



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2012108048/04, 10.08.2010

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:

10.08.2009 GB 0913914.8;

04.02.2010 GB 1001821.6;

20.07.2010 GB 1012168.9

(43) Дата публикации заявки: 20.09.2013 Бюл. № 26

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на национальной фазе: 11.03.2012

(86) Заявка РСТ:

GB 2010/051317 (10.08.2010)

(87) Публикация заявки РСТ:

WO 2011/018653 (17.02.2011)

Адрес для переписки:

191186, Санкт-Петербург, а/я 230, "АРС-ПАТЕНТ", И.И. Липатовой

(71) Заявитель(и):

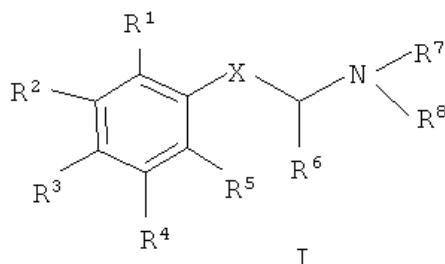
БИОКОПИ ЛИМИТЕД (GB)

(72) Автор(ы):

БРЮ Джон (GB),**БЭННИСТЕР Робин Марк (GB),****СТОЛОФФ Грегори Алан (GB),****ВАНДЕРЛЕЙ Уилсон Каппаррос (GB),****ПЛЕГЕСУЭЛОС Матео Ольга (GB)**(54) **ЛЕЧЕНИЕ ВИРУСНЫХ ИНФЕКЦИЙ**

(57) Формула изобретения

1. Соединение формулы I:-

где X представляет собой CO, СНОН или СН₂;R¹ представляет собой Н или объединен с R²;

R² представляет собой Н, ОН, галоген, замещенную или незамещенную аминогруппу, С₁₋₅ алкильную или алкоксильную группу, возможно содержащую в качестве заместителя один или более из О, ОН, amino и/или фенильную группу, возможно содержащую в качестве заместителя С₁₋₃ алкильную группу, или объединен с R¹;

каждый из R³ и R⁴ независимо представляет собой Н, ОН, галоген, замещенную или

незамещенную аминогруппу, или C_{1-5} алкильную, или алкоксильную группу, возможно содержащую в качестве заместителя один или более из О, ОН, amino, и/или возможно фенильную группу, содержащую в качестве заместителя C_{1-3} алкильную группу;

R^5 представляет собой Н;

R^6 представляет собой Н, C_{1-3} алкильную группу или объединен с R^8 ;

R^7 представляет собой Н или объединен с R^8 ;

R^8 объединен с R^6 или R^7 или представляет собой прямоцепную, разветвленную или циклическую C_{1-9} алкильную группу, возможно содержащую один или более гетероатомов в углеродном скелете и возможно содержащую в качестве заместителя один или более ОН, и/или C_{5-6} арильную группу, возможно содержащую в качестве заместителя один или более ОН или C_{1-5} алкоксильную или алкильную группу;

когда R^1 и R^2 объединены, они образуют вместе с соответствующими циклическими атомами углерода возможно О-замещенную циклоалкильную, циклоалкенил, циклогетероалкильную или циклогетероалкенильную группу, содержащую 5 или 6 атомов углерода или 4 или 5 атомов углерода и гетероатом;

когда R^6 и R^8 объединены, они образуют вместе с атомом азота, с которым связан R^8 , и атомом углерода, с которым связан R^6 , 5- или 6-членную циклогетероалкильную группу; и, когда R^7 и R^8 объединены, они образуют вместе атомом азота, связанным с ними,

5- или 6-членную циклогетероалкильную группу, возможно содержащую в качестве заместителя бензильную группу;

или фармацевтически приемлемая соль или сольват указанного соединения; для применения в лечении острой вирусной инфекции.

2. Соединение по п.1, где R^2 представляет собой гидроксилалкильную группу или карбонилосигруппу и предпочтительно представляет собой Н, ОН, $HOCH_2-$, $O=CHNH-$, $CH_3PhCOO-$, NH_2COO- или галоген, где возможно R^2 представляет собой Н, ОН или Cl.

3. Соединение по п.1, где R_3 представляет собой Н, NH_2 , ОН или $CH_3PnCOO-$.

4. Соединение по п.1, где R^3 представляет собой Н, NH_2 или ОН.

5. Соединение по п.1, где R^4 представляет собой Н, ОН, NH_2COO- или галоген, где R^4 возможно представляет собой Н или Cl.

6. Соединение по п.1, где R^6 представляет собой метил, этил или Н.

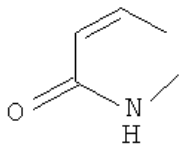
7. Соединение по п.1, где R^7 представляет собой Н.

8. Соединение по п.1, где R^8 представляет собой C_2-C_6 алкильную группу с прямой или разветвленной цепью, возможно содержащую в качестве заместителя ОН, фенил, PhOH или $PhOCH_3$, где возможно R^8 представляет собой трет-бутил, изопропил, $-C(CH_3)_2OH$, $-CH_2PhOCH_3$, $-(CH_2)_2PhOH$, $-CH(CH_3)CH_2CH_2Ph$ или $-CH(CH_3)CH_2CH_2PhOH$.

9. Соединение по п.1, где R^8 представляет собой:

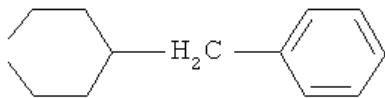


10. Соединение по п.1, где когда R^1 и R^2 объединены, они образуют группу:



11. Соединение по п.1, где когда R^6 и R^8 объединены, они образуют вместе с атомом азота, с которым связан R^8 , и атомом углерода, с которым связан R^6 , циклогетероалкильную группу, содержащую 5 атомов углерода и 1 атом азота.

12. Соединение по п.1, где когда R^7 и R^8 объединены, они образуют группу:



13. Соединение по п.1, где соединение (I) включает любой диастереомер и энантиомер, представленный формулой (I).

14. Соединение по п.1, где соединение (I) представляет собой агонист β_2 -адренергического рецептора.

15. Соединение по п.14, где агонист β_2 -адренергического рецептора представляет собой салбутамол, левосалбутамол, тербуталин, пирбутерол, прокатерол, метапротеренол (или орципреналин), фенотерол, битолтерола мезилат, салметерол, формотерол, бамбутерол, кленбутерол, индакатерол, изопреналин, римитерол, ифенпродил, буфенин, добутамин или ритодрин.

16. Соединение по п.1, где соединение (I) представляет собой бупропион или его метаболит.

17. Соединение по п.16, где метаболит бупропиона представляет собой 2-(1,1-диметилэтил)амино-1-(3-хлорфенил)пропан-1-ол, 2-(1,1-диметил-2-гидроксиэтил)амино-1-(3-хлорфенил)пропан-1-он, (1S,2R)-эритро-2-(1,1-диметилэтил)амино-1-(3-хлорфенил)пропан-1-ол, (1R,2S)-эритро-2-(1,1-диметилэтил)амино-1-(3-хлорфенил)пропан-1-ол, 1S,2S)-трео-2-(1,1-диметилэтил)амино-1-(3-хлорфенил)пропан-1-ол или (1R,2R)-трео-2-(1,1-диметилэтил)амино-1-(3-хлорфенил)пропан-1-ол.

18. Соединение по п.1, где вирусная инфекция, подвергаемая лечению, представляет собой инфекцию парамиксовирусом или ортомиксовирусом.

19. Соединение по п.1, где соединение (I) применяется для лечения инфекции, вызванной любым из вируса гриппа А, вируса гриппа В или вируса гриппа С, или его производным.

20. Соединение по п.19, где соединение (I) применяется для лечения инфекции, вызванной любым серотипом вируса гриппа А, выбранным из группы серотипов, состоящей из: H1N1; H1N2; H2N2; H3N1; H3N2; H3N8; H5N1; H5N2; H5N3; H5N8; H5N9; H7N1; H7N2; H7N3; H7N4; H7N7; H9N2; и H10N7, или его производным.

21. Соединение по п.20, где соединение (I) применяется для лечения вирусных инфекций, вызванных вирусом H1N1 или его производным.

22. Соединение по п.1, где соединение (I) применяется для смягчения воспалительных симптомов вызванной вирусом продукции цитокинов.

23. Соединение по п.22, где соединение (I) модулирует продукцию IFN- γ и/или TNF- α .

