

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21)(22) Заявка: 2018134262, 14.03.2017

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
17.03.2016 ЕР 16160790.8

(43) Дата публикации заявки: 17.04.2020 Бюл. № 11

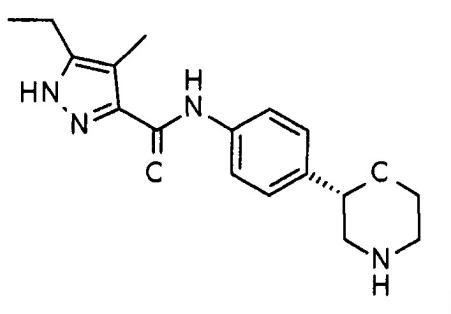
(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 17.10.2018(86) Заявка РСТ:
ЕР 2017/055885 (14.03.2017)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2017/157873 (21.09.2017)Адрес для переписки:
197101, Санкт-Петербург, а/я 128, "АРС-
ПАТЕНТ", С.В. Новоселовой(71) Заявитель(и):
Ф. ХОФФМАНН-ЛЯ РОШ АГ (CH)(72) Автор(ы):
ГАЛЛЕЙ Гуидо (CH),
ХЁНЕР Мариус (CH),
НОРКРОСС Роджер (CH),
ПФЛИГЕР Филипп (CH)

RU 2018134262 A

(54) ПРОИЗВОДНОЕ 5-ЭТИЛ-4-МЕТИЛ-ПИРАЗОЛ-3-КАРБОКСАМИДА, ОБЛАДАЮЩЕЕ
АКТИВНОСТЬЮ АГОНИСТА TAAR

(57) Формула изобретения

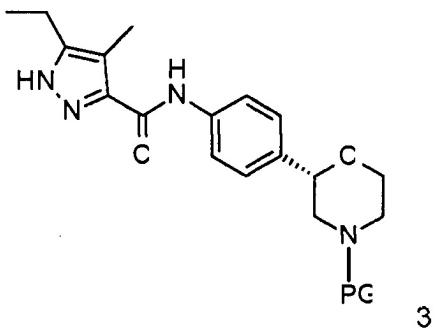
1. Морфолиновое производное формулы



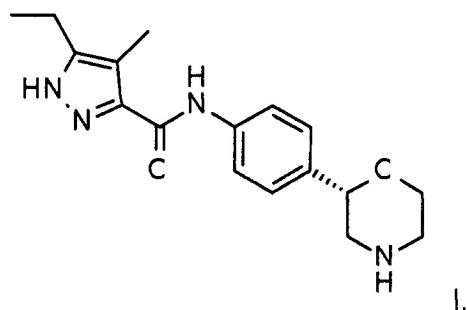
и его фармацевтически приемлемая соль присоединения кислоты.

2. Соединение формулы I, которое представляет собой 5-этил-4-метил-N-[4-[(2S)-
морфолин-2-ил]фенил]-1Н-пиразол-3-карбоксамид.3. Способ получения соединения формулы I согласно пп. 1 и 2, включающий
а) отщепление N-защитной группы (PG) у соединений формулы

RU 2018134262 A



с образованием соединения формулы



где PG является N-защитной группой, выбранной из -C(O)O-трет-бутила (ВОС), и, при желании, превращение полученных соединений в фармацевтически приемлемые соли присоединения кислоты.

4. Соединение формулы I согласно пп. 1 и 2 для применения в качестве терапевтически активного вещества.

5. Соединение формулы I по пп. 1 и 2 для применения в лечении депрессии, тревожных расстройств, биполярного расстройства, синдрома гиперактивности с дефицитом внимания (СГДВ), связанных со стрессом расстройств, шизофрении, болезни Паркинсона, болезни Альцгеймера, эпилепсии, мигрени, гипертензии, злоупотребления веществами, аддикции, нарушений пищевого поведения, диабета, диабетических осложнений, ожирения, дислипидемии, нарушений поглощения энергии и ассимиляции, расстройств и нарушения гомеостаза температуры тела, расстройств сна и циркадного ритма и сердечно-сосудистых расстройств.

6. Соединение формулы I согласно пп. 1 и 2 для применения в лечении шизофрении, биполярного расстройства или депрессии.

7. Фармацевтическая композиция, содержащая соединение формулы I согласно пп. 1 или 2 и фармацевтически приемлемые эксципиенты.

8. Применение соединения формулы I согласно пп. 1 или 2 для изготовления лекарственного средства для лечения депрессии, тревожных расстройств, биполярного расстройства, синдрома гиперактивности с дефицитом внимания (СГДВ), связанных со стрессом расстройств, шизофрении, болезни Паркинсона, болезни Альцгеймера, эпилепсии, мигрени, гипертензии, злоупотребления веществами, аддикции, нарушений пищевого поведения, диабета, диабетических осложнений, ожирения, дислипидемии, нарушений поглощения энергии и ассимиляции, расстройств и нарушения гомеостаза температуры тела, расстройств сна и циркадного ритма и сердечно-сосудистых расстройств.

9. Способ лечения депрессии, тревожных расстройств, биполярного расстройства, синдрома гиперактивности с дефицитом внимания (СГДВ), связанных со стрессом расстройств, шизофрении, болезни Паркинсона, болезни Альцгеймера, эпилепсии, мигрени, гипертензии, злоупотребления веществами, аддикции, нарушений пищевого поведения, диабета, диабетических осложнений, ожирения, дислипидемии, нарушений поглощения энергии и ассимиляции, расстройств и нарушения гомеостаза температуры

тела, расстройств сна и циркадного ритма и сердечно-сосудистых расстройств, включающий введение эффективного количества соединения формулы I согласно пп. 1 или 2.

R U 2 0 1 8 1 3 4 2 6 2 A

R U 2 0 1 8 1 3 4 2 6 2 A