



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(51) МПК
C07D 513/04 (2006.01)

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**(21), (22) Заявка: **2008143557/04**, 27.03.2007(30) Конвенционный приоритет:
06.04.2006 EP 06112297.4(43) Дата публикации заявки: **20.06.2010** Бюл. № 17(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную
фазу: **06.11.2008**(86) Заявка РСТ:
EP 2007/052916 (27.03.2007)(87) Публикация РСТ:
WO 2007/115933 (18.10.2007)Адрес для переписки:
**101000, Москва, М.Златоустинский пер., 10,
кв.15, "ЕВРОМАРКПАТ"**

(71) Заявитель(и):

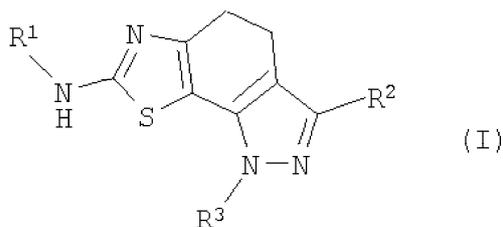
**БЁРИНГЕР ИНГЕЛЬХАЙМ
ИНТЕРНАЦИОНАЛЬ ГМБХ (DE)**

(72) Автор(ы):

**ГРАУЭРТ Маттиас (DE),
МАЙЕР Удо (DE),
ХОФФМАНН Маттиас (DE),
ШОЙЕРЕР Штефан (DE),
ЙЁРГЕНСЕН Анне Т. (DK),
ПАУЧ Александер (DE),
БРАНДЛЬ Трикси (CH),
ХЁНКЕ Кристоф (DE),
БРАЙТФЕЛЬДЕР Штеффен (DE),
ЭРБ Клаус (DE),
ПИПЕР Михаэль (DE),
ПРАГСТ Инго (DE)**(54) **ТИАЗОЛИЛДИГИДРОИНДАЗОЛЫ**

(57) Формула изобретения

1. Соединения общей формулы (I)

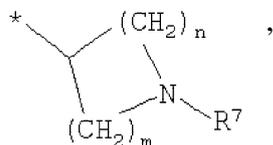


в которой R^1 обозначает водород, $CO-CH_3$, $CO-CH_2-R^4$, $CO-CHMe-R^4$, $CO-OR^4$, $CO-SR^4$, $CO-NH_2$ или $CO-NHR^4$,

R^2 обозначает остаток, выбранный из группы, включающей C_3-C_6 циклоалкил, C_1-C_4 алкил- C_3-C_6 циклоалкил-, C_2-C_4 алкенил- C_3-C_6 циклоалкил-, C_2-C_4 алкинил- C_3-C_6 циклоалкил-, C_5-C_6 циклоалкенил, C_1-C_6 алкил- C_5-C_6 циклоалкенил-, C_2-C_4 алкенил- C_5-C_6 циклоалкенил-, C_2-C_4 алкинил- C_5-C_6 циклоалкенил-, C_5-C_6 циклоалкинил, C_1-C_6 алкил- C_5-C_6 циклоалкинил-, C_2-C_4 алкенил- C_5-C_6 циклоалкинил- и C_2-C_4 алкинил- C_5-C_6 циклоалкинил-, каждый из которых необязательно может быть замещен одним или двумя остатками из группы, включающей CH_3 , F, OCH_3 , OH и NH_2 ,

R^3 обозначает остаток, выбранный из группы, включающей C_6-C_{14} арил, C_1-

С₆алкил-С₆-С₁₄арил-, С₂-С₆алкенил-С₆-С₁₄арил-, С₂-С₆алкинил-С₆-С₁₄арил-, С₅-С₁₀гетероарил, С₁-С₁₂алкил-С₅-С₁₀гетероарил-, С₃-С₁₂алкенил-С₅-С₁₀гетероарил-, С₃-С₁₂алкинил-С₅-С₁₀гетероарил-, С₃-С₆циклоалкил, С₁-С₆алкил-С₃-С₆циклоалкил-, С₂-С₄алкенил-С₃-С₆циклоалкил-, С₂-С₄алкинил-С₃-С₆циклоалкил-, С₅-С₆циклоалкенил, С₁-С₆алкил-С₅-С₆циклоалкенил-, С₂-С₄алкенил-С₅-С₆циклоалкенил-, С₂-С₄алкинил-С₅-С₆циклоалкенил-, С₅-С₆циклоалкинил, С₁-С₆алкил-С₅-С₆циклоалкинил-, С₂-С₄алкенил-С₅-С₆циклоалкинил- и С₂-С₄алкинил-С₅-С₆циклоалкинил-, каждый из которых необязательно может быть замещен одним остатком R⁵ и одним-тремя остатками R⁶, или необязательно замещенный остаток



при этом n и m независимо друг от друга обозначают 1 или 2,

R⁴ обозначает необязательно замещенный остаток, выбранный из группы, включающей С₁-С₄алкил, С₂-С₁₀алкенил, С₂-С₁₀алкинил, С₃-С₆циклоалкил-С₁-С₄алкил-, С₃-С₆циклоалкил-С₃-С₁₀алкенил-, С₃-С₆циклоалкил-С₃-С₁₀алкинил-, С₆-С₁₄арил, С₆-С₁₄арил-С₁-С₄алкил-, С₅-С₁₀гетероарил, С₅-С₁₀гетероарил-С₁-С₄алкил- и галоалкил,

R⁵ обозначает CONR⁸R⁹, NR⁸COR⁹, NR⁸R⁹, OR⁹ или -С₁-С₄алкил-CONR⁸R⁹,

R⁶ в каждом случае независимо обозначает F, Cl, Br, OH, CN, CF₃, CHF₂ или необязательно замещенный остаток, выбранный из группы, включающей -О-С₁-С₃алкил, -О-С₃-С₄алкенил, -О-С₃-С₄алкинил, С₁-С₃алкил, С₂-С₆алкенил, С₂-С₃алкинил, С₃-С₆циклоалкил-С₁-С₄алкил-, С₃-С₆циклоалкил-С₂-С₄алкенил-, С₃-С₆циклоалкил-С₂-С₄алкинил-, С₅-С₆циклоалкенил-С₁-С₄алкил-, С₅-С₆циклоалкенил-С₃-С₁₀алкенил-, С₅-С₆циклоалкенил-С₂-С₄алкинил-, С₆-С₁₄арил-С₁-С₄алкил-, С₆-С₁₄арил-С₂-С₄алкенил-, С₆-С₁₄арил-С₂-С₄алкинил-, С₅-С₁₀гетероарил-С₁-С₄алкил-, С₅-С₁₀гетероарил-С₂-С₄алкенил- и С₅-С₁₀гетероарил-С₂-С₄алкинил-,

R⁷ обозначает водород, COR⁹, CONR⁸R⁹ или остаток, выбранный из группы, включающей С₁-С₁₀алкил, С₃-С₁₀алкенил, С₃-С₁₀алкинил, С₃-С₆циклоалкил-С₁-С₄алкил-, С₃-С₆циклоалкил-С₃-С₁₀алкенил-, С₃-С₆циклоалкил-С₃-С₁₀алкинил-, С₅-С₆циклоалкенил-С₁-С₄алкил-, С₅-С₆циклоалкенил-С₃-С₁₀алкенил-, С₅-С₆циклоалкенил-С₃-С₁₀алкинил-, С₆-С₁₄арил, С₁-С₁₀алкил-С₆-С₁₄арил-, С₂-С₁₀алкенил-С₆-С₁₄арил-, С₂-С₁₀алкинил-С₆-С₁₄арил-, С₅-С₁₀гетероарил, С₁-С₁₂алкил-С₅-С₁₀гетероарил-, С₃-С₁₂алкенил-С₅-С₁₀гетероарил- и С₃-С₁₂алкинил-С₅-С₁₀гетероарил-, каждый из которых необязательно может быть замещен остатком R¹⁴ и остатком R¹³,

R⁸ обозначает водород или необязательно замещенный остаток, выбранный из группы, включающей С₁-С₁₀алкил, С₃-С₁₀алкенил, С₃-С₁₀алкинил, С₃-С₆циклоалкил-С₁-С₄алкил-, С₃-С₆циклоалкил-С₃-С₁₀алкенил-, С₃-С₆циклоалкил-С₃-С₁₀алкинил-, С₅-С₆циклоалкенил-С₁-С₄алкил-, С₅-С₆циклоалкенил-С₃-С₁₀алкенил-, С₅-С₆циклоалкенил-С₃-С₁₀алкинил-, С₆-С₁₄арил-С₁-С₄алкил-, С₆-С₁₄арил-С₃-С₁₀алкенил-, С₆-С₁₄арил-С₃-С₁₀алкинил-, С₅-С₁₀гетероарил, С₅-С₁₀гетероарил-С₁-С₄алкил-, С₅-С₁₀гетероарил-С₁-С₄алкенил-, С₅-С₁₀гетероарил-С₁-С₄алкинил-, С₁-С₄алкил-О-С₂-С₄алкил-, С₁-С₄алкил-О-С₄-С₆алкенил- и С₁-С₄алкил-О-С₄-С₆алкинил-,

R⁹ обозначает водород, необязательно замещенный остаток, выбранный из группы, включающей С₁-С₁₂алкил, С₃-С₁₂алкенил, С₃-С₁₂алкинил, С₃-С₆циклоалкил-С₁-С₁₂алкил-, С₃-С₆циклоалкил-С₃-С₁₂алкенил-, С₃-С₆циклоалкил-С₃-С₁₂алкинил-, С₅-С₆циклоалкенил-С₁-С₄алкил-, С₅-С₆циклоалкенил-С₃-С₁₀алкенил-, С₅-С₆циклоалкенил-

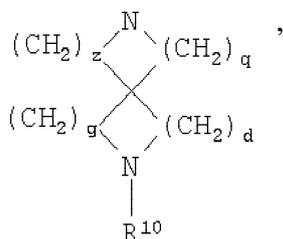
C₃-C₁₀алкинил-, C₆-C₁₄арил-C₁-C₁₂алкил-, C₆-C₁₄арил-C₃-C₁₂алкенил-, C₆-C₁₄арил-C₃-C₁₂алкинил-, C₆-C₁₄арил, C₁-C₁₂алкил-C₆-C₁₄арил-, C₂-C₁₂алкенил-C₆-C₁₄арил-, C₂-C₁₂алкинил-C₆-C₁₄арил-, C₅-C₁₀гетероарил, C₅-C₁₀гетероарил-C₁-C₁₂алкил-, C₅-C₁₀гетероарил-C₃-C₁₂алкенил-, C₅-C₁₀гетероарил-C₃-C₁₂алкинил-, C₃-C₈циклоалкил, C₅-C₈циклоалкенил, NR¹¹R¹²-C₃-C₈циклоалкил-, NR¹¹R¹²-C₅-C₈циклоалкенил- и NR¹¹R¹²-C₅-C₈циклоалкинил-, или необязательно замещенный C₅-

C₈гетероциклоалкил-(CH₂)_q-остаток, содержащий по меньшей мере одну NR¹⁰-группу в 3-8-членном гетероцикле, или

R⁸ и R⁹ совместно образуют насыщенный либо ненасыщенный 4-7-членный алкильный мостик, который необязательно содержит O-атом или S(O)_p-группу, при этом

p и q независимо друг от друга обозначают 0, 1 или 2, или

NR⁸R⁹ обозначает 5-6-членный гетероцикл, необязательно содержащий еще один N-атом и необязательно замещенный остатком, выбранным из группы, включающей R¹⁰, NR¹¹R¹² и NR¹¹R¹² C₁-C₄алкил-, или остаток



где z, q, g и d независимо друг от друга обозначают 1, 2 или 3, а

R¹⁰ обозначает водород или необязательно замещенный остаток, выбранный из группы, включающей C₁-C₁₀алкил, C₃-C₁₀алкенил, C₃-C₁₀алкинил, C₃-C₇циклоалкил-C₁-C₁₀алкил-, C₃-C₇циклоалкил-C₃-C₁₀алкенил-, C₃-C₇циклоалкил-C₃-C₁₀алкинил-, C₃-C₇циклоалкил, C₁-C₆алкил-C₃-C₇циклоалкил-, C₂-C₄алкенил-C₃-C₇циклоалкил-, C₂-C₄алкинил-C₃-C₇циклоалкил-, тетрагидропиранил и (NR⁴)₂CH-C₁-C₁₀алкил-,

R¹¹, R¹² имеют одинаковые или разные значения и обозначают водород или необязательно замещенный остаток, выбранный из группы, включающей C₁-C₁₀алкил, C₃-C₁₀алкенил, C₃-C₁₀алкинил, C₃-C₆циклоалкил-C₁-C₄алкил- и C₃-C₆циклоалкил, или

R¹¹ и R¹² совместно образуют 4-7-членную алкильную цепь, необязательно содержащую гетероатом,

R¹³ обозначает F, Cl, Br, OH, CN, CF₃, CHF₂ или C₁-C₄алкил-O-,

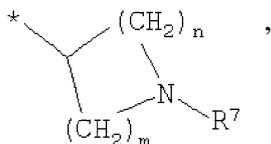
R¹⁴ обозначает NR¹¹R¹² или необязательно замещенный C₃-C₈гетероциклоалкил-(CH₂)_q-остаток, содержащий по меньшей мере одну NR¹⁰-группу в 3-8-членном гетероцикле, или

R¹³ и R¹⁴ совместно образуют насыщенный либо ненасыщенный 4-7-членный алкильный мостик, который необязательно содержит O-атом или S(O)_p-группу, необязательно в виде их таутомеров, их рацематов, их энантиомеров, их диастереомеров и их смесей, а также необязательно в виде их фармакологически безвредных кислотно-аддитивных солей, сольватов и гидратов.

2. Соединения по п.1, в которых R¹ и R³-R¹⁴ могут иметь указанные выше значения, а R² обозначает остаток, выбранный из группы, включающей C₃-C₆циклоалкил, C₁-C₆алкил-C₃-C₆циклоалкил- и C₂-C₄алкенил-C₃-C₆циклоалкил-, каждый из которых необязательно замещен одним или двумя остатками из группы, включающей CH₃, F,

ОСН₃, ОН и NH₂.

3. Соединения по п.1, в которых R¹, R² и R⁴-R¹⁴ могут иметь указанные выше значения, а R³ обозначает остаток, выбранный из группы, включающей фенил и C₅-C₆циклоалкил, каждый из которых необязательно может быть замещен одним остатком R⁵ и одним-тремя остатками R⁶, или необязательно замещенный остаток



где n и m независимо друг от друга обозначают 1 или 2.

4. Соединения по п.1, в которых

R¹-R⁷ и R¹⁰-R¹⁴ могут иметь указанные выше значения, а

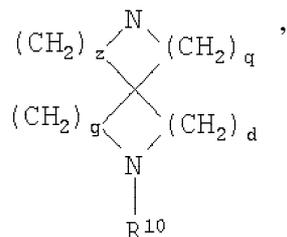
R⁸ обозначает водород или необязательно замещенный остаток, выбранный из группы, включающей C₁-C₁₀алкил, C₃-C₁₀алкенил, C₃-C₁₀алкинил и C₁-C₄алкил-О-C₂-C₄алкил-,

R⁹ обозначает водород, необязательно замещенный остаток, выбранный из группы, включающей C₁-C₁₂алкил, C₃-C₁₂алкенил, C₃-C₁₂алкинил, C₃-C₆циклоалкил-C₁-C₁₂алкил-, C₆-C₁₄арил, C₁-C₁₂алкил-C₆-C₁₄арил-, C₂-C₁₂алкенил-C₆-C₁₄арил-, C₂-C₁₂алкинил-C₆-C₁₄арил-, C₅-C₁₀гетероарил, C₅-C₁₀гетероарил-C₁-C₁₂алкил-, C₅-C₁₀гетероарил-C₃-C₁₂алкенил-, C₅-C₁₀гетероарил-C₃-C₁₂алкинил-, C₃-C₈циклоалкил, C₅-C₈циклоалкенил и NR¹¹R¹²-C₃-C₈циклоалкил-, или необязательно замещенный C₃-C₈гетероциклоалкил-(CH₂)_q-остаток, содержащий по меньшей мере одну NR¹⁰-группу в 3-8-членном гетероцикле, или

R⁸ и R⁹ совместно образуют насыщенный либо ненасыщенный 4-7-членный алкильный мостик, который необязательно содержит О-атом или S(O)_p-группу, при этом

p и q независимо друг от друга обозначают 0, 1 или 2, или

NR⁸R⁹ обозначает 5-6-членный гетероцикл, необязательно содержащий еще один N-атом и необязательно замещенный остатком, выбранным из группы, включающей R¹⁰, NR¹¹R¹² и NR¹¹R¹² C₁-C₄алкил-, или остаток



где z, q, g и d независимо друг от друга обозначают 1, 2 или 3.

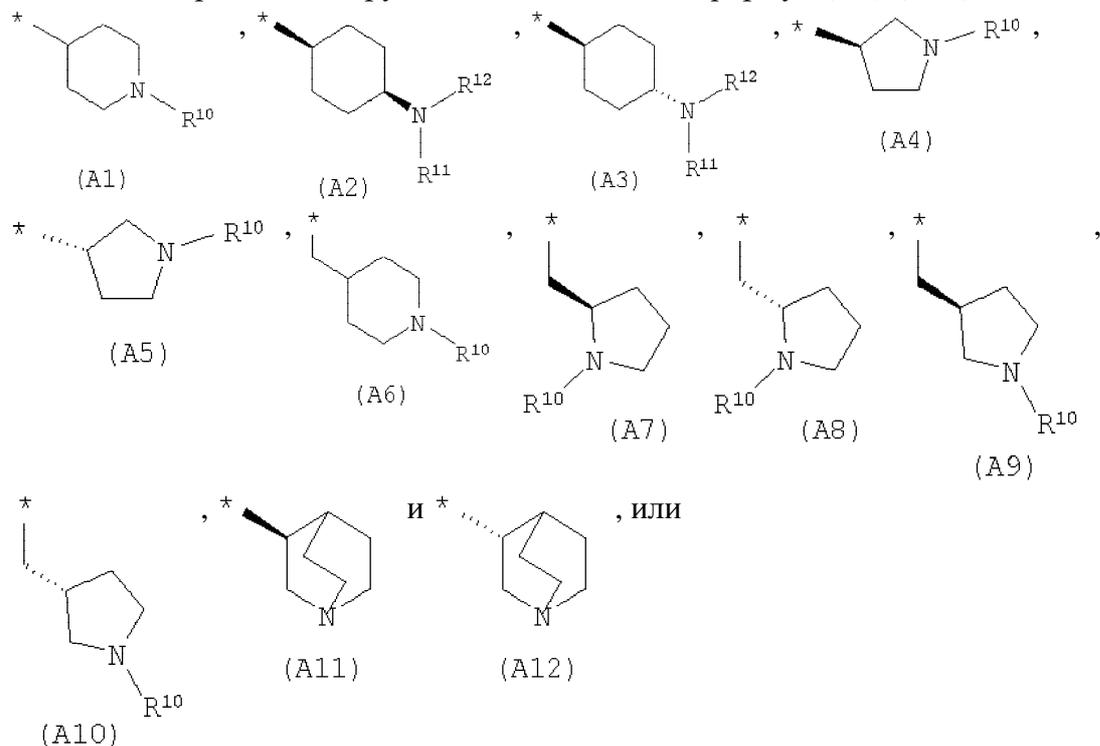
5. Соединения по п.1, в которых

R¹-R⁷ и R¹⁰-R¹⁴ могут иметь указанные выше значения, а

R⁸ обозначает водород или необязательно замещенный остаток, выбранный из группы, включающей C₁-C₁₀алкил, C₃-C₁₀алкенил, C₃-C₁₀алкинил и C₁-C₄алкил-О-C₁-C₄алкил-,

R⁹ обозначает водород, необязательно замещенный остаток, выбранный из группы, включающей C₁-C₁₂алкил, C₃-C₁₂алкенил, C₃-C₁₂алкинил, C₃-C₆циклоалкил-C₁-C₁₂алкил-, C₆-C₁₄арил, C₁-C₁₂алкил-C₆-C₁₄арил-, C₂-C₁₂алкенил-C₆-C₁₄арил-, C₂-C₁₂алкинил-C₆-C₁₄арил-, C₅-C₁₀гетероарил, C₅-C₁₀гетероарил-C₁-C₁₂алкил-, C₅-C₁₀гетероарил-C₃-C₁₂алкенил-, C₅-C₁₀гетероарил-C₃-C₁₂алкинил-, C₃-C₈циклоалкил,

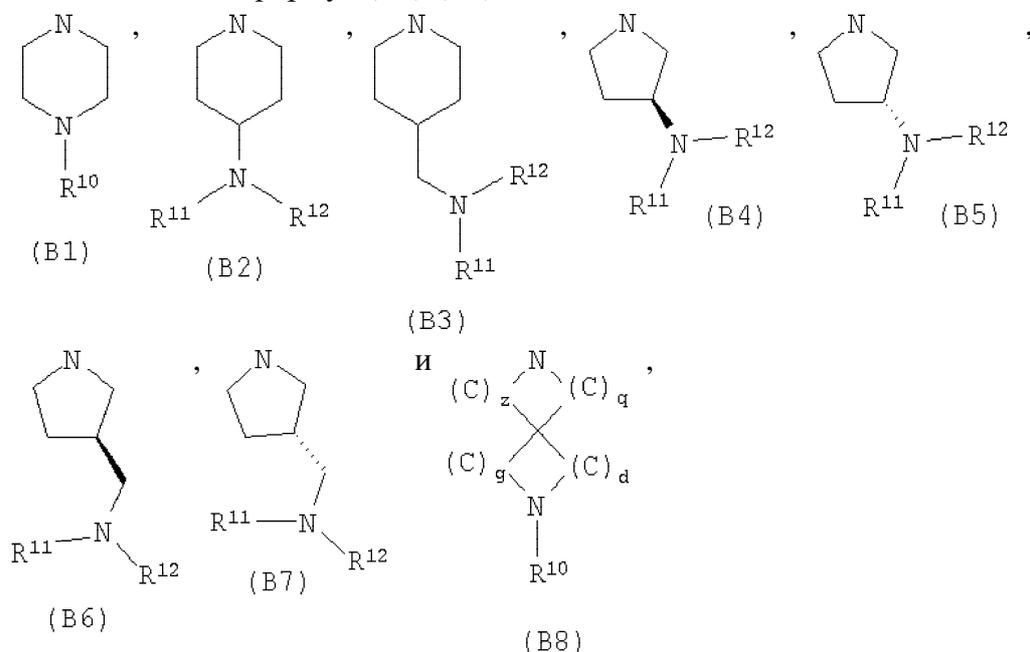
C₅-C₈циклоалкинил и NR¹¹R¹²-C₃-C₈циклоалкил-, или необязательно замещенный остаток, выбранный из группы остатков общих формул (A1)-(A12)



R⁸ и R⁹ совместно образуют насыщенный либо ненасыщенный 4-7-членный алкильный мостик, который необязательно содержит O-атом или S(O)_p-группу, при этом

p и q независимо друг от друга обозначают 0, 1 или 2, или

NR⁸R⁹ обозначает необязательно замещенный остаток, выбранный из группы остатков общих формул (B1)-(B8)



где z, q, g и d независимо друг от друга обозначают 1, 2 или 3.

6. Соединения по одному из пп.1-5, в которых R¹-R⁸ и R¹⁰-R¹² могут иметь указанные выше значения, а R⁷ обозначает COR⁹ или CONR⁸R⁹.

7. Соединения по одному из пп.1-5, в которых R¹-R⁵ и R⁷-R¹⁴ могут иметь указанные выше значения, а R⁶ в каждом случае независимо обозначает F, Cl, CF₃ или необязательно замещенный остаток из группы, включающей -O-C₁-C₃алкил и C₁-

С₃алкил.

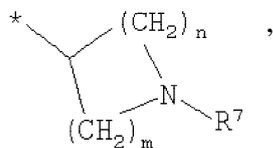
8. Соединения по одному из пп.1-5, в которых

R⁴-R⁶ и R¹⁰-R¹² могут иметь указанные выше значения, а

R¹ обозначает CO-CH₃ или CO-CH₂-R⁴,

R² обозначает циклопропил, необязательно замещенный одним или двумя остатками из группы, включающей CH₃, F, OCH₃, OH и NH₂,

R³ обозначает необязательно замещенный остаток

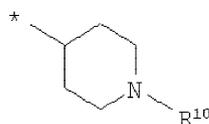


при этом n и m независимо друг от друга обозначают 1 или 2,

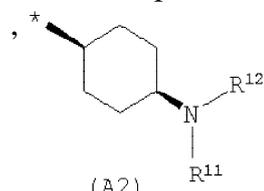
R⁷ обозначает водород, COR⁹ или CONR⁸R⁹,

R⁸ обозначает водород или C₁-C₁₀алкил,

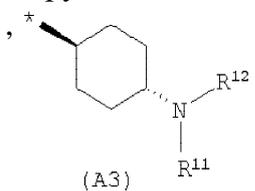
R⁹ обозначает водород, необязательно замещенный остаток, выбранный из группы, включающей C₃-C₈циклоалкил и NR¹¹R¹²-C₃-C₈циклоалкил-, или необязательно замещенный остаток, выбранный из группы остатков общих формул (A1)-(A12)



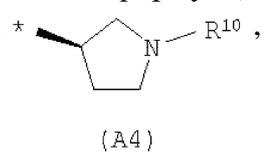
(A1)



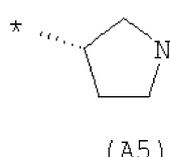
(A2)



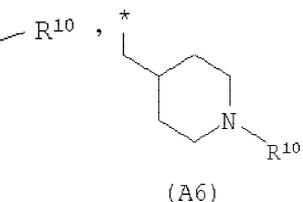
(A3)



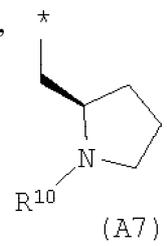
(A4)



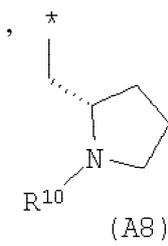
(A5)



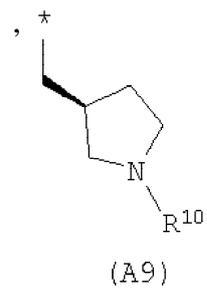
(A6)



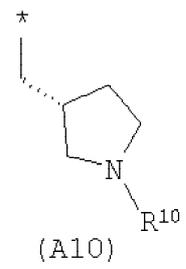
(A7)



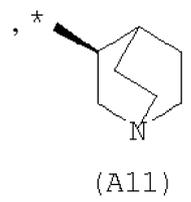
(A8)



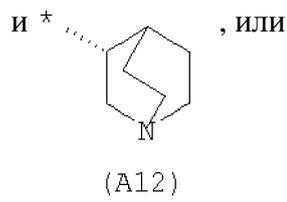
(A9)



(A10)



(A11)



(A12)

NR⁸R⁹ обозначает 5-6-членный гетероцикл, содержащий 1-3 N-атома и необязательно замещенный остатком, выбранным из группы, включающей R¹⁰, NR¹¹R¹² и NR¹¹R¹²C₁-C₄алкил-.

9. Соединения по одному из пп.1-5, в которых

R⁴-R⁶ и R¹⁰-R¹² могут иметь указанные выше значения, а

R¹ обозначает CO-CH₃ или CO-CH₂-R⁴,

R² обозначает C₃-C₆циклоалкил, который необязательно может быть замещен одним или двумя остатками из группы, включающей CH₃, F, OCH₃, OH и NH₂,

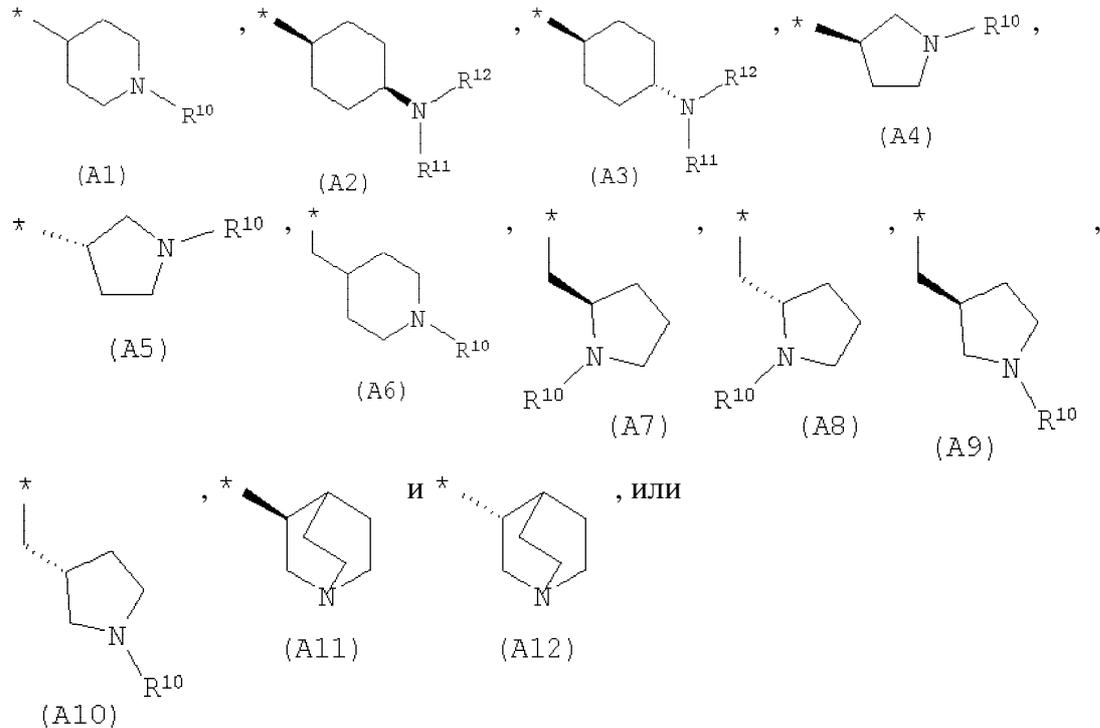
R³ обозначает остаток, выбранный из группы, включающей фенил и C₅-C₆циклоалкил, каждый из которых необязательно может быть замещен одним остатком R⁵ и одним-тремя остатками R⁶,

R^5 обозначает NR^8R^9 , $CONR^8R^9$, NR^8COR^9 или $-C_1-C_4$ алкил- $CONR^8R^9$,

R^6 в каждом случае независимо обозначает F, Cl, Br, CF_3 или необязательно замещенный остаток, выбранный из группы, включающей $-O-C_1-C_3$ алкил, C_1-C_3 алкил, C_3-C_6 циклоалкил- C_1-C_4 алкил- и C_6-C_{14} арил- C_1-C_4 алкил-,

R^8 обозначает водород или необязательно замещенный C_1-C_{10} алкил,

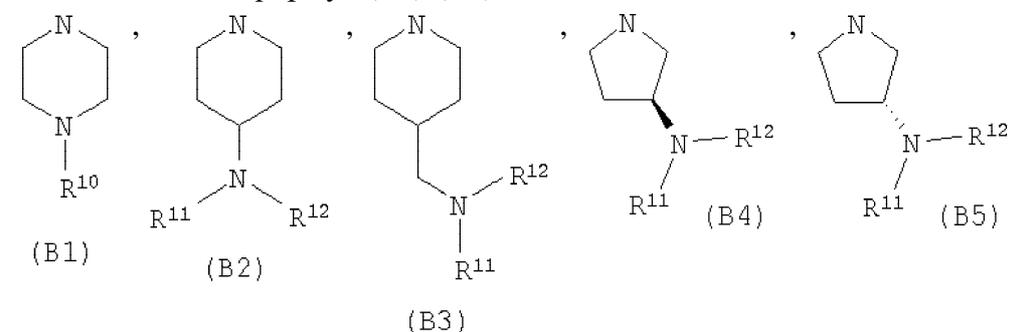
R^9 обозначает водород, необязательно замещенный остаток, выбранный из группы, включающей C_1-C_{12} алкил, C_3-C_6 циклоалкил- C_1-C_{12} алкил-, C_6-C_{14} арил, C_1-C_{12} алкил- C_6-C_{14} арил-, C_5-C_{10} гетероарил, C_5-C_{10} гетероарил- C_1-C_{12} алкил-, C_3-C_8 циклоалкил, C_5-C_8 циклоалкенил и $NR^{11}R^{12}$ - C_3-C_8 циклоалкил-, или необязательно замещенный остаток, выбранный из группы остатков общих формул (A1)-(A12)

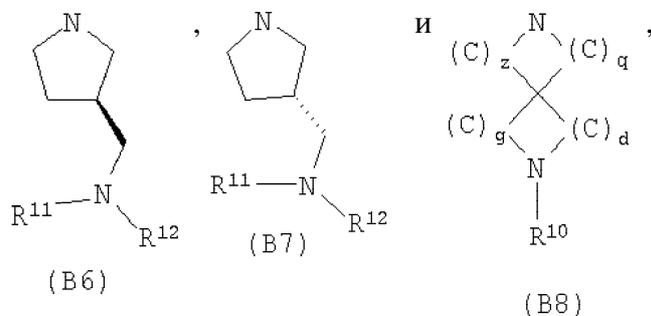


R^8 и R^9 совместно образуют насыщенный либо ненасыщенный 4-7-членный алкильный мостик, который необязательно содержит O-атом или $S(O)_p$ -группу, при этом

p и q независимо друг от друга обозначают 0, 1 или 2, или

NR^8R^9 обозначает необязательно замещенный остаток, выбранный из группы остатков общих формул (B1)-(B8)





где z, q, g и d независимо друг от друга обозначают 1, 2 или 3, а

R¹⁰ обозначает водород или необязательно замещенный остаток, выбранный из группы, включающей C₁-C₁₀алкил, C₃-C₇циклоалкил-C₁-C₁₀алкил-, C₃-C₇циклоалкил, C₁-C₆алкил-C₃-C₇циклоалкил-, тетрагидропиранил и (NR)₂CH-C₁-C₁₀алкил-.

10. Соединения по одному из пп.1-5 для применения в качестве лекарственных средств.

11. Применение соединений по одному из пп.1-9 для приготовления лекарственного средства, предназначенного для лечения заболеваний, в патологии которых участвует активность Р13-киназ и при которых соединения формулы (I) способны при их применении в терапевтически эффективных дозах проявлять терапевтическое действие.

12. Применение по п.11, отличающееся тем, что под указанными заболеваниями подразумеваются воспалительные и аллергические заболевания дыхательных путей.

13. Применение по п.12, отличающееся тем, что речь идет о заболевании, выбранном из группы, включающей хронический бронхит, острый бронхит, бронхит вследствие бактериальной или вирусной инфекции либо поражения грибами или гельминтами, аллергический бронхит, токсический бронхит, хронический обструктивный бронхит (хроническое обструктивное заболевание легких (ХОЗЛ)), астму (наследственную и аллергическую), детскую астму, бронхоэктазы, аллергический альвеолит, аллергический и неаллергический ринит, хронический синусит, кистозный фиброз и муковисцидоз, дефицит α1-антитрипсина, кашель, эмфизему легких, интерстициальные заболевания легких, альвеолит, повышенную реактивность дыхательных путей, полипы носа, отеки легких, пневмонит различного генеза, такой как лучевой пневмонит, обусловленный вдыханием токсических веществ пневмонит или инфекционный пневмонит, коллагенозы, такие как красная волчанка, системная склеродермия, саркоидоз и болезнь Бека.

14. Применение по п.11, отличающееся тем, что под указанными заболеваниями подразумеваются воспалительные и аллергические кожные болезни.

15. Применение по п.14, отличающееся тем, что речь идет о заболевании, выбранном из группы, включающей псориаз, контактный дерматит, атонический дерматит, круговую алопецию, экссудативную многоформную эритему (синдром Стивена-Джонсона), герпетиформный дерматит, склеродермию, витилиго, крапивницу (Urticaria), красную волчанку, фолликулярную и поверхностную пиодермии, эндогенные и экзогенные угри, розовые угри, а также иные воспалительные, аллергические и пролиферативные кожные болезни.

16. Применение по п.11, отличающееся тем, что под указанными заболеваниями подразумеваются воспалительные заболевания глаз.

17. Применение по п.16, отличающееся тем, что речь идет о заболевании, выбранном из группы, включающей конъюнктивиты различных форм, такие как конъюнктивит, вызванный грибковыми или бактериальными инфекциями, аллергический конъюнктивит, конъюнктивит вследствие воздействия раздражающих факторов, вызванный медикаментами конъюнктивит, кератит и увеит.

18. Применение по п.11, отличающееся тем, что под указанными заболеваниями

подразумеваются заболевания слизистой оболочки носа.

19. Применение по п.18, отличающееся тем, что речь идет о заболевании, выбранном из группы, включающей аллергический ринит, аллергический синусит и полипы носа.

20. Применение по п.11, отличающееся тем, что под указанными заболеваниями подразумеваются воспалительные или аллергические болезненные состояния, в которых участвуют аутоиммунные реакции.

21. Применение по п.20, отличающееся тем, что речь идет о заболевании, выбранном из группы, включающей болезнь Крона, язвенный колит, системную красную волчанку, хронический гепатит, множественный склероз, ревматоидный артрит, псориатический артрит, остеоартрит и ревматоидный спондилит.

22. Применение по п.11, отличающееся тем, что под указанными заболеваниями подразумеваются воспаления почек.

23. Применение по п.22, отличающееся тем, что речь идет о заболевании, выбранном из группы, включающей гломерулонефрит, интерстициальный нефрит и идиопатический нефротический синдром.

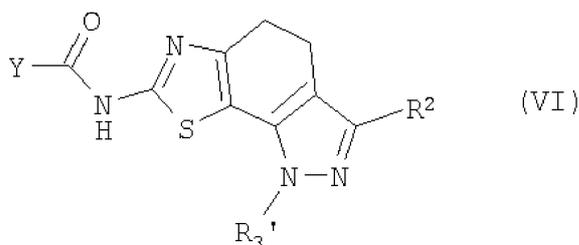
24. Фармацевтическая композиция, содержащая соединение формулы (I) по одному из пп.1-9.

25. Фармацевтическая композиция по п.24, вводимая в организм путем ингаляции и содержащая соединение формулы (I) по одному из пп.1-9.

26. Фармацевтическая композиция по п.24, перорально вводимая в организм и содержащая соединение формулы (I) по одному из пп.1-9.

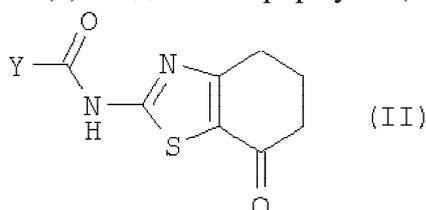
27. Комбинации лекарственных средств, которые наряду с одним или несколькими соединениями формулы (I) по одному из пп.1-9 содержат в качестве другого действующего вещества одно или несколько соединений, выбранных из классов бетаиметиков, антихолинергических средств, кортикостероидов, ингибиторов ФДЭ4, антагонистов LTD4, ингибиторов EGFR, агонистов дофамина, антагонистов рецептора гистамина H1, антагонистов PAF и ингибиторов PI3-киназы, либо их двух- или трехкомпонентные комбинации.

28. Способ получения соединений общей формулы (VI)

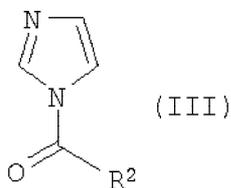


в которой остаток R^2 может иметь указанные выше значения, R_3' обозначает необязательно замещенный остаток, выбранный из группы, включающей 4-PhCOOMe, 4-PhNO₂, 4-пиперидил, цис/транс-4-алкоксикарбонилциклогексил и 4-метоксикарбонилметилфенил, а Y обозначает C₁-C₄алкил или -S-C₁-C₄алкил, отличающийся тем, что

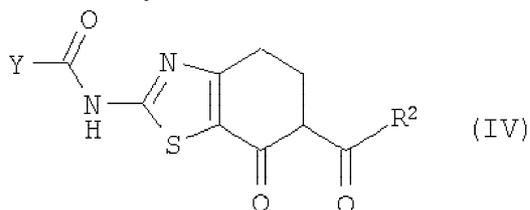
(а) соединение формулы (II)



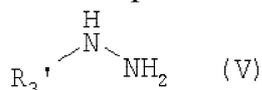
подвергают взаимодействию с соединением формулы (III)



в которой R^2 может иметь указанные выше значения, и
(б) полученное на стадии (а) соединение формулы (IV)

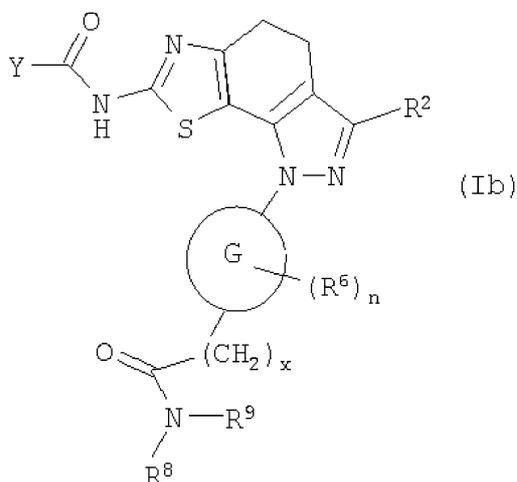


подвергают взаимодействию с соединением формулы (V)



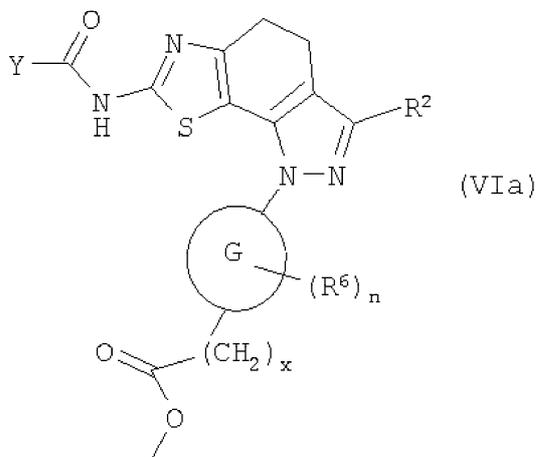
в которой R_3' может иметь указанные выше значения, и циклизируют до соединения формулы (VI).

29. Способ получения соединений общей формулы (Ib)

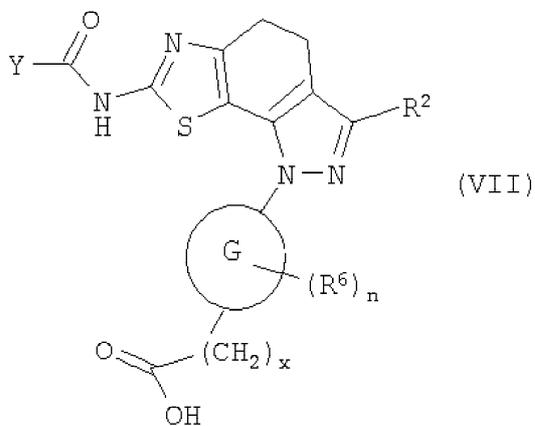


в которой R^2 , R^6 , R^8 и R^9 могут иметь указанные выше значения, G обозначает фенил или циклогексил, а X обозначает 0 или 1, отличающийся тем, что

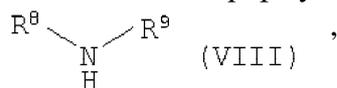
(а) соединение формулы (VIa)



в которой R^2 , R^6 и Y могут иметь указанные выше значения, действием гидроксида щелочного металла превращают в соединение формулы (VII)

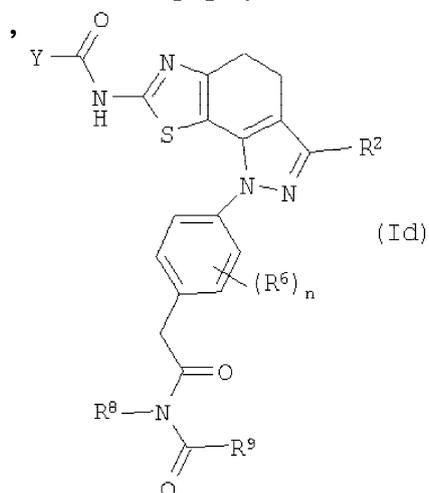
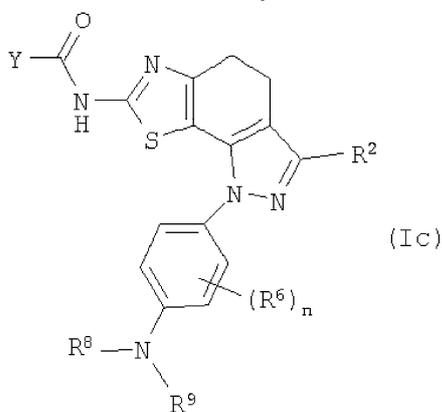


(б) полученное на стадии (а) соединение формулы (VII) подвергают взаимодействию с соединением формулы (VIII)

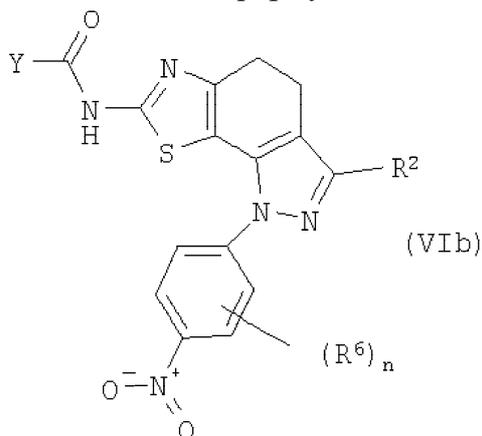


в которой R^8 и R^9 могут иметь указанные выше значения, с получением соединения формулы (Ib).

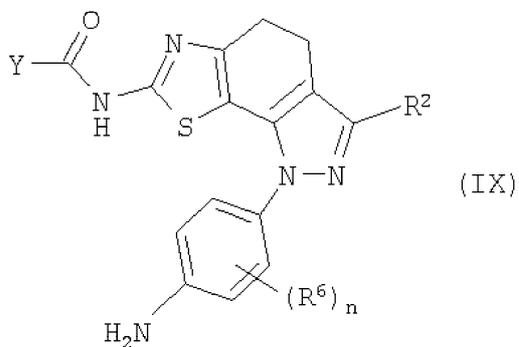
30. Способ получения соединений общей формулы (Ic) или (Id)



где R^2 , R^6 , R^8 , R^9 и Y могут иметь указанные выше значения, отличающийся тем, что соединение формулы (VIb)

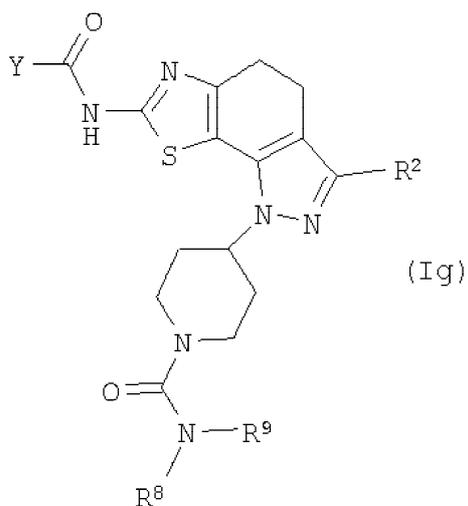
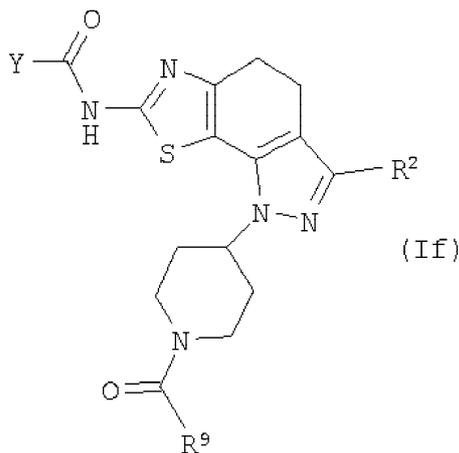
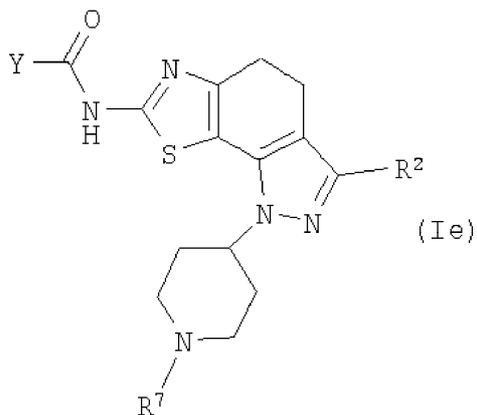


восстанавливают до соединения формулы (IX)

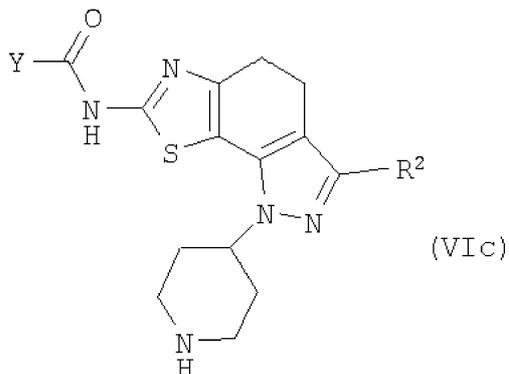


(б) полученное на стадии (а) соединение формулы (IX) путем гидроаминирования превращают в соединение формулы (Ic) или (Id).

31. Способ получения соединений общей формулы (Ie), (If) или (Ig)

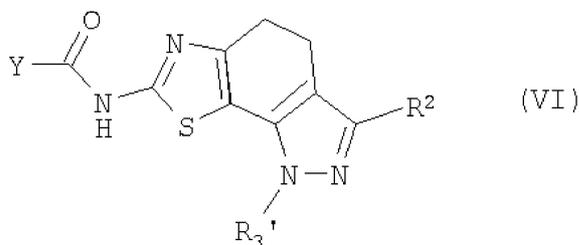


где R^2 , R^7 , R^8 , R^9 и Y могут иметь указанные выше значения, отличающийся тем, что соединение формулы (VIc)



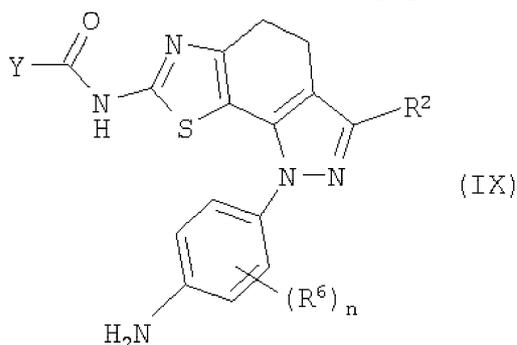
путем гидроаминирования превращают в соединение формулы (Ie), (If) или (Ig).

32. Соединения общей формулы (VI)



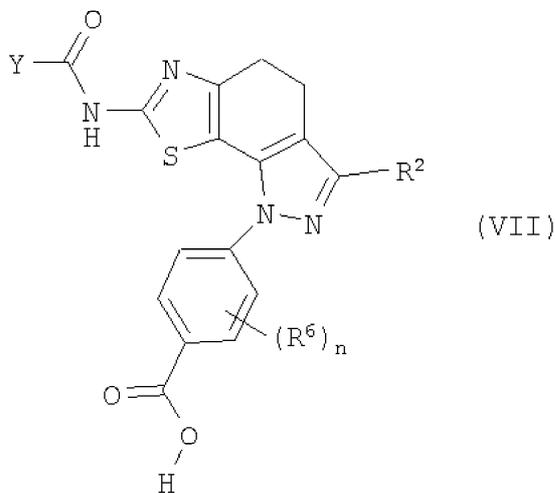
в которой R^2 , R_3' и Y могут иметь указанные выше значения, необязательно в виде их таутомеров, их рацематов, их энантиомеров, их диастереомеров и их смесей, а также необязательно в виде их фармакологически безвредных кислотно-аддитивных солей.

33. Соединения общей формулы (IX)



в которой R^2 , R^6 и Y могут иметь указанные выше значения, необязательно в виде их таутомеров, их рацематов, их энантиомеров, их диастереомеров и их смесей, а также необязательно в виде их фармакологически безвредных кислотно-аддитивных солей.

34. Соединения общей формулы (VII)



в которой R^2 , R^6 и Y могут иметь указанные выше значения, необязательно в виде их таутомеров, их рацематов, их энантиомеров, их диастереомеров и их смесей, а также необязательно в виде их фармакологически безвредных кислотно-аддитивных солей.