

(19)



Евразийское
патентное
ведомство

(21) 202190324 (13) A1

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОЙ ЗАЯВКЕ

(43) Дата публикации заявки
2021.05.18(51) Int. Cl. C07D 498/14 (2006.01)
A61K 31/5383 (2006.01)
A61P 31/16 (2006.01)(22) Дата подачи заявки
2020.03.27(54) ЗАМЕЩЕННЫЙ 3,4,12,12а-ТЕТРАГИДРО-1Н-[1,4]ОКСАЗИНО[3,4-с]ПИРИДО[2,1-*f*][1,2,4]ТРИАЗИН-6,8-ДИОН, ФАРМАЦЕВТИЧЕСКАЯ КОМПОЗИЦИЯ, СПОСОБЫ ИХ ПОЛУЧЕНИЯ И ПРИМЕНЕНИЯ

(31) 2019113751

(32) 2019.05.07

(33) RU

(86) PCT/RU2020/000163

(87) WO 2020/226532 2020.11.12

(71) Заявитель:

ИВАЩЕНКО АНДРЕЙ
АЛЕКСАНДРОВИЧ (RU);
ИВАЩЕНКО АЛЕКСАНДР
ВАСИЛЬЕВИЧ; САВЧУК НИКОЛАЙ
ФИЛИППОВИЧ; ИВАЩЕНКО
АЛЁНА АЛЕКСАНДРОВНА; АСАВИ,
ЛЛС (US)

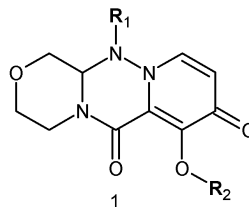
(72) Изобретатель:

Иващенко Андрей Александрович
(RU), Иващенко Александр
Васильевич (US), Митькин Олег
Дмитриевич (RU)

(74) Представитель:

Шмакова Е.А. (RU)

(57) Грипп - острое инфекционное заболевание дыхательных путей, вызываемое вирусом гриппа. Входит в группу острых респираторных вирусных инфекций (ОРВИ). Периодически распространяется в виде эпидемий и пандемий. В настоящее время выявлено более 2000 вариантов вируса гриппа, различающихся между собой антигенным спектром. Учитывая, что грипп представляет собой серьезную угрозу для общественного здравоохранения (в глобальном масштабе ежегодные эпидемии приводят к 3-5 млн случаев тяжелой болезни, миллионам госпитализаций и до 650000 смертей во всем мире), представляется целесообразным поиск новых противогриппозных препаратов, обладающих улучшенными характеристиками. Авторы неожиданно обнаружили, что неизвестное ранее соединение - замещенный 3,4,12,12а-тетрагидро-1Н-[1,4]оксазино[3,4-с]пиридо[2,1-*f*][1,2,4]триазин-6,8-дион общей формулы 1, его стереоизомер, их пролекарство, фармацевтически приемлемая соль, сольват гидрат и их кристаллическая или поликристаллическая форма являются эффективным средством для профилактики и лечения вирусных заболеваний, в том числе гриппа



где R¹ - 6,7-дифтор-5,10-дигидротиено[3,2-с][2]бензотиепин-10-ил, 7,8-дифтор-4,9-дигидротиено[2,23-с][2]бензотиепин-4-ил, (3,4-дифторфенил)(фенил)метил, (3,4-дифторфенил)(2-метилсульфанилфенил)метил, дифенилметил, бис(4-фторфенил)-метил; R² - водород или защитная группа, выбранная из ряда, включающего (C₁-C₃-алкил)оксикарбонилокси, {(C₁-C₃-алкил)оксикарбонил}окси, метокси, {[2-(C₁-C₃-алкил)оксиэтокси]карбонил}окси, {(1R)-2-[(C₁-C₃-алкил)окси]-1-метилэтокси}карбонил}окси, {[3S]-тетрагидрофуран-3-илокси}карбонил}окси, [(тетрагидро-2Н-пиран-4-илокси)карбонил}окси, {(1-ацетилазетидин)-3-илокси}карбонил}окси, {(C₁-C₃-алкил)оксикарбонил}окси, метокси, {[2-(C₁-C₃-алкил)оксиэтокси]карбонил}окси, метокси.

A1

202190324

202190324

A1