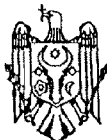


# REPUBLICA MOLDOVA



(19) Agenția de Stat  
pentru Proprietatea Intelectuală

(51) Int.Cl: C07D 405/10 (2006.01)  
C07D 405/12 (2006.01)  
A61K 31/4025 (2006.01)  
A61P 35/00 (2006.01)  
A61P 19/10 (2006.01)

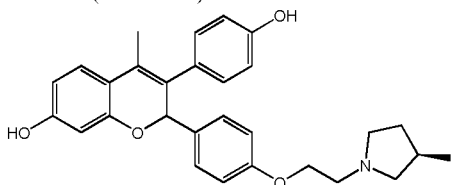
## (12) CERERE DE BREVET DE INVENȚIE

<p>(21) Nr. depozit: a 2014 0054</p> <p>(22) Data depozit: 2012.12.17</p> <p>(31) Nr.: 61/576890</p> <p>(32) Data: 2011.12.16</p> <p>(33) Țara: US</p> <p>(41) Data publicării cererii: 2014.10.31, BOPI nr. 10/2014</p>	<p>(13) A2</p> <p>(85) Data deschiderii fazei naționale în conformitate cu PCT, 2014.05.30</p> <p>(86) Cerere internațională PCT: PCT/US2012/070168, 2012.12.17</p> <p>(87) Publicare internațională: WO 2013/090921 A1, 2013.06.20</p>
<p>(71) Solicitant: OLEMA PHARMACEUTICALS, INC., US</p> <p>(72) Inventatori: KUSHNER Peter J., US; MYLES David C., US; HARMON Cyrus L., US; GALLAGHER Leslie Carol Hodges, US</p> <p>(74) Mandatar autorizat: GLAZUNOV Nicolae</p>	

### (54) Compuși noi de benzopiran, compoziții și utilizări ale acestora

#### (57) Rezumat:

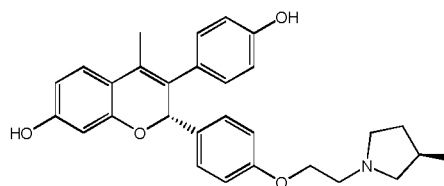
Sunt propuși compuși de benzopiran cu activitate antiestrogenică puternică și în mod esențial fără activitate estrogenică, care reprezintă 3-(4-hidroxifenil)-4-metil-2-(4-{2-[(3R)-3-metilpirolidin-1-il]etoxi}fenil)-2H-cromen-7-ol (OP-1038):



OP-1038

și enantiomerul (2S)-3-(4-hidroxifenil)-4-metil-2-(4-{2-[(3R)-3-metilpirolidin-1-il]etoxi}fenil)-2H-cromen-7-ol (OP-1074):

2



OP-1074

OP-1074 reprezintă un antiestrogen pur în urma testării în calitate de agonist și un antiestrogen complet, la testare în calitate de antagonist. Acești compuși sunt utili pentru tratamentul sau prevenirea diferitor stări care se modulează prin receptorul pentru estrogeni la mamifere, inclusiv la om.

Revendicări: 50

Figuri: 26

Șef secție:

IUSTIN Viorel

Examinator:

JOVMIR Tudor

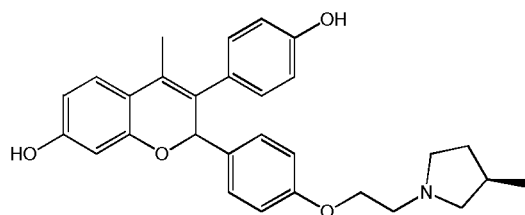
Redactor:

LOZOVANU Maria

## (54) Novel benzopyran compounds, compositions and uses thereof

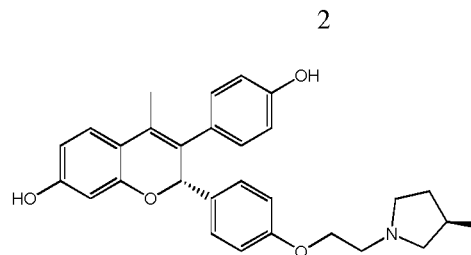
### (57) Abstract:

1  
Benzopyran compounds with strong anti-estrogenic activity and essentially no estrogenic activity are provided, which are 3-(4-hydroxyphenyl)-4-methyl-2-(4-{2-[(3R)-3-methylpyrrolidin-1-yl]ethoxy}phenyl)-2H-chromen-7-ol (OP-1038):



OP-1038

and the enantiomer (2S)-3-(4-hydroxyphenyl)-4-methyl-2-(4-{2-[(3R)-3-methylpyrrolidin-1-yl]ethoxy}phenyl)-2H-chromen-7-ol (OP-1074):



OP-1074

OP-1074 is a pure anti-estrogen when tested in the agonist mode and a complete anti-estrogen when tested in the antagonist mode. These compounds are useful for the treatment or prevention of a variety of conditions that are modulated through the estrogen receptor in mammals including humans.

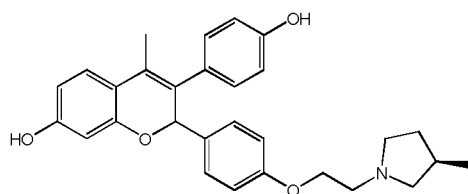
Claims: 50

Fig.: 26

## (54) Новые соединения бензопирана, композиции и их применение

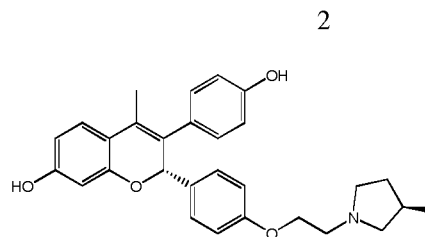
### (57) Реферат:

1  
Предложены бензопирановые соединения с сильной анти-эстрогенной активностью и по существу без эстрогенной активности, которые представляют собой 3-(4-гидроксифенил)-4-метил-2-(4-{2-[(3R)-3-метилпирролидин-1-ил]этокси}-фенил)-2H-хромен-7-ол (OP-1038):



OP-1038

и энантиомер (2S)-3-(4-гидроксифенил)-4-метил-2-(4-{2-[(3R)-3-метилпирролидин-1-ил]этокси}фенил)-2H-хромен-7-ол (OP-1074):



OP-1074

OP-1074 является чистым анти-эстрогеном при тестировании в качестве агониста и полным анти-эстрогеном при тестировании в качестве антагониста. Эти соединения полезны для лечения или предупреждения различных состояний, которые модулируются через рецептор эстрогенов, у млекопитающих, включая людей.

П. формулы: 50

Фиг.: 26