

(12) МЕЖДУНАРОДНАЯ ЗАЯВКА, ОПУБЛИКОВАННАЯ В СООТВЕТСТВИИ С
ДОГОВОРом О ПАТЕНТНОЙ КООПЕРАЦИИ (РСТ)

(19) Всемирная Организация
Интеллектуальной Собственности
Международное бюро



(10) Номер международной публикации
WO 2012/173521 A3

(43) Дата международной публикации
20 декабря 2012 (20.12.2012)

WIPO | PCT

(51) Международная патентная классификация:

C07D 401/06 (2006.01) C07D 487/04 (2006.01)
C07D 401/14 (2006.01) C07D 235/04 (2006.01)
C07D 403/06 (2006.01) C07D 409/10 (2006.01)
C07D 403/10 (2006.01) A61P 35/00 (2006.01)
C07D 403/14 (2006.01) A61K 31/416 (2006.01)
C07D 471/04 (2006.01) A61K 31/4162 (2006.01)

(OBSCHESTVO S OGRANICHENNOY OTVETSTVENNOSTYU "FUSION PHARMA") [RU/RU]; ул. Генерала Дорохова, 18/2, Москва, 119530, Moscow (RU).

(72) Изобретатели; и

(75) Изобретатели/Заявители (только для US): ЧИПОВ, Гермес Григорьевич (CHILOV, Germes Grigorievich) [RU/RU]; ул. Дружбы, Домодедово, Московская обл., 142003, Domodedovo (RU). ТИТОВ, Илья Юрьевич (TITOV, Ilya Yurievich) [RU/RU]; ул. Сайкина, 21-37, Москва, 115432, Moscow (RU).

(21) Номер международной заявки: PCT/RU2012/000423

(22) Дата международной подачи: 29 мая 2012 (29.05.2012)

(25) Язык подачи: Русский

(26) Язык публикации: Русский

(30) Данные о приоритете: 2011124304 16 июня 2011 (16.06.2011) RU

(71) Заявитель (для всех указанных государств, кроме US):
ОБЩЕСТВО С ОГРАНИЧЕННОЙ
ОТВЕТСТВЕННОСТЬЮ "ФБЮЖН ФАРМА"

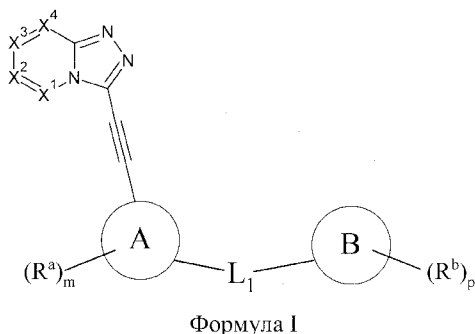
(74) Агент: КОРНИЕНКО, Елена Викторовна (KORNIENKO, Elena Viktorovna); а/я 67, Москва, 127562, Moscow (RU).

(81) Указанные государства (если не указано иначе, для каждого вида национальной охраны): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO,

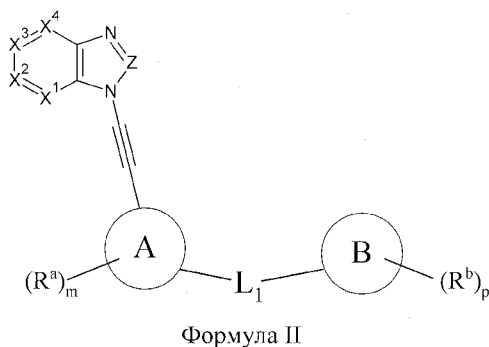
[продолжение на следующей странице]

(54) Title: PROTEIN KINASE INHIBITORS (VARIANTS), USE THEREOF IN TREATING ONCOLOGICAL DISEASES AND A PHARMACEUTICAL COMPOSITION BASED THEREON

(54) Название изобретения : ИНГИБИТОРЫ ПРОТЕИНКИНАЗ (ВАРИАНТЫ), ИХ ПРИМЕНЕНИЕ ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ ОНКОЛОГИЧЕСКИХ ЗАБОЛЕВАНИЙ И ФАРМАЦЕВТИЧЕСКАЯ КОМПОЗИЦИЯ НА ИХ ОСНОВЕ



Формула I



Формула II

(57) Abstract: The present invention relates to the treatment of oncological, chronic inflammatory and similar diseases with the aid of new families of chemical compounds having improved efficiency with regard to the inhibition of Abl kinase and mutant forms thereof, as well as other therapeutically significant kinases. It describes protein kinase inhibitors in the form of compounds of general formula (I) and compounds of general formula (II), or a tautomer, an individual isomer, a mixture of isomers, a pharmaceutically acceptable salt, a solvate or a hydrate thereof.

(57) Реферат: Данное изобретение касается терапии онкологических, хронических воспалительных и прочих заболеваний с помощью новых семейств химических соединений, обладающих повышенной эффективностью в ингибировании Abl-киназы и ее мутантных форм, а также других терапевтически значимых киназ. Описаны ингибиторы протеинкиназ, представляющие собой соединения с общей формулой (I), а также соединения общей формулы (II). их таутомеры, индивидуальный изомер или смесь изомеров, их фармацевтически приемлемая соль, сольват или гидрат.



DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(84) Указанные государства (если не указано иначе, для каждого вида региональной охраны): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), евразийский (AM, AZ, BY, KG, KZ,

RU, TJ, TM), европейский патент (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Опубликована:

— с отчётом о международном поиске (статья 21.3)

(88) Дата публикации отчёта о международном поиске:
28 марта 2013

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/RU 2012/000423

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER		
See additional sheet		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED		
Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)		
C07D 401/06, 401/14, 403/06, 403/10, 403/14, 471/04, 487/04, 235/04, 409/10, A61P 35/00, A61K 31/416, 31/4162		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)		
STN, PatSearch, RUPAT, Esp@cenet		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 2007/075869 A2 (APJAD PHARMACEUTICALS, INC.) 05.07.2007, the claims	1-16(1), 16(2)
A	RU 2340611 C2 (VERTEKS FARMASIUTIKALZ INKORPOREITED) 10.12.2008	1-16(1), 16(2)
☐ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☒ See patent family annex.		
* Special categories of cited documents: "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier application or patent but published on or after the international filing date "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art "&" document member of the same patent family		
Date of the actual completion of the international search		Date of mailing of the international search report
12 October 2012 (12.10.2012)		13 December 2012 (13.12.2012)
Name and mailing address of the ISA/		Authorized officer
Facsimile No.		Telephone No.

CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

C07D 401/06 (2006.01)
C07D 401/14 (2006.01)
C07D 403/06 (2006.01)
C07D 403/10 (2006.01)
C07D 403/14 (2006.01)
C07D 471/04 (2006.01)
C07D 487/04 (2006.01)
C07D 235/04 (2006.01)
C07D 409/10 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)
A61K 31/416 (2006.01)
A61K 31/4162 (2006.01)

ОТЧЕТ О МЕЖДУНАРОДНОМ ПОИСКЕ

Номер международной заявки

PCT/RU 2012/000423

A. КЛАССИФИКАЦИЯ ПРЕДМЕТА ИЗОБРЕТЕНИЯ		<i>C07D 401/06 (2006.01)</i> <i>C07D 401/14 (2006.01)</i> <i>C07D 403/06 (2006.01)</i> <i>C07D 403/10 (2006.01)</i> <i>C07D 403/14 (2006.01)</i> <i>C07D 471/04 (2006.01)</i> <i>C07D 487/04 (2006.01)</i> <i>C07D 235/04 (2006.01)</i> <i>C07D 409/10 (2006.01)</i> <i>A61P 35/00 (2006.01)</i> <i>A61K 31/416 (2006.01)</i> <i>A61K 31/4162 (2006.01)</i>
Согласно Международной патентной классификации МПК		
B. ОБЛАСТЬ ПОИСКА		
Проверенный минимум документации (система классификации с индексами классификации)		
C07D 401/06, 401/14, 403/06, 403/10, 403/14, 471/04, 487/04, 235/04, 409/10, A61P 35/00, A61K 31/416, 31/4162		
Другая проверенная документация в той мере, в какой она включена в поисковые подборки		
Электронная база данных, использовавшаяся при поиске (название базы и, если, возможно, используемые поисковые термины)		
STN, PatSearch, RUPAT, Esp@cenet		
C. ДОКУМЕНТЫ, СЧИТАЮЩИЕСЯ РЕЛЕВАНТНЫМИ:		
Категория*	Цитируемые документы с указанием, где это возможно, релевантных частей	Относится к пункту №
X	WO 2007/075869 A2 (ARIAD PHARMACEUTICALS, INC.) 05.07.2007, формула	1-16(1), 16(2)
A	RU 2340611 C2 (ВЕРТЕКС ФАРМАСЬЮТИКАЛЗ ИНКОРПОРЕЙТЕД) 10.12.2008	1-16(1), 16(2)
☐ последующие документы указаны в продолжении графы C. ☐ данные о патентах-аналогах указаны в приложении		
* Особые категории ссылочных документов:	"Т" более поздний документ, опубликованный после даты международной подачи или приоритета, но приведенный для понимания принципа или теории, на которых основывается изобретение	
"А" документ, определяющий общий уровень техники и не считающийся особо релевантным	"Х" документ, имеющий наиболее близкое отношение к предмету поиска; заявленное изобретение не обладает новизной или изобретательским уровнем, в сравнении с документом, взятым в отдельности	
"Е" более ранняя заявка или патент, но опубликованная на дату международной подачи или после нее	"У" документ, имеющий наиболее близкое отношение к предмету поиска; заявленное изобретение не обладает изобретательским уровнем, когда документ взят в сочетании с одним или несколькими документами той же категории, такая комбинация документов очевидна для специалиста	
"L" документ, подвергающий сомнению притязание(я) на приоритет, или который приводится с целью установления даты публикации другого ссылочного документа, а также в других целях (как указано)	"&" документ, являющийся патентом-аналогом	
"О" документ, относящийся к устному раскрытию, использованию, экспонированию и т.д.		
"Р" документ, опубликованный до даты международной подачи, но после даты испрашиваемого приоритета		
Дата действительного завершения международного поиска	Дата отправки настоящего отчета о международном поиске	
12 октября 2012 (12.10.2012)	13 декабря 2012 (13.12.2012)	
Наименование и адрес ISA/RU: ФИПС, РФ, 123995, Москва, Г-59, ГСП-5, Бережковская наб., 30-1 Факс: (499) 243-33-37	Уполномоченное лицо: О. Фокина Телефон № (495) 531-64-81	