

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

(21)(22) Заявка: 2014144404, 04.04.2013

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
05.04.2012 EP 12163308.5

(43) Дата публикации заявки: 27.05.2016 Бюл. № 15

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 05.11.2014(86) Заявка РСТ:
EP 2013/057071 (04.04.2013)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2013/150087 (10.10.2013)Адрес для переписки:
109012, Москва, ул. Ильинка, 5/2, ООО
"Союзпатент"

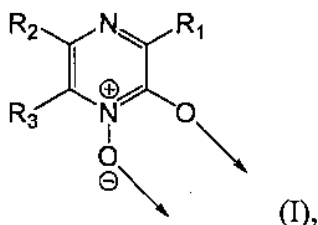
(71) Заявитель(и):

ВИФОР (ИНТЕРНАЦИОНАЛЬ) АГ (СН)

(72) Автор(ы):

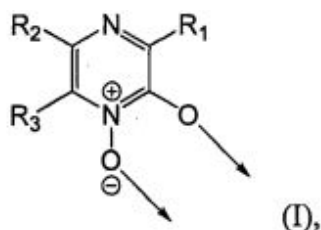
**БАРК Томас (СН),
БУР Вильм (DE),
БУРКХАРДТ Сюзанна (СН),
БУРГЕРТ Михаэль (DE),
КАНКЛИНИ Камилло (СН),
ДЮРРЕНБЕРГЕР Франц (СН),
ФУНК Феликс (СН),
ГАЙСЕР Петер Отто (СН),
КАЛОГЕРАКИС Арис (СН),
МАЙЕР Симона (СН),
ФИЛИПП Эрик (СН),
РАЙМ Штефан (СН),
ЗИБЕР Диана (СН),
ШМИТТ Йорг (СН),
ШВАРЦ Катрин (СН)**(54) **ЖЕЛЕЗО (III)-ПИРАЗИН-КОМПЛЕКСНЫЕ СОЕДИНЕНИЯ ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ И
ПРОФИЛАКТИКИ ЯВЛЕНИЙ ДЕФИЦИТА ЖЕЛЕЗА В ОРГАНИЗМЕ И ЖЕЛЕЗОДЕФИЦИТНОЙ
АНЕМИИ**

(57) Формула изобретения

1. Комплексное соединение железа (III)-пиразин-2-ол-1-оксидг или его
фармацевтически приемлемые соли для применения при лечении и профилактике явлений
дефицита железа и железодефицитной анемии, а также сопровождающих их симптомов.2. Комплексное соединение железа (III) для применения по п. 1, содержащее, по
меньшей мере, один лиганд формулы (I):где стрелками показана координационная связь с одним или разными атомами
железа, R₁, R₂, R₃ могут быть одинаковыми или разными и выбраны из группы,
состоящей из:водорода,
галогена,

при необходимости замещенного алкила,
 при необходимости замещенного алкоксила,
 при необходимости замещенного арила,
 при необходимости замещенного алкоксикарбонила и
 при необходимости замещенного аминокарбонила,
 или R_2 , R_3 вместе с атомами углерода, с которыми они связаны, образуют при необходимости замещенное 5- или 6-членное насыщенное или ненасыщенное кольцо, которое при необходимости может содержать один или несколько гетероатомов, или его фармацевтически приемлемые соли.

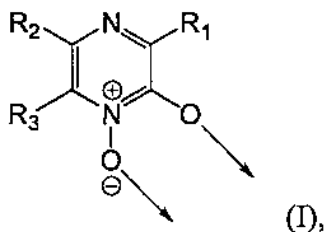
3. Комплексное соединения железа (III) для применения по п. 2, содержащее, по меньшей мере, один лиганд формулы (I):



где стрелками показана координационная связь с одним или разными атомами железа, R_1 , R_2 , R_3 могут быть одинаковыми или разными, и выбраны из группы, состоящей из:

водорода,
 при необходимости замещенного алкила,
 галогена,
 или R_2 , R_3 вместе с атомами углерода, с которыми они связаны, образуют 5- или 6-членное карбоциклическое кольцо,
 или его фармацевтически приемлемые соли.

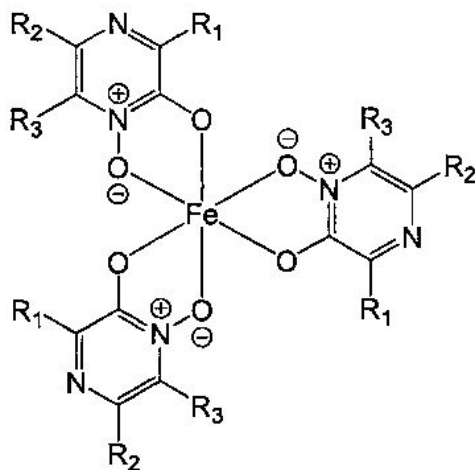
4. Комплексное соединение железа (III) для применения по п. 3, содержащее, по меньшей мере, один лиганд формулы (I):



где стрелками показана координационная связь с одним или разными атомами железа, R_1 , R_2 , R_3 могут быть одинаковыми или разными и выбраны из группы, состоящей из водорода и алкила, который при необходимости может быть замещен алкоксилем,

или R_2 , R_3 образуют вместе пропиленовую ($-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2$), бутиленовую ($-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2$), азабутиленовую или оксабутиленовую группы,
 или его фармацевтически приемлемые соли.

5. Комплексное соединение железа (III) для применения по п. 1, которое имеет следующую формулу:



(II)

где R_1 , R_2 , R_3 могут быть одинаковым или разными и означают, как указано выше, и его фармацевтически приемлемые соли.

6. Комплексное соединение железа (III) для применения по п. 1 в твердой форме.

7. Комплексное соединение, железо (III)-пиразин-2-ол-1-оксид, как определено в любом из пп. 1 - 5, в твердой форме для применения в качестве лекарственного средства.

8. Комплексное соединение железа (III) для применения по п. 1, при симптоматике: усталость, апатия, ослабление концентрации внимания, низкая познавательная эффективность, трудности отыскании нужных слов, забывчивость, неестественная бледность, раздражительность, увеличение частоты сердечных сокращений (тахикардия), повреждение или опухлость языка, увеличенная селезенка, прихоти беременных (пикацизм), головные боли, отсутствие аппетита, повышенная подверженность инфекциям и депрессивные расстройства.

9. Комплексное соединение железа (III) для применения по п. 1 при лечении железодефицитной анемии у беременных, латентной железодефицитной анемии у детей и лиц в возрасте от 18 до 21 года, железодефицитной анемии при желудочно-кишечных аномалиях, вследствие потери крови, как, например, желудочно-кишечные кровотечения (например, из-за язв, карцином, геморроя, воспалительных нарушений, приема ацетилсалициловой кислоты), вследствие менструации, ранений, психоза (спру), пониженного поступления железа с пищей, в частности, у избирательно питающихся детей и лиц в возрасте от 18 до 21 года, слабости иммунитета, вызванной железодефицитной анемией, ухудшения мозговой функции из-за железодефицитной анемии, синдрома усталых ног, вызванного железодефицитной анемией, железодефицитной анемии при раке, железодефицитной анемии, вызванной химиотерапией, железодефицитной анемии, вызванной воспалением (A1), железодефицитной анемии при застойной сердечной недостаточности (CHF), при хронической почечной недостаточности на стадии 3-5, железодефицитной анемии, вызванной хроническим воспалением (ACD), железодефицитной анемии при ревматическом артрите, при красной волчанке и при воспалительных болезнях кишечника.

10. Комплексное соединение железа (III) для применения по п. 1, при котором оно принимается orally.

11. Комплексное соединение железа (III) для применения по п. 10, при котором оно принимается в форме таблетки или капсулы, а также в кислотостойких формах или в формах с зависящими от pH покрытиями.

12. Комплексное соединение железа (III) для применения по п. 10 или 11, при котором

оно принимается в форме фармацевтической композиции, содержащей, по меньшей мере, физиологически приемлемый носитель или эксципиент.

13. Композиция, содержащая комплексное соединение железа (III), как определено в любом из пп. 1-6 или 12, в комбинации, по меньшей мере, с одним дополнительным лекарственным средством, воздействующим на метаболизм железа.

RU 201414404 A

RU 201414404 A