



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):

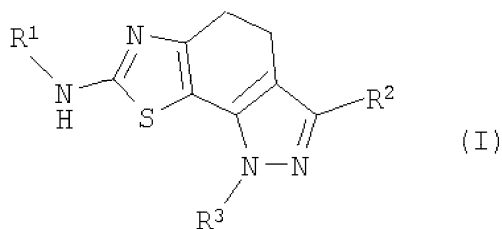
**БЁРИНГЕР ИНГЕЛЬХАЙМ  
ИНТЕРНАЦИОНАЛЬ ГМБХ (DE)**

(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)

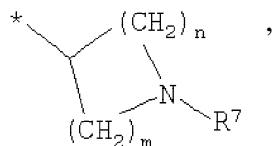


в которой  $R^1$  обозначает водород,  $CO-CH_3$ ,  $CO-CH_2-R^4$ ,  $CO-CHMe-R^4$ ,  $CO-OR^4$ ,  $CO-SR^4$ ,  $CO-NH_2$  или  $CO-NHR^4$ ,

$R^2$  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,  $C_1-$

C<sub>6</sub>алкил-C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>арил-, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>алкенил-C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>арил-, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>алкинил-C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>арил-, C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>гетероарил, C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>алкил-C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>гетероарил-, C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>алкенил-C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>гетероарил-, C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>алкинил-C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>гетероарил-, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкил-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкил-, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>алкенил-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкил-, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>алкинил-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкил-, C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкенил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкил-C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкенил-, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>алкенил-C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкенил-, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>алкинил-C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкенил-, C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкинил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкил-C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкинил-, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>алкенил-C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкинил- и C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>алкинил-C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкинил-, каждый из которых необязательно может быть замещен одним остатком R<sup>5</sup> и одним-тремя остатками R<sup>6</sup>, или необязательно замещенный остаток



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

R<sup>4</sup> обозначает необязательно замещенный остаток, выбранный из группы, включающей C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкил, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>алкенил, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>алкинил, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкил-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкил-, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкил-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>алкенил-, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкил-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>алкинил-, C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>арил, C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>арил-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкил-, C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>гетероарил, C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>гетероарил-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкил- и галоалкил,

R<sup>5</sup> обозначает CONR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>, NR<sup>8</sup>COR<sup>9</sup>, NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>, OR<sup>9</sup> или -C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкил-CONR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>,

R<sup>6</sup> в каждом случае независимо обозначает F, Cl, Br, OH, CN, CF<sub>3</sub>, CHF<sub>2</sub> или необязательно замещенный остаток, выбранный из группы, включающей -O-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкил, -O-C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>алкенил, -O-C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>алкинил, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкил, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>алкенил, C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>алкинил, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкил-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкил-, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкил-C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>алкенил-, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкил-C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>алкинил-, C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкенил-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкил-, C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкенил-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>алкенил-, C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкенил-C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>алкинил-, C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>арил-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкил-, C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>арил-C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>алкенил-, C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>арил-C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>алкинил-, C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>гетероарил-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкил-, C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>гетероарил-C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>алкенил- и C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>гетероарил-C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>алкинил-,

R<sup>7</sup> обозначает водород, COR<sup>9</sup>, CONR<sup>8</sup>R<sup>9</sup> или остаток, выбранный из группы, включающей C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>алкил, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>алкенил, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>алкинил, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкил-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкил-, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкил-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>алкенил-, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкил-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>алкинил-, C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкенил-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкил-, C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкенил-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>алкенил-, C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкенил-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>алкинил-, C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>арил, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>алкил-C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>арил-, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>алкенил-C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>арил-, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>алкинил-C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>арил-, C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>гетероарил, C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>алкил-C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>гетероарил-, C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>алкенил-C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>гетероарил- и C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>алкинил-C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>гетероарил-, каждый из которых необязательно может быть замещен остатком R<sup>14</sup> и остатком R<sup>13</sup>,

R<sup>8</sup> обозначает водород или необязательно замещенный остаток, выбранный из группы, включающей C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>алкил, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>алкенил, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>алкинил, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкил-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкил-, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкил-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>алкенил-, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкил-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>алкинил-, C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкенил-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкил-, C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкенил-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>алкенил-, C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкенил-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>алкинил-, C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>арил-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкил-, C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>арил-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>алкенил-, C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>арил-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>алкинил-, C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>гетероарил, C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>гетероарил-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкил-, C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>гетероарил-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкенил-, C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>гетероарил-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкинил-, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкил-O-C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>алкил-, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкил-O-C<sub>4</sub>-C<sub>6</sub>алкенил- и C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкил-O-C<sub>4</sub>-C<sub>6</sub>алкинил-,

R<sup>9</sup> обозначает водород, необязательно замещенный остаток, выбранный из группы, включающей C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>алкил, C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>алкенил, C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>алкинил, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкил-C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>алкил-, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкил-C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>алкенил-, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкил-C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>алкинил-, C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкенил-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкил-, C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкенил-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>алкенил-, C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкенил-

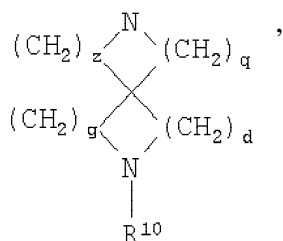
C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>алкинил-, C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>арил-C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>алкил-, C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>арил-C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>алкенил-, C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>арил-C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>алкинил-, C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>арил, C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>алкил-C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>арил-, C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>алкенил-C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>арил-, C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>алкинил-C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>арил-, C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>гетероарил, C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>гетероарил-C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>алкил-, C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>гетероарил-C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>алкенил-, C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>гетероарил-C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>алкинил-, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>циклоалкил, C<sub>5</sub>-C<sub>8</sub>циклоалкенил, NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup>-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>циклоалкил-, NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup>-C<sub>5</sub>-C<sub>8</sub>циклоалкенил- и NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup>-C<sub>5</sub>-C<sub>8</sub>циклоалкинил-, или необязательно замещенный C<sub>5</sub>-

C<sub>8</sub>гетероциклоалкил-(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>-остаток, содержащий по меньшей мере одну NR<sup>10</sup>-группу в 3-8-членном гетероцикле, или

R<sup>8</sup> и R<sup>9</sup> совместно образуют насыщенный либо ненасыщенный 4-7-членный алкильный мостик, который необязательно содержит O-атом или S(O)<sub>p</sub>-группу, при этом

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

NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup> обозначает 5-6-членный гетероцикл, необязательно содержащий еще один N-атом и необязательно замещенный остатком, выбранным из группы, включающей R<sup>10</sup>, NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup> и NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкил-, или остаток



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

R<sup>10</sup> обозначает водород или необязательно замещенный остаток, выбранный из группы, включающей C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>алкил, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>алкенил, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>алкинил, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>циклоалкил-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>алкил-, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>циклоалкил-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>алкенил-, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>циклоалкил-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>алкинил-, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>циклоалкил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкил-C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>циклоалкил-, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>алкенил-C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>циклоалкил-, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>алкинил-C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>циклоалкил-, тетрагидропиранил и (NR<sup>4</sup>)<sub>2</sub>CH-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>алкил-,

R<sup>11</sup>, R<sup>12</sup> имеют одинаковые или разные значения и обозначают водород или необязательно замещенный остаток, выбранный из группы, включающей C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>алкил, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>алкенил, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>алкинил, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкил-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкил- и C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкил, или

R<sup>11</sup> и R<sup>12</sup> совместно образуют 4-7-членную алкильную цепь, необязательно содержащую гетероатом,

R<sup>13</sup> обозначает F, Cl, Br, OH, CN, CF<sub>3</sub>, CHF<sub>2</sub> или C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкил-O-,

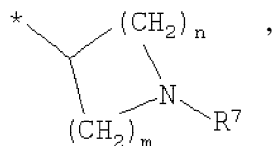
R<sup>14</sup> обозначает NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup> или необязательно замещенный C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>гетероциклоалкил-(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>-остаток, содержащий по меньшей мере одну NR<sup>10</sup>-группу в 3-8-членном гетероцикле, или

R<sup>13</sup> и R<sup>14</sup> совместно образуют насыщенный либо ненасыщенный 4-7-членный алкильный мостик, который необязательно содержит O-атом или S(O)<sub>p</sub>-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 R<sup>1</sup> и R<sup>3</sup>-R<sup>14</sup> могут иметь указанные выше значения, а R<sup>2</sup> обозначает остаток, выбранный из группы, включающей C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкил-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкил- и C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>алкенил-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкил-, каждый из которых необязательно замещен одним или двумя остатками из группы, включающей CH<sub>3</sub>, F,

ОСН<sub>3</sub>, ОН и NH<sub>2</sub>.

3. Соединения по п.1, в которых R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> и R<sup>4</sup>-R<sup>14</sup> могут иметь указанные выше значения, а R<sup>3</sup> обозначает остаток, выбранный из группы, включающей фенил и C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкил, каждый из которых необязательно может быть замещен одним остатком R<sup>5</sup> и одним-тремя остатками R<sup>6</sup>, или необязательно замещенный остаток



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

4. Соединения по п.1, в которых

R<sup>1</sup>-R<sup>7</sup> и R<sup>10</sup>-R<sup>14</sup> могут иметь указанные выше значения, а

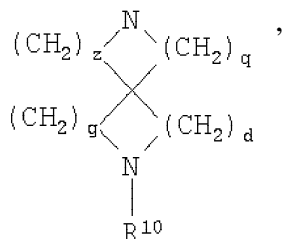
R<sup>8</sup> обозначает водород или необязательно замещенный остаток, выбранный из группы, включающей C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>алкил, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>алкенил, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>алкинил и C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкил-О-C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>алкил-,

R<sup>9</sup> обозначает водород, необязательно замещенный остаток, выбранный из группы, включающей C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>алкил, C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>алкенил, C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>алкинил, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкил-C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>алкил-, C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>арил, C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>алкил-C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>арил-, C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>алкенил-C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>арил-, C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>алкинил-C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>арил-, C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>гетероарил, C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>гетероарил-C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>алкил-, C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>гетероарил-C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>алкенил-, C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>гетероарил-C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>алкинил-, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>циклоалкил, C<sub>5</sub>-C<sub>8</sub>циклоалкенил и NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup>-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>циклоалкил-, или необязательно замещенный C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>гетероциклоалкил-(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>-остаток, содержащий по меньшей мере одну NR<sup>10</sup>-группу в 3-8-членном гетероцикле, или

R<sup>8</sup> и R<sup>9</sup> совместно образуют насыщенный либо ненасыщенный 4-7-членный алкильный мостик, который необязательно содержит О-атом или S(O)<sub>p</sub>-группу, при этом

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

NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup> обозначает 5-6-членный гетероцикл, необязательно содержащий еще один N-атом и необязательно замещенный остатком, выбранным из группы, включающей R<sup>10</sup>, NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup> и NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкил-, или остаток



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

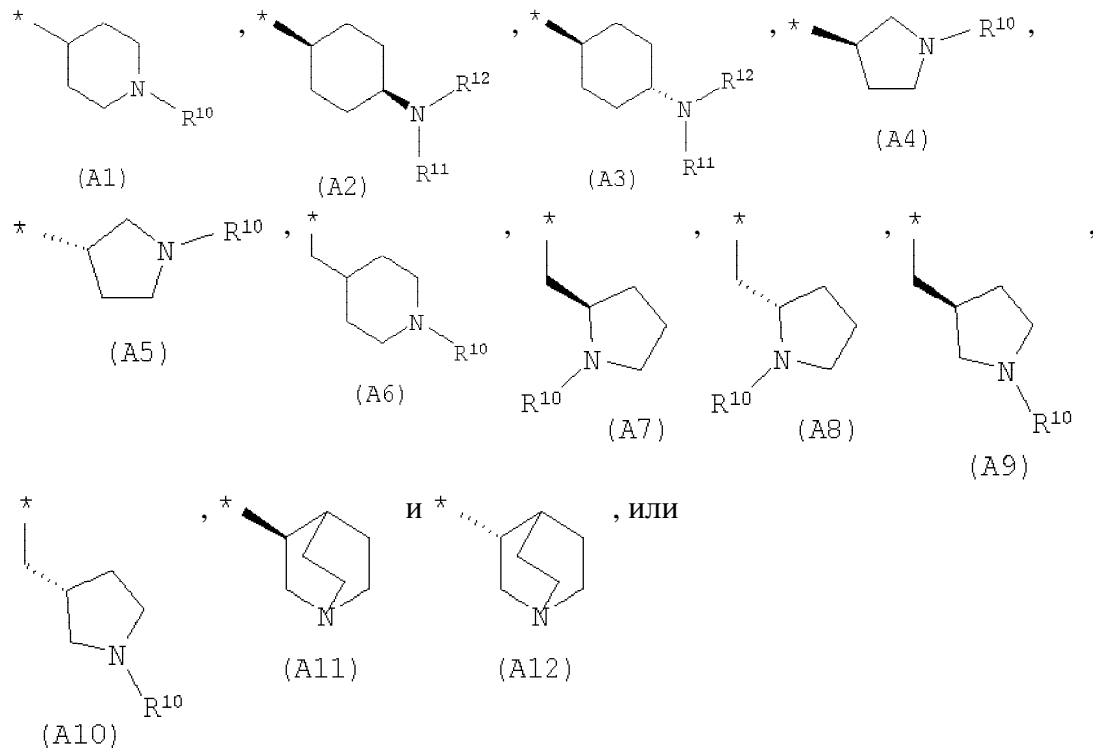
5. Соединения по п.1, в которых

R<sup>1</sup>-R<sup>7</sup> и R<sup>10</sup>-R<sup>14</sup> могут иметь указанные выше значения, а

R<sup>8</sup> обозначает водород или необязательно замещенный остаток, выбранный из группы, включающей C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>алкил, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>алкенил, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>алкинил и C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкил-О-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкил-,

R<sup>9</sup> обозначает водород, необязательно замещенный остаток, выбранный из группы, включающей C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>алкил, C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>алкенил, C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>алкинил, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкил-C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>алкил-, C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>арил, C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>алкил-C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>арил-, C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>алкенил-C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>арил-, C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>алкинил-C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>арил-, C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>гетероарил, C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>гетероарил-C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>алкил-, C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>гетероарил-C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>алкенил-, C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>гетероарил-C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>алкинил-, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>циклоалкил,

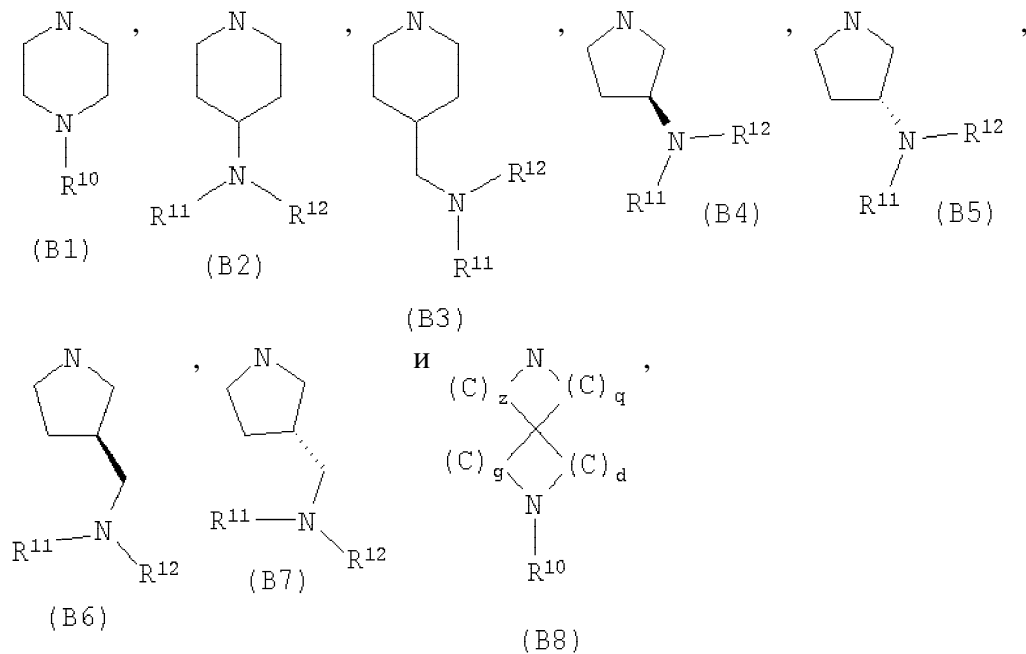
C<sub>5</sub>-C<sub>8</sub>циклоалкинил и NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup>-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>циклоалкил-, или необязательно замещенный остаток, выбранный из группы остатков общих формул (A1)-(A12)



R<sup>8</sup> и R<sup>9</sup> совместно образуют насыщенный либо ненасыщенный 4-7-членный алкильный мостик, который необязательно содержит O-атом или S(O)<sub>p</sub>-группу, при этом

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

NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup> 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 R<sup>1</sup>-R<sup>8</sup> и R<sup>10</sup>-R<sup>12</sup> могут иметь указанные выше значения, а R<sup>7</sup> обозначает COR<sup>9</sup> или CONR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>.

7. Соединения по одному из пп.1-5, в которых R<sup>1</sup>-R<sup>5</sup> и R<sup>7</sup>-R<sup>14</sup> могут иметь указанные выше значения, а R<sup>6</sup> в каждом случае независимо обозначает F, Cl, CF<sub>3</sub> или необязательно замещенный остаток из группы, включающей -O-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкил и C<sub>1</sub>-

С<sub>3</sub>алкил.

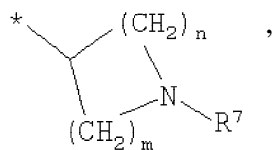
8. Соединения по одному из пп.1-5, в которых

R<sup>4</sup>-R<sup>6</sup> и R<sup>10</sup>-R<sup>12</sup> могут иметь указанные выше значения, а

R<sup>1</sup> обозначает CO-CH<sub>3</sub> или CO-CH<sub>2</sub>-R<sup>4</sup>,

R<sup>2</sup> обозначает циклопропил, необязательно замещенный одним или двумя остатками из группы, включающей CH<sub>3</sub>, F, OCH<sub>3</sub>, OH и NH<sub>2</sub>,

R<sup>3</sup> обозначает необязательно замещенный остаток

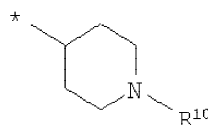


при этом n и m независимо друг от друга обозначают 1 или 2,

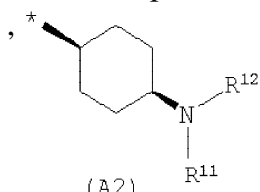
R<sup>7</sup> обозначает водород, COR<sup>9</sup> или CONR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>,

R<sup>8</sup> обозначает водород или C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>алкил,

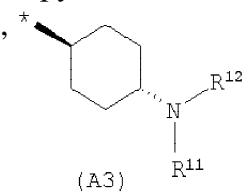
R<sup>9</sup> обозначает водород, необязательно замещенный остаток, выбранный из группы, включающей C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>циклоалкил и NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup>-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>циклоалкил-, или необязательно замещенный остаток, выбранный из группы остатков общих формул (A1)-(A12)



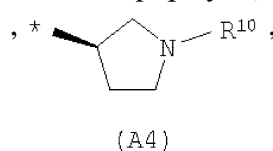
(A1)



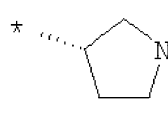
(A2)



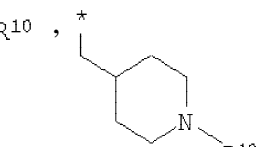
(A3)



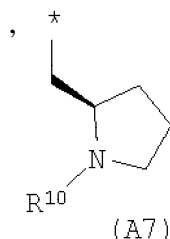
(A4)



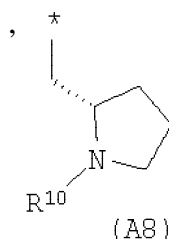
(A5)



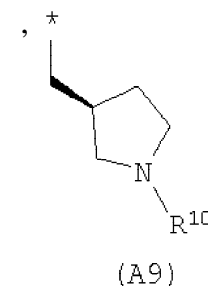
(A6)



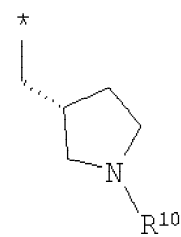
(A7)



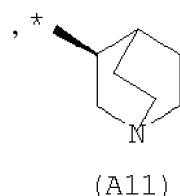
(A8)



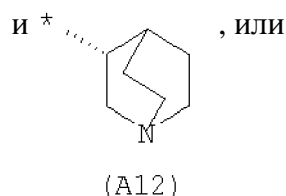
(A9)



(A10)



(A11)



(A12)

NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup> обозначает 5-6-членный гетероцикл, содержащий 1-3 N-атома и необязательно замещенный остатком, выбранным из группы, включающей R<sup>10</sup>, NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup> и NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup>C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкил-.

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

R<sup>4</sup>-R<sup>6</sup> и R<sup>10</sup>-R<sup>12</sup> могут иметь указанные выше значения, а

R<sup>1</sup> обозначает CO-CH<sub>3</sub> или CO-CH<sub>2</sub>-R<sup>4</sup>,

R<sup>2</sup> обозначает C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкил, который необязательно может быть замещен одним или двумя остатками из группы, включающей CH<sub>3</sub>, F, OCH<sub>3</sub>, OH и NH<sub>2</sub>,

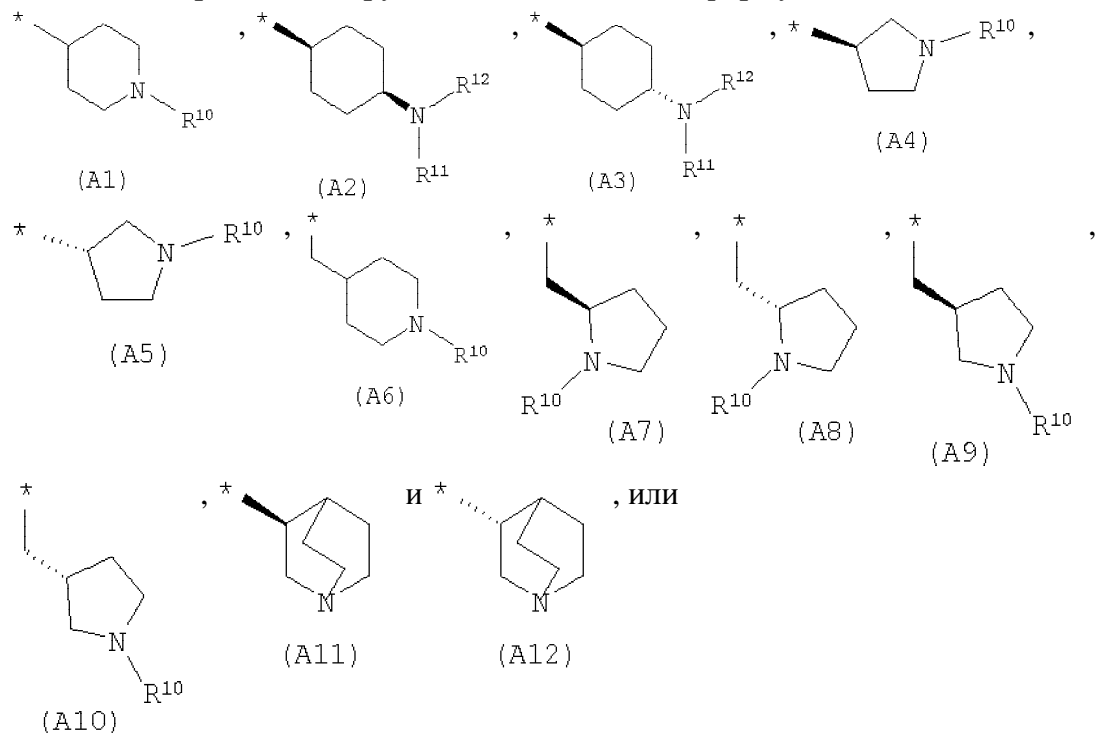
R<sup>3</sup> обозначает остаток, выбранный из группы, включающей фенил и C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкил, каждый из которых необязательно может быть замещен одним остатком R<sup>5</sup> и одним-тремя остатками R<sup>6</sup>,

$R^5$  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,

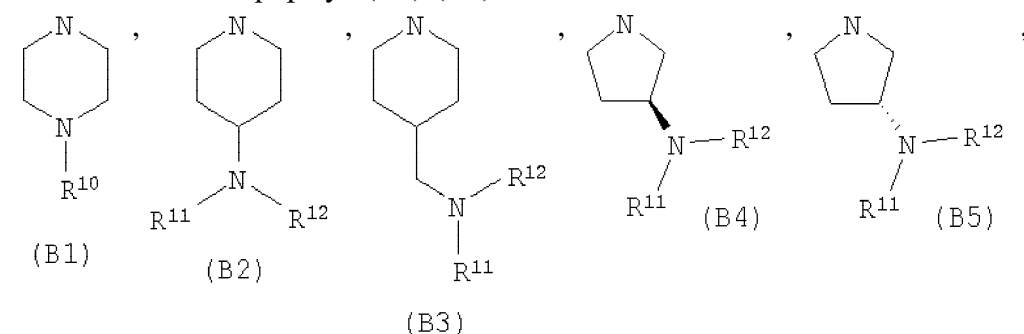
$R^9$  обозначает водород, необязательно замещенный остаток, выбранный из группы, включающей  $C_1-C_{12}$ алкил,  $C_3-C_6$ циклоалкил- $C_1-C_{12}$ алкил-,  $C_6-C_{14}$ арил,  $C_1-C_{12}$ алкил- $C_6-C_{14}$ арил-,  $C_5-C_{10}$ гетероарил,  $C_5-C_{10}$ гетероарил- $C_1-C_{12}$ алкил-,  $C_3-C_8$ 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)

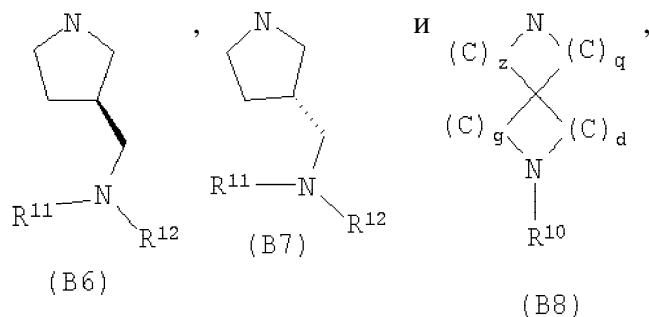


$R^8$  и  $R^9$  совместно образуют насыщенный либо ненасыщенный 4-7-членный алкильный мостик, который необязательно содержит O-атом или  $S(O)_p$ -группу, при этом

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

R<sup>10</sup> обозначает водород или необязательно замещенный остаток, выбранный из группы, включающей C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>алкил, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>циклоалкил-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>алкил-, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>циклоалкил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкил-C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>циклоалкил-, тетрагидропиранил и (NR)<sub>2</sub>CH-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>алкил-.

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.

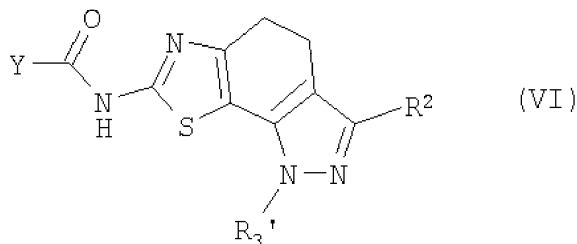
24. Фармацевтическая композиция, содержащая соединение формулы (I) по одному из пп.1-9.

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.

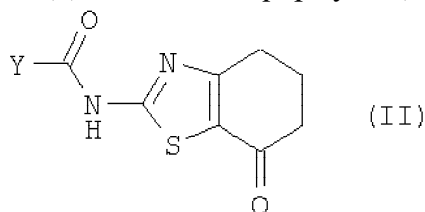
27. Комбинации лекарственных средств, которые наряду с одним или несколькими соединениями формулы (I) по одному из пп.1-9 содержат в качестве другого действующего вещества одно или несколько соединений, выбранных из классов бета-агонистов, антихолинергических средств, кортикостероидов, ингибиторов ФДЭ4, 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)

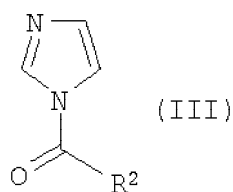


в которой остаток R<sup>2</sup> может иметь указанные выше значения, R<sub>3</sub>' обозначает необязательно замещенный остаток, выбранный из группы, включающей 4-PhCOOMe, 4-PhNO<sub>2</sub>, 4-пиперидил, цис/транс-4-алкоксикарбонилциклогексил и 4-метоксикарбонилметилфенил, а Y обозначает C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкил или -S-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкил, отличающийся тем, что

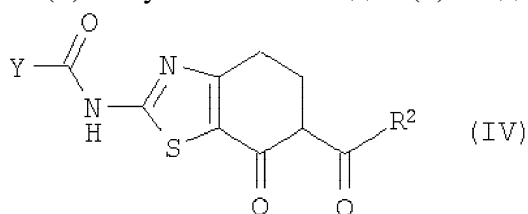
(а) соединение формулы (II)



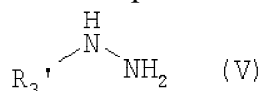
подвергают взаимодействию с соединением формулы (III)



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

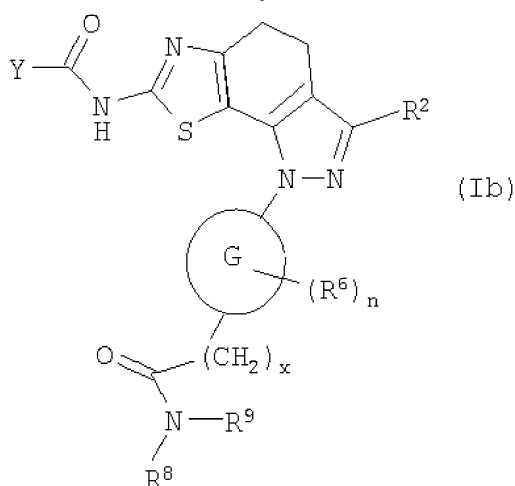


подвергают взаимодействию с соединением формулы (V)



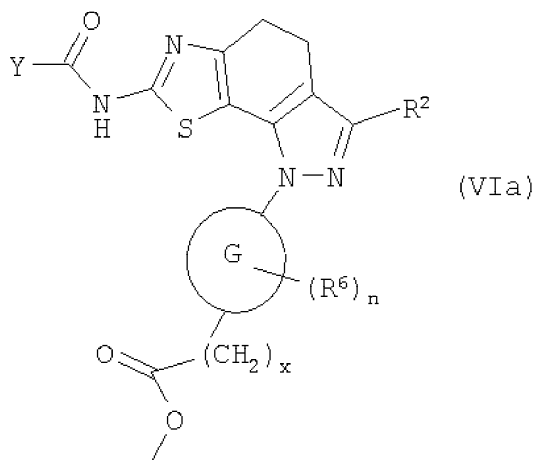
в которой  $R_3'$  может иметь указанные выше значения, и циклизуют до соединения формулы (VI).

29. Способ получения соединений общей формулы (Ib)

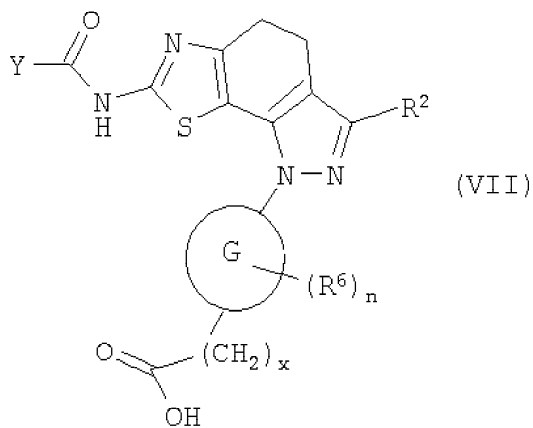


в которой  $R^2$ ,  $R^6$ ,  $R^8$  и  $R^9$  могут иметь указанные выше значения, G обозначает фенил или циклогексил, а X обозначает 0 или 1, отличающийся тем, что

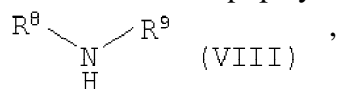
(а) соединение формулы (VIa)



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

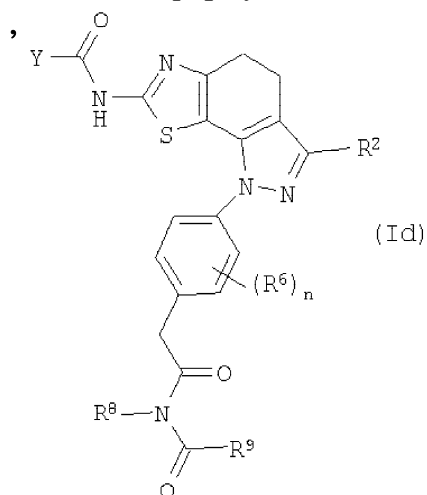
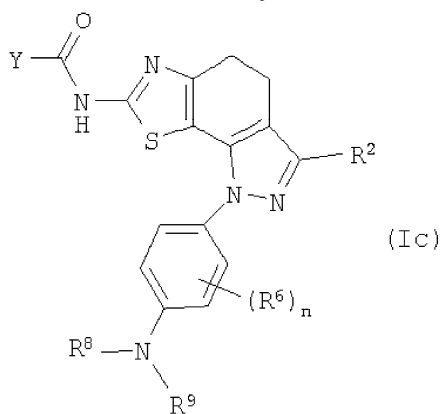


(б) полученное на стадии (а) соединение формулы (VII) подвергают взаимодействию с соединением формулы (VIII)

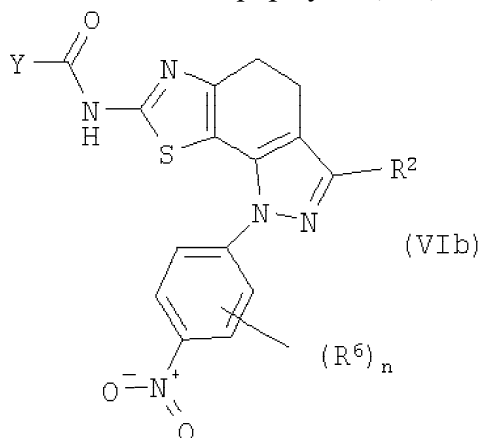


в которой  $R^8$  и  $R^9$  могут иметь указанные выше значения, с получением соединения формулы (Ib).

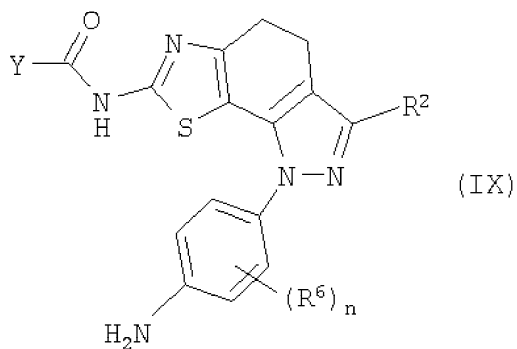
30. Способ получения соединений общей формулы (Ic) или (Id)



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

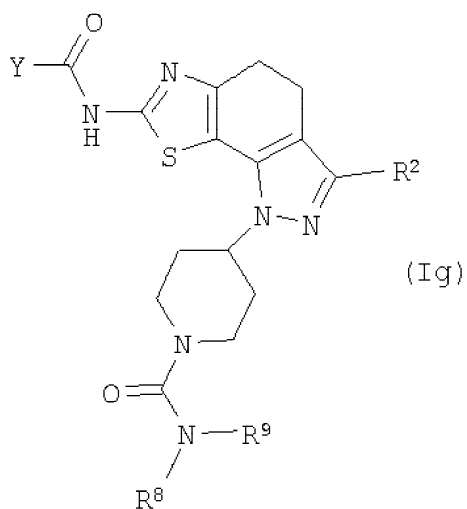
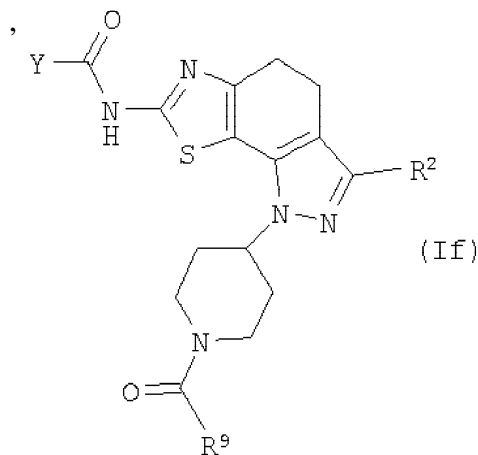
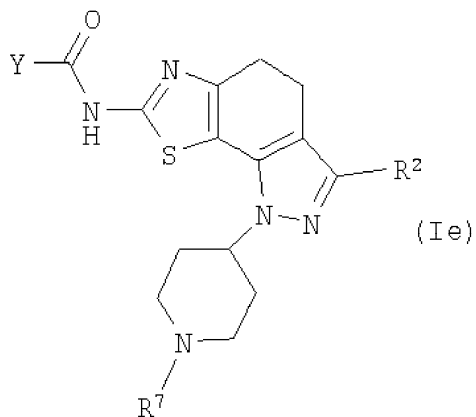


восстанавливают до соединения формулы (IX)

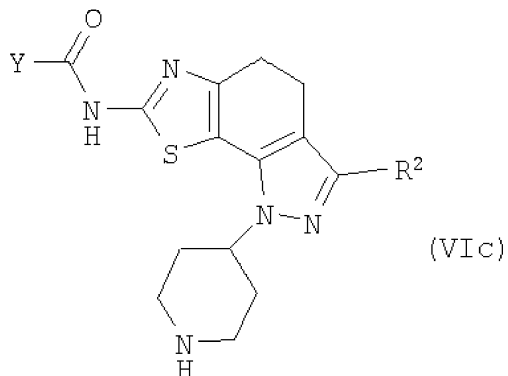


(б) полученное на стадии (а) соединение формулы (IX) путем гидроаминирования превращают в соединение формулы (Ic) или (Id).

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

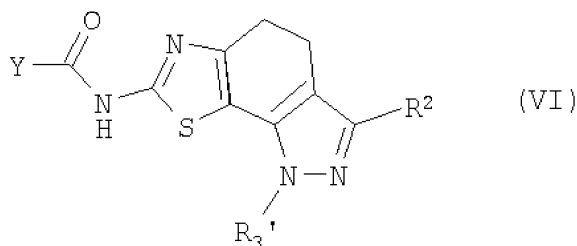


где  $R^2$ ,  $R^7$ ,  $R^8$ ,  $R^9$  и  $Y$  могут иметь указанные выше значения, отличающийся тем, что соединение формулы (VIc)



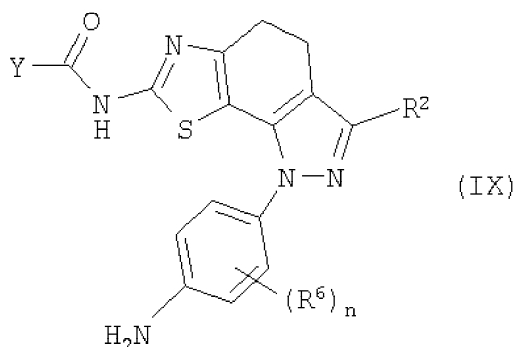
путем гидроаминирования превращают в соединение формулы (Ie), (If) или (Ig).

32. Соединения общей формулы (VI)



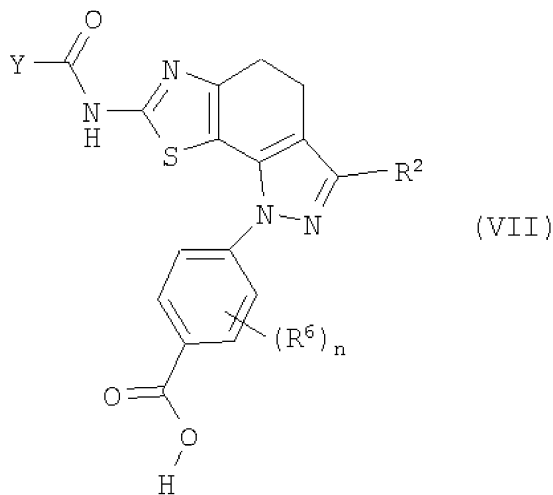
в которой  $R^2$ ,  $R_3'$  и Y могут иметь указанные выше значения, необязательно в виде их таутомеров, их рацематов, их энантиомеров, их диастереомеров и их смесей, а также необязательно в виде их фармакологически безвредных кислотно-аддитивных солей.

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.