



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2019115059, 27.10.2017

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
27.10.2016 US 62/413,907

(43) Дата публикации заявки: 27.11.2020 Бюл. № 33

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 27.05.2019(86) Заявка РСТ:
US 2017/058755 (27.10.2017)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2018/081558 (03.05.2018)Адрес для переписки:
119019, Москва, Гоголевский бульвар,11,
Строкова Ольга Владимировна

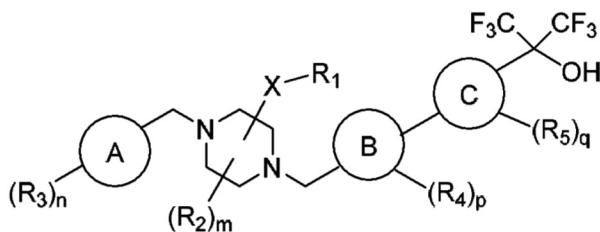
(71) Заявитель(и):

ЭСКАЛЬЕР БАЙОСАЙЕНСЕС, БВ (US)

(72) Автор(ы):

МОХАН, Раджу (US),
НУСС, Джон (US),
ХАРРИС, Джэйсон (US)(54) **МОДУЛЯТОРЫ ROR-ГАММА**(57) **Формула изобретения**

1. Соединение, имеющее структуру Формулы (I):



Формула (I);

где:

(A) представляет собой фенил или 5-членное или 6-членное гетероарильное кольцо;

(B) представляет собой фенил или 5-членное или 6-членное гетероарильное кольцо;

(C) представляет собой фенил или 5-членное или 6-членное гетероарильное кольцо;

X представляет собой связь, C₁-C₆алкил или C₁-C₆гетероалкил;R₁ представляет собой -C(=O)OR₆ или -C(=O)N(R₆)₂;

каждый R_2 независимо представляет собой галоген, C_1-C_6 алкил или C_1-C_6 алкокси;
 каждый R_3 , каждый R_4 и каждый R_5 независимо представляют собой галоген, C_1-C_6
 алкил, C_1-C_6 галоалкил, C_1-C_6 алкокси, C_1-C_6 гетероалкил, $-OR_7$, $-N(R_7)_2$, $-CN$, $-C(=O)R_8$
 $-, -C(=O)OR_7, -C(=O)N(R_7)_2, -NR_7C(=O)R_8, -NR_7SO_2R_8, -SO_2R_8$ или $-SO_2N(R_7)_2$;

каждый R_6 независимо представляет собой водород, C_1-C_6 алкил или $-C_1-C_6$ алкил-
 $Y-R_9$;

каждый Y независимо представляет собой $-O-$, $-S-$ или $-N(R_{10})-$;

каждый R_7 независимо представляет собой водород, C_1-C_6 алкил, C_1-C_6 галоалкил
 или C_1-C_6 гетероалкил;

каждый R_8 независимо представляет собой C_1-C_6 алкил или C_1-C_6 гетероалкил;

каждый R_9 независимо представляет собой водород или C_1-C_6 алкил;

каждый R_{10} независимо представляет собой водород или C_1-C_6 алкил;

m имеет значения 0, 1, 2, 3 или 4;

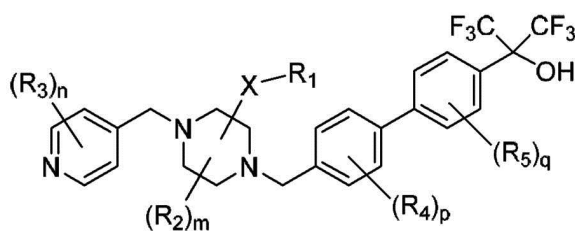
n имеет значения 0, 1, 2, 3 или 4;

p имеет значения 0, 1, 2, 3 или 4; и

q имеет значения 0, 1, 2 или 3;

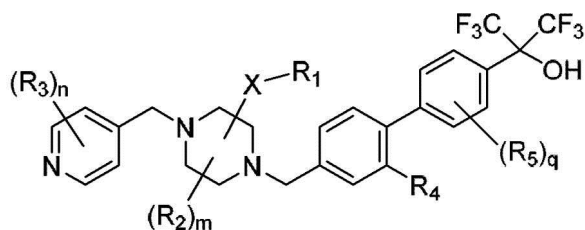
или его фармацевтически приемлемая соль или сольват.

2. Соединение по п. 1, имеющее структуру Формулы (Ia):



Формула (Ia)

3. Соединение по п. 2, имеющее структуру Формулы (Ib):



Формула (Ib);

где:

X представляет собой связь, C_1-C_6 алкил или C_1-C_6 гетероалкил;

R_1 представляет собой $-C(=O)OR_6$ или $-C(=O)N(R_6)_2$;

каждый R_2 независимо представляет собой галоген, C_1-C_6 алкил или C_1-C_6 алкокси;

каждый R_3 независимо представляет собой галоген, C_1-C_6 алкил, C_1-C_6 галоалкил, C_1
 $-C_6$ алкокси, C_1-C_6 гетероалкил, $-OR_7$, $-N(R_7)_2$, $-CN$, $-C(=O)R_8$, $-C(=O)OR_7$, $-C(=O)N(R_7)_2$,
 $-NR_7C(=O)R_8$, $-NR_7SO_2R_8$, $-SO_2R_8$ или $-SO_2N(R_7)_2$;

R_4 представляет собой водород или C_1-C_6 алкил;

каждый R_5 независимо представляет собой галоген, C_1-C_6 алкил, C_1-C_6 галоалкил, C_1
 $-C_6$ алкокси, C_1-C_6 гетероалкил, $-OR_7$, $-N(R_7)_2$, $-CN$, $-C(=O)R_8$, $-C(=O)OR_7$, $-C(=O)N(R_7)_2$,
 $-NR_7C(=O)R_8$, $-NR_7SO_2R_8$, $-SO_2R_8$ или $-SO_2N(R_7)_2$;

каждый R_6 независимо представляет собой водород, C_1 - C_6 алкил или - C_1 - C_6 алкил- $Y-R_9$;

каждый Y независимо представляет собой -O-, -S- или -N(R_{10})-;

каждый R_7 независимо представляет собой водород, C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 галоалкил или C_1 - C_6 гетероалкил;

каждый R_8 независимо представляет собой C_1 - C_6 алкил или C_1 - C_6 гетероалкил;

каждый R_9 независимо представляет собой водород или C_1 - C_6 алкил;

каждый R_{10} независимо представляет собой водород или C_1 - C_6 алкил;

m имеет значения 0, 1, 2, 3 или 4;

n имеет значения 0, 1, 2, 3 или 4; и

q имеет значения 0, 1, 2 или 3;

или его фармацевтически приемлемая соль или сольват.

4. Соединение по п. 3, где R_1 представляет собой -C(=O)OR₆.

5. Соединение по п. 4, где R_6 представляет собой C_1 - C_6 алкил.

6. Соединение по п. 5, где R_1 представляет собой -C(=O)OCH₃, -C(=O)OCH₂CH₃ или -C(=O)OCH(CH₃)₂.

7. Соединение по п. 4, где R_6 представляет собой - C_1 - C_6 алкил- $Y-R_9$.

8. Соединение по п. 7, где Y представляет собой -O-.

9. Соединение по п. 8, где R_9 представляет собой водород.

10. Соединение по п. 8, где R_9 представляет собой C_1 - C_6 алкил.

11. Соединение по любому из пп. 3-10, где X представляет собой связь.

12. Соединение по любому из пп. 3-10, где X представляет собой C_1 - C_6 алкил.

13. Соединение по п. 12, где X представляет собой -CH₂-.

14. Соединение по любому из пп. 3-13, где m равно 0, n равно 0, и q равно 0.

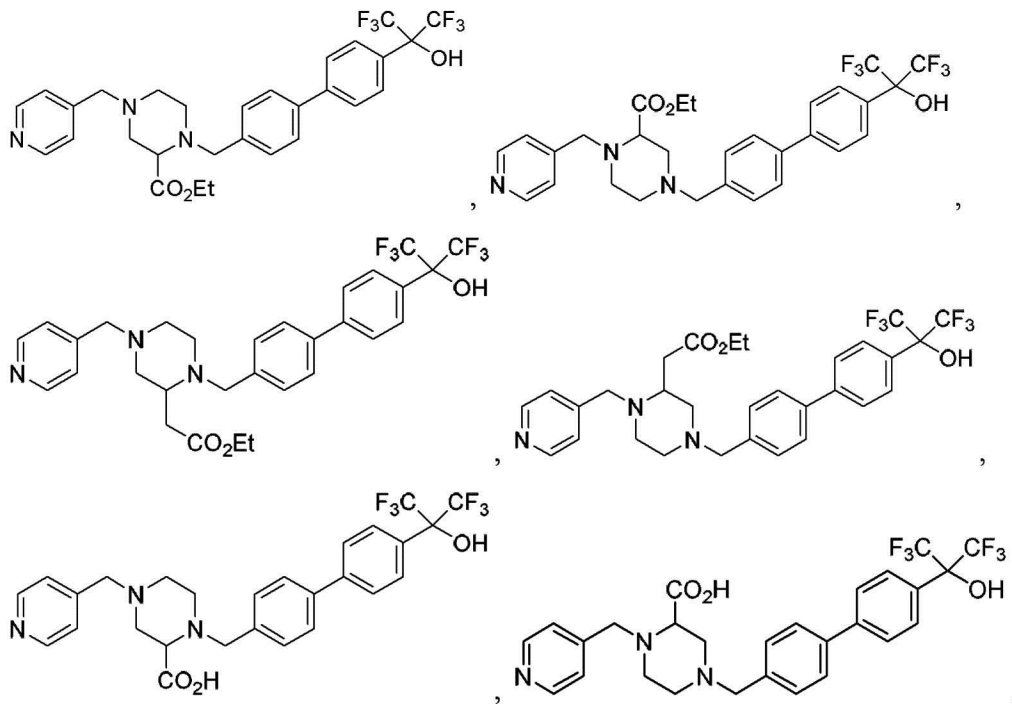
15. Соединение по любому из пп. 3-14, где R_4 представляет собой водород.

16. Соединение по любому из пп. 3-14, где R_4 представляет собой C_1 - C_6 алкил.

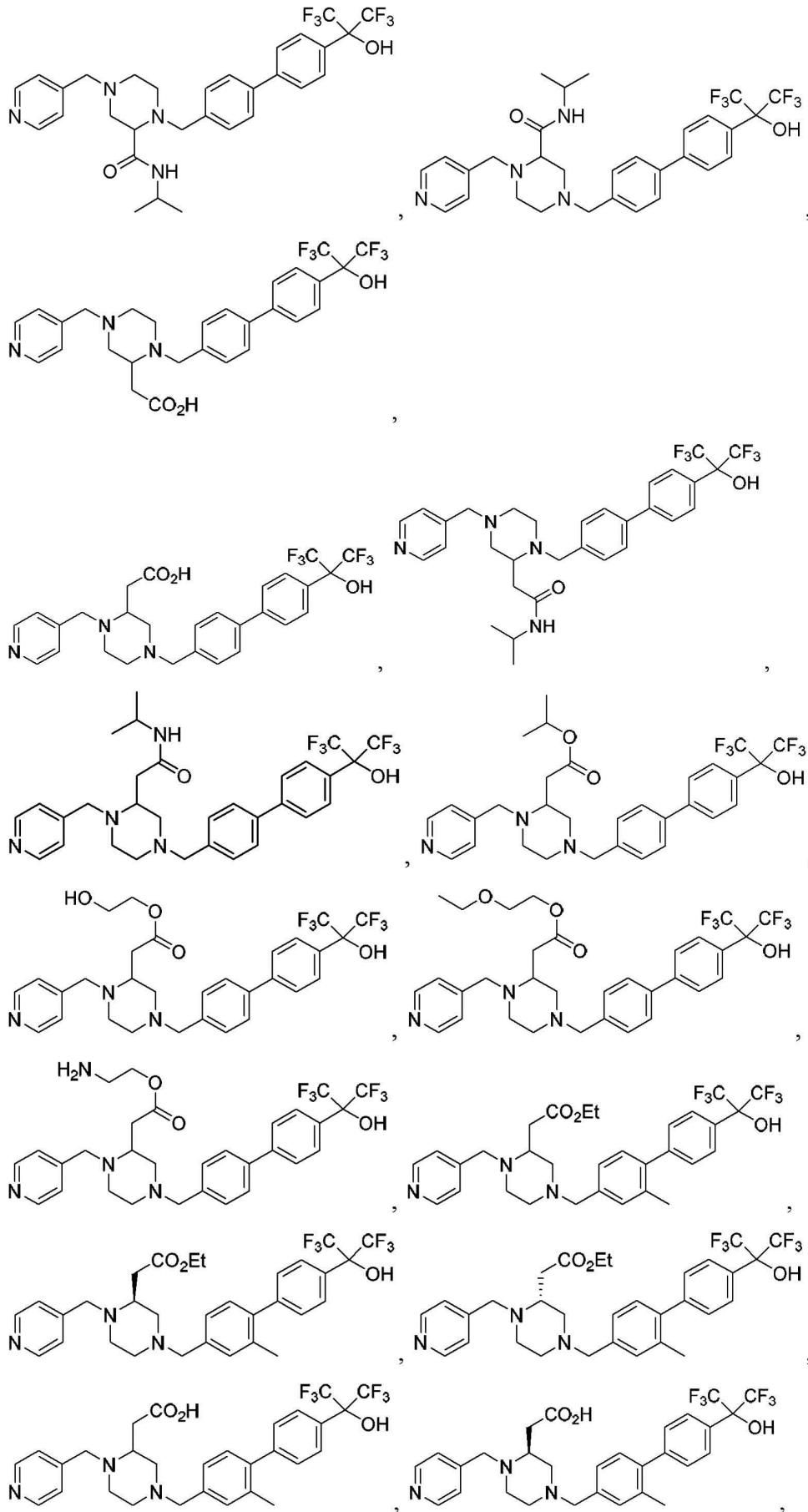
17. Соединение по любому из пп. 3-14, где R_4 представляет собой -CH₃.

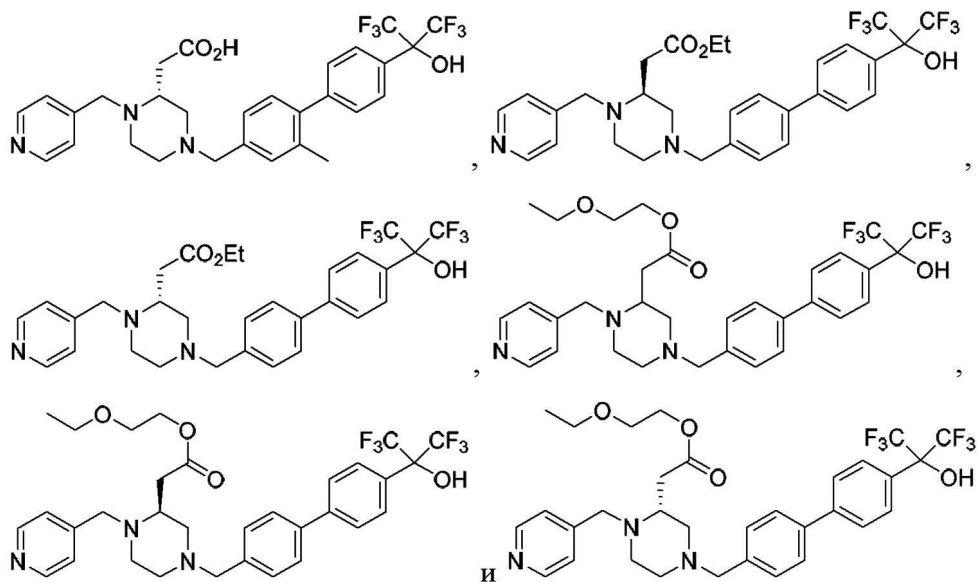
18. Соединение, выбранное из:

A 6505116102 RU



RU 2019115059 A





или его фармацевтически приемлемая соль или сольват.

19. Фармацевтическая композиция для лечения кожного заболевания, расстройства или состояния, выбранного из группы, состоящей из старения кожи, образования рубцов, псориаза, дерматита, экземы, крапивницы, розацеа, ожогов и акне, содержащая фармацевтически приемлемый разбавитель, эксципиент или связующее, и соединение по любому из пп. 1-18; или его фармацевтически приемлемую соль или сольват.

20. Применение соединения по любому из пп. 1-18 или его фармацевтически приемлемой соли или сольвата для лечения кожного заболевания, расстройства или состояния, выбранного из группы, состоящей из старения кожи, образования рубцов, псориаза, дерматита, экземы, крапивницы, розацеа, ожогов и акне.