



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2014153571, 04.06.2013

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:

05.06.2012 KR 10-2012-0060314

(43) Дата публикации заявки: 27.07.2016 Бюл. № 21

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на национальной фазе: 12.01.2015

(86) Заявка РСТ:

KR 2013/004932 (04.06.2013)

(87) Публикация заявки РСТ:

WO 2013/183920 (12.12.2013)

Адрес для переписки:

109012, Москва, ул. Ильинка, 5/2, ООО
"Союзпатент"

(71) Заявитель(и):

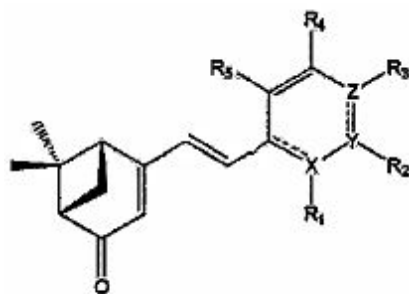
**КОРЕЯ ЮНИВЕРСИТИ РИСЕРЧ ЭНД
БИЗНЕС ФАУНДЕЙШН (KR)**

(72) Автор(ы):

**КИМ Вон Ки (KR),
ЧХВЕ Ёнсок (KR),
СОН Суми (KR)**(54) **ФАРМАЦЕВТИЧЕСКАЯ КОМПОЗИЦИЯ, СОДЕРЖАЩАЯ ПРОИЗВОДНОЕ ВЕРБЕНОЛА, ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ ИЛИ ПРОФИЛАКТИКИ НЕЙРОДЕГЕНЕРАТИВНОГО ЗАБОЛЕВАНИЯ**

(57) Формула изобретения

1. Фармацевтическая композиция для профилактики или лечения дегенеративного заболевания мозга, содержащая в качестве действующего вещества производное вербенона, представленное изображенной ниже формулой 1, или его фармацевтически приемлемую соль:

**Формула 1.**

где R₁, R₂, R₃, R₄ и R₅ каждый независимо представляют собой по меньшей мере один заместитель, выбранный из группы, состоящей из атома водорода, атома галогена, выбранного из F, O, Br и I, гидроксильной группы, C₁-C₃ алкильной группы, C₁-C₃ алкокси-группы, амино-группы, C₁-C₃ алкиламино-группы, C₁-C₃ алкилдиамино-

группы, C₅-C₈ ароматического цикла, C₅-C₈ циклического кольца и C₅-C₈ гетероароматического цикла;

X, Y и Z каждый независимо представляют собой атом углерода или по меньшей мере один гетероатом, выбранный из группы, состоящей из атомов N, O S; и

----- означает двойную связь или одинарную связь.

2. Фармацевтическая композиция по п. 1, в которой R₁, R₂, R₃, R₄ и R₅ каждый независимо представляют собой по меньшей мере один заместитель, выбранный из группы, состоящей из атома водорода, атома галогена, выбранного из F, Cl, Br и I, гидроксильной группы, метильной группы, этильной группы, метокси-группы, этокси-группы, амино-группы, C₅-C₆ ароматического цикла, C₅-C₆ циклического кольца и C₅-C₆ гетероароматического цикла.

3. Фармацевтическая композиция по п. 2, в которой R₁, R₂, R₃, R₄ и R₅ каждый независимо представляют собой по меньшей мере один заместитель, выбранный из группы, состоящей из атома водорода, атома галогена, выбранного из F, O, Br и I, гидроксильной группы, метильной группы, метокси-группы, фенильной группы, пиррольной группы и пиридиновой группы.

4. Фармацевтическая композиция по п. 1, в которой X, Y и Z каждый независимо представляют собой атом углерода или по меньшей мере один гетероатом, выбранный из группы, состоящей из атомов N, O и S.

5. Фармацевтическая композиция по п. 4, в которой X, Y и Z каждый независимо представляют собой по меньшей мере один атом, выбранный из группы, состоящей из атома углерода и атома N.

6. Фармацевтическая композиция по п. 1, содержащая соединение, выбранное из группы, состоящей из следующих соединений:

- (1S,5R)-4-(4-гидроксистирил)-6,6-диметилбицикло[3.1.1]гепт-3-ен-2-он (3a);
- (1S,5R)-4-(4-гидрокси-2-метоксистирил)-6,6-диметтабицикло[3.1.1]гепт-3-ен-2-он(3b);
- (1S,5R)-4-(3,4-дигидроксистирил)-6,6-диметилбицикло[3.1.1]гепт-3-ен-2-он(3c);
- (1S,5R)-4-(3-бром-4-гидроксистирил)-6,6-диметилбицикло[3.1.1]гепт-3-ен-2-он (3d);
- (1S,5R)-4-(4-гидрокси-2,6-диметоксистирил)-6,6-диметилбицикло[3.1.1]гепт-3-ен-2-он(3e);
- (1S,5R)-4-(3,4-дигидрокси-5-метоксистирил)-6,6-диметилбицикло[3.1.1]гепт-3-ен-2-он (3f);
- (1S,5R)-4-(3-гидроксистирил)-6,6-диметилбицикло[3.1.1]гепт-3-ен-2-он(3g);
- (1S,5R)-4-(2-гидроксистирил)-6,6-диметилбицикло[3.1.1]гепт-3-ен-2-он(3h);
- (1S,5R)-4-(2-гидрокси-4-метоксистирил)-6,6-диметилбицикло[3.1.1]гепт-3-ен-2-он(3i);
- (1S,5R)-6,6-диметил-4-стирил-бицикло[3.1.1]гепт-3-ен-2-он(4a);
- (1S,5R)-4-(4-фторстирил)-6,6-диметилбицикло[3.1.1]гепт-3-ен-2-он(4b);
- (1S,5R)-4-(4-метоксистирил)-6,6-диметилбицикло[3.1.1]гепт-3-ен-2-он(4c);
- (1S,5R)-4-(2-(бифенил-4-ил)винил)-6,6-диметилбицикло[3.1.1]гепт-3-ен-2-он(4d);
- (1S,5R)-4-(4-(1H-пиррол-1-ил)стирил)-6,6-диметилбицикло[3.1.1]гепт-3-ен-2-он(4e);
- (1S,5R)-4-(3,4-диметоксистирил)-6,6-диметилбицикло[3.1.1]гепт-3-ен-2-он(4f);
- (1S,5R)-4-(3,5-диметоксистирил)-6,6-диметилбицикло[3.1.1]гепт-3-ен-2-он(4g);
- (1S,5R)-4-(2,5-диметоксистирил)-6,6-диметилбицикло[3.1.1]гепт-3-ен-2-он(4h);
- (1S,5R)-4-(5-бром-2-метоксистаил)-6,6-диметилбицикло[3.1.1]гепт-3-ен-2-он(4i);
- (1S,5R)-6,6-диметил-4-((E)-2-(пиридин-2-ил)винил)-бицикло[3.1.1]гепт-3-ен-2-он(5a);
- (1S,5R)-6,6-диметил-4-((E)-2-(пиридин-3-ил)винил)-бицикло[3.1.1]гепт-3-ен-2-он(5b);

и

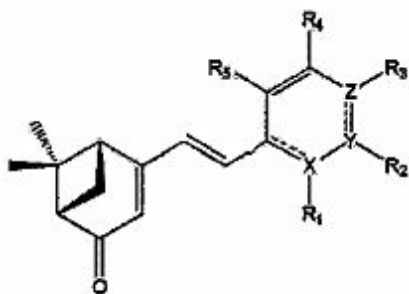
- (1S,5R)-6,6-диметил-4-((E)-2-(пиридин-4-ил)-винил)-бицикло[3.1.1]гепт-3-ен-2-он(5c).

7. Фармацевтическая композиция по п. 1, в которой дегенеративное заболевание

мозга представляет собой инсульт, паралич, деменцию, болезнь Альцгеймера, болезнь Паркинсона или болезнь Хантингтона.

8. Фармацевтическая композиция по п. 1, в которой дегенеративное заболевание мозга представляет собой инсульт.

9. Функциональный пищевой продукт для профилактики или смягчения симптомов дегенеративного заболевания мозга, содержащий в качестве действующего вещества производное вербенона формулы 1 или его фармацевтически приемлемую соль:



Формула 1.

где R₁, R₂, R₃, R₄ и R₅ каждый независимо представляют собой по меньшей мере один заместитель, выбранный из группы, состоящей из атома водорода, атома галогена, выбранного из F, Cl, Br и I, гидроксильной группы, C₁-C₃ алкильной группы, C₁-C₃ алкокси-группы, amino-группы, C₁-C₃ алкиламино-группы, C₁-C₃ алкилдиамино-группы, C₅-C₈ ароматического цикла, C₅-C₈ циклического кольца и C₅-C₈ гетероароматического цикла;

X, Y и Z каждый независимо представляют собой атом углерода или по меньшей мере один гетероатом, выбранный из группы, состоящей из атомов N, O S; и

----- означает двойную связь или одинарную связь.

10. Функциональный пищевой продукт по п. 9, в котором R₁, R₂, R₃, R₄ и R₅ каждый независимо представляют собой по меньшей мере один заместитель, выбранный из группы, состоящей из атома водорода, атома галогена, выбранного из F, Cl, Br и I, гидроксильной группы, метильной группы, этильной группы, метокси-группы, этокси-группы, amino-группы, C₅-C₆ ароматического цикла, C₅-C₆ циклического кольца и C₅-C₆ гетероароматического цикла.

11. Функциональный пищевой продукт по п. 10, в котором R₁, R₂, R₃, R₄ и R₅ каждый независимо представляют собой по меньшей мере один заместитель, выбранный из группы, состоящей из атома водорода, атома галогена, выбранного из F, O, Br и I, гидроксильной группы, метильной группы, метокси-группы, фенильной группы, пиррольной группы и пиридиновой группы.

12. Функциональный пищевой продукт по п. 9, в котором X, Y и Z каждый независимо представляют собой атом углерода или по меньшей мере один гетероатом, выбранный из группы, состоящей из атомов N, O и S.

13. Функциональный пищевой продукт по п. 12, в котором X, Y и Z каждый независимо представляют собой по меньшей мере один атом, выбранный из группы, состоящей из атома углерода и атома N.

14. Функциональный пищевой продукт по п. 9, в котором композиция содержит соединение, выбранное из группы, состоящей из следующих соединений:

(1S,5R)-4-(4-гидроксистирил)-6,6-диметилбицикло[3.1.1]гепт-3-ен-2-он(3a);

(1S,5R)-4-(4-гидрокси-2-метоксистирил)-6,6-диметилбицикло[3.1.1]гепт-3-ен-2-он(3b);

(1S,5R)-4-(3,4-дигидроксистирил)-6,6-диметилбицикло[3.1.1]гепт-3-ен-2-он(3c);

(1S,5R)-4-(3-бром-4-гидроксистирил)-6,6-диметилбицикло[3.1.1]гепт-3-ен-2-он(3d);

- (1S,5R)-4-(4-гидрокси-2,6-диметоксистирил)-6,6-диметилбицикло[3.1.1]гепт-3-ен-2-он(3e);
 (1S,5R)-4-(3,4-дигидрокси-5-метоксистирил)-6,6-диметилбицикло[3.1.1]гепт-3-ен-2-он(3f);
 (1S,5R)-4-(3-гидроксистирил)-6,6-диметилбицикло[3.1.1]гепт-3-ен-2-он(3g);
 (1S,5R)-4-(2-гидроксистирил)-6,6-диметилбицикло[3.1.1]гепт-3-ен-2-он(3h);
 (1S,5R)-4-(2-гидрокси-4-метоксистирил)-6,6-диметилбицикло[3.1.1]гепт-3-ен-2-он(3i);
 (1S,5R)-6,6-диметил-4-стерил-бицикло[3.1.1]гепт-3-ен-2-он(4a);
 (1S,5R)-4-(4-фторстирил)-6,6-диметилбицикло[3.1.1]гепт-3-ен-2-он (4b);
 (1S,5R)-4-(4-метоксистирил)-6,6-диметилбицикло[3.1.1]гепт-3-ен-2-он(4c);
 (1S,5R)-4-(2-(бифенил-4-ил)винил)-6,6-диметилбицикло[3.1.1]гепт-3-ен-2-он(4d);
 (1S,5R)-4-(4-(1H-пиррол-1-ил)стирил)-6,6-диметилбицикло[3.1.1]гепт-3-ен-2-он(4e);
 (1S,5R)-4-(3,4-диметоксистирил)-6,6-диметилбицикло[3.1.1]гепт-3-ен-2-он(4f);
 (1S,5R)-4-(3,5-диметоксистирил)-6,6-диметилбицикло[3.1.1]гепт-3-ен-2-он(4g);
 (1S,5R)-4-(2,5-диметоксистарил)-6,6-диметилбицикло[3.1.1]гепт-3-ен-2-он(4h);
 (1S,5R)-4-(5-бром-2-метоксистирил)-6,6-дшлетилбицикло[3.1.1]гепт-3-ен-2-он(4i);
 (1S,5R)-6,6-диметил-4-((E)-2-(пиридин-2-ил)винил)-бицикло[3.1.1]гепт-3-ен-2-он(5a);
 (1S,5R)-6,6-диметил-4-((E)-2-(пиридин-3-ил)винил)-бицикло[3.1.1]гепт-3-ен-2-он(5b);

и

(1S,5R)-6,6-диметил-4-((E)-2-(пиридин-4-ил)-винил)-бицикло[3.1.1]гепт-3-ен-2-он(5c).

15. Функциональный пищевой продукт по п. 9, в котором дегенеративное заболевание мозга представляет собой инсульт, паралич, деменцию, болезнь Альцгеймера, болезнь Паркинсона или болезнь Хантингтона.

16. Функциональный пищевой продукт по п. 15, в котором дегенеративное заболевание мозга представляет собой инсульт.