РОССИЙСКАЯ ФЕДЕРАЦИЯ

(19) **RU** (11) **2012 141 706** (13) **A**

(51) МПК
C07D 413/14 (2006.01)

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21)(22) Заявка: **2012141706/04, 25.09.2012**

Приоритет(ы):
(30) Конвенционный приоритет:
07.06.2007 US 60/942,553
(62) Номер и дата подачи первоначальной заявки, из которой данная заявка выделена: **2009147708 23.12.2009**

(43) Дата публикации заявки: **27.03.2014** Бюл. № 9

Адрес для переписки:
191036, Санкт-Петербург, а/я 24, "НЕВИНПАТ"

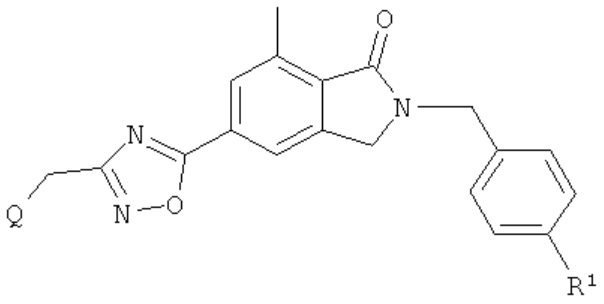
(71) Заявитель(и):
АстраЗенека АБ (SE)

(72) Автор(ы):
КЛЭЙТОН Джошуа (CA),
ЭГЛ Айан (CA),
ЭМПФИЛД Джеймс (US),
ФОЛМЕР Джеймс (US),
ИСААК Метеин (CA),
МА Фупенг (US),
СЛАССИ Абдельмалик (CA)

(54) ПРОИЗВОДНЫЕ ОКСАДИАЗОЛА И ИХ ПРИМЕНЕНИЕ В КАЧЕСТВЕ ПОТЕНЦИРУЮЩИХ СРЕДСТВ В ОТНОШЕНИИ МЕТАБОТРОПНЫХ ГЛУТАМАТНЫХ РЕЦЕПТОРОВ-842

(57) Формула изобретения

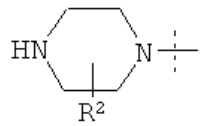
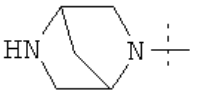
1. Соединение формулы I:



Формула I

где:

R^1 представляет собой галогено или C_{1-3}галогеноалкоксил;

Q представляет собой  или , и

R^2 представляет собой водород или C_{1-3}алкил;

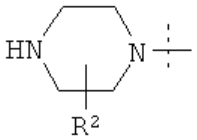
или его фармацевтически приемлемая соль, оптический изомер или комбинация указанного соединения или соли.

2. Соединение по п.1, где R^1 представляет собой хлоро, или его фармацевтически приемлемая соль, или оптический изомер указанного соединения или соли.

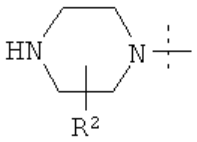
RU 2012141706 A

RU 2012141706 A

3. Соединение по п.1, где R^1 представляет собой трифторметоксил, или его фармацевтически приемлемая соль, или оптический изомер указанного соединения или соли.

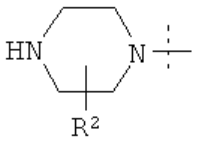
4. Соединение по п.1, где Q представляет собой  ; или его

фармацевтически приемлемая соль, или оптический изомер указанного соединения или соли.

5. Соединение по п.4, где Q представляет собой  ; а R^2 представляет

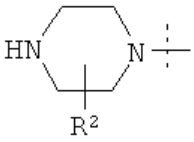
собой H, или его фармацевтически приемлемая соль, или оптический изомер указанного соединения или соли.

6. Соединение по п.1, где R^1 представляет собой хлоро, и Q представляет собой

 , или его фармацевтически приемлемая соль, или оптический изомер

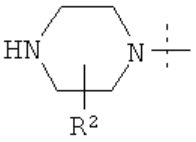
указанного соединения или соли.

7. Соединение по п.1, где R^1 представляет собой трифторметоксил, и Q представляет

собой  , или его фармацевтически приемлемая соль, или оптический изомер

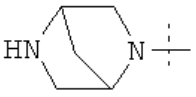
указанного соединения или соли.

8. Соединение по п.1, где R^1 представляет собой хлоро или трифторметоксил, Q

представляет собой  , где R^2 представляет собой H, или его

фармацевтически приемлемая соль, или оптический изомер указанного соединения или соли.

9. Соединение по п.1, где R^1 представляет собой хлоро или трифторметоксил, и Q

представляет собой  , или его фармацевтически приемлемая соль, или

оптический изомер указанного соединения или соли.

10. Соединение или его фармацевтически приемлемая соль по п.1, где соединение выбрано из:

7-метил-5-(3-пиперазин-1-илметил-[1,2,4]оксадиазол-5-ил)-2-(4-трифторметоксибензил)-2,3-дигидроизоиндол-1-она;

2-(4-хлорбензил)-5-[3-(2,5-диазабицикло[2.2.1]гепт-2-илметил-[1,2,4]оксадиазол-5-ил]-7-метил-2,3-дигидроизоиндол-1-она;

2-(4-хлорбензил)-7-метил-5-[3-(3-метилпиперазин-1-илметил)-[1,2,4]оксадиазол-5-ил]-2,3-дигидроизоиндол-1-она;

RU 2012141706 A

RU 2012141706 A

2-(4-хлорбензил)-7-метил-5-(3-пиперазин-1-илметил-[1,2,4]оксадиазол-5-ил)-2,3-дигидроизоиндол-1-она;

2-(4-хлорбензил)-7-метил-5-[3-(2-метилпиперазин-1-илметил-[1,2,4]оксадиазол-5-ил]-2,3-дигидроизоиндол-1-она или

2-(4-хлорбензил)-7-метил-5-[3-(2-метилпиперазин-1-илметил-[1,2,4]оксадиазол-5-ил]-2,3-дигидроизоиндол-1-она.

11. Фармацевтическая композиция, содержащая соединение или соль по любому из пп.1-10 и фармацевтически приемлемый носитель или эксципиент.

12. Соединение или соль по любому из пп.1-10 для применения в лечении субъекта, страдающего неврологическими или психиатрическими расстройствами, ассоциированными с глутаматной дисфункцией.

13. Соединение или соль для применения по п.12, где неврологическое или психиатрическое расстройство, ассоциированное с глутаматной дисфункцией, выбрано из болезни Альцгеймера, церебральных недостаточностей, вторичных по отношению к длительному эпилептическому статусу, толерантности к веществам, синдрома отмены вещества, психоза, шизофрении, тревоги, генерализованного тревожного расстройства, панического расстройства, социофобии, обсессивно-компульсивного расстройства и посттравматического стрессового расстройства (PTSD), расстройств настроения, депрессии, мании или биполярных расстройств.

14. Применение соединения или соли по любому из пп.1-10 в изготовлении лекарственного средства для терапии неврологических и психиатрических расстройств, ассоциированных с глутаматной дисфункцией.

15. Применение соединения или соли по п.14, где неврологические и психиатрические расстройства выбраны из болезни Альцгеймера, церебральных недостаточностей, вторичных по отношению к длительному эпилептическому статусу, толерантности к веществам, синдрома отмены вещества, психоза, шизофрении, тревоги, генерализованного тревожного расстройства, панического расстройства, социофобии, обсессивно-компульсивного расстройства и посттравматического стрессового расстройства (PTSD), расстройств настроения, депрессии, мании или биполярных расстройств.

RU 2012141706 A

RU 2012141706 A