

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21)(22) Заявка: 2011126607/04, 01.12.2009

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
02.12.2008 ЕР 08170435.5

(43) Дата публикации заявки: 10.01.2013 Бюл. № 1

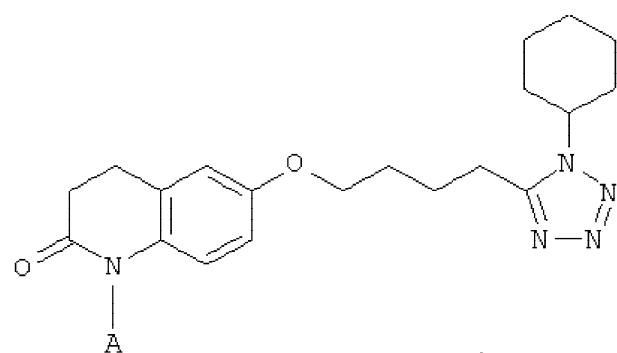
(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 04.07.2011(86) Заявка РСТ:
ЕР 2009/066159 (01.12.2009)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2010/063724 (10.06.2010)Адрес для переписки:
101000, Москва, М. Златоустинский пер., 10,
кв. 15, "ЕВРОМАРКПАТ"(71) Заявитель(и):
КАРДИОЛИНКС АГ (CH)(72) Автор(ы):
**ЗАРТОР Дирк (DE),
ШЕРХАГ Армин (CH)**

A

**(54) НИТРАТНЫЕ ПРОИЗВОДНЫЕ ЦИЛОСТАЗОЛА ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ СОСУДИСТЫХ
ЗАБОЛЕВАНИЙ И НАРУШЕНИЙ ОБМЕНА ВЕЩЕСТВ**

(57) Формула изобретения

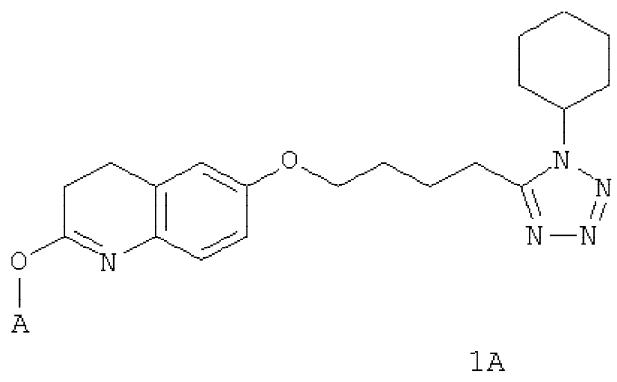
1. Соединение формулы 1 или 1A



RU

2011126607 A

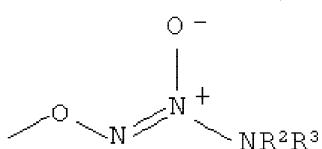
RU 2011126607 A



где А - представляет собой

- $(C=O)_a-(CH_2)_b-O-NO_2$;
- $(C=O)-(CH_2OCH_2)_cCH_2-O-NO_2$;
- $(CH_2CH_2O)_cCH_2CH_2-O-NO_2$; или
- $(C=O)_a-(CH_2)_d-CH[(CH_2)_e-O-NO_2]_2$;
- $(C=O)-NR^1-(CH_2)_b-O-NO_2$;
- $(C=O)-O-(CH_2)_b-O-NO_2$;
- $CH_2O-(C=O)-NR^1-(CH_2)_b-O-NO_2$;
- $CH_2O-(C=O)-O-(CH_2)_b-O-NO_2$; или
- $CH_2O-(C=O)-(CH_2)_b-O-NO_2$; и
- а - представляет собой 0 или 1;
- б - находится между 1 и 10;
- с - представляет собой 1, 2 или 3;
- д - представляет собой 0,1 или 2;
- е - находится между 1 и 4, и

R^1 - представляет собой H , C_{1-4} -алкил или $-CH_2O-(C=O)-NH-(CH_2)_b-O-NO_2$, и такие соединения, в которых $-O-NO_2$ заменено на



где R^2 и R^3 - оба представляют собой этил или 2-аминоэтил, или NR^2R^3 вместе представляют пирролидин, пиперидин, пiperазин или 4-метилпиперазин;

2. Соединение согласно п.1 формулы 1, где

А - представляет собой $(C=O)_a-(CH_2)_b-O-NO_2$; $-(C=O)-(CH_2OCH_2)_cCH_2-O-NO_2$; $-(CH_2CH_2O)_cCH_2CH_2-O-NO_2$; или $-(C=O)_a-(CH_2)_d-CH[(CH_2)_e-O-NO_2]_2$.

3. Соединение согласно п.1 формулы 1, где

А - представляет собой $-(C=O)_a-(CH_2)_b-O-NO_2$ или $-(C=O)_a-(CH_2)_d-CH[(CH_2)_e-O-NO_2]_2$ и

а - представляет собой 0 или 1, б находится между 1 и 6; д - представляет собой 0, 1 или 2 и е - представляет собой 1 или 2.

4. Соединение согласно п.1 формулы 1, где

А - представляет собой $-(C=O)_a-(CH_2)_b-O-NO_2$ или $-(C=O)_a-(CH_2)_d-CH[(CH_2)_e-O-NO_2]_2$ и

а - представляет собой 1; б - представляет собой 2, 3, 4 или 5; д - представляет собой 0 или 1; и е - представляет собой 1 или 2.

5. Соединение согласно п.1 формулы 1, где

А - представляет собой $-(C=O)_a-(CH_2)_d-CH[(CH_2)_e-O-NO_2]_2$, и а - представляет

собой 1, d - представляет собой 0 или 1, и e - представляет собой 1 или 2.

6. Соединение согласно п.1 формулы 1 или 1A, где

A - представляет собой $-(C=O)_a-(CH_2)_b-O-NO_2$; $-(C=O)_a-(CH_2)_d-CH[(CH_2)_e-O-NO_2]_2$;

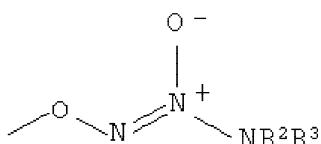
$-(C=O)-NR^1-(CH_2)_b-O-NO_2$; $-(C=O)-O-(CH_2)_b-O-NO_2$;

$-CH_2O-(C=O)-NR^1-(CH_2)_b-O-NO_2$; $-CH_2O-(C=O)-O-(CH_2)_b-O-NO_2$; или

$-CH_2O-(C=O)-(CH_2)_b-O-NO_2$;

a - представляет собой 0 или 1; b находится между 1 и 10; d - представляет собой 0, 1 или 2; e находится между 1 и 4;

R¹ - представляет собой H, C₁₋₄-алкил или $-CH_2O-(C=O)-NH-(CH_2)_b-O-NO_2$, и такие соединения, в которых $-O-NO_2$ заменено на



где R² и R³ оба представляют собой этил или 2-аминоэтил, или NR²R³ вместе представляют собой пирролидин, пиперидин, пиперазин или 4-метилпиперазин.

7. Соединение согласно п.1 формулы 1 или 1A, где

A - представляет собой $-(C=O)_a-(CH_2)_b-O-NO_2$; $-(C=O)_a-(CH_2)_d-CH[(CH_2)_e-O-NO_2]_2$;

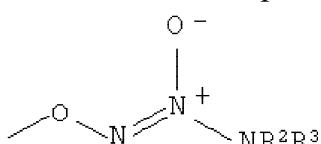
$-(C=O)-NR^1-(CH_2)_b-O-NO_2$; $-(C=O)-O-(CH_2)_b-O-NO_2$;

$-CH_2O-(C=O)-NR^1-(CH_2)_b-O-NO_2$; $-CH_2O-(C=O)-O-(CH_2)_b-O-NO_2$; или

$-CH_2O-(C=O)-(CH_2)_b-O-NO_2$;

a - представляет собой 0 или 1, b находится между 1 и 6; d - представляет собой 0, 1 или 2; e - представляет собой 1 или 2;

R¹ - представляет собой H, метил или $-CH_2O-(C=O)-NH-(CH_2)_b-O-NO_2$, и такие соединения, в которых $-O-NO_2$ заменено на



где R² и R³ оба представляют собой этил, или NR₂R₃ вместе представляют пирролидин.

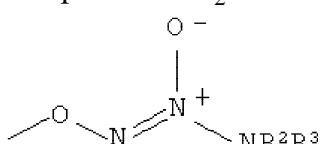
8. Соединение согласно п.1 формулы 1, где

A - представляет собой $-(C=O)_a-(CH_2)_b-O-NO_2$; $-(C=O)_a-(CH_2)_d-CH[(CH_2)_e-O-NO_2]_2$; или

$-CH_2O-(C=O)-NR^1-(CH_2)_b-O-NO_2$;

a - представляет собой 1; b - представляет собой 2, 3, 4 или 5; d - представляет собой 0 или 1; и e - представляет собой 1 или 2;

R¹ - представляет собой H или $-CH_2O-(C=O)-NH-(CH_2)_b-O-NO_2$; и такие соединения, в которых $-O-NO_2$ заменено на



где NR²R³ вместе представляют собой пирролидин.

9. Соединение согласно п.1 формулы 1, где

A - представляет собой $-(C=O)-CH_2-CH[CH_2-O-NO_2]_2$.

10. Соединение согласно п.1 формулы 1, где

A - представляет собой $-(C=O)-CH_2-CH_2-CH_2-O-NO_2$.

11. Соединение согласно п.1 формулы 1, где
A - представляет собой $-\text{CH}_2\text{O}-(\text{C}=\text{O})-\text{NH}-(\text{CH}_2)_2-\text{O}-\text{NO}_2$.
12. Соединение согласно п.1 формулы 1, где
A - представляет собой $-\text{CH}_2\text{O}-(\text{C}=\text{O})-\text{NR}^1-(\text{CH}_2)_2-\text{O}-\text{NO}_2$, и R^1 - представляет собой $-\text{CH}_2\text{O}-(\text{C}=\text{O})-\text{NH}-(\text{CH}_2)_2-\text{O}-\text{NO}_2$.
13. Фармацевтическая композиция, содержащая соединение по любому из пп.1-12.
14. Соединение по любому из пп.1-12 для лечения сосудистых заболеваний и нарушений обмена веществ.
15. Способ лечения сосудистых заболеваний и нарушений обмена веществ, который включает введение соединения по любому из пп.1-12 в количестве, эффективном против указанной болезни теплокровному животному, требующему такого лечения.