

(19)



Евразийское  
патентное  
ведомство

(21) 202191896 (13) A1

## (12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОЙ ЗАЯВКЕ

(43) Дата публикации заявки  
2021.10.12(22) Дата подачи заявки  
2020.03.05(51) Int. Cl. C07D 498/14 (2006.01)  
C07D 498/18 (2006.01)  
A61K 31/5365 (2006.01)  
A61K 31/537 (2006.01)  
A61K 31/553 (2006.01)  
A61K 31/4985 (2006.01)  
A61P 31/18 (2006.01)(54) АНЕЛИРОВАННЫЕ 9-ГИДРОКСИ-1,8-ДИОКСО-1,3,4,8-ТЕТРАГИДРО-2Н-ПИРИДО[1,2- $\alpha$ ]ПИРАЗИН-7-КАРБОКСАМИДЫ - ИНГИБИТОРЫ ИНТЕГРАЗЫ ВИЧ, СПОСОБЫ ИХ ПОЛУЧЕНИЯ И ПРИМЕНЕНИЯ

(31) 2019117193

(32) 2019.06.03

(33) RU

(86) PCT/RU2020/000118

(87) WO 2020/246910 2020.12.10

(71) Заявитель:

ИВАЩЕНКО АНДРЕЙ  
АЛЕКСАНДРОВИЧ (RU);  
ИВАЩЕНКО АЛЕКСАНДР  
ВАСИЛЬЕВИЧ; САВЧУК НИКОЛАЙ  
ФИЛИППОВИЧ; ИВАЩЕНКО  
АЛЕНА АЛЕКСАНДРОВНА; АЛЛА  
ХЕМ, ЛЛС (US)

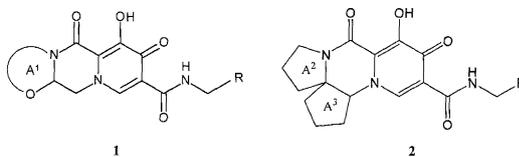
(72) Изобретатель:

Ивашенко Андрей Александрович  
(RU), Иващенко Александр  
Васильевич, Савчук Николай  
Филиппович (US), Митькин Олег  
Дмитриевич (RU)

(74) Представитель:

Шмакова Е.А. (RU)

(57) Изобретение относится к новому соединению, обладающему противовирусной активностью, в частности ингибиторной активностью в отношении интегразы вируса иммунодефицита человека (ВИЧ). Предметом настоящего изобретения является новый аннелированный 9-гидрокси-1,8-диоксо-1,3,4,8-тетрагидро-2Н-пиридо[1,2- $\alpha$ ]пирозин-7-карбоксамид, общей формулы 1 и 2, его стереоизомер, его фармацевтически приемлемая соль, его сольват, его кристаллическая или его поликристаллическая форма



где кольцо A<sup>1</sup> представляет собой необязательно замещенный метилом 5-7-членный насыщенный гетероцикл или гетеробикацикл, кольцо A<sup>2</sup> представляет собой 5-6-членный необязательно замещенный метилом насыщенный или частично насыщенный моноциклический гетероцикл, кольцо A<sup>3</sup> представляет собой 5-6-членный моноциклический насыщенный циклоалкан и тетрагидро-2Н-пиран, R представляет собой 5-7-членный необязательно замещенный одним, двумя или тремя необязательно одинаковыми заместителями моноциклический или бициклический гетероциклический радикал, включающий 1-4 гетероатома, выбранных из ряда O, S и N, исключая (2S,5R,11aS)-8-гидрокси-7,9-диоксо-N-[[3-(трифторметил)пиридин-2-ил]метил]-2,3,4,5,7,9,13,13а-октагидро-2,5-метанпиридо[1',2':4,5]пиразино[2,1-b][1,3]оксазепино-10-карбоксамид (формулы A4) и (1R,4S,12aR)-N-[(3,5-дифторпиридин-2-ил)метил]-7-гидрокси-6,8-диоксо-1,2,3,4,6,8,12,12а-октагидро-1,4-метанодипиридо[1,2-а:1',2'-d]пирозин-9-карбоксамид (формулы A5).

A1

202191896

202191896

A1