

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2012126083/04, 07.12.2010

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:  
10.12.2009 EP 09178642.6

(43) Дата публикации заявки: 20.01.2014 Бюл. № 2

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на  
национальной фазе: 10.07.2012(86) Заявка РСТ:  
EP 2010/069098 (07.12.2010)(87) Публикация заявки РСТ:  
WO 2011/070029 (16.06.2011)Адрес для переписки:  
191186, Санкт-Петербург, а/я 230, "АРС-  
ПАТЕНТ", И.И. Липатовой

(71) Заявитель(и):

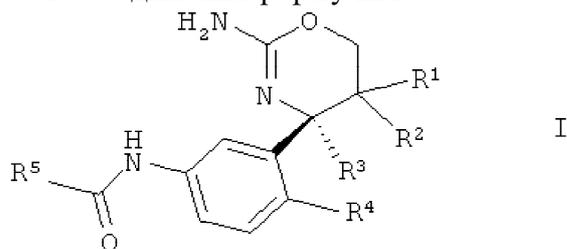
**Ф. ХОФФМАНН-ЛЯ РОШ АГ (CH)**

(72) Автор(ы):

**БЭННЕР Дэвид (CH),  
ХИЛЬПЕРТ Ханс (CH),  
МАУЗЕР Харальд (CH),  
МАЙВЕГ Александре Ф. (CN),  
РОДЖЕРС-ЭВАНС Марк (CH)**(54) **ПРОИЗВОДНЫЕ АМИНООКСАЗИНА**

## (57) Формула изобретения

## 1. Соединения формулы I

где R<sup>1</sup> представляет собой атом водорода или C<sub>1-7</sub>-алкил;R<sup>2</sup> представляет собой атом водорода или C<sub>1-7</sub>-алкил;либо R<sup>1</sup> и R<sup>2</sup> вместе с атомом С, к которому они присоединены, образуют C<sub>3-7</sub>-циклоалкильное кольцо;R<sup>3</sup> представляет собой C<sub>1-7</sub>-алкил или C<sub>3-7</sub>-циклоалкил;либо R<sup>2</sup> и R<sup>3</sup> вместе с атомами С, к которым они присоединены, образуют C<sub>3-7</sub>-циклоалкильное или 3-7-членное О-гетероциклическое кольцо;R<sup>4</sup> выбран из группы, состоящей из атома водорода, C<sub>1-7</sub>-алкила, атома галогена, циано и C<sub>1-7</sub>-алкокси;R<sup>5</sup> представляет собой i) арил, незамещенный или замещенный одной, двумя или

тремя группами, выбранными из группы, состоящей из  $C_{1-7}$ -алкила, атома галогена, галоген- $C_{1-7}$ -алкила,  $C_{1-7}$ -алкокси, галоген- $C_{1-7}$ -алкокси, циано, гидроксид- $C_{1-7}$ -алкила, оксо и фенила,

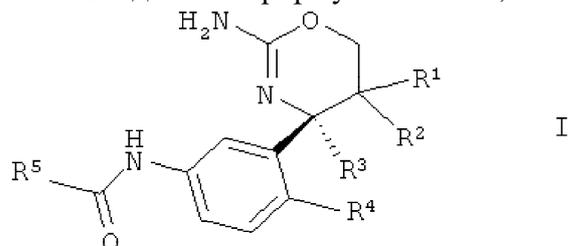
ii) гетероарил, незамещенный или замещенный одной, двумя или тремя группами, выбранными из группы, состоящей из  $C_{1-7}$ -алкила, атома галогена, галоген- $C_{1-7}$ -алкила,  $C_{1-7}$ -алкокси, галоген- $C_{1-7}$ -алкокси, циано, гидроксид- $C_{1-7}$ -алкила, оксо и фенила,

iii)  $C_{1-7}$ -алкил, незамещенный или замещенный одной, двумя, тремя, четырьмя или пятью группами, индивидуально выбранными из группы, состоящей из атома галогена, галоген- $C_{1-7}$ -алкила,  $C_{1-7}$ -алкокси, галоген- $C_{1-7}$ -алкокси, циано и гидроксид- $C_{1-7}$ -алкила,

iv)  $C_{3-7}$ -циклоалкильное кольцо, незамещенное или замещенное одной, двумя или тремя группами, выбранными из группы, состоящей из  $C_{1-7}$ -алкила, атома галогена, галоген- $C_{1-7}$ -алкила,  $C_{1-7}$ -алкокси, галоген- $C_{1-7}$ -алкокси, циано и гидроксид- $C_{1-7}$ -алкила,

v) 3-7-членное O-гетероциклическое кольцо, незамещенное или замещенное одной, двумя или тремя группами, выбранными из группы, состоящей из  $C_{1-7}$ -алкила, атома галогена, галоген- $C_{1-7}$ -алкила,  $C_{1-7}$ -алкокси, галоген- $C_{1-7}$ -алкокси, циано и гидроксид- $C_{1-7}$ -алкила, или их фармацевтически приемлемые соли.

2. Соединения формулы I по п.1,



где

$R^1$  представляет собой атом водорода или  $C_{1-7}$ -алкил;

$R^2$  представляет собой атом водорода или  $C_{1-7}$ -алкил;

либо  $R^1$  и  $R^2$  вместе с атомом С, к которому они присоединены, образуют  $C_{3-7}$ -циклоалкильное кольцо;

$R^3$  представляет собой  $C_{1-7}$ -алкил или  $C_{3-7}$ -циклоалкил;

либо  $R^2$  и  $R^3$  вместе с атомами С, к которым они присоединены, образуют  $C_{3-7}$ -циклоалкильное или 3-7-членное O-гетероциклическое кольцо;

$R^4$  выбран из группы, состоящей из атома водорода,  $C_{1-7}$ -алкила, атома галогена, циано и  $C_{1-7}$ -алкокси;

$R^5$  представляет собой арил или гетероарил, где арил или гетероарил является незамещенным или замещен одной, двумя или тремя группами, выбранными из группы, состоящей из  $C_{1-7}$ -алкила, атома галогена, галоген- $C_{1-7}$ -алкила,  $C_{1-7}$ -алкокси, галоген- $C_{1-7}$ -алкокси, циано, гидроксид- $C_{1-7}$ -алкила, оксо и фенила; или их фармацевтически приемлемые соли.

3. Соединения формулы I по п.1, где  $R^1$  и  $R^2$  вместе с атомом С, к которому они присоединены, образуют  $C_{3-7}$ -циклоалкильное кольцо.

4. Соединения формулы I по п.1, где  $R^1$  и  $R^2$  вместе с атомом С, к которому они присоединены, образуют циклопропил.

5. Соединения формулы I по п.1, где  $R^1$  и  $R^2$  представляют собой атом водорода.

6. Соединения формулы I по п.1, где  $R^3$  представляет собой  $C_{1-7}$ -алкил.

7. Соединения формулы I по п.1, где  $R^3$  представляет собой метил.
8. Соединения формулы I по п.1, где  $R^3$  представляет собой этил.
9. Соединения формулы I по п.1, где  $R^4$  представляет собой атом галогена.
10. Соединения формулы I по п.1, где  $R^4$  представляет собой фтор.
11. Соединения формулы I по п.1, где  $R^5$  представляет собой гетероарил, который является незамещенным или замещен одной, двумя или тремя группами, выбранными из группы, состоящей из  $C_{1-7}$ -алкила, атома галогена, галоген- $C_{1-7}$ -алкила,  $C_{1-7}$ -алкокси, галоген- $C_{1-7}$ -алкокси, циано, гидрокси- $C_{1-7}$ -алкила, оксо и фенила.
12. Соединения формулы I по п.1, где  $R^5$  представляет собой гетероарил, выбранный из группы, состоящей из пиридила, пиразинила, пиримидинила, пиридазинила, 6-оксо-1,6-дигидропиридазинила, 5-оксо-4,5-дигидропиразинила, пирролила, фурила, тиенила, оксазолила, изоксазолила, оксадиазолила, тиадиазолила, тетразолила, пиразолила, имидазолила, триазолила, тиазолила, хинолинила, изохинолинила, циннолинила, пиразоло[1,5-a]пиридила, имидазо[1,2-a]пиридила, тиено[2,3-c]пиридила, хиноксалинила, бензо[b]тиенила, бензотиазолила, бензотриазолила, индолила, индазолила и 3,4-дигидро-1H-изохинолинила, где гетероарил является незамещенным или замещен одной, двумя или тремя группами, выбранными из группы, состоящей из  $C_{1-7}$ -алкила, атома галогена, галоген- $C_{1-7}$ -алкила,  $C_{1-7}$ -алкокси, галоген- $C_{1-7}$ -алкокси, циано, гидрокси- $C_{1-7}$ -алкила, оксо и фенила.
13. Соединения формулы I по п.1, где  $R^5$  представляет собой гетероарил, выбранный из группы, состоящей из тиенила, оксазолила, изоксазолила, пиразолила, пиридила, пиримидинила, пиразинила, 6-оксо-1,6-дигидропиридазинила, 5-оксо-4,5-дигидропиразинила и имидазо[1,2-a]пиридилв, где гетероарил является незамещенным или замещен одной, двумя или тремя группами, выбранными из группы, состоящей из  $C_{1-7}$ -алкила, атома галогена, галоген- $C_{1-7}$ -алкила,  $C_{1-7}$ -алкокси, галоген- $C_{1-7}$ -алкокси, циано, гидрокси- $C_{1-7}$ -алкила, оксо и фенила.
14. Соединения формулы I по п.1, где  $R^5$  представляет собой гетероарил, выбранный из группы, состоящей из тиенила, оксазолила, пиридила, пиримидинила и пиразинила, где гетероарил является незамещенным или замещен одной, двумя или тремя группами, выбранными из группы, состоящей из  $C_{1-7}$ -алкила, атома галогена, галоген- $C_{1-7}$ -алкила,  $C_{1-7}$ -алкокси, галоген- $C_{1-7}$ -алкокси, циано, гидрокси- $C_{1-7}$ -алкила, оксо и фенила.
15. Соединения формулы I по п.1, где  $R^5$  представляет собой гетероарил, выбранный из группы, состоящей из тиенила, оксазолила, пиридила, пиримидинила и пиразинила, замещенного одной, двумя или тремя группами, выбранными из группы, состоящей из  $C_{1-7}$ -алкила, атома галогена, галоген- $C_{1-7}$ -алкила,  $C_{1-7}$ -алкокси, галоген- $C_{1-7}$ -алкокси, циано, гидрокси- $C_{1-7}$ -алкила, оксо и фенила.
16. Соединения формулы I по п.1, где  $R^5$  представляет собой гетероарил, выбранный из группы, состоящей из 1H-пиразолила, бензо[b]тиофенила, изоксазолила, оксазолила, пиразинила, пиридинила, пиримидинила, тиазолила, тиено[2,3-c]пиридинила и тиофенила, где гетероарил является незамещенным или замещен одной или двумя группами, выбранными из группы, состоящей из  $C_{1-7}$ -алкила, атома галогена, галоген- $C_{1-7}$ -алкокси, галоген- $C_{1-7}$ -алкила,  $C_{1-7}$ -алкокси, циано и фенила.
17. Соединения формулы I по п.1, где  $R^5$  представляет собой гетероарил, выбранный из группы, состоящей из 1H-пиразолила, тиазолила, оксазолила, пиридинила, замещенного одним или двумя заместителями, выбранными из группы, состоящей из  $C_{1-7}$ -алкила, атома галогена и циано.

18. Соединения формулы I по п.1, где R<sup>5</sup> представляет собой гетероарил, выбранный из группы, состоящей из 1H-пиразол-3-ила, бензо[b]тиофен-2-ила, изоксазол-3-ила, оксазол-4-ила, пиразин-2-ила, пиридин-2-ила, пиримидин-2-ила, тиазол-4-ила, тиено[2,3-с]пиридин-7-ила и тиофен-2-ила, где гетероарил является незамещенным или замещен одной или двумя группами, выбранными из группы, состоящей из метила, фтора, хлора, дифторметокси, трифторэтокси, трифторметила, метокси, циано и фенила.

19. Соединения формулы I по п.1, где R<sup>5</sup> представляет собой фенил, который является незамещенным или замещен одной, двумя или тремя группами, выбранными из группы, состоящей из C<sub>1-7</sub>-алкила, атома галогена, галоген-C<sub>1-7</sub>-алкила, C<sub>1-7</sub>-алкокси, галоген-C<sub>1-7</sub>-алкокси, циано, гидроксид-C<sub>1-7</sub>-алкила, оксо и фенила.

20. Соединения формулы I по п.1, где R<sup>5</sup> представляет собой фенил, замещенный одним или двумя атомами галогена.

21. Соединения формулы I по п.1, где R<sup>5</sup> представляет собой C<sub>1-7</sub>-алкил, незамещенный или замещенный одним, двумя, тремя, четырьмя или пятью атомами галогена.

22. Соединения формулы I по п.1, где R<sup>5</sup> представляет собой этил, замещенный одним, двумя, тремя, четырьмя или пятью атомами фтора.

23. Соединения формулы I по п.1, где R<sup>5</sup> представляет собой C<sub>3-7</sub>-циклоалкильное кольцо, незамещенное или замещенное одной, двумя или тремя группами, выбранными из группы, состоящей из атома галогена и галоген-C<sub>1-7</sub>-алкила.

24. Соединения формулы I по п.1, где R<sup>5</sup> представляет собой циклопропил, незамещенный или замещенный одной или двумя группами, выбранными из группы, состоящей из фтора и трифторметила.

25. Соединения формулы I по п.1, где R<sup>5</sup> представляет собой 3-7-членное O-гетероциклическое кольцо, незамещенное или замещенное одной, двумя или тремя группами, выбранными из группы, состоящей из C<sub>1-7</sub>-алкила, атома галогена, галоген-C<sub>1-7</sub>-алкила, C<sub>1-7</sub>-алкокси, галоген-C<sub>1-7</sub>-алкокси, циано и гидроксид-C<sub>1-7</sub>-алкила.

26. Соединения формулы I по п.1, где R<sup>5</sup> представляет собой оксетанил, замещенный метилом.

27. Соединения формулы I по п.1, выбранные из группы, состоящей из 3,5-Дихлорпиридин-2-карбоновой кислоты [3-((S)-2-амино-4-метил-5,6-дигидро-4H-[1,3]оксазин-4-ил)-4-фторфенил]-амида,

5-Хлорпиридин-2-карбоновой кислоты [3-((S)-2-амино-4-метил-5,6-дигидро-4H-[1,3]оксазин-4-ил)-4-фторфенил]-амида,

5-Фторпиридин-2-карбоновой кислоты [3-((S)-2-амино-4-метил-5,6-дигидро-4H-[1,3]оксазин-4-ил)-4-фторфенил]-амида,

Пиридин-2-карбоновой кислоты [3-((S)-2-амино-4-метил-5,6-дигидро-4H-[1,3]оксазин-4-ил)-4-фторфенил]-амида,

5-Трифторметилпиридин-2-карбоновой кислоты [3-((S)-2-амино-4-метил-5,6-дигидро-4H-[1,3]оксазин-4-ил)-4-фторфенил]-амида,

3-Фторпиридин-2-карбоновой кислоты [3-((S)-2-амино-4-метил-5,6-дигидро-4H-[1,3]оксазин-4-ил)-4-фторфенил]-амида,

5-Фтортиофен-2-карбоновой кислоты [3-((S)-2-амино-4-метил-5,6-дигидро-4H-[1,3]оксазин-4-ил)-4-фторфенил]-амида,

2-Метилоксазол-4-карбоновой кислоты [3-((S)-2-амино-4-метил-5,6-дигидро-4H-[1,3]оксазин-4-ил)-4-фторфенил]-амида,



3-Метилтиофен-2-карбоновой кислоты [3-((S)-2-амино-4-метил-5,6-дигидро-4Н-[1,3]оксазин-4-ил)-4-фторфенил]-амида,

3-Хлор-5-фторпиридин-2-карбоновой кислоты [3-((S)-2-амино-4-метил-5,6-дигидро-4Н-[1,3]оксазин-4-ил)-4-фторфенил]-амида,

5-Хлорпиридин-2-карбоновой кислоты [3-((S)-6-амино-8-метил-5-окса-7-азаспиро[2.5]окт-6-ен-8-ил)-4-фторфенил]-амида,

3-Фторпиридин-2-карбоновой кислоты [3-((S)-6-амино-8-метил-5-окса-7-азаспиро[2.5]окт-6-ен-8-ил)-4-фторфенил]-амида,

5-Хлор-3-метилпиридин-2-карбоновой кислоты [3-((S)-6-амино-8-метил-5-окса-7-азаспиро[2.5]окт-6-ен-8-ил)-4-фторфенил]-амида,

5-Метоксипиридин-2-карбоновой кислоты [3-((S)-6-амино-8-метил-5-окса-7-азаспиро[2.5]окт-6-ен-8-ил)-4-фторфенил]-амида,

5-Фторпиридин-2-карбоновой кислоты [3-((S)-6-амино-8-метил-5-окса-7-азаспиро[2.5]окт-6-ен-8-ил)-4-фторфенил]-амида,

5-Цианопиридин-2-карбоновой кислоты [3-((S)-6-амино-8-метил-5-окса-7-азаспиро[2.5]окт-6-ен-8-ил)-4-фторфенил]-амида,

5-Дифторметоксипиридин-2-карбоновой кислоты [3-((S)-6-амино-8-метил-5-окса-7-азаспиро[2.5]окт-6-ен-8-ил)-4-фторфенил]-амида,

Пиридин-2-карбоновой кислоты [3-((S)-6-амино-8-метил-5-окса-7-азаспиро[2.5]окт-6-ен-8-ил)-4-фторфенил]-амида,

5-Хлорпиримидин-2-карбоновой кислоты [3-((S)-6-амино-8-метил-5-окса-7-азаспиро[2.5]окт-6-ен-8-ил)-4-фторфенил]-амида,

N-[3-((S)-2-Амино-4-метил-5,6-дигидро-4Н-[1,3]оксазин-4-ил)-4-фторфенил]-2,3,3,3-тетрафторпропионамида,

2,2-Дифторциклопропанкарбоновой кислоты [3-((S)-2-амино-4-метил-5,6-дигидро-4Н-[1,3]оксазин-4-ил)-4-фторфенил]-амида,

(S)-N-(3-(6-амино-8-метил-5-окса-7-азаспиро[2.5]окт-6-ен-8-ил)-4-фторфенил)-2,6-дифторбензамида,

(S)-N-(3-(6-амино-8-метил-5-окса-7-азаспиро[2.5]окт-6-ен-8-ил)-4-фторфенил)-3-хлорпиколинамида,

(S)-N-(3-(6-амино-8-метил-5-окса-7-азаспиро[2.5]окт-6-ен-8-ил)-4-фторфенил)-3,5-дифторпиколинамида,

(S)-N-(3-(6-амино-8-метил-5-окса-7-азаспиро[2.5]окт-6-ен-8-ил)-4-фторфенил)-3-хлор-5-(трифторметил)пиколинамида,

(S)-N-(3-(6-амино-8-метил-5-окса-7-азаспиро[2.5]окт-6-ен-8-ил)-4-фторфенил)-3-(трифторметил)пиколинамида,

(S)-N-(3-(6-амино-8-метил-5-окса-7-азаспиро[2.5]окт-6-ен-8-ил)-4-фторфенил)-3-хлор-5-фторпиколинамида,

(S)-N-(3-(6-амино-8-метил-5-окса-7-азаспиро[2.5]окт-6-ен-8-ил)-4-фторфенил)-3,5-дихлорпиколинамида,

(S)-N-(3-(6-амино-8-метил-5-окса-7-азаспиро[2.5]окт-6-ен-8-ил)-4-фторфенил)-1-(трифторметил)циклопропанкарбоксамид,

N-(3-((S)-6-амино-8-метил-5-окса-7-азаспиро[2.5]окт-6-ен-8-ил)-4-фторфенил)-2,2-дифторциклопропанкарбоксамид,

(S)-N-(3-(6-амино-8-метил-5-окса-7-азаспиро[2.5]окт-6-ен-8-ил)-4-фторфенил)-4-хлор-1-метил-1Н-пиразол-3-карбоксамид,

(S)-N-(3-(6-амино-8-метил-5-окса-7-азаспиро[2.5]окт-6-ен-8-ил)-4-фторфенил)-5-хлор-4-метилизоксазол-3-карбоксамид,

1-Трифторметилциклопропанкарбоновой кислоты [3-((S)-2-амино-4-метил-5,6-дигидро-4Н-[1,3]оксазин-4-ил)-4-фторфенил]-амида,

N-[3-((S)-2-Амино-4-метил-5,6-дигидро-4Н-[1,3]оксазин-4-ил)-4-фторфенил]-3,3,3-трифтор-пропионамида,

(S)-N-(3-(2-амино-4-метил-5,6-дигидро-4Н-1,3-оксазин-4-ил)-4-фторфенил)-3-(2,2,2-трифторэтокси)пиколинамида,

5-Дифторметоксипиридин-2-карбоновой кислоты [3-((S)-2-амино-4-метил-5,6-дигидро-4Н-[1,3]оксазин-4-ил)-4-фторфенил]-амида,

(S)-N-(3-(2-амино-4-метил-5,6-дигидро-4Н-1,3-оксазин-4-ил)-4-фторфенил)-3-метилоксетан-3-карбоксамид,

(S)-N-(3-(2-амино-4-метил-5,6-дигидро-4Н-1,3-оксазин-4-ил)-4-фторфенил)-4-метилизоксазол-3-карбоксамид,

4-Хлор-1Н-пиразол-3-карбоновой кислоты [3-((S)-2-амино-4-метил-5,6-дигидро-4Н-[1,3]оксазин-4-ил)-4-фторфенил]-амида, и

5-Хлорпиридин-2-карбоновой кислоты [3-((4aS,7aS)-2-амино-4a,5-дигидро-4Н-фуоро[3,4-d][1,3]оксазин-7a-ил)-4-фторфенил]-амида,

или их фармацевтически приемлемых солей.

28. Соединения формулы I по п.1, выбранные из группы, состоящей из

3,5-Дихлорпиридин-2-карбоновой кислоты [3-((S)-2-амино-4-этил-5,6-дигидро-4Н-[1,3]оксазин-4-ил)-4-фторфенил]-амида,

5-Хлор-3-метилпиридин-2-карбоновой кислоты [3-((S)-2-амино-4-этил-5,6-дигидро-4Н-[1,3]оксазин-4-ил)-4-фторфенил]-амида,

2-Метилоксазол-4-карбоновой кислоты [3-((S)-2-амино-4-этил-5,6-дигидро-4Н-[1,3]оксазин-4-ил)-4-фторфенил]-амида,

5-Цианопиридин-2-карбоновой кислоты [3-((S)-2-амино-4-метил-5,6-дигидро-4Н-[1,3]оксазин-4-ил)-4-фторфенил]-амида,

5-Хлор-3-метилпиридин-2-карбоновой кислоты [3-((S)-2-амино-4-метил-5,6-дигидро-4Н-[1,3]оксазин-4-ил)-4-фторфенил]-амида,

2-Метилтиазол-4-карбоновой кислоты [3-((S)-2-амино-4-метил-5,6-дигидро-4Н-[1,3]оксазин-4-ил)-4-фторфенил]-амида,

1-Метил-1Н-пиразол-3-карбоновой кислоты [3-((S)-2-амино-4-метил-5,6-дигидро-4Н-[1,3]оксазин-4-ил)-4-фторфенил]-амида,

6-Хлорпиридин-2-карбоновой кислоты [3-((S)-2-амино-4-метил-5,6-дигидро-4Н-[1,3]оксазин-4-ил)-4-фторфенил]-амида,

3,5-Дифторпиридин-2-карбоновой кислоты [3-((S)-2-амино-4-метил-5,6-дигидро-4Н-[1,3]оксазин-4-ил)-4-фторфенил]-амида,

5-Хлор-3-метилпиридин-2-карбоновой кислоты [3-((S)-6-амино-8-метил-5-окса-7-азаспиро[2.5]окт-6-ен-8-ил)-4-фторфенил]-амида,

(S)-N-(3-(6-амино-8-метил-5-окса-7-азаспиро[2.5]окт-6-ен-8-ил)-4-фторфенил)-3,5-дихлорпиколинамида, и

(S)-N-(3-(6-амино-8-метил-5-окса-7-азаспиро[2.5]окт-6-ен-8-ил)-4-фторфенил)-4-хлор-1-метил-1Н-пиразол-3-карбоксамид,

или их фармацевтически приемлемые соли.

29. Соединения формулы I по п.1, выбранные из группы, состоящей из

3,5-дихлорпиридин-2-карбоновой кислоты [3-((S)-2-амино-4-метил-5,6-дигидро-4Н-[1,3]оксазин-4-ил)-4-фторфенил]-амида,

5-хлорпиридин-2-карбоновой кислоты [3-((S)-2-амино-4-метил-5,6-дигидро-4Н-[1,3]оксазин-4-ил)-4-фторфенил]-амида,

5-фторпиридин-2-карбоновой кислоты [3-((S)-2-амино-4-метил-5,6-дигидро-4Н-[1,3]оксазин-4-ил)-4-фторфенил]-амида,

пиридин-2-карбоновой кислоты [3-((S)-2-амино-4-метил-5,6-дигидро-4Н-[1,3]оксазин-4-ил)-4-фторфенил]-амида,



5-метоксипиридин-2-карбоновой кислоты [3-((S)-2-амино-4-метил-5,6-дигидро-4Н-[1,3]оксазин-4-ил)-4-фторфенил]-амида,

3-хлор-5-трифторметилпиридин-2-карбоновой кислоты [3-((S)-2-амино-4-метил-5,6-дигидро-4Н-[1,3]оксазин-4-ил)-4-фторфенил]-амида,

6-хлорпиридин-2-карбоновой кислоты [3-((S)-2-амино-4-метил-5,6-дигидро-4Н-[1,3]оксазин-4-ил)-4-фторфенил]-амида,

3,5-дифторпиридин-2-карбоновой кислоты [3-((S)-2-амино-4-метил-5,6-дигидро-4Н-[1,3]оксазин-4-ил)-4-фторфенил]-амида,

3-метилтиофен-2-карбоновой кислоты [3-((S)-2-амино-4-метил-5,6-дигидро-4Н-[1,3]оксазин-4-ил)-4-фторфенил]-амида,

3-хлор-5-фторпиридин-2-карбоновой кислоты [3-((S)-2-амино-4-метил-5,6-дигидро-4Н-[1,3]оксазин-4-ил)-4-фторфенил]-амида,

или их фармацевтически приемлемые соли.

30. Соединения формулы I по любому из пп.1-29 для применения в качестве лекарственных средств.

31. Соединения формулы I по п.30 для применения в качестве лекарственных средств для лечения или предупреждения заболеваний, которые связаны с ингибированием активности ВАСЕ2.

32. Соединения формулы I по п.31 для применения в качестве лекарственных средств для лечения или предупреждения диабета, в частности диабета типа 2.

33. Фармацевтические композиции, содержащие соединение формулы I по любому из п.п.1-29 и фармацевтически приемлемый носитель и/или адъювант.

34. Способ лечения заболеваний, которые связаны с ингибированием активности ВАСЕ2, в частности лечения диабета типа 2, который включает введение терапевтически активного количества соединения формулы I по любому из п.п.1-29 человеку или животному.

35. Применение соединений формулы I по любому из пп.1-29 для получения лекарственных средств для лечения или предупреждения заболеваний, которые связаны с ингибированием активности ВАСЕ2.

36. Применение по п.35 для получения лекарственных средств для лечения или предупреждения диабета, в частности диабета типа 2.

---

#### HE9A Изменение адреса для переписки с заявителем

Адрес для переписки:

197101, Санкт-Петербург, а/я 128, "АРС-ПАТЕНТ"

Дата публикации: 20.01.2014 Бюл. № 02/2014

---