

## (57) Формула изобретения

## 1. Применение соединения формулы I:

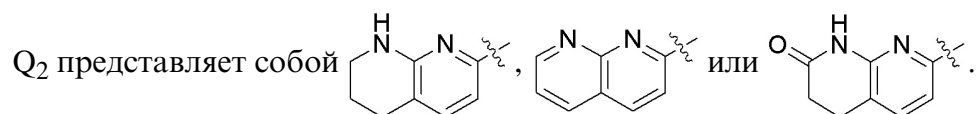


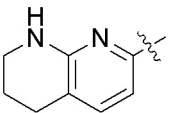
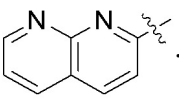
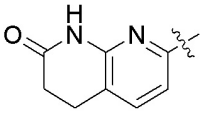
или его фармацевтически приемлемой соли или сольвата в лечении или профилактике фиброза у субъекта, где:

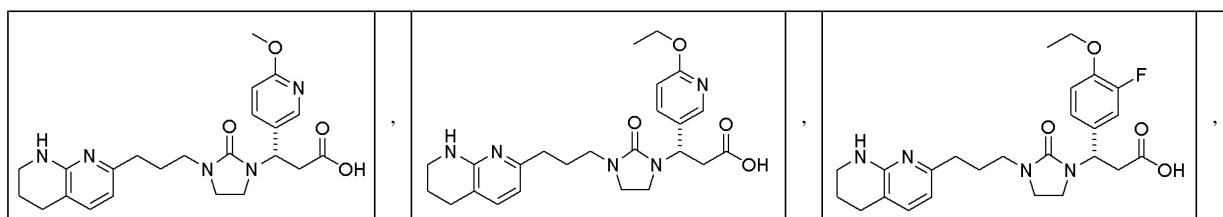
 $X_1-X_2$  представляет собой  $CHR_1-CH_2$ ,  $CH=CH$  или  $C(O)-CH_2$ ; $R_1$  представляет собой H или OH; $Y=Y'$  представляет собой  $CR_3=N$ ,  $CR_4=CR_4$  или  $C(O)-NH$ ; $R_3$  представляет собой  $C_1-C_3$  алкокси, F, или  $R_3$  вместе с  $R_2$  и атомами углерода, к которым они присоединены, 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 H, или вместе с  $R_3$  и атомами углерода, к которым они присоединены, образуют фенильное кольцо; и



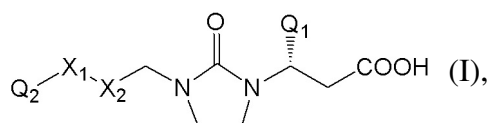
2. Применение по п.1, где  $X_1-X_2$  представляет собой  $CHR_1-CH_2$ .
3. Применение по п.2, где  $R_1$  представляет собой H.
4. Применение по п.2, где  $R_1$  представляет собой OH.
5. Применение по п.1, где  $X_1-X_2$  представляет собой  $CH=CH$ .
6. Применение по п.1, где  $X_1-X_2$  представляет собой  $C(O)-CH_2$ .
7. Применение по п.1, где  $Y= Y'$  представляет собой  $CR_3=N$ .
8. Применение по п.7, где  $R_3$  представляет собой метокси, этокси или пропокси.
9. Применение по п.7, где  $R_3$  вместе с  $R_2$  и атомами углерода, к которым они присоединены, образуют фенильное кольцо.
10. Применение по п.1, где  $Y= Y'$  представляет собой  $CR_4=CR_4$ .
11. Применение по п.10, где один из  $R_4$  представляет собой метокси, этокси или пропокси.
12. Применение по п.10, где 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.
13. Применение по п.1, где  $Y= Y'$  представляет собой  $C(O)-NH$ .
14. Применение по п.1, где  $Q_2$  представляет собой .
15. Применение по п.1, где  $Q_2$  представляет собой .
16. Применение по п.1, где  $Q_2$  представляет собой .
17. Применение по п.1, где соединение выбрано из:



	,		,		,
	,		,		,
	,		,		
		и			

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 сольвата в лечении или профилактике фиброза у субъекта, где:

$X_1-X_2$  представляет собой  $CHR_1-CH_2$ ,  $CH=CH$  или  $C(O)-CH_2$ ;

$R_1$  представляет собой H или OH;

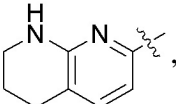
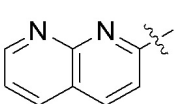
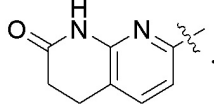


$Y=Y'$  представляет собой  $CR_3=N$ ,  $CR_4=CR_4$  или  $C(O)-NH$ ;

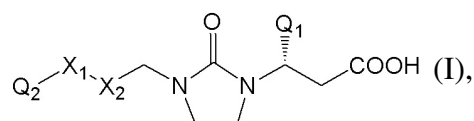
$R_3$  представляет собой  $C_1-C_3$  алкокси, F, или  $R_3$  вместе с  $R_2$  и атомами углерода, к которым они присоединены, образуют фенильное кольцо;

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 H, или вместе с  $R_3$  и атомами углерода, к которым они присоединены, образуют фенильное кольцо; и

Q<sub>2</sub> представляет собой ,  или .

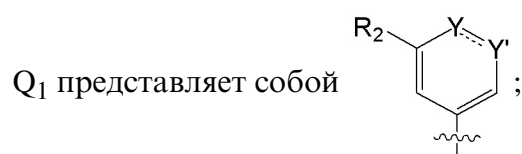
20. Способ лечения или профилактики фиброза, включающий введение субъекту, нуждающемуся в этом, терапевтически эффективного количества соединения формулы I:



или его фармацевтически приемлемой соли или сольвата, где:

X<sub>1</sub>-X<sub>2</sub> представляет собой CHR<sub>1</sub>-CH<sub>2</sub>, CH=CH или C(O)-CH<sub>2</sub>;

R<sub>1</sub> представляет собой H или OH;



Y==Y' представляет собой CR<sub>3</sub>=N, CR<sub>4</sub>=CR<sub>4</sub> или C(O)-NH;

R<sub>3</sub> представляет собой C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> алкокси, F, или R<sub>3</sub> вместе с R<sub>2</sub> и атомами углерода, к которым они присоединены, образуют фенильное кольцо;

каждый R<sub>4</sub> независимо представляет собой C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> алкокси, F, или два R<sub>4</sub> 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<sub>2</sub> представляет собой H, или вместе с R<sub>3</sub> и атомами углерода, к которым они присоединены, образуют фенильное кольцо; и

