



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2019116512, 15.11.2017

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:  
16.11.2016 US 62/423,099

(43) Дата публикации заявки: 17.12.2020 Бюл. № 35

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на  
национальной фазе: 17.06.2019(86) Заявка РСТ:  
US 2017/061868 (15.11.2017)(87) Публикация заявки РСТ:  
WO 2018/093947 (24.05.2018)Адрес для переписки:  
119019, Москва, Гоголевский бульвар,11,  
Строкова Ольга Владимировна

(71) Заявитель(и):

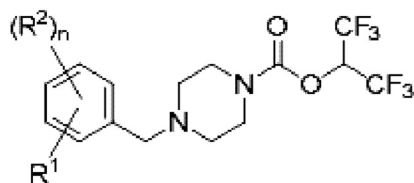
АБАЙД ТЕРАПЬЮТИКС, ИНК. (US)

(72) Автор(ы):

ГРАЙС, Шерил А. (US),  
БУЗАРД, Дэниел Дж. (US),  
ШАГХАФИ, Майкл Б. (US)(54) **ИНГИБИТОРЫ MAGL**

## (57) Формула изобретения

1. Соединение, характеризующееся структурой формулы (I):



Формула (I);

где:

 $R^1$  представляет собой  $-R^{14}$ ,  $-OR^3$ ,  $-SR^4$ ,  $-S(O)_2R^4$  или  $-C\equiv C-(CR^6R^7)-R^8$ ;каждый  $R^2$  независимо выбран из  $C_{1-6}$ алкила, галогена,  $-CN$ ,  $C_{1-6}$ галогеналкила, $-C_{1-6}$ алкил(гетероциклоалкила),  $-OR^{17}$  и  $-C(O)NR^{18}R^{19}$ ; $R^3$  представляет собой  $-(CR^6R^7)_m-R^8$ ,  $-(CR^6R^7)_p-Y-(CR^6R^7)_q-R^8$  или  $-(CR^6R^7)_t-C_{3-6}$ циклоалкил- $R^8$ ; $R^4$  представляет собой  $-(CR^6R^7)_m-R^8$ ,  $-(CR^6R^7)_v-C(O)OH$  или  $-(CR^6R^7)_p-Y-(CR^6R^7)_q-R^8$ ; $Y$  представляет собой  $-O-$  или  $-N(R^{22})-$ ;

каждый  $R^6$  и  $R^7$  независимо выбран из H, F, и  $C_{1-6}$ алкила или  $R^6$  и  $R^7$ , вместе с углеродом, к которому они присоединены, образуют  $C_{3-6}$ циклоалкильное кольцо;

$R^8$  представляет собой  $-C(O)OR^9$ ,  $-C(O)R^{10}$  или  $-C(O)O-(CR^{12}R^{13})-OC(O)R^{11}$ ;

$R^{8'}$  представляет собой  $-C(O)OR^{9'}$ ,  $-C(O)R^{10'}$  или  $-C(O)O-(CR^{12}R^{13})-OC(O)R^{11}$ ;

$R^9$  представляет собой H или  $C_{1-6}$ алкил;

$R^{9'}$  представляет собой  $C_{1-6}$ алкил;

$R^{10}$  представляет собой  $C_{1-6}$ алкил или  $-NHSO_2R^{21}$ ;

$R^{10'}$  представляет собой  $C_{2-6}$ алкил или  $-NHSO_2R^{21}$ ;

$R^{11}$  представляет собой  $C_{1-6}$ алкил или  $C_{1-6}$ алкокси;

$R^{12}$  и  $R^{13}$  представляет собой каждый независимо H или  $C_{1-6}$ алкил;

$R^{14}$  представляет собой  $-(CR^{15}R^{16})_m-R^8$  или  $-(CR^6R^7)_p-Y-(CR^6R^7)_q-R^8$ ;

каждый  $R^{15}$  и  $R^{16}$  независимо выбран из H, F и  $C_{1-6}$ алкила;

каждый  $R^{17}$  независимо выбран из H,  $C_{1-6}$ алкила,  $C_{1-6}$ галогеналкила и  $C_{3-6}$ циклоалкила;

каждый  $R^{18}$  и  $R^{19}$  независимо выбран из H,  $C_{1-6}$ алкила,  $C_{3-6}$ циклоалкила, арила и гетероарила или  $R^{18}$  и  $R^{19}$ , вместе с азотом, к которому они присоединены, образуют гетероциклоалкильное кольцо, необязательно замещенное одним, двумя или тремя  $R^{20}$ ;

каждый  $R^{20}$  независимо выбран из галогена,  $C_{1-6}$ алкила,  $C_{1-6}$ галогеналкила, оксо,  $-CN$  и  $C_{3-6}$ циклоалкила;

$R^{21}$  представляет собой  $C_{1-6}$ алкил или  $C_{3-6}$ циклоалкил;

$R^{22}$  представляет собой H,  $C_{1-6}$ алкил или  $-SO_2R^{23}$ ;

$R^{23}$  представляет собой  $C_{1-6}$ алкил;

m представляет собой 1, 2, 3 или 4;

n представляет собой 0, 1, 2, 3 или 4;

p представляет собой 2, 3 или 4;

q представляет собой 1, 2 или 3;

t представляет собой 0, 1 или 2 и

v представляет собой 3 или 4;

или его фармацевтически приемлемая соль или сольват.

2. Соединение по п. 1 или его фармацевтически приемлемая соль или сольват, где  $R^1$  представляет собой  $-OR^3$ .

3. Соединение по п. 1 или 2 или его фармацевтически приемлемая соль или сольват, где  $R^3$  представляет собой  $-(CR^6R^7)_m-R^8$ .

4. Соединение по любому из пп. 1-3 или его фармацевтически приемлемая соль или сольват, где m представляет собой 1, 2 или 3.

5. Соединение по любому из пп. 1-4 или его фармацевтически приемлемая соль или сольват, где каждый  $R^6$  и  $R^7$  независимо выбран из H и  $C_{1-6}$ алкила.

6. Соединение по любому из пп. 1-4 или его фармацевтически приемлемая соль или

сольват, где  $R^6$  и  $R^7$ , вместе с углеродом, к которому они присоединены, образуют  $C_{3-6}$ циклоалкильное кольцо.

7. Соединение по любому из пп. 1-6 или его фармацевтически приемлемая соль или сольват, где  $R^8$  представляет собой  $-C(O)OR^9$ .

8. Соединение по п. 7 или его фармацевтически приемлемая соль или сольват, где  $R^9$  представляет собой H.

9. Соединение по п. 7 или его фармацевтически приемлемая соль или сольват, где  $R^9$  представляет собой  $C_{1-6}$ алкил.

10. Соединение по любому из пп. 1-6 или его фармацевтически приемлемая соль или сольват, где  $R^8$  представляет собой  $-C(O)R^{10}$ .

11. Соединение по п. 10 или его фармацевтически приемлемая соль или сольват, где  $R^{10}$  представляет собой  $-NHSO_2R^{21}$ .

12. Соединение по п. 11 или его фармацевтически приемлемая соль или сольват, где  $R^{21}$  представляет собой  $C_{3-6}$ циклоалкил.

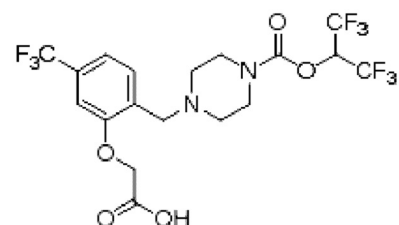
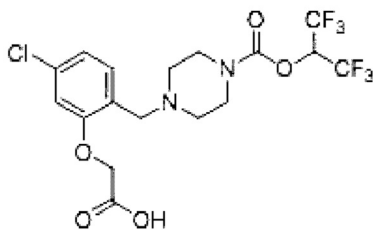
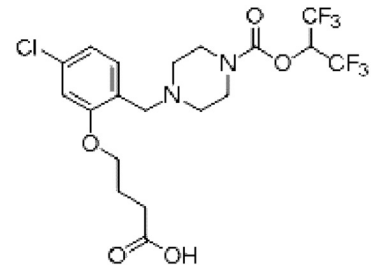
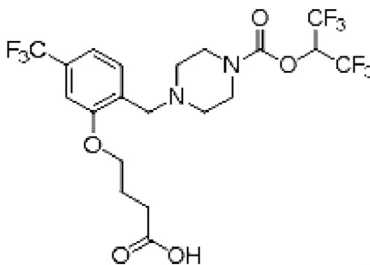
13. Соединение по п. 11 или его фармацевтически приемлемая соль или сольват, где  $R^{21}$  представляет собой  $C_{1-6}$ алкил.

14. Соединение по любому из пп. 1-13 или его фармацевтически приемлемая соль или сольват, где каждый  $R^2$  независимо выбран из  $C_{1-6}$ алкила, галогена и  $C_{1-6}$ галогеналкила.

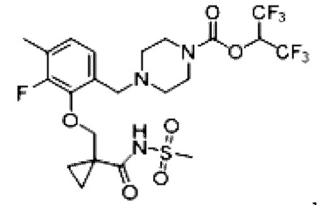
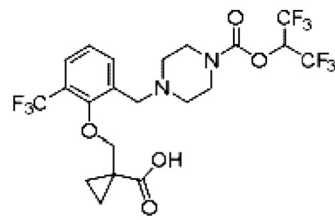
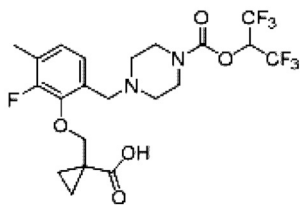
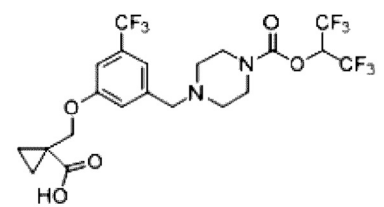
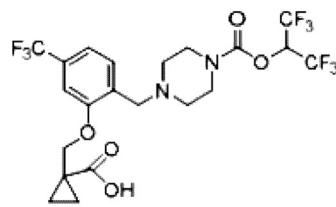
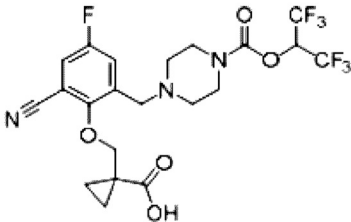
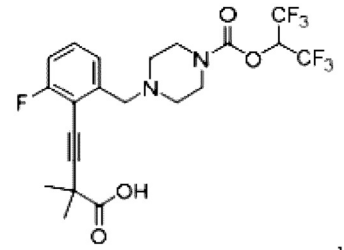
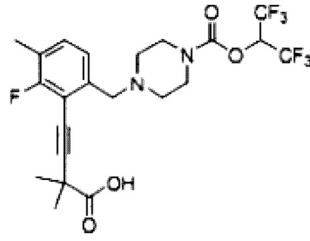
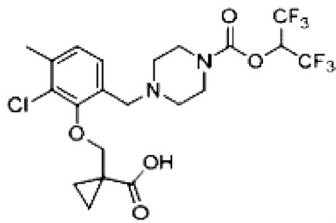
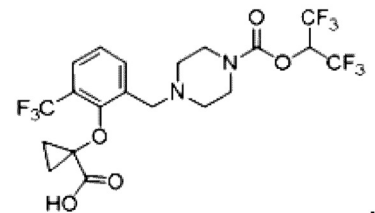
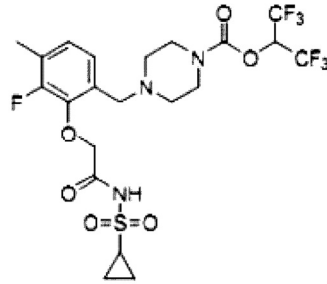
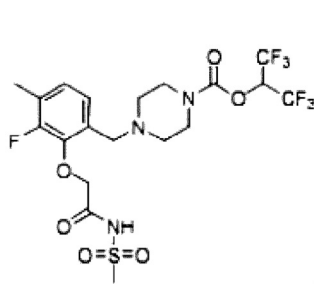
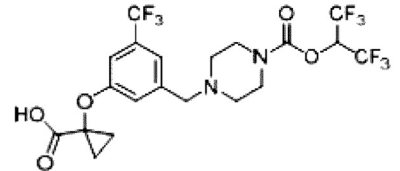
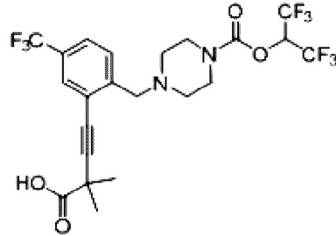
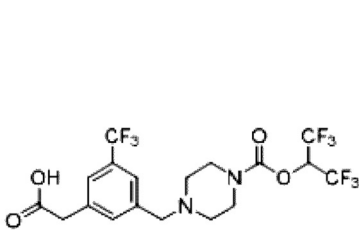
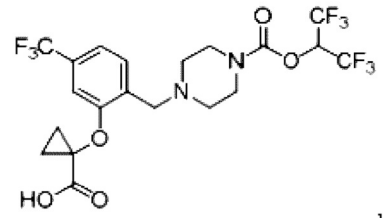
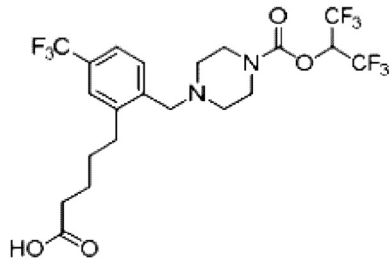
15. Соединение по любому из пп. 1-14 или его фармацевтически приемлемая соль или сольват, где n представляет собой 1.

16. Соединение по любому из пп. 1-14 или его фармацевтически приемлемая соль или сольват, где n представляет собой 2.

17. Соединение, характеризующееся структурой, выбранной из:

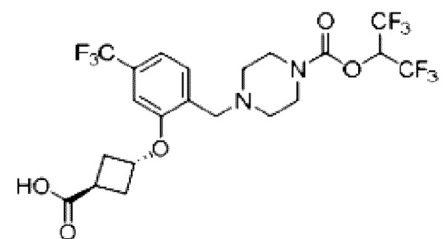
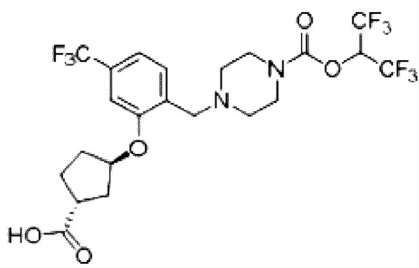
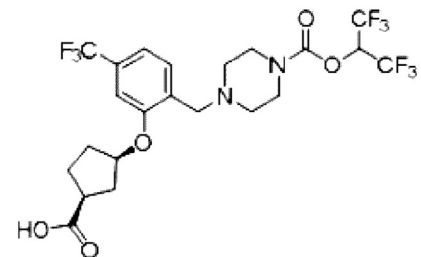
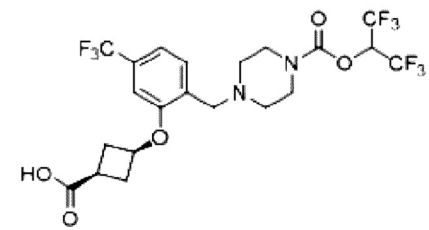
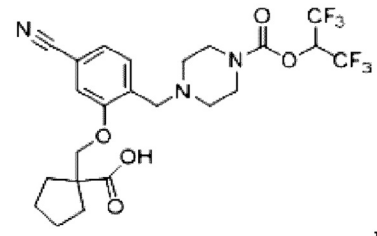
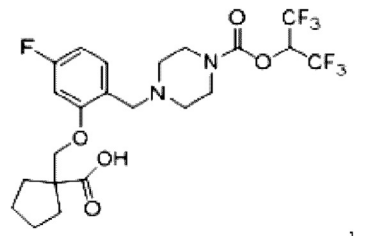
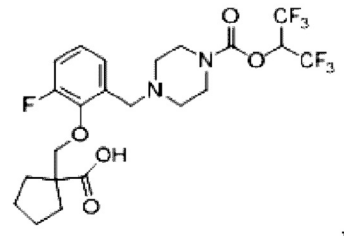
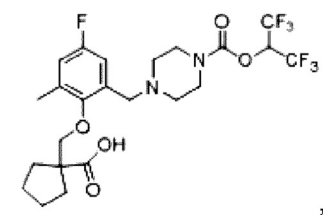
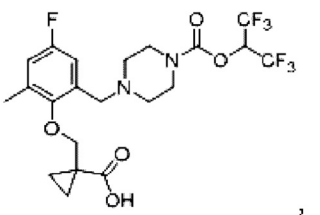
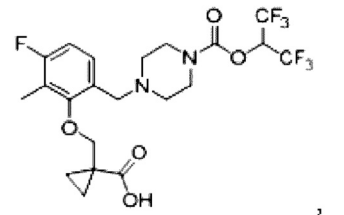
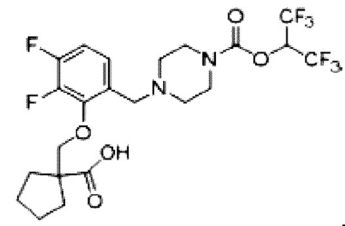
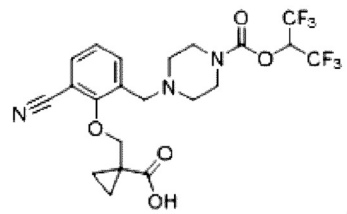
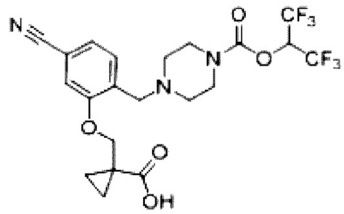
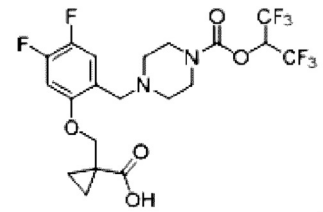
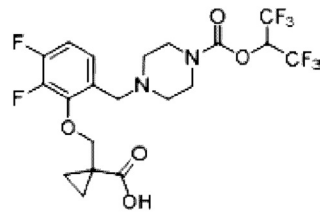
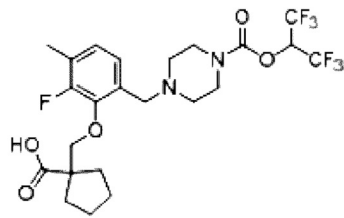


RU 2019116102 A 2159116512

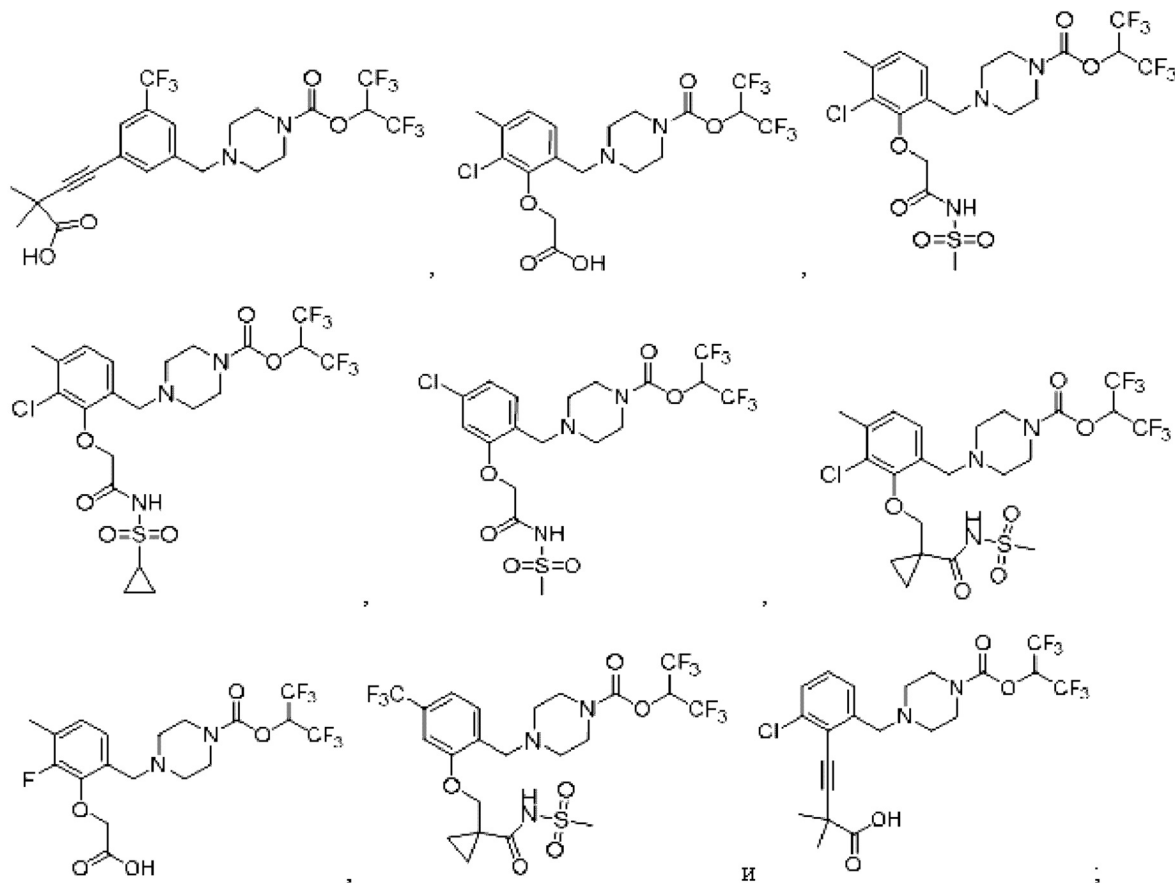


RU 2019116512 A

A 2159116102 RU



RU 2019116512 A



или его фармацевтически приемлемая соль или сольват.

18. Фармацевтическая композиция для лечения боли, эпилепсии/припадочного расстройства, рассеянного склероза, нейромиелита зрительного нерва (НМО), синдрома Туретта, болезни Альцгеймера, боли в животе, связанной с синдром раздраженного кишечника, или синдрома дефицита внимания или гиперактивности (ADHD), содержащая соединение по любому из пп. 1-17 или его фармацевтически приемлемую соль или сольват и по меньшей мере одно фармацевтически приемлемое вспомогательное вещество.

19. Применение соединения по любому из пп. 1-17 или его фармацевтически приемлемой соли или сольвата для лечения боли, эпилепсии/припадочного расстройства, рассеянного склероза, нейромиелита зрительного нерва (НМО), синдрома Туретта, болезни Альцгеймера, боли в животе, связанной с синдром раздраженного кишечника, или синдрома дефицита внимания или гиперактивности (ADHD).