

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2016151390, 04.06.2015

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:  
04.06.2014 SE 1450681-0

(43) Дата публикации заявки: 17.07.2018 Бюл. № 20

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на  
национальной фазе: 09.01.2017(86) Заявка РСТ:  
SE 2015/050654 (04.06.2015)(87) Публикация заявки РСТ:  
WO 2015/187089 (10.12.2015)Адрес для переписки:  
109012, Москва, ул. Ильинка, 5/2, ООО  
"Союзпатент"

(71) Заявитель(и):

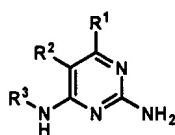
ТОМАС ХЕЛЛЕДАЙС СТИФТЕЛСЕ ФЁР  
МЕДИСИНСК ФОРСКНИНГ (SE)

(72) Автор(ы):

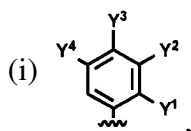
СКОБИ Мартин (SE),  
ВАЛНЕР Олов (SE),  
КОЛМЕЙСТЕР Тобиас (SE),  
ВАЛИН Карл Свен Аксель (SE),  
ХЕНРИКСОН Карл Мартин (SE),  
ХОМАН Эверт (SE),  
ХЕЛЛЕДАЙ Томас (SE),  
ЖАК Сильвэн (FR),  
ДЕРОЗ Матье (SE),  
ЖАК-КОРДОНЬЕ Мари-Каролин (FR),  
ФИСКЕСУНД Роланд Юлиус Ю (SE)(54) **ИНГИБИТОРЫ МТН1 ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ ВОСПАЛИТЕЛЬНЫХ И АУТОИММУННЫХ  
ЗАБОЛЕВАНИЙ**

## (57) Формула изобретения

1. Соединение формулы I,



(I)

или его фармацевтически приемлемая соль,  
для применения в лечении аутоиммунных заболеваний и воспалительных состояний,  
где:R<sup>1</sup> представляет собой

(i) или

(ii) 6-членный гетероарил, замещенный одной или более группами, выбранными из  
Y<sup>5</sup>, или(iii) 5-10-членный моноциклический или бициклический гетероарил, соединенный с  
пиримидиновым циклом соединения формулы I через атом углерода гетероарила, при  
этом указанный гетероарил необязательно замещен одной или более группами,

выбранными из  $Y^5$ , или

(iv) -этинил- $Y^6$ ;

$R^2$  представляет собой атом водорода, атом галогена, -CN или  $C_{1-3}$  алкил, необязательно замещенный одним или более атомами фтора; и

$R^3$  представляет собой -X-L-J, - $C_{1-12}$  алкил, необязательно замещенный одним или более  $Z^1$ , или гетероциклоалкил, необязательно замещенный одной или более группами, выбранными из  $Z^2$ ; или

$R^1$  представляет собой

(v) 3-8-членный неароматический цикл, необязательно содержащий один или два гетероатома и/или одну или две двойные связи, и при этом указанный цикл необязательно замещен одной или более группами, выбранными из  $Y^7$ ;

$R^2$  представляет собой атом водорода, атом галогена, -CN или  $C_{1-3}$  алкил, необязательно замещенный одним или более атомами фтора; и

$R^3$  представляет собой -X-L-J; или

$R^1$  такой, как указано выше; и

$R^2$  и  $R^3$  соединены друг с другом, образуя вместе с атомами, к которым они присоединены, 5-8-членный неароматический цикл, где соединительный мостик, образованный  $R^2$  и  $R^3$ , необязательно замещен одной или более группами, выбранными из  $Z^3$ , и необязательно замещен -X-L-J;

X представляет собой - $C_{1-6}$  алкилен-, необязательно замещенный одним или более  $T^1$ , или  $-(C(R^A)_2)_p$ - $C_{2-5}$ гетероциклоалкилен- $(C(R^A)_2)_q$ -, где указанный гетероциклоалкилен необязательно замещен одним или более  $T^2$ ;

L представляет собой простую связь или  $-L^1-L^2$ -;

$L^1$  представляет собой - $N(R^B)$ -, -O-, - $S(O)_m$ -, - $C(O)N(R^C)$ -, - $N(R^D)C(O)$ -, - $S(O)_nN(R^E)$ -, - $N(R^F)S(O)_n$ - или - $N(R^G)C(O)N(R^H)$ -;

$L^2$  представляет собой простую связь или - $C_{1-6}$ алкилен-;

J представляет собой

(i) 6-10-членный арил, необязательно замещенный  $D^1$  и необязательно замещенный одной или более группами, выбранными из  $R^X$ , или

(ii) 5-11-членный моноциклический или бициклический гетероарильный цикл, где указанный гетероарил содержит 1-3 атома азота, и/или один атом кислорода, и/или один или два атома серы, и указанный гетероарил необязательно замещен  $D^2$  и необязательно замещен одной или более группами, выбранными из  $R^Y$ ;

$Y^1$  представляет собой атом водорода, атом галогена, -CN,  $R^a$ , -A-C(Q) $R^b$ , -A-C(Q) $N(R^c)R^d$ , -A-C(Q)OR<sup>e</sup>, -A-S(O)<sub>n</sub>R<sup>f</sup>, -A-S(NR<sup>g</sup>)(O)R<sup>h</sup>, -A-S(O)<sub>n</sub>N(R<sup>i</sup>)R<sup>j</sup>, -A-S(O)<sub>n</sub>OR<sup>k</sup>, -B(OR<sup>l</sup>)<sub>2</sub>, -N<sub>3</sub>, -NO<sub>2</sub>, -OR<sup>m</sup> -SR<sup>n</sup>;

каждый  $Y^2$ ,  $Y^3$  и  $Y^4$  независимо представляет собой атом водорода, атом галогена,  $R^a$ , -A-C(Q) $R^b$ , -A-C(Q) $N(R^c)R^d$ , -A-C(Q)OR<sup>e</sup>, -A-S(O)<sub>n</sub>R<sup>f</sup>, -A-S(NR<sup>g</sup>)(O)R<sup>h</sup>, -A-S(O)<sub>n</sub>N(R<sup>i</sup>)R<sup>j</sup>,

$-A-S(O)_nOR^k$ ,  $-B(OR^1)_2$ ,  $-N_3$ ,  $-NO_2$ ,  $-OH$ ,  $-OR^m$  или  $-SR^n$ ;

$Y^5$  представляет собой атом галогена,  $R^a$ ,  $-A-C(Q)R^b$ ,  $-A-C(Q)N(R^c)R^d$ ,  $-A-C(Q)OR^e$ ,  $-A-S(O)_nR^f$ ,  $-A-S(NR^g)(O)R^h$ ,  $-A-S(O)_nN(R^i)R^j$ ,  $-A-S(O)_nOR^k$ ,  $-B(OR^1)_2$ ,  $-N_3$ ,  $-NO_2$ ,  $-OH$ ,  $-OR^m$  или  $-SR^n$ ;

$Y^6$  представляет собой арил или гетероарил, оба необязательно замещены одной или более группами, выбранными из атома галогена,  $-CN$ ,  $R^a$ ,  $-A-C(Q)R^b$ ,  $-A-C(Q)N(R^c)R^d$ ,  $-A-C(Q)OR^e$ ,  $-A-S(O)_nR^f$ ,  $-A-S(NR^g)(O)R^h$ ,  $-A-S(O)_nN(R^i)R^j$ ,  $-A-S(O)_nOR^k$ ,  $-B(OR^1)_2$ ,  $-N_3$ ,  $-NO_2$ ,  $-OH$ ,  $-OR^m$  и  $-SR^n$ ;

$Y^7$  представляет собой атом галогена,  $R^a$ ,  $-A-C(Q)R^b$ ,  $-A-C(Q)N(R^c)R^d$ ,  $-A-C(Q)OR^e$ ,  $-A-S(O)_nR^f$ ,  $-A-S(O)_nN(R^i)R^j$ ,  $-A-S(O)_nOR^k$ ,  $-OH$ ,  $-OR^m$  или  $Q$ ;

$Q$  представляет собой  $=O$ ,  $=S$ ,  $=NR^0$ ,  $=NN(R^p)R^q$ ,  $=N(OR^r)$ ,  $=NS(O)_2N(R^s)R^t$  или  $=C(H)NO_2$ ;

$A$  представляет собой простую связь,  $-N(R^1)-$ ,  $-C(Q)N(R^j)-$  или  $-O-$ ;

каждый  $R^a$ ,  $R^f$ ,  $R^h$  и  $R^m$  независимо представляет собой  $C_{1-6}$  алкил, необязательно замещенный одной или более группами, выбранными из  $W^1$ , гетероциклоалкил, необязательно замещенный одной или более группами, выбранными из  $W^2$ , или арил или гетероарил, оба необязательно замещенные одной или более группами, выбранными из  $W^3$ ;

каждый  $R^b$ ,  $R^c$ ,  $R^d$ ,  $R^e$ ,  $R^g$ ,  $R^i$ ,  $R^j$ ,  $R^k$ ,  $R^l$ ,  $R^o$ ,  $R^p$ ,  $R^q$ ,  $R^r$ ,  $R^s$  и  $R^t$  независимо представляет собой атом водорода,  $C_{1-6}$  алкил, необязательно замещенный одной или более группами, выбранными из  $W^1$ , гетероциклоалкил, необязательно замещенный одной или более группами, выбранными из  $W^2$ , или арил или гетероарил, оба необязательно замещенные одной или более группами, выбранными из  $W^3$ ; или

любые два  $R^c$  и  $R^d$ ,  $R^i$  и  $R^j$ ,  $R^p$  и  $R^q$  и/или  $R^s$  и  $R^t$  соединены друг с другом, образуя вместе с атомом азота, к которому они присоединены, 3-8-членный моноциклический или бициклический цикл, необязательно содержащий один или два дополнительных гетероатома, и при этом указанный цикл необязательно замещен одной или более группами, выбранными из  $W^2$ ,  $C_{1-3}$  алкила, необязательно замещенного одной или более группами, выбранными из  $W^1$ , и  $=O$ ; или

два  $R^l$  соединены друг с другом, образуя вместе с атомом бора и с атомами кислорода, к которым они присоединены, 5-8-членный гетероциклический цикл, необязательно содержащий один или больше дополнительных гетероатомов, и при этом указанный цикл необязательно замещен одной или более группами, независимо выбранными из атома галогена,  $C_{1-3}$  алкила, необязательно замещенного одним или более атомами галогена, и  $=O$ ;

$W^1$  представляет собой атом галогена,  $-CN$ ,  $-A^1-C(O)R^{b1}$ ,  $-A^1-C(O)N(R^{c1})R^{d1}$ ,  $-A^1-C(O)OR^{e1}$ ,  $-A^1-S(O)_nR^{f1}$ ,  $-A^1-S(O)_nOR^{g1}$ ,  $-N(R^{h1})R^{i1}$ ,  $-OR^{j1}$  или  $=O$ ;

$W^2$  представляет собой атом галогена,  $-CN$ ,  $R^{a1}$ ,  $-A^1-C(O)R^{b1}$ ,  $-A^1-C(O)N(R^{c1})R^{d1}$ ,

$-A^1-C(O)OR^{e1}$ ,  $-A^1-S(O)_nR^{f1}$ ,  $-A^1-S(O)_nOR^{g1}$ ,  $-N(R^{h1})R^{i1}$ ,  $-OR^{j1}$  или  $=O$ ;

$W^3$  представляет собой атом галогена,  $-CN$ ,  $R^{a1}$ ,  $-A^1-C(O)R^{b1}$ ,  $-A^1-C(O)N(R^{c1})R^{d1}$ ,  $-A^1-C(O)OR^{e1}$ ,  $-A^1-S(O)_nR^{f1}$ ,  $-A^1-S(O)_nOR^{g1}$ ,  $-OR^{j1}$ ,  $-A^1-S(NR^{k1})(O)R^{l1}$ ,  $-A^1-S(O)_nN(R^{m1})R^{n1}$ ,  $-N_3$ ,  $-NO_2$ ,  $-SR^{o1}$  или  $=O$ ;

$A^1$  представляет собой простую связь,  $-N(R^K)-$  или  $-O-$ ;

каждый  $R^{a1}$ ,  $R^{f1}$  и  $R^{l1}$  независимо представляет собой  $C_{1-6}$  алкил, необязательно замещенный одним или более атомами фтора;

каждый  $R^{b1}$ ,  $R^{c1}$ ,  $R^{d1}$ ,  $R^{e1}$ ,  $R^{g1}$ ,  $R^{h1}$ ,  $R^{i1}$ ,  $R^{j1}$ ,  $R^{k1}$ ,  $R^{m1}$ ,  $R^{n1}$  и  $R^{o1}$  независимо представляет собой атом водорода или  $C_{1-6}$  алкил, необязательно замещенный одним или более атомами фтора; или

любые два  $R^{c1}$  и  $R^{d1}$ ,  $R^{h1}$  и  $R^{i1}$  и/или  $R^{m1}$  и  $R^{n1}$  соединены друг с другом, образуя вместе с

атомом азота, к которому они присоединены, 3-6-членный цикл, необязательно содержащий один дополнительный гетероатом, и при этом указанный цикл необязательно замещен одной или более группами, выбранными из атома фтора,  $C_{1-3}$  алкила, необязательно замещенного одним или более атомами фтора, и  $=O$ ;

$Z^1$  представляет собой атом галогена,  $-CN$ ,  $-A^2-C(Q^1)R^{b2}$ ,  $-A^2-C(Q^1)N(R^{c2})R^{d2}$ ,  $-A^2-C(Q^1)OR^{e2}$ ,  $-A^2-S(O)_nR^{f2}$ ,  $-A^2-S(O)_nOR^{g2}$ ,  $-A^2-S(NR^{h2})(O)R^{i2}$ ,  $-A^2-S(O)_nN(R^{j2})R^{k2}$ ,  $-N(R^{l2})R^{m2}$ ,  $-OR^{n2}$ ,  $-SR^{o2}$  или гетероциклоалкил, необязательно замещенный одной или более группами, выбранными из  $W^5$ ;

$Z^2$  представляет собой атом галогена,  $-CN$ ,  $R^{a2}$ ,  $-A^2-C(Q^1)R^{b2}$ ,  $-A^2-C(Q^1)N(R^{c2})R^{d2}$ ,  $-A^2-C(Q^1)OR^{e2}$ ,  $-A^2-S(O)_nR^{f2}$ ,  $-A^2-S(O)_nOR^{g2}$ ,  $-A^2-S(NR^{h2})(O)R^{i2}$ ,  $-A^2-S(O)_nN(R^{j2})R^{k2}$ ,  $-N(R^{l2})R^{m2}$ ,  $-OR^{n2}$  или  $=Q^1$ ;

$Z^3$  представляет собой  $R^{a2}$  или  $=Q^1$ ;

$Q^1$  представляет собой  $=O$ ,  $=S$ ,  $=NR^{p2}$ ,  $=NN(R^{q2})R^{r2}$ ,  $=N(OR^{s2})$ ,  $=NS(O)_2N(R^{t2})R^{u2}$  или  $=C(H)NO_2$ ;

$A^2$  представляет собой простую связь,  $-N(R^L)-$ ,  $-C(Q^1)N(R^M)-$  или  $-O-$ ;

каждый  $R^{a2}$ ,  $R^{f2}$ ,  $R^{i2}$ ,  $R^{n2}$  и  $R^{o2}$  независимо представляет собой  $C_{1-6}$  алкил, необязательно замещенный одной или более группами, выбранными из  $W^4$ , или гетероциклоалкил, необязательно замещенный одной или более группами, выбранными из  $W^5$ ;

$R^{m2}$  представляет собой  $C_{2-6}$  алкил, необязательно замещенный одной или более группами, выбранными из  $W^4$ ;

каждый  $R^{b2}$ ,  $R^{c2}$ ,  $R^{d2}$ ,  $R^{e2}$ ,  $R^{g2}$ ,  $R^{h2}$ ,  $R^{j2}$ ,  $R^{k2}$ ,  $R^{l2}$ ,  $R^{p2}$ ,  $R^{q2}$ ,  $R^{r2}$ ,  $R^{s2}$ ,  $R^{t2}$  и  $R^{u2}$  независимо представляет собой атом водорода,  $C_{1-6}$  алкил, необязательно замещенный одной или более группами, выбранными из  $W^4$ , гетероциклоалкил, необязательно замещенный одной или более группами, выбранными из  $W^5$ ; или

любые два  $R^{c2}$  и  $R^{d2}$ ,  $R^{j2}$  и  $R^{k2}$ ,  $R^{l2}$  и  $R^{m2}$ ,  $R^{q2}$  и  $R^{r2}$  и/или  $R^{t2}$  и  $R^{u2}$  соединены друг с

другом, образуя вместе с атомом азота, к которому они присоединены, 3-8-членный моноциклический или бициклический цикл, необязательно содержащий один или два дополнительных гетероатома, и при этом указанный цикл необязательно замещен одной или более группами, выбранными из  $W^5$ ,  $C_{1-3}$  алкила, необязательно замещенного одной или более группами, выбранными из  $W^4$ , и  $=O$ ;

$W^4$  представляет собой атом галогена,  $-CN$ ,  $-A^3-C(O)R^{b3}$ ,  $-A^3-C(O)N(R^{c3})R^{d3}$ ,  $-A^3-C(O)OR^{e3}$ ,  $-A^3-S(O)_nR^{f3}$ ,  $-A^3-S(O)_nOR^{g3}$ ,  $-OR^{h3}$ ,  $=O$  или  $W^6$ ;

$W^5$  представляет собой атом галогена,  $-CN$ ,  $R^{a3}$ ,  $-A^3-C(O)R^{b3}$ ,  $-A^3-C(O)N(R^{c3})R^{d3}$ ,  $-A^3-C(O)OR^{e3}$ ,  $-A^3-S(O)_nR^{f3}$ ,  $-A^3-S(O)_nOR^{g3}$ ,  $-OR^{h3}$ ,  $=O$  или  $W^6$ ;

$W^6$  представляет собой фенил или гетероарил, оба необязательно замещены одной или

более группами, выбранными из атом галогена и  $R^{a3}$ ;

$A^3$  представляет собой простую связь,  $-N(R^L)-$  или  $-O-$ ;

каждый  $R^{a3}$  и  $R^{f3}$  независимо представляет собой  $C_{1-6}$  алкил, необязательно замещенный одним или более атомами фтора;

каждый  $R^{b3}$ ,  $R^{c3}$ ,  $R^{d3}$ ,  $R^{e3}$ ,  $R^{g3}$  и  $R^{h3}$  независимо представляет собой атом водорода или  $C_{1-6}$  алкил, необязательно замещенный одним или более атомами фтора; или

$R^{c3}$  и  $R^{d3}$  соединены друг с другом, образуя вместе с атомом азота, к которому они присоединены, 3-6-членный цикл, необязательно содержащий один дополнительный гетероатом, и при этом указанный цикл необязательно замещен одной или более группами, выбранными из атома фтора,  $C_{1-3}$  алкила, необязательно замещенного одним или более атомами фтора, и  $=O$ ;

$D^1$  и  $D^2$  представляют собой  $R^{a4}$ ,  $-A^4-C(Q^2)R^{b4}$ ,  $-A^4-C(Q^2)N(R^{c4})R^{d4}$ ,  $-A^4-C(Q^2)OR^{e4}$ ,  $-A^4-S(O)_nR^{f4}$ ,  $-A^4-S(O)_nC(O)R^{g4}$ ,  $-A^4-S(NR^{h4})(O)R^{i4}$ ,  $-A^4-S(O)_nN(R^{j4})R^{k4}$ ,  $-A^4-S(O)_nOR^{l4}$ ,  $-B(OR^{m4})_2$ ,  $-N_3$ ,  $-N(R^{n4})R^{o4}$ ,  $-N(H)CN$ ,  $-NO_2$ ,  $-ONO_2$ ,  $-OR^{p4}$ ,  $-SR^{q4}$  или, когда  $J$  является частично ароматическим,  $=Q^2$ ;

$Q^2$  представляет собой  $=O$ ,  $=S$ ,  $=NR^{r4}$ ,  $=NN(R^{s4})R^{t4}$ ,  $=N(OR^{u4})$ ,  $=NS(O)_2N(R^{v4})R^{w4}$  или  $=C(H)NO_2$ ;

$A^4$  представляет собой простую связь,  $-N(R^M)-$ ,  $-C(Q)N(R^N)-$  или  $-O-$ ;

каждый  $R^X$  и  $R^Y$  независимо представляет собой атом галогена,  $-CN$ ,  $R^{a4}$ ,  $-N(R^{n4})R^{o4}$ ,  $-NO_2$ ,  $-OR^{p4}$  или  $=O$ ;

$R^{c4}$  представляет собой атом водорода,  $R^{a4}$ ,  $-C(O)OR^{e4}$ ,  $-S(O)_nR^{f4}$ ,  $-S(O)_nN(R^{j4})R^{k4}$ ,  $-N(R^{n4})R^{o4}$  или  $-OR^{p4}$ ;

каждый  $R^{a4}$ ,  $R^{f4}$  и  $R^{i4}$  независимо представляет собой  $C_{1-6}$  алкил, необязательно замещенный одной или более группами, выбранными из  $G^1$ , гетероциклоалкил, необязательно замещенный одной или более группами, выбранными из  $G^2$ , арил, необязательно замещенный одной или более группами, выбранными из  $G^3$ , или гетероарил, необязательно замещенный одной или более группами, выбранными из

$G^4$ ;

каждый  $R^{b4}, R^{d4}, R^{e4}, R^{g4}, R^{h4}, R^{j4}, R^{k4}, R^{l4}, R^{m4}, R^{n4}, R^{o4}, R^{p4}, R^{q4}, R^{r4}, R^{s4}, R^{t4}, R^{u4}, R^{v4}$  и  $R^{w4}$  независимо представляет собой атом водорода,  $C_{1-6}$  алкил, необязательно замещенный одной или более группами, выбранными из  $G^1$ , гетероциклоалкил, необязательно замещенный одной или более группами, выбранными из  $G^2$ , арил, необязательно замещенный одной или более группами, выбранными из  $G^3$ , или гетероарил, необязательно замещенный одной или более группами, выбранными из  $G^4$ ; или

любые два  $R^{c4}$  и  $R^{d4}, R^{j4}$  и  $R^{k4}, R^{n4}$  и  $R^{o4}, R^{s4}$  и  $R^{t4}$  и/или  $R^{v4}$  и  $R^{w4}$  соединены друг с другом, образуя вместе с атомом азота, к которому они присоединены, 3-6-членный цикл,

необязательно содержащий один гетероатом, и при этом указанный цикл необязательно замещен одной или более группами, выбранными из атома фтора,  $C_{1-3}$  алкила, необязательно замещенного одним или более атомами фтора, и  $=O$ ; или

два  $R^{m4}$  соединены друг с другом, образуя вместе с атомом бора и с атомами кислорода, к которым они присоединены, 5-8-членный гетероциклический цикл, необязательно содержащий один или больше дополнительных гетероатомов, и при этом указанный цикл необязательно замещен одной или более группами, независимо выбранными из атома галогена,  $C_{1-3}$  алкила, необязательно замещенного одним или более атомами галогена, и  $=O$ ;

каждый  $G^1$  независимо выбран из атома галогена,  $-CN, -N(R^{b5})R^{c5}, -N(H)C(O)R^{d5}, -N(H)S(O)_nR^{h5}, -OR^{k5}, -S(O)_mR^{l2}$  или  $=O$ ;

каждый  $G^2$  независимо выбран из атома галогена,  $R^{a5}, -CN, -N(R^{b5})R^{c5}, -N(H)C(O)R^{d5}, -N(H)S(O)_nR^{h5}, -OR^{k5}, -S(O)_mR^{l2}$  или  $=O$ ;

каждый  $G^3$  и  $G^4$  независимо выбраны из атома галогена,  $-CN, R^{a5}, -N(R^{b5})R^{c5}, -A^5-C(O)R^{d5}, -A^5-C(O)N(R^{e5})R^{f5}, -A^5-C(O)OR^{g5}, -A^5-S(O)_nR^{h5}, -A^5-S(O)_nN(R^{i5})R^{j5}, -OR^{k5}$  или  $=O$ ;

$A^5$  представляет собой простую связь или  $-N(H)-$ ;

$R^{a5}$  представляет собой  $C_{1-6}$  алкил, необязательно замещенный одним или более атомами галогена;

каждый  $R^{b5}, R^{c5}, R^{d5}, R^{e5}, R^{f5}, R^{g5}, R^{h5}, R^{i5}, R^{j5}, R^{k5}$  и  $R^{l5}$  независимо представляет собой атом водорода или  $C_{1-6}$  алкил, необязательно замещенный одним или более атомами галогена; или

любые два  $R^{b5}$  и  $R^{c5}, R^{e5}$  и  $R^{f5}$  и/или  $R^{i5}$  и  $R^{j5}$  соединены друг с другом, образуя вместе с атомом азота, к которому они присоединены, 3-6-членный цикл, необязательно содержащий один дополнительный гетероатом, и при этом указанный цикл необязательно замещен одной или более группами, выбранными из атома галогена,  $C_{1-3}$  алкила, необязательно замещенного одним или более атомами галогена, и  $=O$ ;

каждый  $R^A, R^B, R^C, R^D, R^E, R^F, R^G, R^H, R^I, R^J, R^K, R^L, R^M$  и  $R^N$  независимо представляет собой атом водорода или  $C_{1-3}$  алкил, необязательно замещенный одним или более атомами фтора;

$T^1$  представляет собой атом галогена,  $-CN, -N(R^{b6})R^{c6}$  или  $-OR^{d6}$ ;

$T^2$  представляет собой атом галогена,  $-CN$ ,  $R^{a6}$ ,  $-OR^{d6}$  или  $=O$ ;

каждый  $R^{a6}$  независимо представляет собой  $C_{1-6}$ алкил, необязательно замещенный одним или более атомами галогена;

каждый  $R^{b6}$ ,  $R^{c6}$  и  $R^{d6}$  независимо представляет собой атом водорода или  $C_{1-6}$  алкил, необязательно замещенный одним или более атомами галогена; или

$R^{b6}$  и  $R^{c6}$  соединены друг с другом, образуя вместе с атомом азота, к которому они присоединены, 3-6-членный цикл;

каждый  $p$  и  $q$  независимо равен 0, 1 или 2, при условии, что сумма  $p$  и  $q$  равна 0, 1 или 2;

каждый  $m$  независимо равен 0, 1 или 2;

каждый  $n$  независимо равен 1 или 2;

при условии, что когда  $X$  представляет собой  $-CH_2CH_2-$ ,  $L$  представляет собой  $-L^1-L^2-$ ,

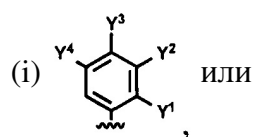
$L^1$  представляет собой  $-N(H)-$  или  $-N(Me)-$ ,  $L^2$  представляет собой простую связь, и  $J$  представляет собой 4-пиримидинил, и указанный 4-пиримидинил является незамещенным или имеет заместители  $-CH_3$ ,  $-NH_2$  или  $-N(H)CH_2CH(CH_3)_2$ , то  $R^1$  не представляет собой фенил, 3-хлорфенил, 3,5-дихлорфенил или 5-хлор-2-метоксифенил, и

при условии, что формула I не представляет собой

(S)- $N^4$ -(1-(2,4-дифторфенил)этил)-6-(пиразоло[1,5-a]пиримидин-3-ил)пиримидин-2,4-диамин.

2. Соединение для применения по п. 1, в котором

$R^1$  представляет собой



(ii) 6-членный гетероарил, замещенный одной или более группами, выбранными из  $Y^5$ , или

(iii) 5-10-членный моноциклический или бициклический гетероарил, соединенный с пиримидином формулы I через атом углерода гетероарильного цикла, где указанный гетероарильный цикл необязательно замещен одной или более группами, выбранными из  $Y^5$ ;

$R^2$  представляет собой атом водорода или  $C_{1-3}$  алкил, необязательно замещенный одним

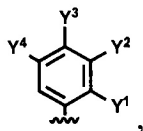
или более атомами фтора;

и

$R^3$  представляет собой  $-X-L-J$ ,  $-C_{1-12}$  алкил, необязательно замещенный одной или более группами, выбранными из  $Z^1$ , или гетероциклоалкил, необязательно замещенный одной или более группами, выбранными из  $Z^2$ .

3. Соединение для применения по п. 2, в котором

$R^1$  представляет собой



по меньшей мере один из  $Y^1$ ,  $Y^2$ ,  $Y^3$  и  $Y^4$  отличен от атома водорода;

$R^2$  представляет собой атом водорода или метил;

$R^3$  представляет собой -X-L-J или -C<sub>1-6</sub> алкил, необязательно замещенный одним или более  $Z^1$ , или гетероциклоалкил, необязательно замещенный одним или более  $Z^2$ ;

$Y^1$  представляет собой атом водорода, атом галогена, -CN,  $R^a$  или -OR<sup>m</sup>; и

каждый  $Y^2$ ,  $Y^3$  и  $Y^4$  независимо представляют собой атом водорода, атом галогена,  $R^a$ , -A-C(Q) $R^b$ , -C(Q)N( $R^c$ ) $R^d$ , -C(Q)OR<sup>e</sup>, -A-S(O)<sub>n</sub> $R^f$ , -S(O)<sub>n</sub>N( $R^i$ ) $R^j$ , -OH или -OR<sup>m</sup>.

4. Соединение для применения по п. 3, в котором

по меньшей мере два из  $Y^1$ ,  $Y^2$ ,  $Y^3$  и  $Y^4$  отличны от атома водорода.

5. Соединение для применения по п. 4, в котором

$Y^3$  и  $Y^4$  представляют собой атом водорода; и

$Y^1$  и  $Y^2$  независимо выбраны из атома фтора, атома хлора, -Me или -CF<sub>3</sub>.

6. Соединение для применения по п. 2, в котором

$R^1$  представляет собой 6-членный гетероарил, замещенный одной или более группами, выбранными из  $Y^5$ ;

$R^2$  представляет собой атом водорода; и

$R^3$  представляет собой -X-L-J или -C<sub>1-6</sub> алкил, необязательно замещенный одной или более группами, выбранными из  $Z^1$ .

7. Соединение для применения по п. 2, в котором

$R^1$  представляет собой 5-членный моноциклический гетероарил, связанный с пиримидином формулы I через атом углерода гетероарильного цикла и необязательно замещенный одним или более  $Y^5$ ;

$R^2$  представляет собой атом водорода; и

$R^3$  представляет собой -X-L-J или -C<sub>1-6</sub> алкил, необязательно замещенный  $Z^1$ .

8. Соединение для применения по п. 2, в котором

$R^1$  представляет собой бициклический гетероарил, связанный с пиримидином формулы I через атом углерода гетероарильного цикла, при этом указанный цикл необязательно замещен одним или более  $Y^5$ ;

$R^2$  представляет собой атом водорода; и

$R^3$  представляет собой -X-L-J или -C<sub>1-6</sub> алкил, необязательно замещенный одной или более группами, выбранными из  $Z^1$ .

9. Соединение для применения по п. 1, в котором

$R^1$  представляет собой -этинил- $Y^6$ ;

$R^2$  представляет собой атом водорода; и

$R^3$  представляет собой -X-L-J или -C<sub>1-6</sub> алкил, необязательно замещенный одной или



более

группами, выбранными из  $Z^1$ .

10. Соединение для применения по п. 1, в котором

$R^3$  представляет собой -X-L-J.

11. Соединение для применения по п. 1, в котором

$R^1$  представляет собой 3-8-членный неароматический цикл, необязательно содержащий один или два гетероатома и/или одну или две двойные связи, и при этом указанный цикл необязательно замещен одной или более группами, выбранными из  $Y^7$ ;

$R^2$  представляет собой атом водорода или  $C_{1-3}$  алкил, необязательно замещенный одним или более атомами фтора; и

$R^3$  представляет собой -X-L-J.

12. Соединение для применения по п. 1, в котором

$R^2$  и  $R^3$  соединены друг с другом, образуя вместе с атомами, к которым они присоединены, 5-6-членный неароматический цикл, где соединительный мостик, образованный  $R^2$  и  $R^3$ , необязательно замещен одной или более группами, выбранными из  $Z^3$ , и необязательно замещен -X-L-J.

13. Соединение для применения по п. 10, в котором

X представляет собой  $-CH_2-$ ,  $-CH_2CH_2-$ ,  $-CH(Me)-$ ,  $-C(Me)_2-$ ,  $-CH_2CH(Me)-$ ,  $-CH(Me)CH_2-$ ,  $-CH_2CH_2CH_2-$ ,  $-CH(Me)CH_2CH_2-$ ,  $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$ ,  $-CH_2C(CH_3)_2CH_2-$ , -циклопропилен- или  $-CH_2-C\equiv CH_2-$ .

14. Соединение для применения по п. 13, в котором

X представляет собой  $-CH_2CH_2-$ ,  $-CH_2CH_2CH_2-$  или -циклопропилен-.

15. Соединение для применения по п. 1, в котором

L представляет собой  $-L^1-L^2-$ .

16. Соединение для применения по п. 15, в котором

$L^1$  представляет собой  $-N(H)-$ ,  $-O-$ ,  $-SO_2-$ ,  $-C(O)N(H)-$ ,  $-SO_2N(H)-$  или  $-N(H)C(O)N(H)-$ .

17. Соединение для применения по п. 16, в котором

$L^1$  представляет собой  $-N(H)-$ ,  $-O-$  или  $-N(H)C(O)N(H)-$ .

18. Соединение для применения по п. 1, в котором

$L^2$  представляет собой простую связь.

19. Соединение для применения по п. 1, в котором

$L^2$  представляет собой  $-CH_2-$  или  $-CH_2CH_2-$ .

20. Соединение для применения по п. 1, в котором

L представляет собой простую связь.

21. Соединение для применения по п. 1, в котором

J представляет собой фенил, необязательно замещенный  $D^1$  и необязательно замещенный

одной или более группами, выбранными из  $R^X$ .

22. Соединение для применения по п. 1, в котором

J представляет собой 5-11-членный моноциклический или бициклический гетероарильный цикл, содержащий 1-3 атома азота, и/или один атом кислорода, и/или один или два атома серы, и при этом указанный цикл необязательно замещен  $D^2$  и необязательно замещен одной или более группами, выбранными из  $R^Y$ .

23. Соединение для применения по п. 1, в котором  $R^3$  представляет собой  $-C_{1-6}$  алкил, необязательно замещенный одной или более группами, выбранными из  $Z^1$ .

24. Соединение для применения по п. 23, в котором

$R^3$  представляет собой циклический или частично циклический  $-C_{3-6}$  алкил.

25. Соединение для применения по любому из пп. 1-24, где указанное состояние выбрано из следующих: ревматоидный артрит, системная красная волчанка, болезнь Крона, язвенный колит, рассеянный склероз, лимфопролиферативные заболевания (например, вызванные вирусом Эпштейна-Барра и цитомегаловирусом), отторжение после трансплантации органа, гранулематоз Вегенера, псориаз, болезнь Бехтерева, болезнь Бехчета, синдром Гийена-Барре, дерматомиозит, миозит, полимиозит, первичный билиарный цирроз, антифосфолипидный синдром, аутоиммунный гепатит, аутоиммунная кардиомиопатия, очаговая алопеция, атеросклероз, диабет 1-го типа, аутоиммунный увеит, болезнь Гудпасчера, болезнь Грейвса, болезнь Хашимото, смешанное поражение соединительной ткани, миастения гравис, обыкновенная пузырчатка, пернициозная анемия, синдром Шегрена, гигантоклеточный артериит, язвенный колит, васкулит, синдром Черджа-Строса, постполиомиелитный синдром, идиопатическая тромбоцитопеническая пурпура, болезнь Пейрони и контрактура Дюпюитрена.

26. Соединение для применения по п. 25, где указанное состояние выбрано из группы, состоящей из ревматоидного артрита, системной красной волчанки, болезни Крона, рассеянного склероза, отторжения после трансплантации органа и атеросклероза.

27. Соединение для применения по п. 25, где указанное состояние представляет собой псориаз.

28. Комбинированный продукт, содержащий:

(А) соединение для применения по любому из пп. 1-27 или его фармацевтически приемлемую соль; и

(В) одно или больше других терапевтических средств, которые могут применяться при лечении заболевания, указанного в любом из пп. 1-27,

где каждый из компонентов (А) и (В) входит в состав препарата в смеси с фармацевтически приемлемым вспомогательным веществом, разбавителем или носителем.

29. Комбинированный продукт по п. 28, в котором компонент (В) выбран из группы, состоящей из глюкокортикоидов, TNF- $\alpha$  ингибиторов, анти-CD20, иммуносупрессантов или антиметаболитов.

30. Способ лечения заболевания, указанного в любом из пп. 1-27, включающий введение терапевтически эффективного количества соединения по любому из пп. 1-27 или его фармацевтически приемлемой соли пациенту, нуждающемуся в таком лечении.