



(51) МПК

C07D 513/04 (2006.01)

A61K 31/4745 (2006.01)

A61K 31/4743 (2006.01)

A61P 7/06 (2006.01)

**ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ**

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21)(22) Заявка: 2013142448/04, 16.02.2012

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:

18.02.2011 ЕР 11155103.2;

08.04.2011 US 61/473,223;

02.02.2012 US 13/364,566

(43) Дата публикации заявки: 27.03.2015 Бюл. № 9

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на национальной фазе: 18.09.2013

(86) Заявка РСТ:

ЕР 2012/052694 (16.02.2012)

(87) Публикация заявки РСТ:

WO 2012/110603 (23.08.2012)

Адрес для переписки:

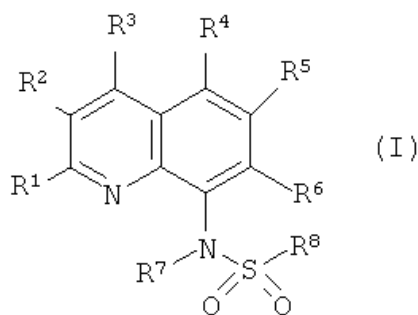
109012, Москва, ул. Ильинка, 5/2, ООО

"Союзпатент"

(71) Заявитель(и):

ВИФОР (ИНТЕРНАЦИОНАЛЬ) АГ (СН)

(72) Автор(ы):

БУР Вильм (DE),**БУРКХАРДТ Сюзанна (СН),****ДЮРРЕНБЕРГЕР Франц (СН),****ФУНК Феликс (СН),****ГЕЙССЕР Петер Отто (СН),****КОРДЕН Винсент Энтони (GB),****КОРТНИ Стивен Мартин (GB),****ДЭВЕНПОРТ Тара (GB),****СЛЭК Марк (DE),****РИДГИЛЛ Марк Питер (GB),****ЯРНОЛЬД Кристофер Джон (GB),****ДОСОН Грэм (GB),****Бойс Сюзан (DE),****ЭЛЛЕНБРУК Альбертус Антониус (NZ)****(54) НОВЫЕ СУЛЬФОАМИНОХИНОЛИНОВЫЕ АНТАГОНИСТЫ ГЕПСИДИНА****(57) Формула изобретения****1. Соединения общей формулы (I)**

в которой

R¹ выбран из

- атома водорода,
- галогена и
- необязательно замещенного алкила;

R² выбран из

- атома водорода и

- необязательно замещенного алкила;

R^3 выбран из

- атома водорода,
- атома галогена,
- необязательно замещенного аминокарбонила,
- необязательно замещенной амино-группы,
- необязательно замещенного алкила,
- необязательно замещенного алкоксикарбонила,
- необязательно замещенной алкокси-группы, и
- необязательно замещенного гетероциклила;

R^4 выбран из

- атома водорода,
- атома галогена,
- циано-группы,
- необязательно замещенного аминокарбонила,
- необязательно замещенной амино-группы,
- необязательно замещенного алкила, и
- необязательно замещенного ацила,
- необязательно замещенной алкокси-группы и
- необязательно замещенного гетероциклила;

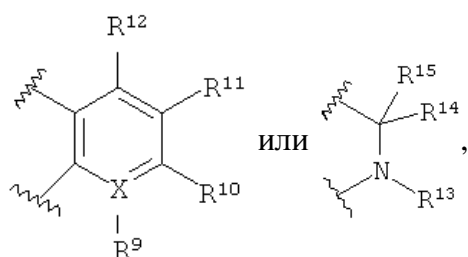
R^5 выбран из

- атома водорода,
- атома галогена,
- необязательно замещенного алкила, и
- необязательно замещенной алкокси-группы;

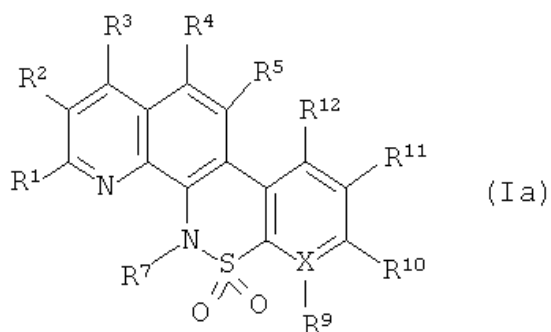
R^7 выбран из

- атома водорода и
- необязательно замещенного алкила;

и в которой R^6 и R^8 вместе образуют остаток формулы



образуя соединение общей формулы (Ia)

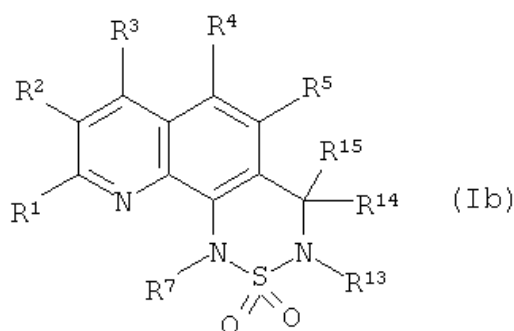


где

X представляет собой C или N;

R^9, R^{10}, R^{11} и R^{12} , одинаковые или разные, независимо выбраны из группы, состоящей из:

- атома водорода,
 - гидроксила,
 - карбоксила,
 - атома галогена,
 - циано-группы,
 - нитро-группы,
 - необязательно замещенной amino-группы,
 - необязательно замещенного алкила,
 - необязательно замещенного ацила,
 - необязательно замещенного алкоксикарбонила,
 - необязательно замещенной ацилокси-группы,
 - необязательно замещенной алкокси-группы,
 - необязательно замещенной арилокси-группы,
 - необязательно замещенного арила, и
 - необязательно замещенного гетероциклила;
- и образуя соединение общей формулы (Ib)



где

R^{13} выбран из группы, состоящей из:

- атома водорода,
- необязательно замещенного сульфонил (-SO₂R),
- необязательно замещенного алкила,
- необязательно замещенного ацила,
- необязательно замещенного алкоксикарбонила,
- необязательно замещенного арила, и
- необязательно замещенного гетероциклила; и

R^{14} и R^{15} , одинаковые или разные, независимо выбраны из группы, состоящей из:

- атома водорода,
- гидроксила,
- атома галогена,
- циано-группы,
- карбоксила,
- необязательно замещенной amino-группы,
- необязательно замещенного алкила,
- необязательно замещенного ацила,
- необязательно замещенного алкоксикарбонила,
- необязательно замещенной ацилокси-группы,
- необязательно замещенной алкокси-группы,
- необязательно замещенной арилокси-группы,

- обязательно замещенного алкенила,
 - обязательно замещенного арила, и
 - обязательно замещенного гетероциклила;
- или их фармацевтически приемлемые соли, предназначенные для применения в лечении нарушений метаболизма железа.

2. Соединения по п.1, в которых

R^9 , R^{10} , R^{11} и R^{12} , одинаковые или разные, независимо выбраны из группы, состоящей из:

- атома водорода,
 - атома галогена,
 - обязательно замещенного алкила,
 - обязательно замещенной алкокси-группы,
- или их фармацевтически приемлемые соли.

3. Соединения по п.1, в которых

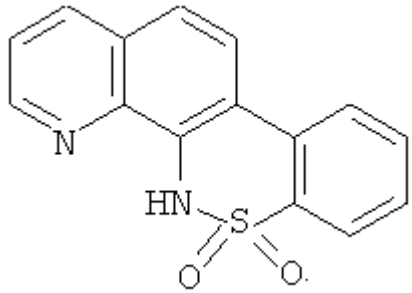
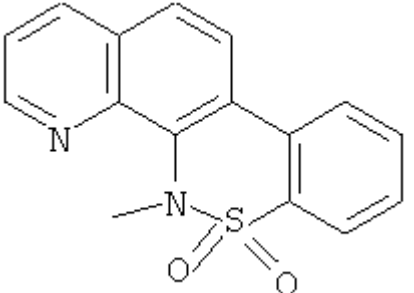
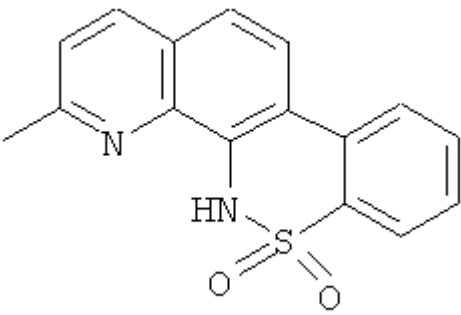
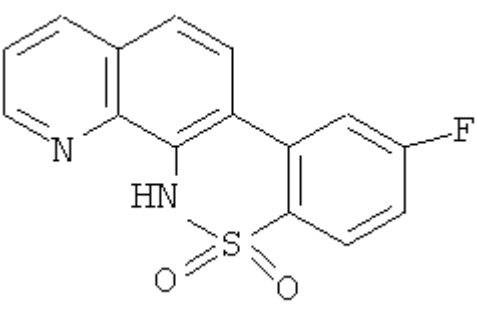
R^{13} выбран из группы, состоящей из:

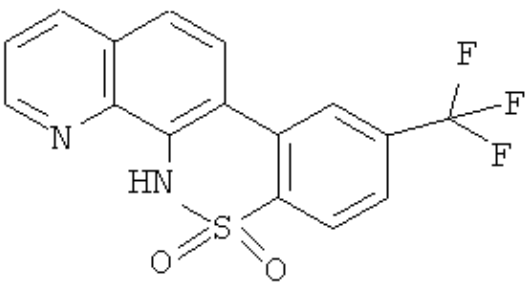
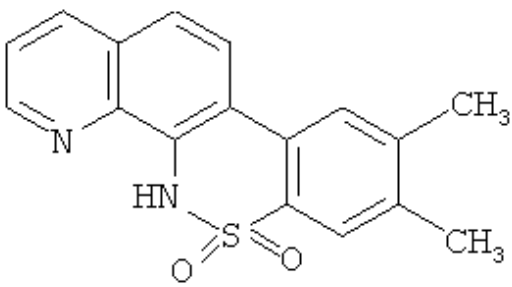
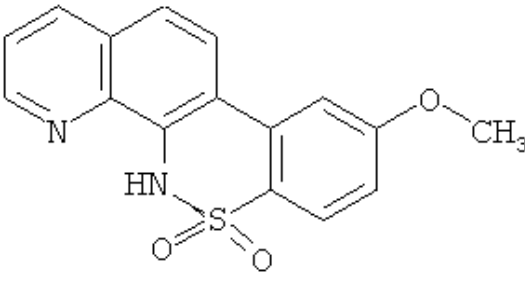
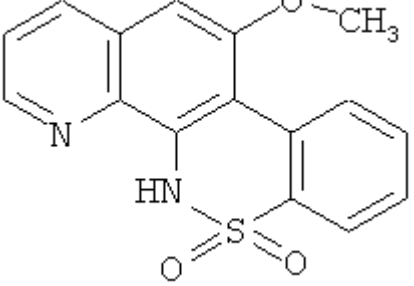
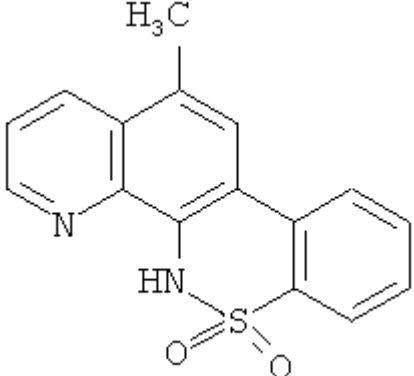
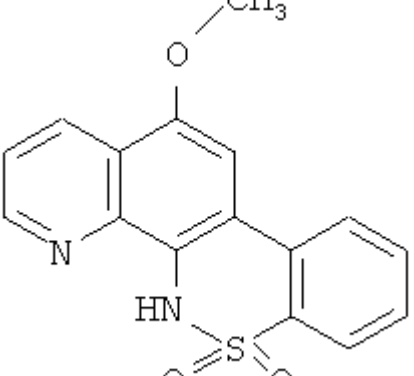
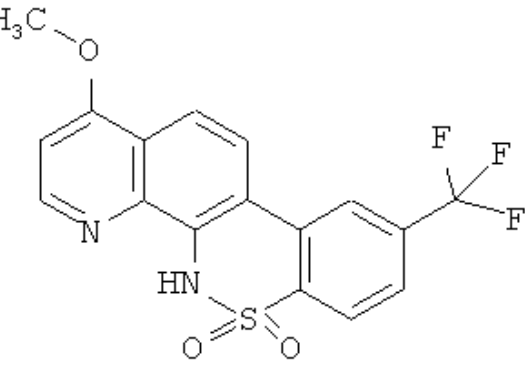
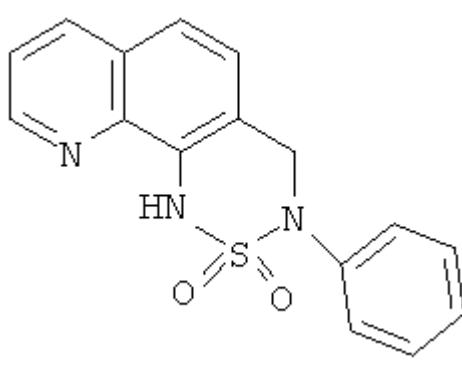
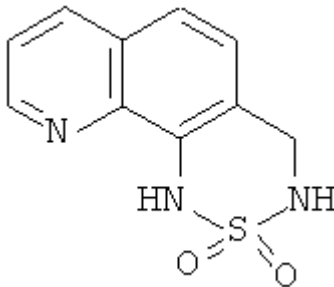
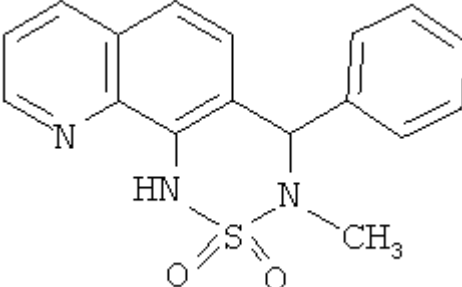
- атома водорода,
- обязательно замещенного алкила, и
- обязательно замещенного арила; и

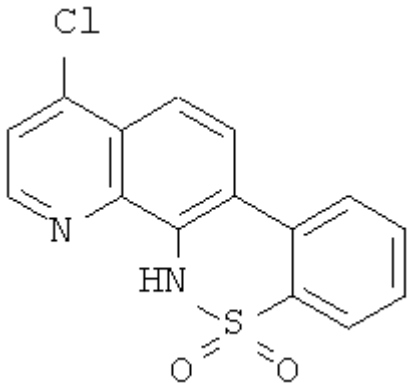
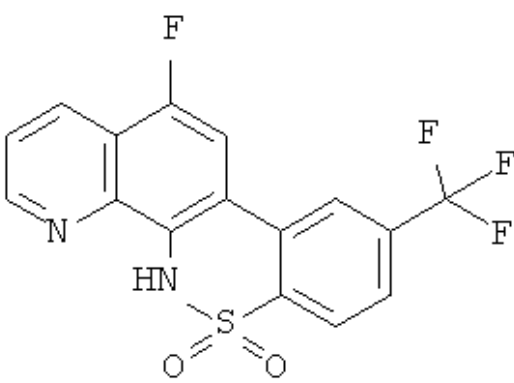
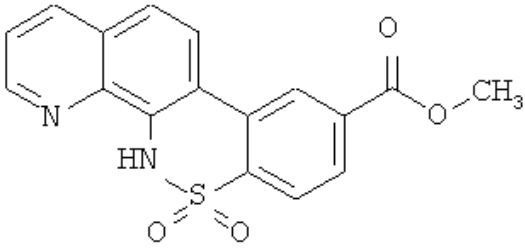
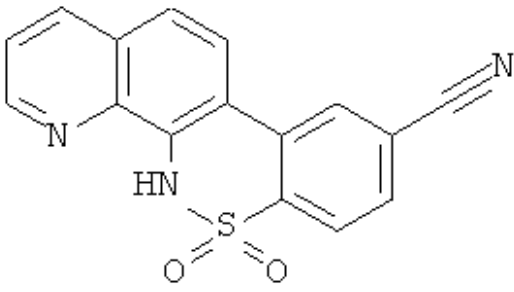
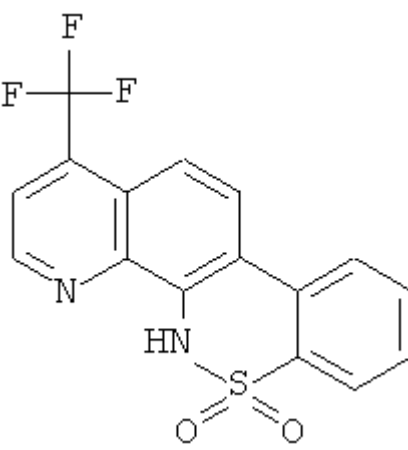
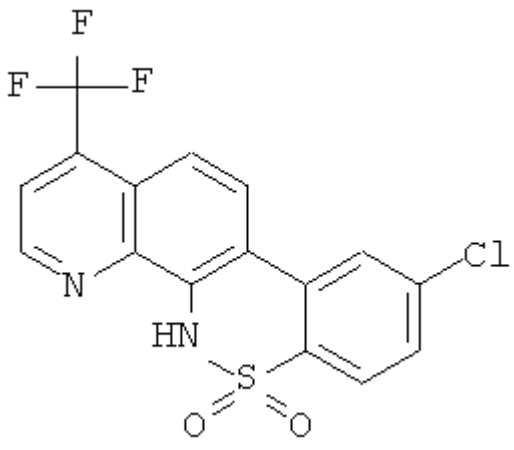
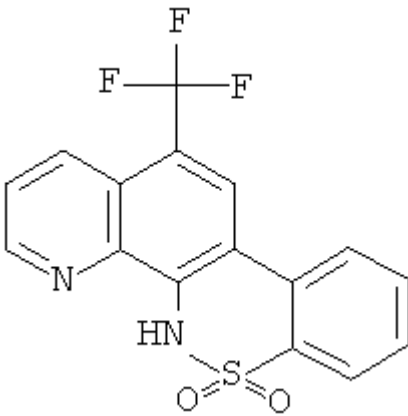
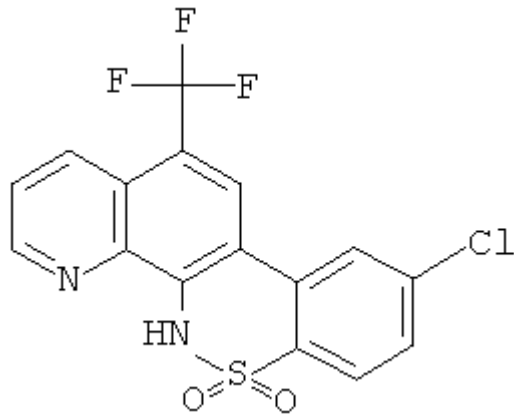
R^{14} и R^{15} , одинаковые или разные, независимо выбраны из группы, состоящей из:

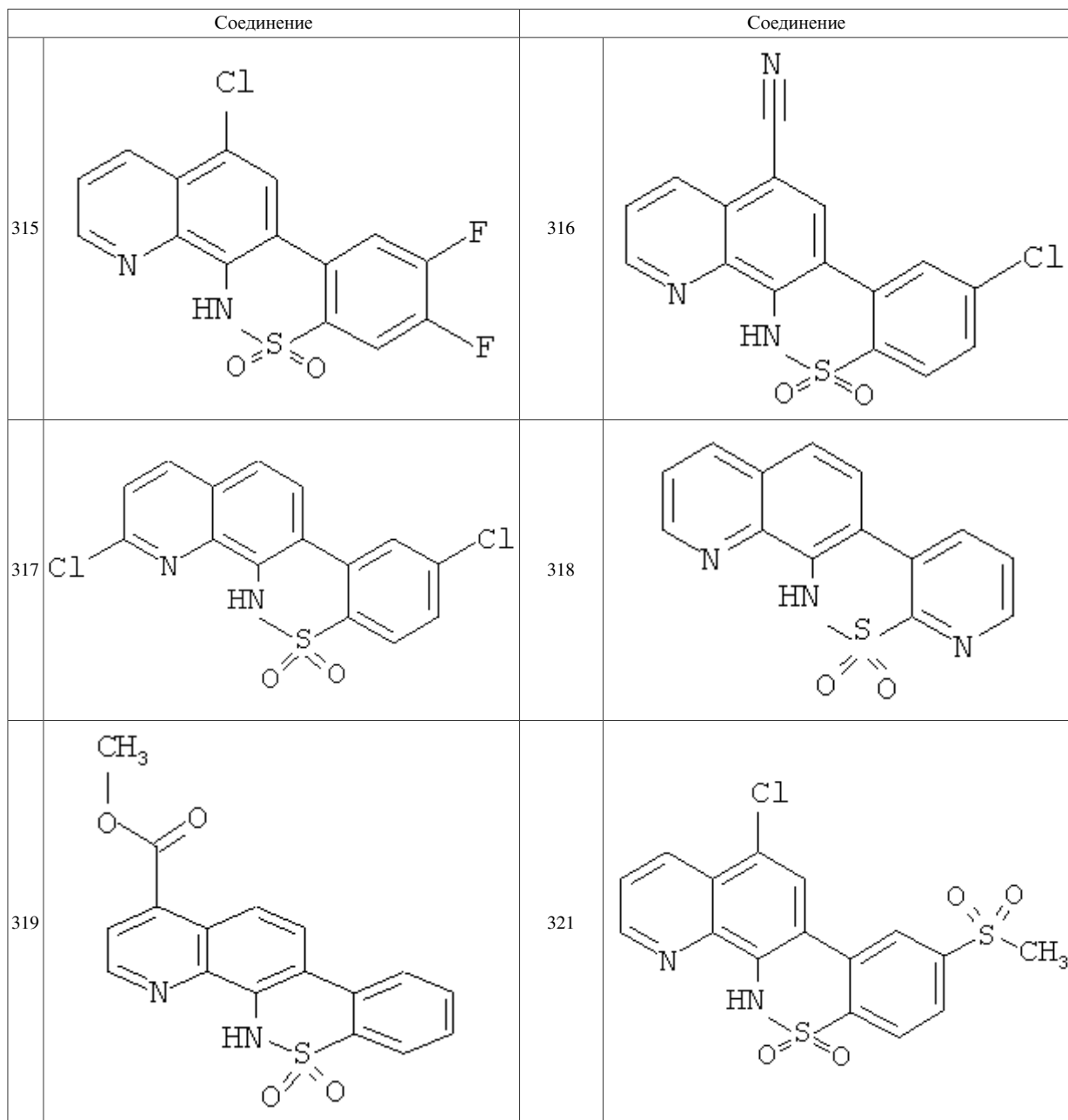
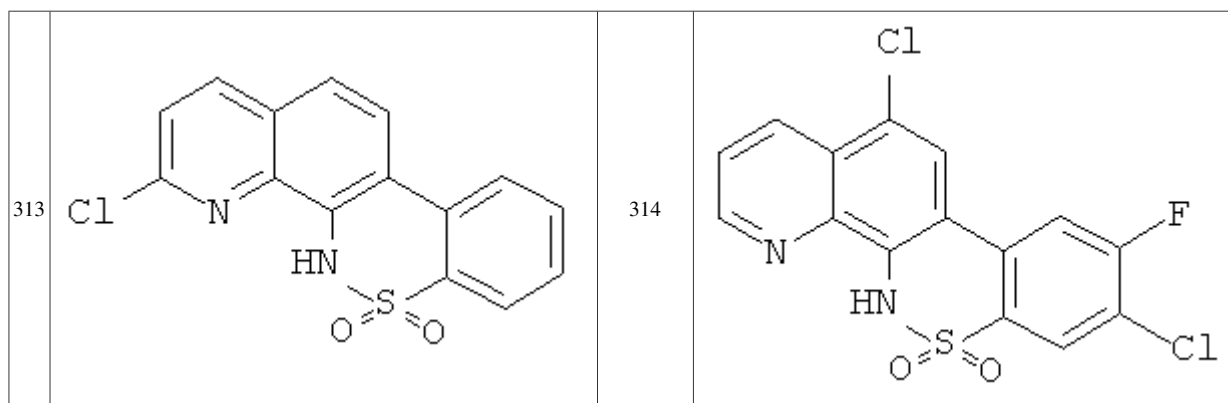
- атома водорода,
 - обязательно замещенного алкила, и
 - обязательно замещенного арила и
 - обязательно замещенного гетероциклила;
- или их фармацевтически приемлемые соли.

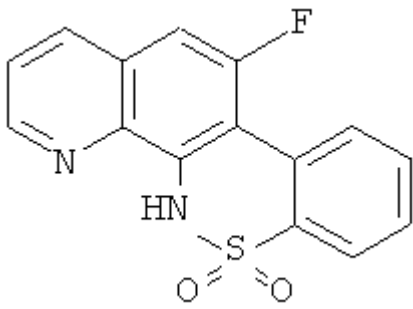
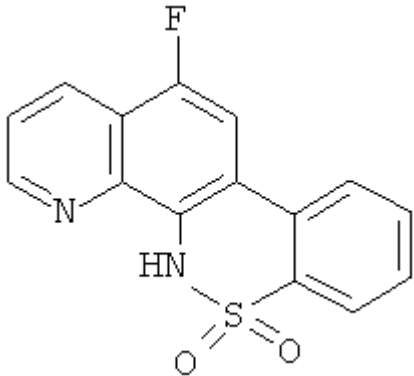
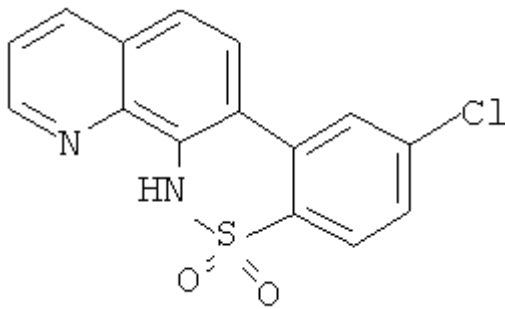
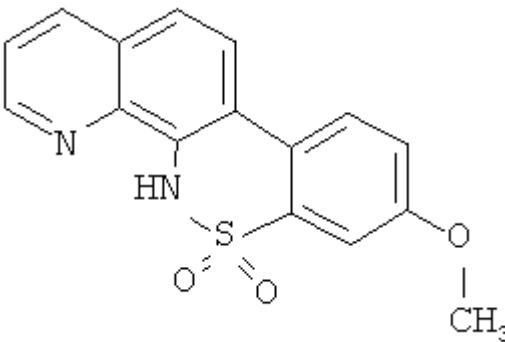
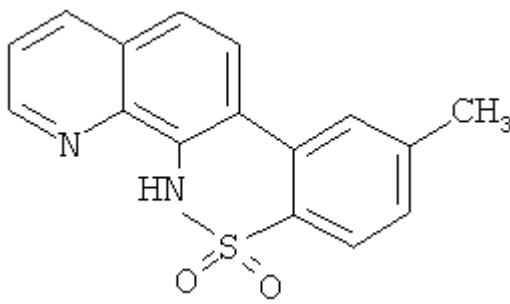
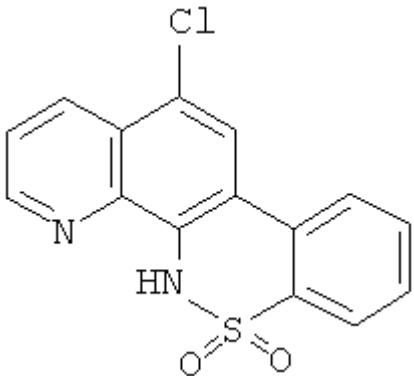
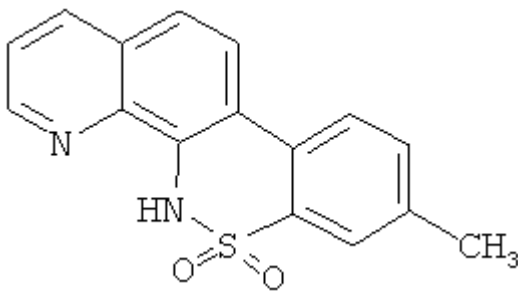
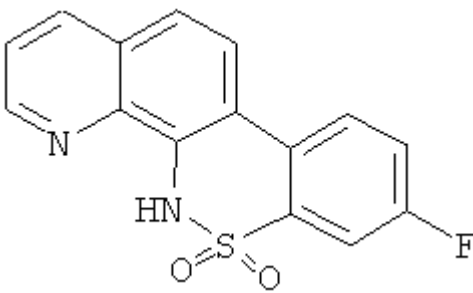
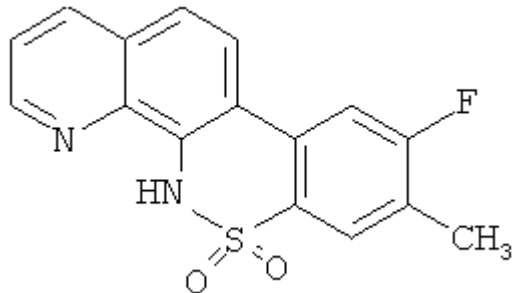
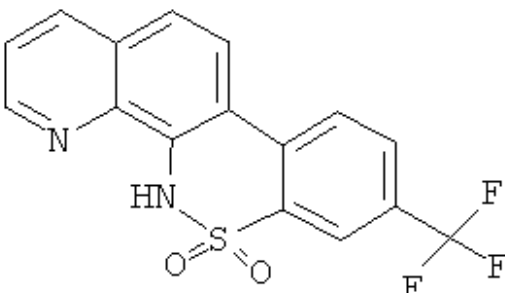
4. Соединения по п.1, выбранные из:

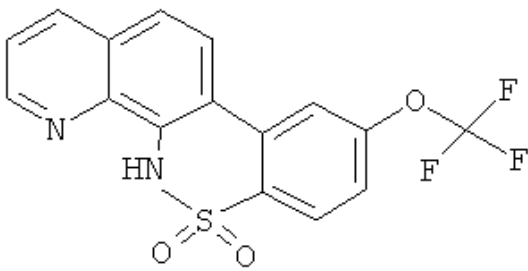
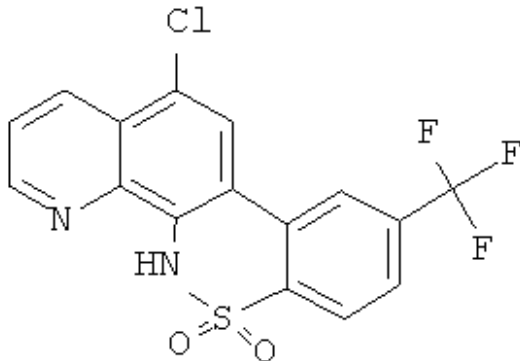
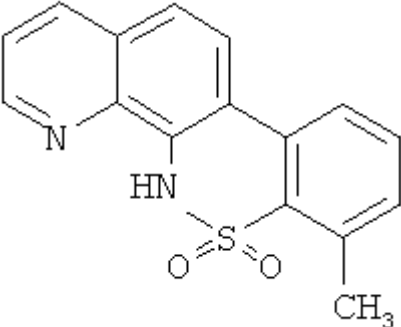
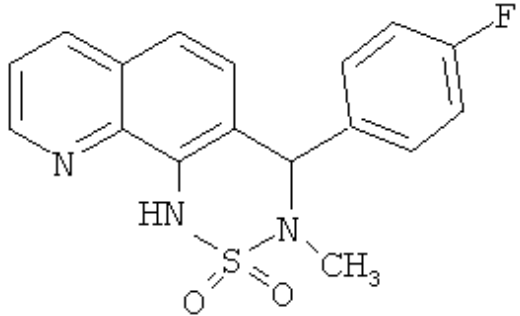
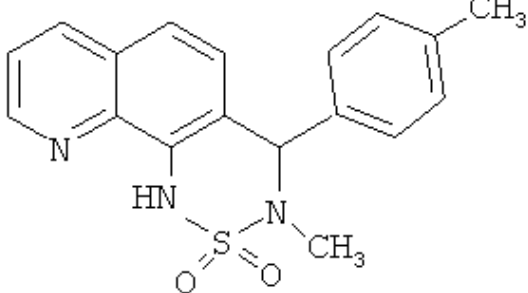
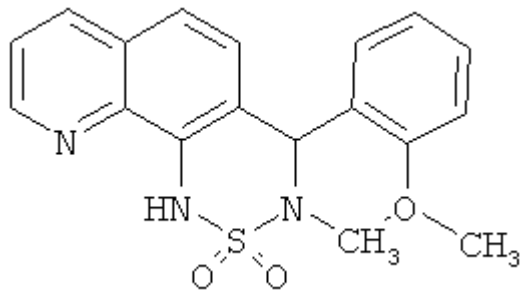
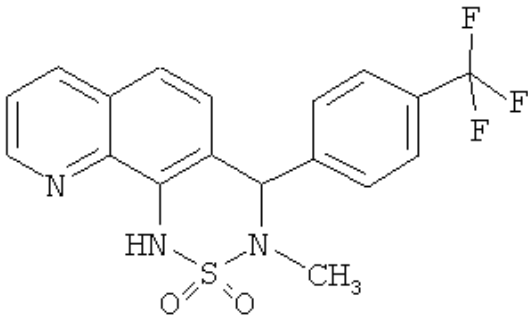
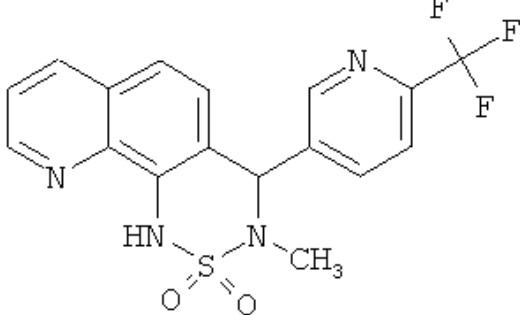
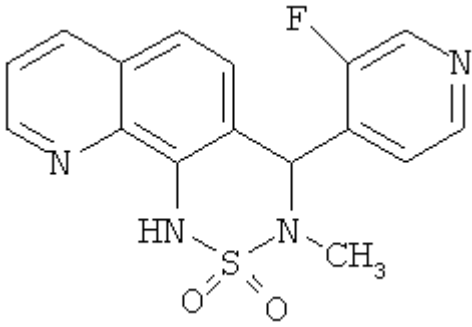
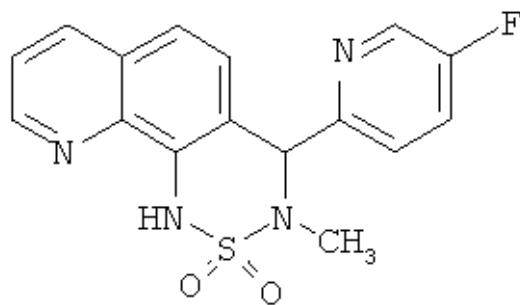
Соединение		Соединение	
2		3	
22		74	

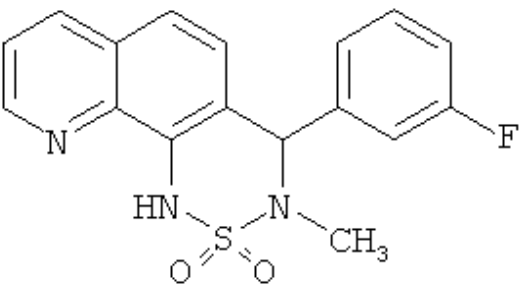
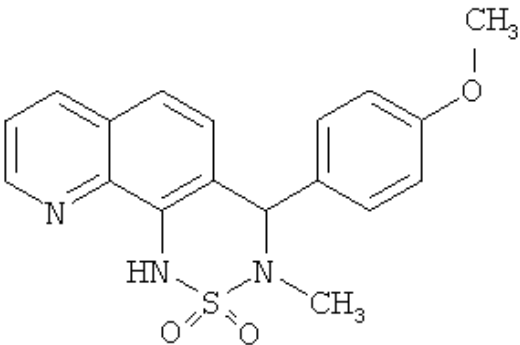
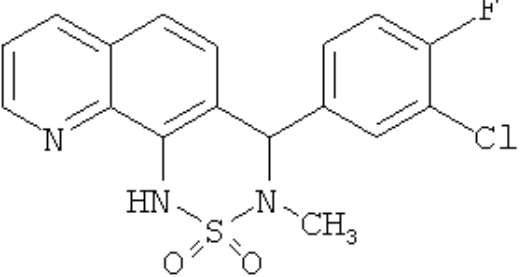
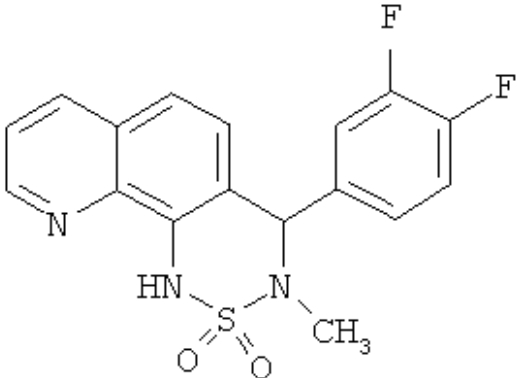
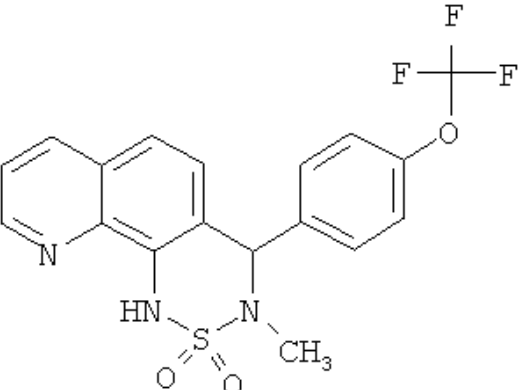
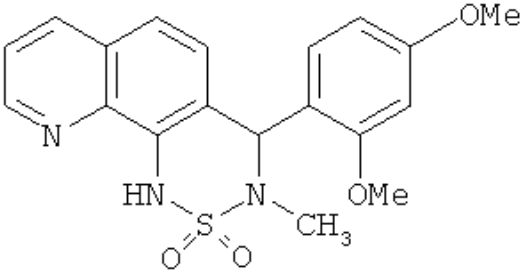
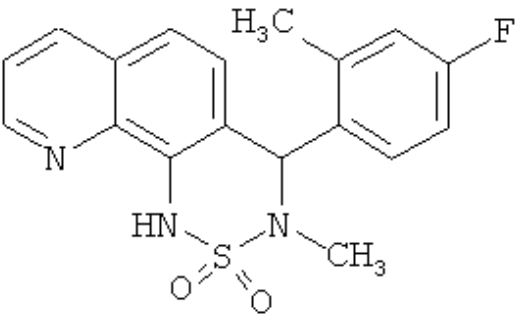
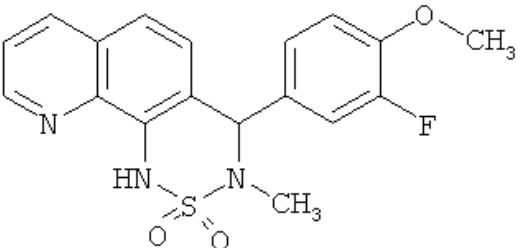
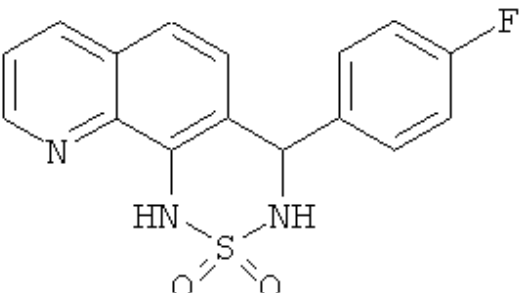
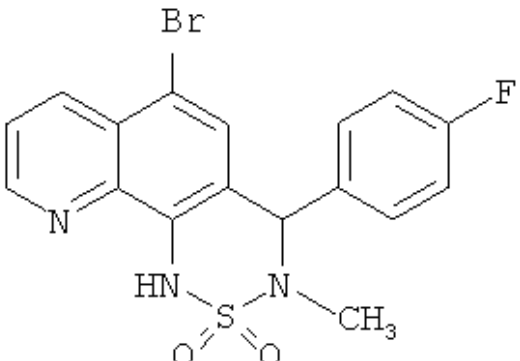
78		104	
105		106	
107		108	
109		113	
114		115	

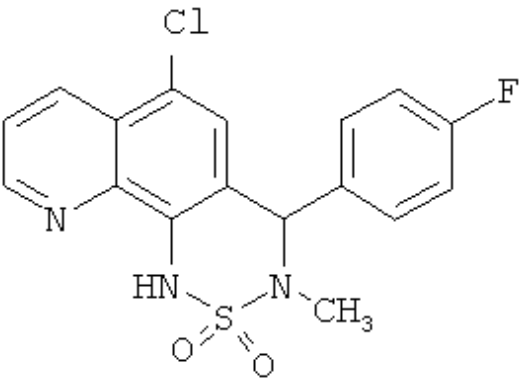
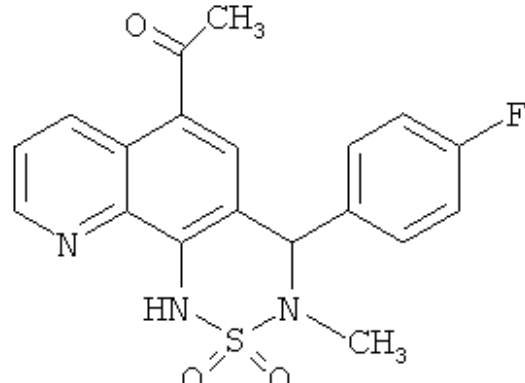
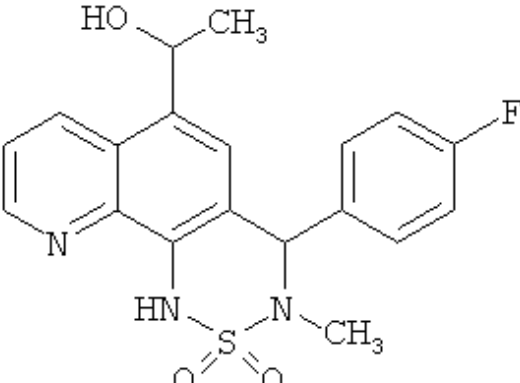
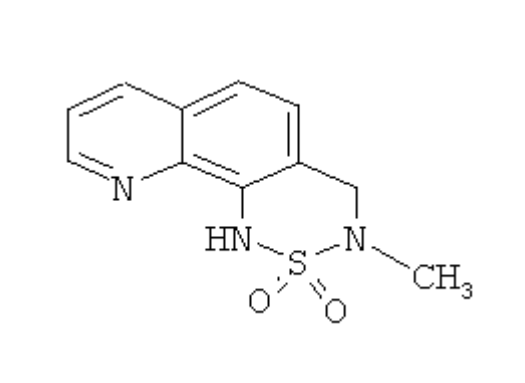
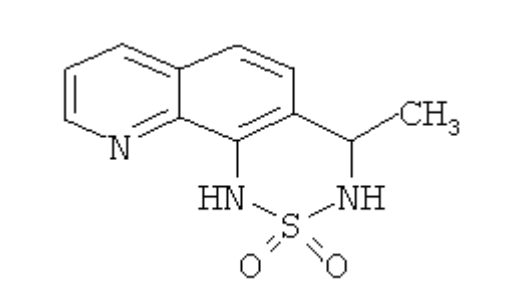
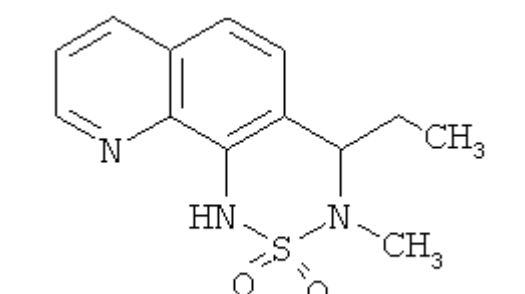
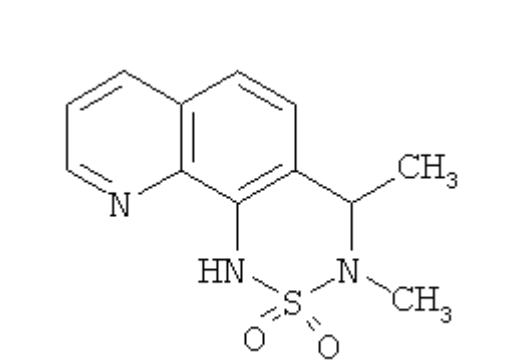
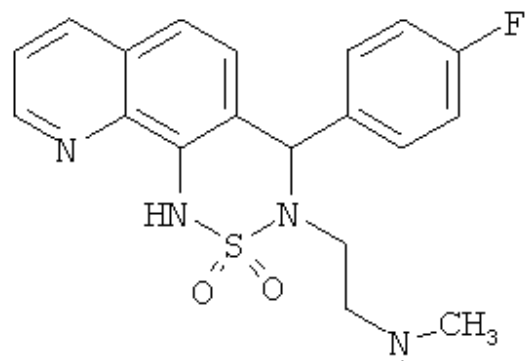
305		306	
307		308	
309		310	
311		312	

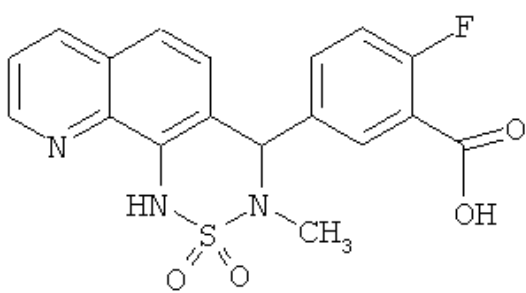
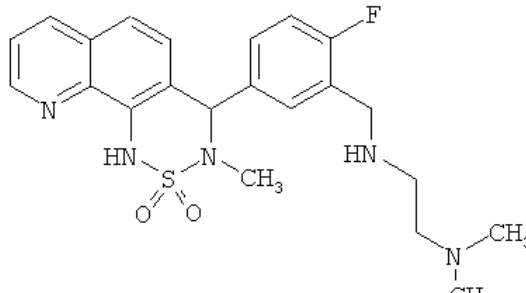
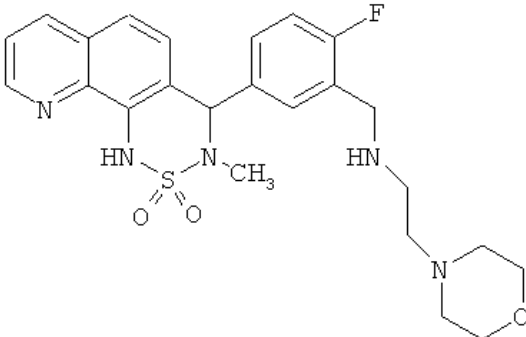
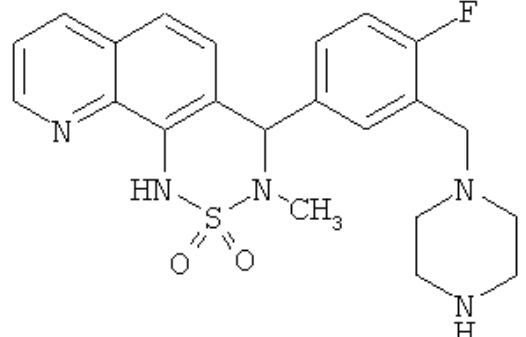


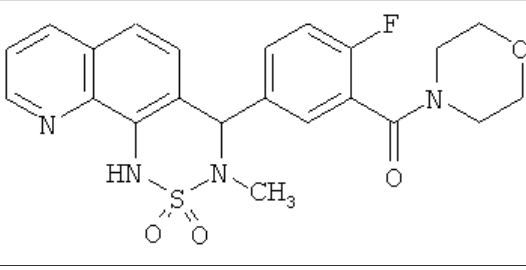
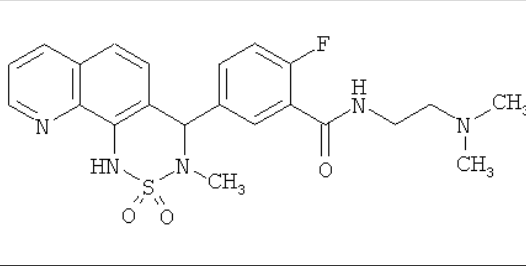
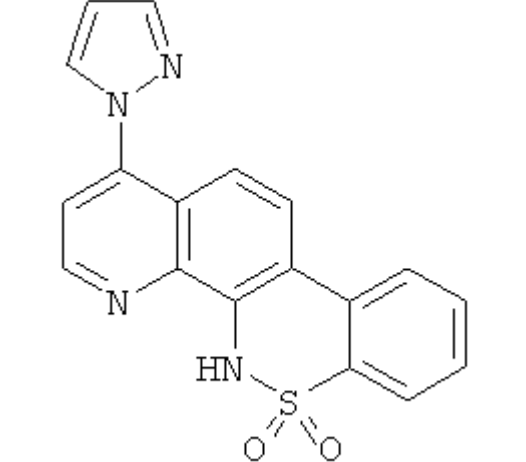
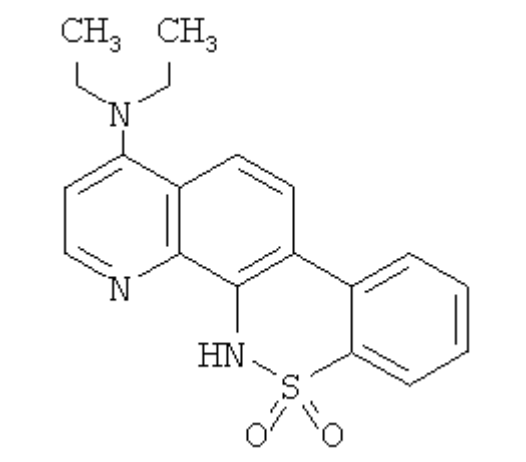
323		324	
325		326	
327		328	
Соединение		Соединение	
329		330	
331		332	

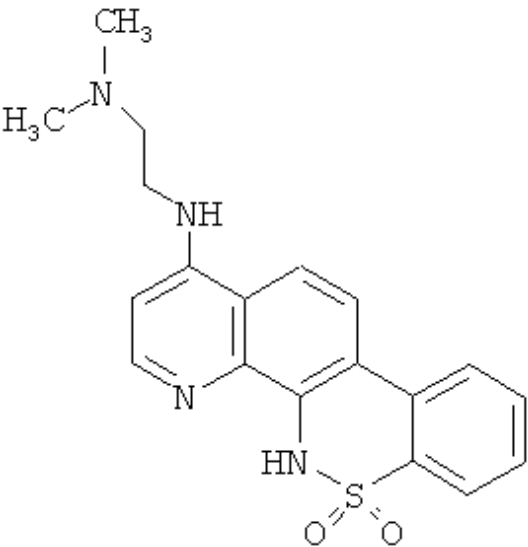
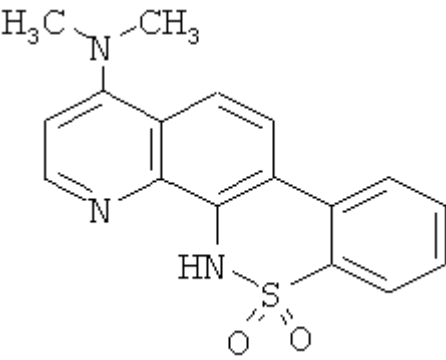
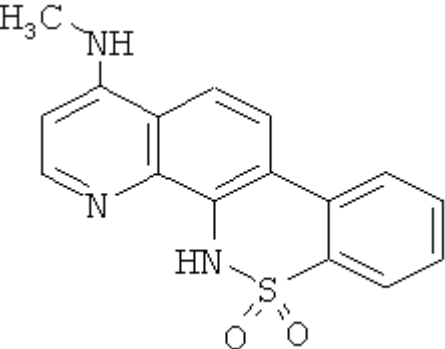
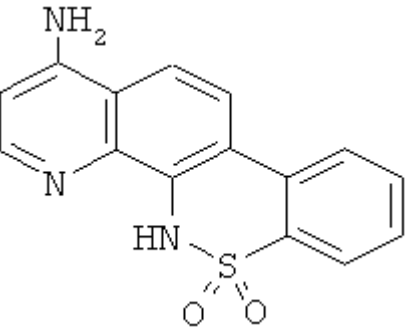
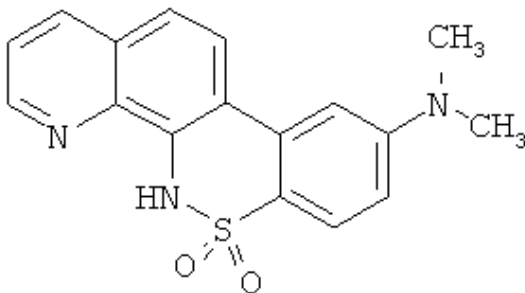
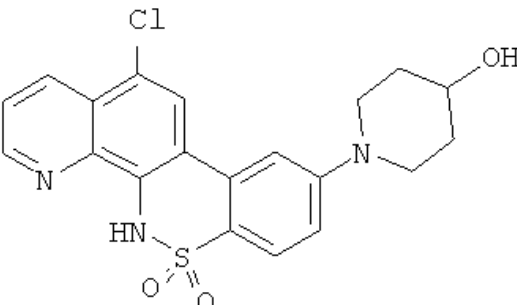
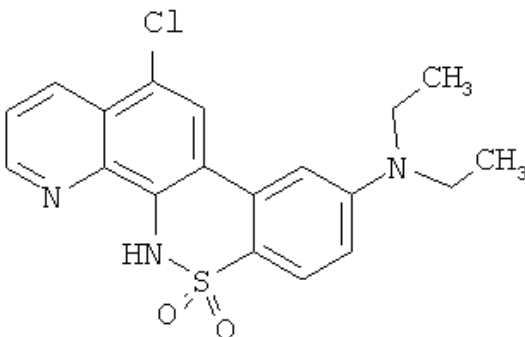
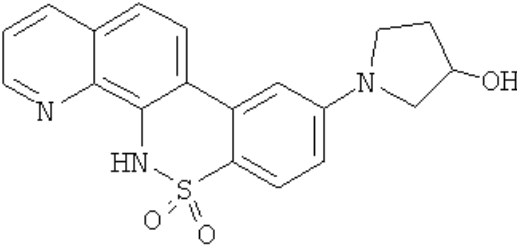
333		334	
335		382	
383		384	
385		386	
Соединение		Соединение	
387		388	

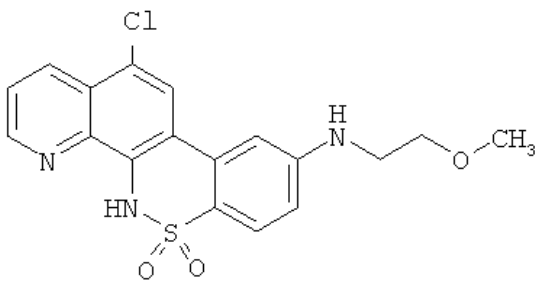
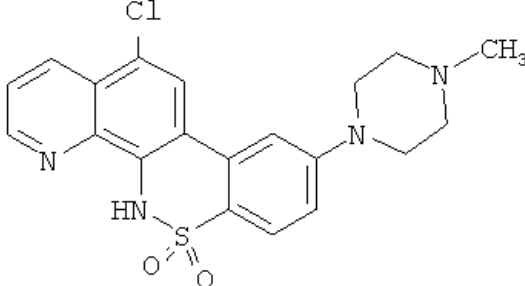
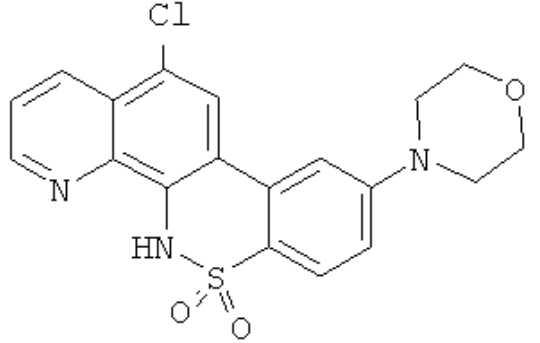
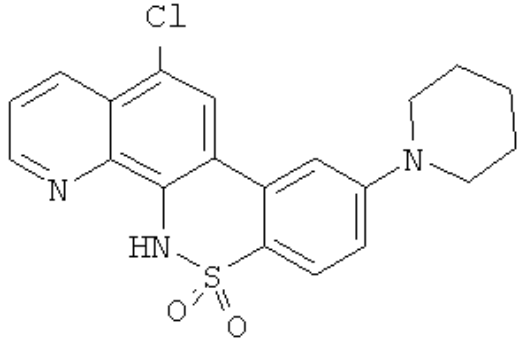
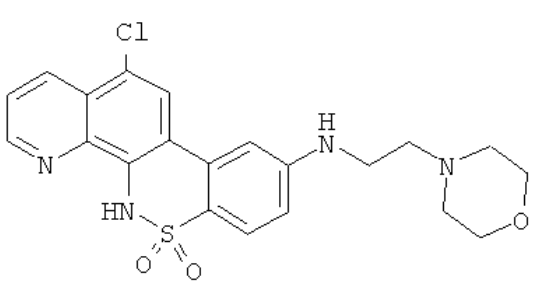
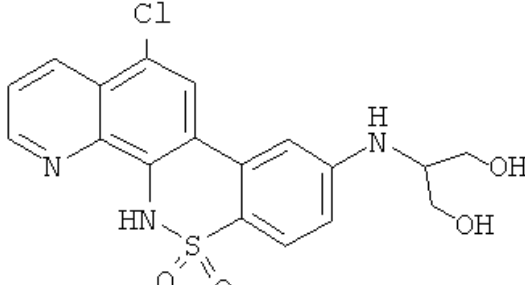
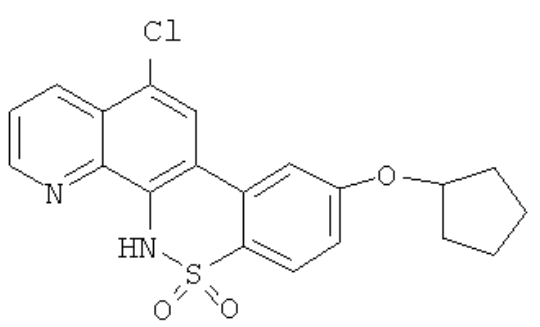
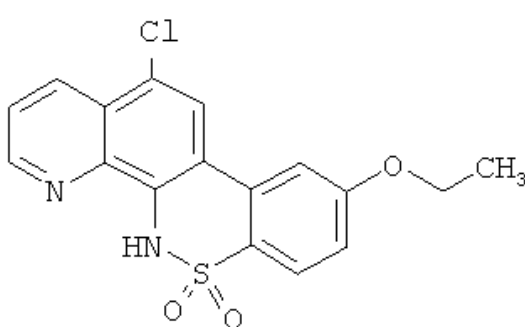
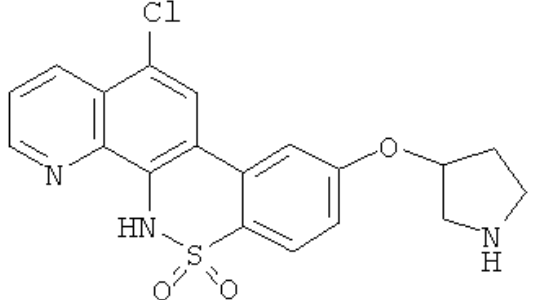
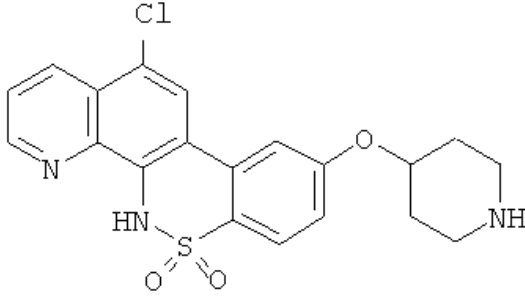
389		390	
391		392	
393		394	
395		396	
398		399	

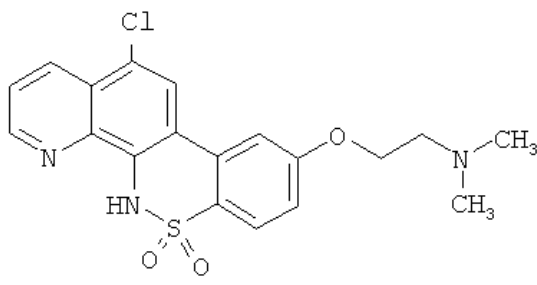
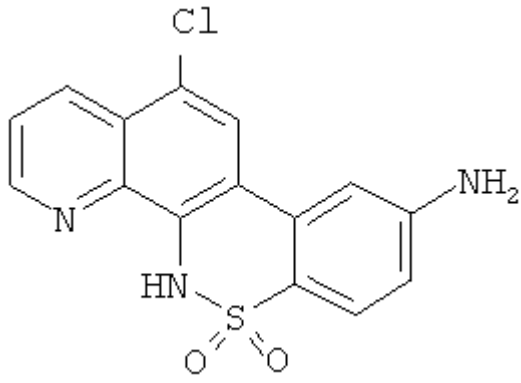
Соединение		Соединение	
401		402	
403		405	
407		412	
413		416	

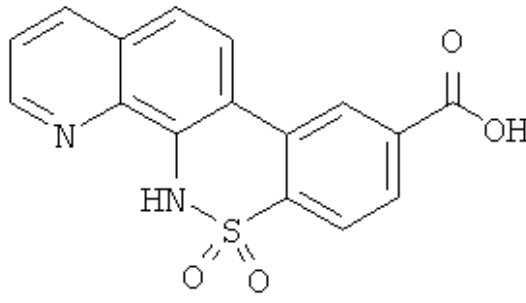
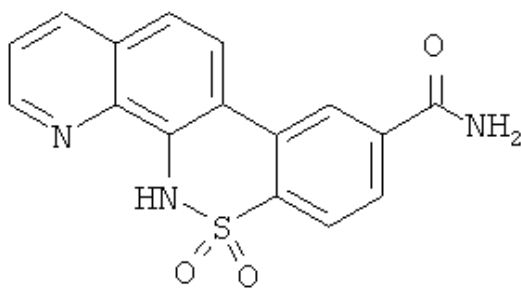
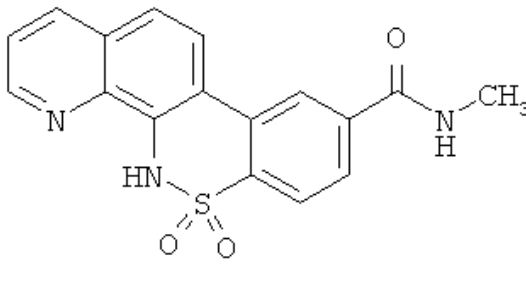
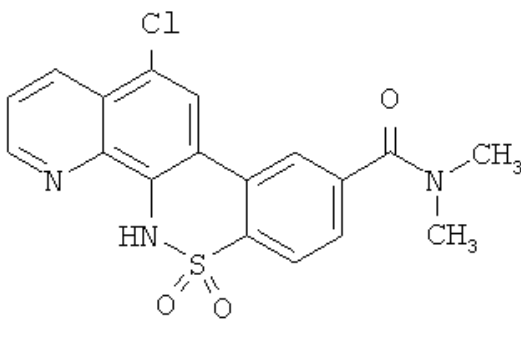
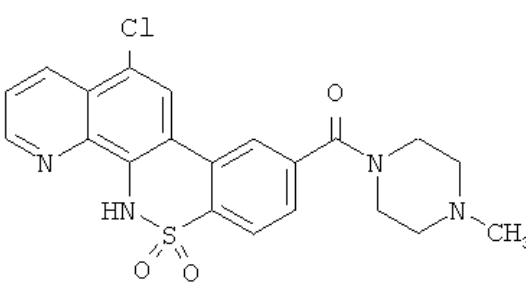
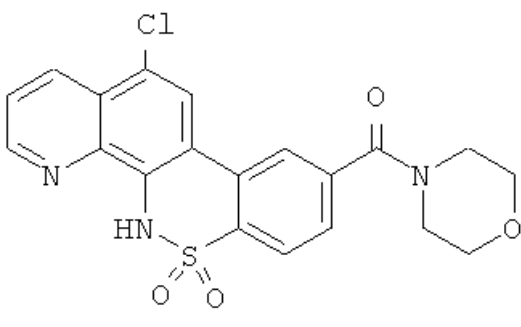
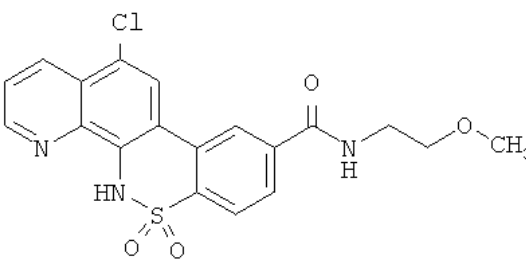
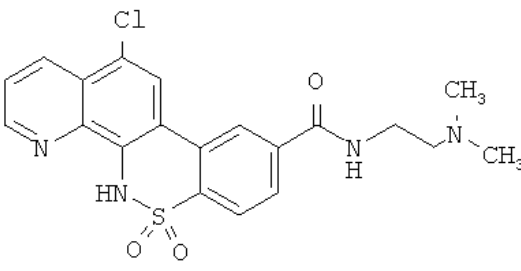
424		425	
426		427	

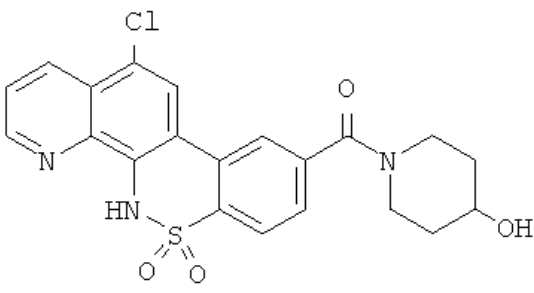
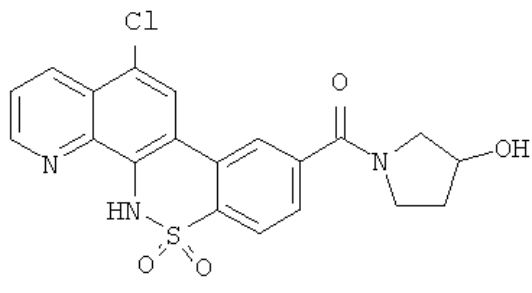
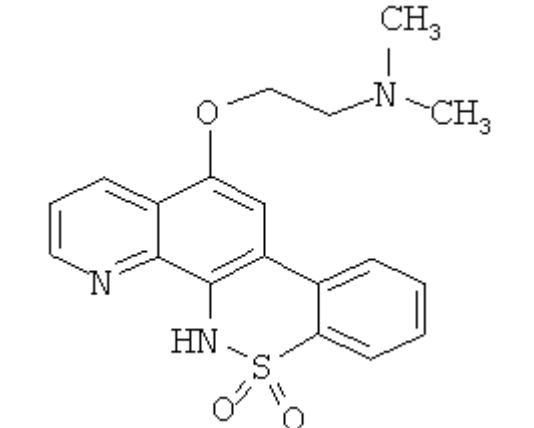
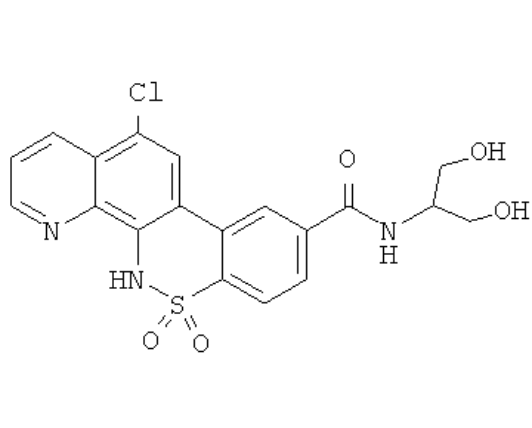
Соединение		Соединение	
428		429	
494		495	

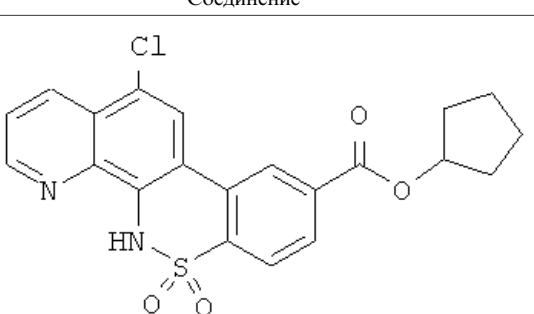
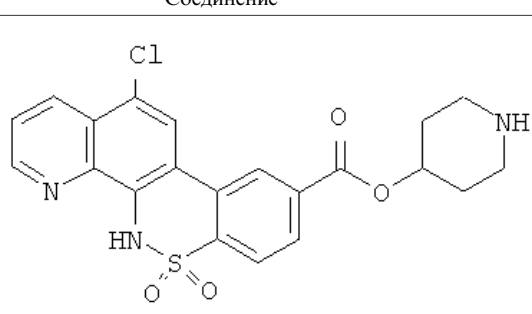
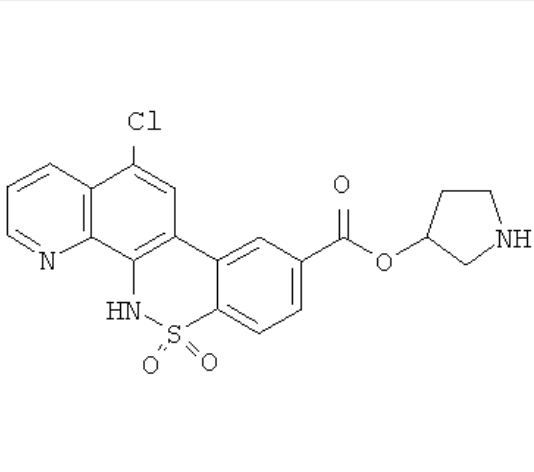
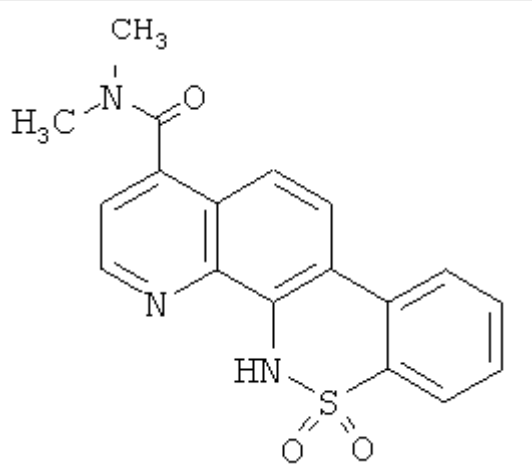
496		497	
498		499	
502		504	
505		506	
Соединение		Соединение	

507		508	
509		510	
511		512	
514		515	
516		517	

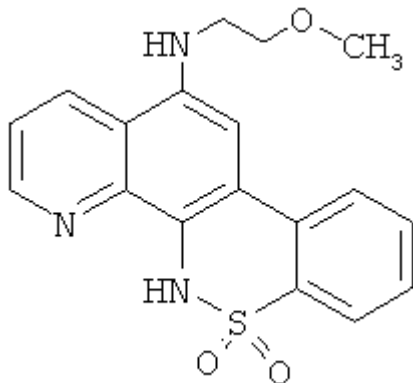
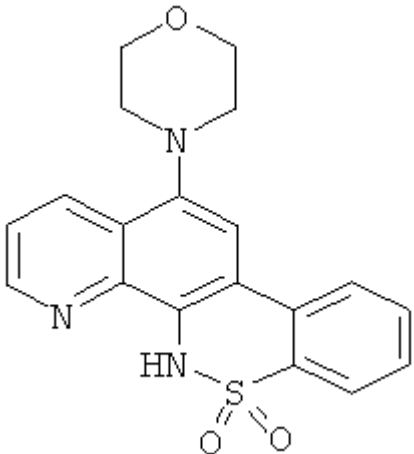
518		519	
-----	-----------------------------------------------------------------------------------	-----	------------------------------------------------------------------------------------

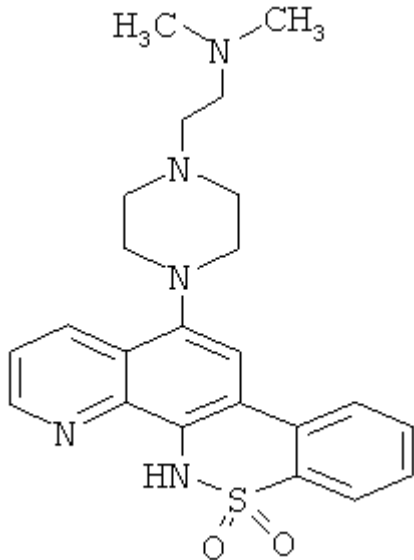
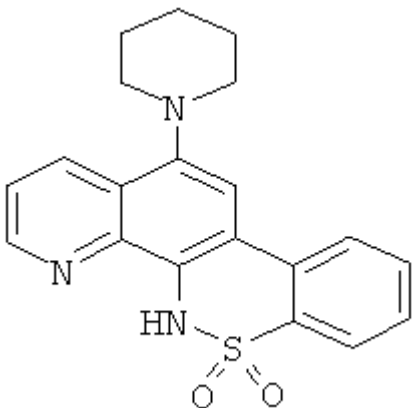
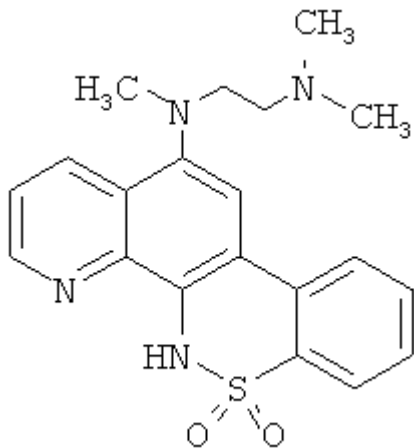
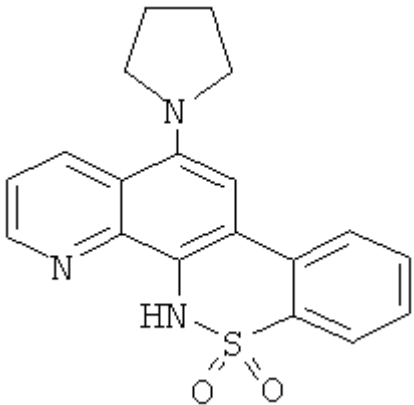
Соединение		Соединение	
520		521	
522		525	
526		527	
528		529	

530		531	
562		532	

Соединение		Соединение	
533		536	
537		541	

542	 <chem>CNC(=O)c1ccc2c(c1)c3ccccc3n2S(=O)(=O)N</chem>	543	 <chem>NC(=O)c1ccc2c(c1)c3ccccc3n2S(=O)(=O)N</chem>
544	 <chem>C1CCN(CC1)CCNC(=O)c1ccc2c(c1)c3ccccc3n2S(=O)(=O)N</chem>	545	 <chem>Brc1ccc2c(c1)c3ccccc3n2S(=O)(=O)N</chem>
546	 <chem>CN(C)CCNC(=O)c1ccc2c(c1)c3ccccc3n2S(=O)(=O)N</chem>	547	 <chem>C1CCN(CC1)CCNC(=O)c1ccc2c(c1)c3ccccc3n2S(=O)(=O)N</chem>

548		549	
-----	-----------------------------------------------------------------------------------	-----	------------------------------------------------------------------------------------

Соединение		Соединение	
550		551	
552		553	

554		555	
556		557	
560		561	
572		589	

или их фармацевтически приемлемые соли.

5. Соединения по одному или нескольким из пп. 1-4, предназначенные для применения в лечении нарушений метаболизма железа, выбранных из группы, включающей заболевания, вызванные дефицитом железа, и/или анемии, в частности анемии при раковых заболеваниях, анемии вследствие химиотерапии, анемии, вызванные

воспалением (AI), анемии при застойной сердечной недостаточности (CHF; хроническая сердечная недостаточность), анемии при хронической почечной недостаточности 3-5 стадии (CDK 3-5; хроническая болезнь почек 3-5 стадии), анемии, вызванные хроническим воспалением (ACD), анемии при ревматоидном артрите (RA), анемии при системной красной волчанке (SLE) и анемии при воспалительных заболеваниях кишечника (IBD, воспалительная болезнь кишечника).

6. Композиция, содержащая одно или более соединений по одному или нескольким из пп.1-5 и один или несколько фармацевтических носителей и/или вспомогательных соединений и/или растворителей.

7. Комбинированный препарат, содержащий одно или более соединений по одному или нескольким из пп.1-5 или композицию по п.6 и по меньшей мере одно дополнительное фармацевтически активное соединение, представляющее собой, в частности, соединение для лечения нарушений метаболизма железа и связанных с ними симптомов, предпочтительно железосодержащее соединение.

8. Соединения по одному или нескольким из пп.1-4, композиция по п.6 и комбинированные препараты по п.7, предназначенные для применения в качестве лекарственного средства для перорального или парэнтерального введения.

RU 2013142448 A

RU 2013142448 A