



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,  
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(51) МПК  
C07D 205/08 (2006.01)

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21), (22) Заявка: 2009120679/04, 18.10.2007

(30) Конвенционный приоритет:  
02.11.2006 DE 102006051655.9

(43) Дата публикации заявки: 10.12.2010 Бюл. № 34

(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную  
фазу: 02.06.2009

(86) Заявка РСТ:  
EP 2007/009018 (18.10.2007)

(87) Публикация РСТ:  
WO 2008/052658 (08.05.2008)

Адрес для переписки:  
129090, Москва, ул.Б.Спасская, 25, стр.3,  
ООО "Юридическая фирма Городисский и  
Партнеры", пат.пов. А.В.Мицу, рег.№ 364

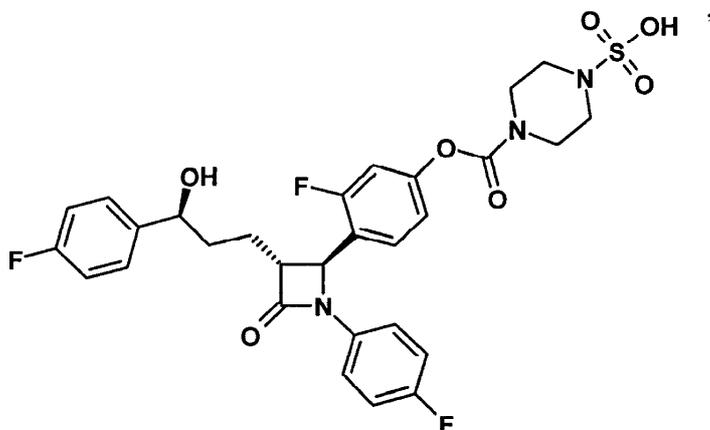
(71) Заявитель(и):  
**САНОФИ-АВЕНТИС ДОЙЧЛАНД  
ГМБХ (DE)**

(72) Автор(ы):  
**ЙЕНЕ Герхард (DE),  
ФРИК Венделин (DE),  
ЛИНДЕНШМИДТ Андреас (DE),  
ХОЙЕР Хуберт (DE),  
ШЕФЕР Ханс-Людвиг (DE),  
КРАМЕР Вернер (DE),  
ГРАФ Клаус-Дитер (DE),  
ШМИДЕР Вольфганг (DE)**

(54) **НОВЫЙ ДИФЕНИЛАЗЕТИДИНОН, ЗАМЕЩЕННЫЙ ПИПЕРАЗИН-1-СУЛЬФОКИСЛОТОЙ, ОБЛАДАЮЩИЙ УЛУЧШЕННЫМИ ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИМИ СВОЙСТВАМИ**

(57) Формула изобретения

1. Соединение формулы (I):



I

а также его фармацевтически приемлемые соли.

2. Лекарственное средство, содержащее соединение по п.1.

3. Лекарственное средство, содержащее соединение по п.1 и, по меньшей мере, одно другое биологически активное вещество.

4. Лекарственное средство по п.3, отличающееся тем, что в качестве другого биологически активного вещества оно содержит одно или несколько соединений, нормализующих липидный обмен.

5. Лекарственное средство по п.3 или 4, отличающееся тем, что в качестве другого биологически активного вещества оно содержит одно (один) или несколько антидиабетических средств, гипогликемических биологически активных веществ, средств против ожирения, подавляющих аппетит средств, ингибиторов HMGCoA-редуктазы, ингибиторов резорбции холестерина, агонистов PPAR-гамма, агонистов PPAR-альфа, агонистов PPAR-альфа/гамма, агонистов PPAR-дельта, частичных агонистов/антагонистов PPAR-гамма, фибратов, МТР-ингибиторов, СЕТР-ингибиторов, ангибиторов резорбции желчной кислоты, полимерных адсорберов желчной кислоты, индукторов LDL-рецептора, АСАТ-ингибиторов, антиоксидантов, витаминов, модуляторов липопротеинлипазы, ингибиторов АТФ-цитрат-лиазы, ингибиторов скваленсинтетазы, антагонистов липопротеина(а), ингибиторов липазы, инсулинов, производных GLP-1, GLP-1, сульфонилмочевин, бигуанидов, меглитинидов, тиазолидиндионов, ингибиторов  $\alpha$ -глюкозидазы, воздействующих на АТФ-зависимый калиевый канал бета-клеток биологически активных веществ, ингибиторов гликогенфосфорилазы, антагонистов рецептора глюкагона, активаторов глюкокиназы, ингибиторов глюконеогенеза, ингибиторов фруктозо-1,6-бисфосфатазы, модуляторов транспортера глюкозы 4, ингибиторов глутаминфруктозо-6-фосфатамидотрансферазы, ингибиторов дипептидилпептидазы-IV, ингибиторов 11-бета-гидроксистероид-дегидрогеназы-1, ингибиторов протеинтирозинфосфатазы-1В, модуляторов натрийзависимого транспортера глюкозы 1 или 2, модуляторов GPR40, ингибиторов гормончувствительной липазы, ингибиторов ацетил-СоА-карбоксилазы, ингибиторов фосфоенолпируваткарбоксикиназы, ингибиторов гликогенсинтазокиназы-3, CART-модуляторов, NPY-антагонистов, пептид YY 3-36, антагонистов каннабиноидного рецептора 1, антагонистов МСН-рецептора, МС4-агонистов, антагонистов орексина, гистамин-Н3-агонистов, CRF-антагонистов, CRF ВР-антагонистов, агонистов урокортина,  $\beta$ 3-агонистов, агонистов MSH (меланоцитстимулирующего гормона), агонистов ССК-А, ингибиторов повторного поглощения серотонина, смешанных серотонин- и норадренергических соединений, агонистов 5НТ-рецептора, агонистов 5-НТ2С-рецептора, антагонистов 5-НТ6-рецептора, агонистов бомбезина, антагонистов галанина, человеческий гормон роста, AOD-9604, высвобождающих гормон роста соединений, антагонистов грелина, TRH-агонистов, разъединяющих белок 2- или 3-модуляторов, лептин, агонистов лептина, DA-агонистов (бромкриптин, допрексин), ингибиторов липазы/амилазы, RXR-модуляторов, ингибиторов диацилглицерин-О-ацилтрансфераз, ингибиторов синтазы жирной кислоты, оксинтомодулин, олеоилэстрон или агонистов рецептора гормона щитовидной железы, TR- $\beta$ -агонистов или амфетаминов.

6. Соединение по п.1 для применения в качестве лекарственного средства в целях лечения нарушений липидного обмена.

7. Способ получения лекарственного средства, содержащего соединение по п.1, отличающийся тем, что биологически активное вещество смешивают с фармацевтически пригодным носителем, и эту смесь доводят до пригодной для введения формы.

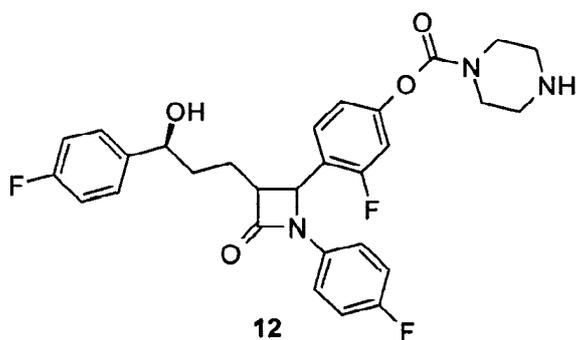
8. Применение соединения по п.1 для получения лекарственного средства в целях лечения гиперлипидемии.

9. Применение соединения по п.1 для получения лекарственного средства в целях снижения уровня холестерина в сыворотке.

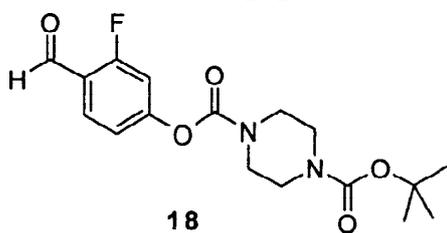
10. Применение соединения по п.1 для получения лекарственного средства в целях лечения артериосклеротических явлений.

11. Применение соединения по п.1 для получения лекарственного средства в целях лечения резистентности к инсулину.

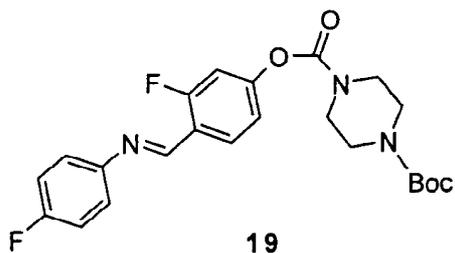
12. Соединение формулы 12:



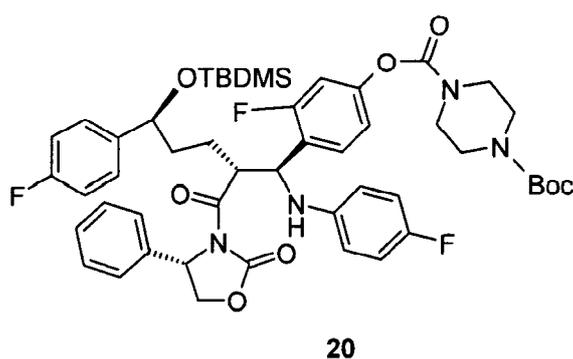
13. Соединение формулы 18:



14. Соединение формулы 19:



15. Соединение формулы 20:

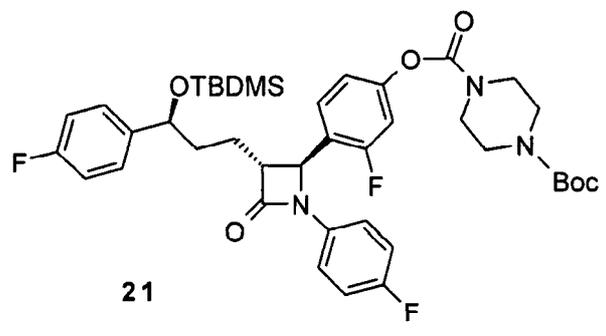


16. Соединение формулы 21:

RU 2009120679 A

RU 2009120679 A

RU 2009120679 A



21

RU 2009120679 A