

(19)



Евразийское
патентное
ведомство

(21) 200400304 (13) A1

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОЙ ЗАЯВКЕ

(43) Дата публикации заявки:
2004.08.26

(51)⁷ C 07D 403/12, 401/12, 407/12,
409/12, 413/12, 417/12, 403/14,
233/96

(22) Дата подачи заявки:
2002.08.09

A 61K 31/505
C 07D 239/46, 239/48
C 07C 211/00

(54) ПРОИЗВОДНЫЕ ПИРИМИДИНА, ИНГИБИРУЮЩИЕ ВИЧ

Приоритетные данные:

(31) 01203090.4; 02077748.8

(32) 2001.08.13; 2002.06.10

(33) EP

(86) PCT/EP 2002/008953

(87) WO 2003/016306 2003.02.27

(71) Заявитель:

**ЯНССЕН ФАРМАЦЕВТИКА
Н.В. (BE)**

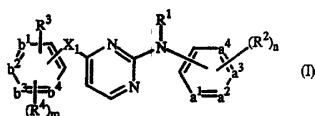
(72) Изобретатель:

**Гийемон Жером Эмиль Жорж,
Паланжян Патрис (FR), Де
Жонж Марк Рене, Койманс
Люсьен Мария Хенрикус, Вин-
керс Хендрик Мартен, Дайер
Фредерик Франс Дезире, Херес
Ян, Ван Акен Кун Жанн Аль-
фонс, Леви Паулус Йоаннес,
Жанссен Поль Адриан Ян (BE)**

(74) Представитель:

**Медведев В.Н.,
Павловский А.Н. (RU)**

(57) Настоящее изобретение относится к инги-
биторам репликации ВИЧ формулы (I)



их N-оксидам, фармацевтически приемлемым адди-
тивным солям, четвертичным аминам или стереохимически изомерным формам, где кольцо, содержащее

$-a^1=a^2-a^3=a^4-$ и $-b^1=b^2-b^3=b^4-$, представляет собой фенил, пиридил, пиримидинил, пиразинил, пиридазинил; n равен 0-5, m равен 1-4; R¹ представляет собой водород; арил; формил; C_{1,6}-алкилкарбонил; C_{1,6}-алкил; C_{1,6}-алкилоксикарбонил; замещенный C_{1,6}-алкил, C_{1,6}-алкилкарбонил; R² представляет собой гидрокси, галоген, необязательно замещенный C_{1,6}-алкил, C_{3,7}-циклоалкил, необязательно замещенный C_{2,6}-алкинил, необязательно замещенный C_{2,6}-алкилокси, C_{1,6}-алкилоксикарбонил, карбоксил, циано, нитро, amino, моно- или ди (C_{1,6}-алкил)амино, полигалогенметил, полигалогенметилокси, полигалогенметилтио, -S(=O)_pR⁶, -NH-S(=O)_pR⁶, -C(=O)R⁶, -NHC(=O)H, -C(=O)NHNH₂, -NHC(=O)R⁶, C(=NH)R⁶ или 5-членный гетероцикл; X₁ представляет собой -NR⁵, -NH-NH-, -N=N-, -O-, -C(=O)-, C_{1,4}-алкандиил, -CHOH-, -S-, -S(=O)_p-, -X₂-C_{1,4}-алкандиил- или -C_{1,4}-алкандиил-X₂; R³ представляет собой NHR¹³; NR¹³R¹⁴; -C(=O)-NHR¹³; -C(=O)-NR¹³R¹⁴; -C(=O)-R¹⁵; -CH=N-NH-C(=O)-R¹⁶, замещенный C_{1,6}-алкил, необязательно замещенный C_{1,6}-алкилокси-C_{1,6}-алкил; замещенный C_{2,6}-алкинил, замещенный C_{2,6}-алкинил, C_{1,6}-алкил, замещенный гидрокси и вторым заместителем; -C(=N-O-R⁸)-C_{1,4}-алкил; R⁷ или X₃-R⁷; R⁴ представляет собой галоген, гидрокси, C_{1,6}-алкил, C_{3,7}-циклоалкил, C_{1,6}-алкилокси, циано, нитро, полигалоген-C_{1,6}-алкил, полигалоген-C_{1,6}-алкилокси, аминокарбонил, C_{1,6}-алкилоксикарбонил, C_{1,6}-алкилкарбонил, формил, amino, моно- или ди(C_{1,4}-алкил)амино; их применению в качестве лекарственного средства, способам их получения и содержащим их фармацевтическим препаратам.

Международная заявка была опубликована вместе с отчетом о международном поиске.

200400304 A1

200400304 A1