

(19)



Евразийское  
патентное  
ведомство

(11) 006656

(13) B1

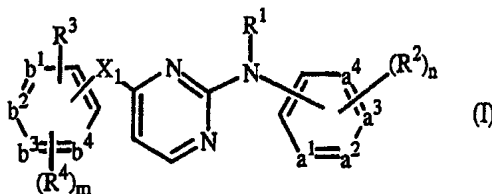
## (12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОМУ ПАТЕНТУ

- (45) Дата публикации и выдачи патента: 2006.02.24
- (21) Номер заявки: 200400304
- (22) Дата подачи: 2002.08.09
- (51) Int.Cl. C07D 403/12 (2006.01)  
C07D 401/12 (2006.01)  
C07D 407/12 (2006.01)  
C07D 409/12 (2006.01)  
C07D 413/12 (2006.01)  
C07D 417/12 (2006.01)  
C07D 403/14 (2006.01)  
C07D 233/96 (2006.01)  
A61K 31/505 (2006.01)  
C07D 239/46 (2006.01)  
C07D 239/48 (2006.01)  
C07C 211/00 (2006.01)

### (54) ПРОИЗВОДНЫЕ ПИРИМИДИНА, ИНГИБИРУЮЩИЕ ВИЧ

- (31) 01203090.4; 02077748.8
- (32) 2001.08.13; 2002.06.10
- (33) EP
- (43) 2004.08.26
- (86) PCT/EP 2002/008953
- (87) WO 2003/016306 2003.02.27
- (71)(73) Заявитель и патентовладелец:  
ЯНССЕН ФАРМАЦЕВТИКА Н.В. (BE)
- (72) Изобретатель:  
Гийемон Жером Эмиль Жорж, Паланжян Патрис (FR), Де Жонж Марк Рене, Койманс Люсьен Мария Хенрикус, Винкерс Хендрик Мартен, Дайер Фредерик Франс Дезире, Херес Ян, Ван Акен Кун Жанн Альфонс, Леви Паулус Йоаннес, Жанссен Поль Адриан Ян (BE)
- (74) Представитель:  
Медведев В.Н., Павловский А.Н. (RU)
- (56) US-A-5958935  
EP-A-0945443  
D'AURIA M. ET AL.: "Photochemical Dimerization in Solution of Arylacrylonitrile Derivatives", TETRAHEDRON, ELSEVIER SCIENCE PUBLISHERS, AMSTERDAM, NL, vol. 53, no. 51, 22 December 1997 (1997-12-22), pages 17307-17316, XP004106551, ISSN: 0040-4020, page 17311, compound n° 7  
EP-A-1002795  
WO-A-0027825

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



их N-оксидам, фармацевтически приемлемым аддитивным 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

006656

B1

B1

006656

---

фенил, пиридил, пиримидинил, пиразинил, пиридазинил; n равен 0-5, m равен 1-4; R<sup>1</sup> представляет собой водород; арил; формил; C<sub>1-6</sub>алкилкарбонил; C<sub>1-6</sub>алкил; C<sub>1-6</sub>алкилоксикарбонил; замещенный C<sub>1-6</sub> алкил, C<sub>1-6</sub>алкилкарбонил; R<sup>2</sup> представляет собой гидроксигруппу, галоген, необязательно замещенный C<sub>1-6</sub>алкил, C<sub>3-7</sub>циклоалкил, необязательно замещенный C<sub>2-6</sub>алкенил, необязательно замещенный C<sub>2-6</sub>алкинил, C<sub>1-6</sub>алкилокси, C<sub>1-6</sub>алкилоксикарбонил, карбоксил, циано, нитро, amino, моно- или ди(C<sub>1-6</sub>алкил)амино, полигалогенметил, полигалогенметилокси, полигалогенметилтио, -S(=O)<sub>p</sub>R<sup>6</sup>, -NH-S(=O)<sub>p</sub>R<sup>6</sup>, -C(=O)R<sup>6</sup>, -NHC(=O)H, -C(=O)NHNH<sub>2</sub>, -NHC(=O)R<sup>6</sup>, C(=NH)R<sup>6</sup> или 5-членный гетероцикл; X<sub>1</sub> представляет собой -NR<sup>5</sup>, -NH-NH-, -N=N-, -O-, -C(=O)-, C<sub>1-4</sub>алкандиил, -CHOH-, -S-, -S(=O)<sub>p</sub>-, -X<sub>2</sub>-C<sub>1-4</sub>алкандиил- или -C<sub>1-4</sub>алкандиил-X<sub>2</sub>; R<sup>3</sup> представляет собой NHR<sup>13</sup>; NR<sup>13</sup>R<sup>14</sup>; -C(=O)-NHR<sup>13</sup>; -C(=O)-NR<sup>13</sup>R<sup>14</sup>; -C(=O)-R<sup>15</sup>; -CH=N-NH-C(=O)-R<sup>16</sup>, замещенный C<sub>1-6</sub>алкил, необязательно замещенный C<sub>1-6</sub>алкилокси-C<sub>1-6</sub>алкил; замещенный C<sub>2-6</sub>алкенил, замещенный C<sub>2-6</sub>алкинил, C<sub>1-6</sub>алкил, замещенный гидроксигруппой и вторым заместителем; -C(=N-O-R<sup>8</sup>)-C<sub>1-4</sub>алкил; R<sup>7</sup> или X<sub>3</sub>-R<sup>7</sup>; R<sup>4</sup> представляет собой галоген, гидроксигруппу, C<sub>1-6</sub>алкил, C<sub>3-7</sub>циклоалкил, C<sub>1-6</sub>алкилокси, циано, нитро,

---