



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21), (22) Заявка: 2008143547/04, 27.03.2007

(30) Конвенционный приоритет:
06.04.2006 EP 06112298.2

(43) Дата публикации заявки: 20.05.2010 Бюл. № 14

(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную
фазу: 06.11.2008(86) Заявка РСТ:
EP 2007/052914 (27.03.2007)(87) Публикация РСТ:
WO 2007/115931 (18.10.2007)Адрес для переписки:
101000, Москва, М.Златоустинский пер., 10,
кв.15, "ЕВРОМАРКПАТ"

(71) Заявитель(и):

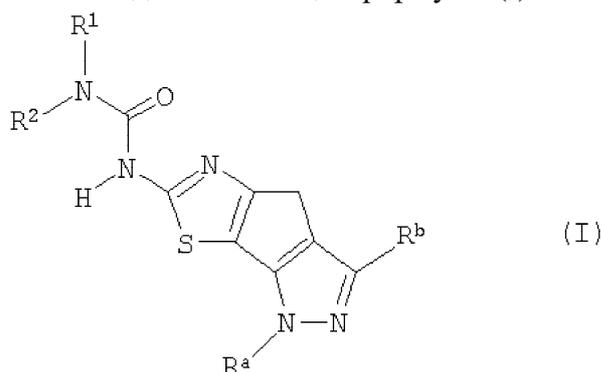
**БЁРИНГЕР ИНГЕЛЬХАЙМ
ИНТЕРНАЦИОНАЛЬ ГМБХ (DE)**

(72) Автор(ы):

**БРАЙТФЕЛЬДЕР Штефен (DE),
МАЙЕР Удо (DE),
ХЁНКЕ Кристоф (DE),
ЙЁРГЕНСЕН Анне Т. (DK),
ПАУЧ Александер (DE),
БРАНДЛЬ Трикси (CH),
ГРАУЕРТ Маттиас (DE),
ХОФФМАНН Маттиас (DE),
ШОЙЕРЕР Штефан (DE),
ЭРБ Клаус (DE),
ПИПЕР Михаэль (DE),
ПРАГСТ Инго (DE)**(54) ТИАЗОЛИЛДИГИДРОЦИКЛОПЕНТАПИРАЗОЛЫ ДЛЯ ПРИМЕНЕНИЯ В КАЧЕСТВЕ
ИНГИБИТОРОВ Р13-КИНАЗЫ

(57) Формула изобретения

1. Соединения общей формулы (I)



в которой R^a обозначает водород или необязательно замещенный остаток, выбранный из группы, включающей C_1 - C_8 алкил, C_2 - C_8 алкенил, C_2 - C_8 алкинил, C_3 - C_8 циклоалкил, C_3 - C_8 циклоалкенил, C_1 - C_6 галоалкил, C_6 - C_{14} арил, C_6 - C_{14} арил- C_1 - C_5 алкил-, C_5 - C_{10} гетероарил, C_3 - C_8 циклоалкил- C_1 - C_4 алкил-, C_3 - C_8 циклоалкенил- C_1 - C_4 алкил-, C_5 - C_{10} гетероарил- C_1 - C_4 алкил-, C_9 - C_{13} спиросистему, C_3 - C_8 гетероциклоалкил и C_3 - C_8 гетероциклоалкил- C_1 - C_4 алкил-,

R^b обозначает водород, NH_2 , OH или необязательно замещенный остаток,

выбранный из группы, включающей C₁-C₈алкил, C₃-C₈циклоалкил, C₂-C₈алкенил, C₂-C₈алкинил, C₃-C₈циклоалкенил, C₁-C₆галоалкил, C₆-C₁₄арил, C₆-C₁₄арил-C₁-C₅алкил-, C₅-C₁₀гетероарил, C₃-C₈циклоалкил-C₁-C₄алкил-, C₃-C₈циклоалкенил-C₁-C₄алкил-, C₅-C₁₀гетероарил-C₁-C₄алкил-, C₉-C₁₃спиросистему, C₃-C₈гетероциклоалкил, CONH₂, C₆-C₁₄арил-NH-, C₃-C₈гетероциклоалкил-NH- и OMe,

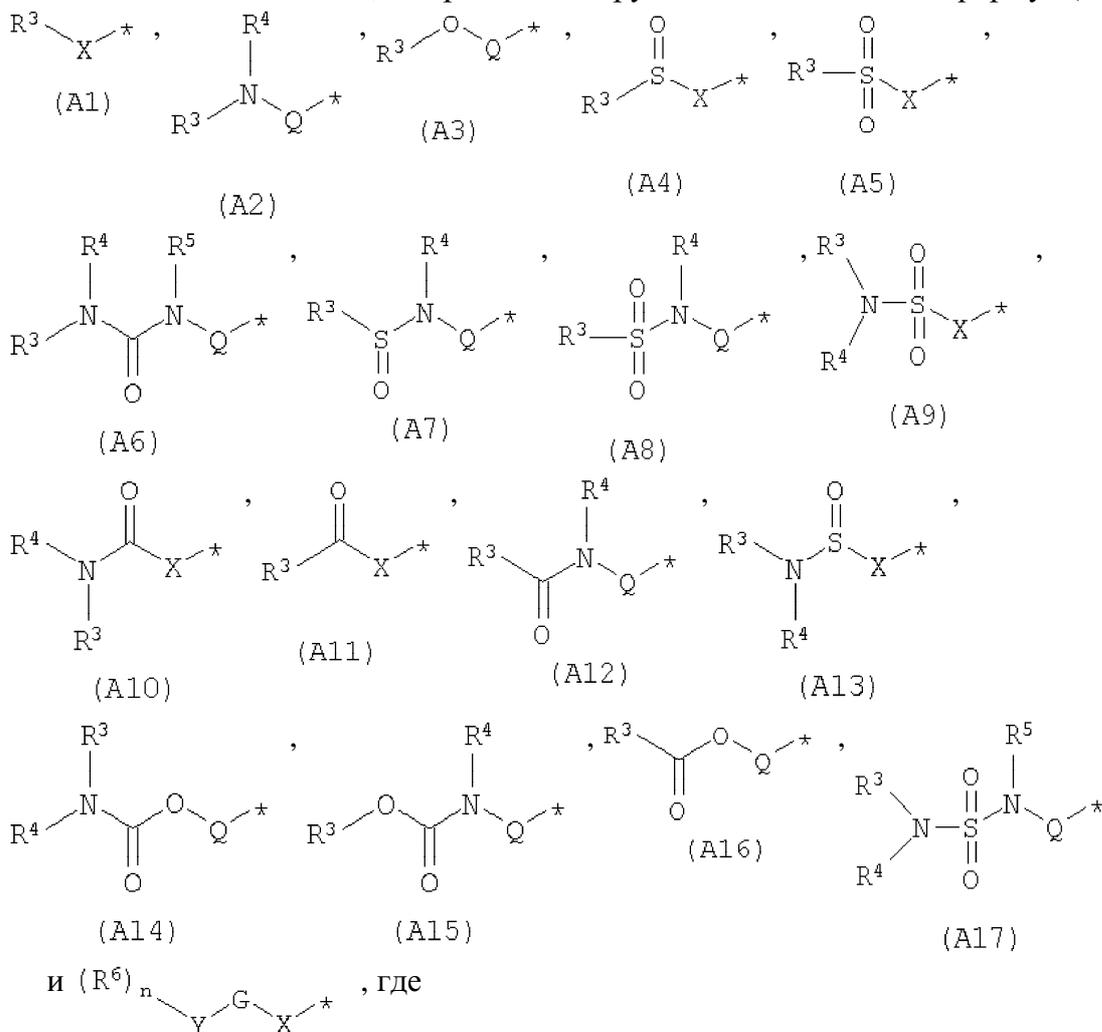
R¹ обозначает водород или необязательно замещенный остаток, выбранный из группы, включающей C₁-C₈алкил, C₃-C₈циклоалкил, C₂-C₈алкенил, C₂-C₈алкинил и C₆-C₁₄арил-C₁-C₅алкил-,

R² обозначает водород или необязательно замещенный остаток, выбранный из группы, включающей C₁-C₈алкил, C₃-C₈циклоалкил, C₂-C₈алкенил, C₃-C₈циклоалкенил, C₁-C₆галоалкил, C₆-C₁₄арил, C₆-C₁₄арил-C₁-C₅алкил-, C₅-C₁₀гетероарил, C₃-C₈циклоалкил-C₁-C₄алкил-, C₃-C₈циклоалкенил-C₁-C₄алкил-, C₅-C₁₀гетероарил-C₁-C₆алкил-, C₉-C₁₃спиросистему, C₃-C₈гетероциклоалкил, C₃-C₈гетероциклоалкил-C₁-C₆алкил- и C₆-C₁₄арил-C₁-C₆алкил-, или

R¹ и R² совместно образуют необязательно замещенное пяти-, шести- либо семичленное кольцо, состоящее из атомов углерода и необязательно 1 или 2 гетероатомов, выбранных из группы, включающей кислород, серу и азот, или

R¹ и R² совместно образуют необязательно замещенную девяти-тринадцатичленную спироциклическую систему или

R² обозначает остаток, выбранный из группы остатков общих формул (A1)-(A18)



X и Y могут быть соединены с одним и тем же или с разными атомами

заместителя G,

X обозначает связь или необязательно замещенный остаток, выбранный из группы, включающей C₁-C₇алкилен, C₃-C₇алкенилен и C₃-C₇алкинилен, или

X совместно с R¹, R³ или R⁴ могут образовывать C₁-C₇алкиленовый мостик,

Y обозначает связь или необязательно замещенный C₁-C₄алкилен,

Q обозначает необязательно замещенный остаток, выбранный из группы, включающей C₁-C₇алкилен, C₃-C₇алкенилен и C₃-C₇алкинилен, или

Q совместно с R¹, R³ или R⁴ могут образовывать C₁-C₇алкиленовый мостик,

R³, R⁴, R⁵ имеют одинаковые или разные значения и обозначают водород или необязательно замещенный остаток, выбранный из группы, включающей C₁-C₈алкил, C₃-C₈циклоалкил, C₂-C₆галоалкил, C₁-C₄алкил-C₃-C₈циклоалкил-, C₃-C₈циклоалкил-C₁-C₄алкил-, NR⁷R⁸, NR⁷R⁸-C₁-C₄алкил-, C₁-C₄алкоксигруппу, C₁-C₄алкокси-C₁-C₄алкил-, C₆-C₁₄арил и C₅-C₁₀гетероарил, или

по два заместителя из числа R³, R⁴, R⁵ совместно образуют необязательно замещенное пяти-, шести- либо семичленное кольцо, состоящее из атомов углерода и необязательно 1 или 2 гетероатомов, выбранных из группы, включающей кислород, серу и азот,

G обозначает насыщенную, частично насыщенную либо ненасыщенную кольцевую систему из 3-10 C-атомов, до 6 из которых необязательно заменены на гетероатомы, выбранные из группы, включающей азот, кислород и серу,

R⁶ в каждом случае независимо обозначает водород, необязательно замещенный остаток, выбранный из группы, включающей =O, C₁-C₈алкил, C₂-C₆алкенил C₃-C₈циклоалкил, C₂-C₆галоалкил, C₆-C₁₄арил, C₅-C₁₀гетероарил и C₃-C₈гетероциклоалкил, или остаток, выбранный из группы, включающей NR⁷R⁸, OR⁷,

-CO-C₁-C₃алкил-NR⁷R⁸, -O-C₁-C₃алкил-NR⁷R⁸, CONR⁷R⁸, NR⁷COR⁸, -CO-C₁-C₃алкил-NR⁷(CO)OR⁸, -O(CO)NR⁷R⁸, NR⁷(CO)NR⁸R⁹, NR⁷(CO)OR⁸, (CO)OR⁷, -O(CO)R⁷, COR⁷, (SO)R⁷, (SO₂)R⁷, (SO₂)NR⁷R⁸, NR⁷(SO₂)R⁸, NR⁷(SO₂)NR⁸R⁹, CN, -C₁-C₃алкил-C₆-C₁₄арил, -NH-CO-NH-C₁-C₃алкил и галоген,

n обозначает 1, 2 или 3,

R⁷, R⁸, R⁹ имеют одинаковые или разные значения и обозначают водород или необязательно замещенный остаток, выбранный из группы, включающей C₁-C₈алкил, C₃-C₈циклоалкил, C₁-C₆галоалкил, C₁-C₄алкил-C₃-C₈циклоалкил-, C₃-C₈циклоалкил-C₁-C₃алкил-, C₆-C₁₄арил, C₁-C₄алкил-C₆-C₁₄арил-, C₆-C₁₄арил-C₁-C₄алкил-, C₃-C₈гетероциклоалкил, C₁-C₅алкил-C₃-C₈гетероциклоалкил-, C₃-C₈гетероциклоалкил-C₁-C₄алкил-, C₁-C₄алкил(CO)- и C₁-C₄алкил-O(CO)-, или

по два заместителя из числа R⁷, R⁸, R⁹ совместно образуют необязательно замещенное пяти-, шести- либо семичленное кольцо, состоящее из атомов углерода и необязательно 1 или 2 гетероатомов, выбранных из группы, включающей кислород, серу и азот,

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, при условии, что из объема изобретения исключены следующие соединения:

- а) 1,1-диметил-3-(4-фенил-4,7-дигидро-3-тиа-1,4,5-триазацiclo-пента[а]пентален-2-ил)мочевина,
- б) (4-фенил-4,7-дигидро-3-тиа-1,4,5-триазацicloпента[а]пентален-2-ил)мочевина,
- в) 1-(2-диметиламиноэтил)-3-(4-фенил-4,7-дигидро-3-тиа-1,4,5-триазацicloпента[а]

пентален-2-ил)мочевина,

г) 1-(2-диметиламиноэтил)-1-метил-3-(4-фенил-4,7-дигидро-3-тиа-1,4,5-триазапентациклопента[а]пентален-2-ил)мочевина,

д) (4-фенил-4,7-дигидро-3-тиа-1,4,5-триазапентациклопента[а]пентален-2-ил)амид 4-метилпиперазин-1-карбоновой кислоты,

е) 1-[4-(2-хлорфенил)-4,7-дигидро-3-тиа-1,4,5-триазапентациклопента[а]пентален-2-ил]-3-(2-диметиламиноэтил)мочевина,

ж) 3-[4-(2-хлорфенил)-4,7-дигидро-3-тиа-1,4,5-триазапентациклопента[а]пентален-2-ил]-1-(2-диметиламиноэтил)-1-метилмочевина,

з) 1-[4-(2-хлорфенил)-4,7-дигидро-3-тиа-1,4,5-триазапентациклопента[а]пентален-2-ил]-3-метилмочевина,

и) 1-[4-(2-хлорфенил)-4,7-дигидро-3-тиа-1,4,5-триазапентациклопента[а]пентален-2-ил]-3-(2-имидазол-1-илэтил)мочевина,

к) 3-[4-(2-хлорфенил)-4,7-дигидро-3-тиа-1,4,5-триазапентациклопента[а]пентален-2-ил]-1,1-диметилмочевина и

л) (4-фенил-4,7-дигидро-3-тиа-1,4,5-триазапентациклопента[а]пентален-2-ил)амид пиперидин-1-карбоновой кислоты.

2. Соединения по п.1, в которых

X, Y, Q и G могут иметь указанные выше значения, а

R^a обозначает водород или остаток, выбранный из группы, включающей C₁-C₈алкил, C₂-C₈алкенил, C₂-C₈алкинил, C₃-C₈циклоалкил, C₃-C₈циклоалкенил, C₁-C₆галоалкил, C₆-C₁₄арил, C₆-C₁₄арил-C₁-C₅алкил-, C₅-C₁₀гетероарил, C₃-C₈циклоалкил-C₁-C₄алкил-, C₃-C₈циклоалкенил-C₁-C₄алкил-, C₅-C₁₀гетероарил-C₁-C₄алкил-, C₉-C₁₃спиросистему, C₃-C₈гетероциклоалкил и C₃-C₈гетероциклоалкил-C₁-C₄алкил-, каждый из которых необязательно может быть замещен одним или несколькими одинаковыми или разными остатками, выбранными из группы, включающей C₁-C₆алкил, C₂-C₆алкенил, C₂-C₆алкинил, C₃-C₈циклоалкил, C₁-C₆галоалкил, галоген, OH, C₁-C₄алкоксигруппу, CN, NO₂, NR¹⁰R¹¹, OR¹⁰, COR¹⁰, COOR¹⁰, CONR¹⁰R¹¹, NR¹⁰COR¹¹, NR¹⁰(CO)NR¹¹R¹², O(CO)NR¹⁰R¹¹, NR¹⁰(CO)OR¹¹, SO₂R¹⁰, SOR¹⁰, SO₂NR¹⁰R¹¹, NR¹⁰SO₂NR¹¹R¹² и NR¹⁰SO₂R¹¹,

R¹⁰, R¹¹, R¹² имеют одинаковые или разные значения и обозначают водород или остаток, выбранный из группы, включающей C₁-C₆алкил, C₂-C₆алкенил, C₂-C₆алкинил, C₃-C₈циклоалкил и C₁-C₆галоалкил, или по два заместителя из числа R¹⁰, R¹¹, R¹² совместно образуют пяти-, шести- либо семичленное кольцо, состоящее из атомов углерода и необязательно 1 или 2 гетероатомов, выбранных из группы, включающей кислород, серу и азот,

R^b обозначает водород, NH₂, OH или необязательно замещенный остаток, выбранный из группы, включающей C₁-C₈алкил, C₃-C₈циклоалкил, C₂-C₈алкенил, C₂-C₈алкинил, C₃-C₈циклоалкенил, C₁-C₆галоалкил, C₆-C₁₄арил, C₆-C₁₄арил-C₁-C₅алкил-, C₅-C₁₀гетероарил, C₃-C₈циклоалкил-C₁-C₄алкил-, C₃-C₈циклоалкенил-C₁-C₄алкил-, C₅-C₁₀гетероарил-C₁-C₄алкил-, C₉-C₁₃спиросистему, C₃-C₈гетероциклоалкил, CONH₂, C₆-C₁₄арил-NH-, C₃-C₈гетероциклоалкил-NH- и OMe, каждый из которых необязательно может быть замещен одним или несколькими одинаковыми или разными остатками, выбранными из группы, включающей C₁-C₆алкил, C₂-C₆алкенил, C₂-C₆алкинил, C₃-C₈циклоалкил, C₁-C₆галоалкил, галоген, OH, OMe, CN, NH₂, NHMe и NMe₂,

R¹ обозначает водород или остаток, выбранный из группы, включающей C₁-C₈алкил, C₃-C₈циклоалкил, C₂-C₈алкенил, C₂-C₈алкинил и C₆-C₁₄арил-C₁-C₅алкил-, каждый из которых необязательно может быть замещен одним или несколькими

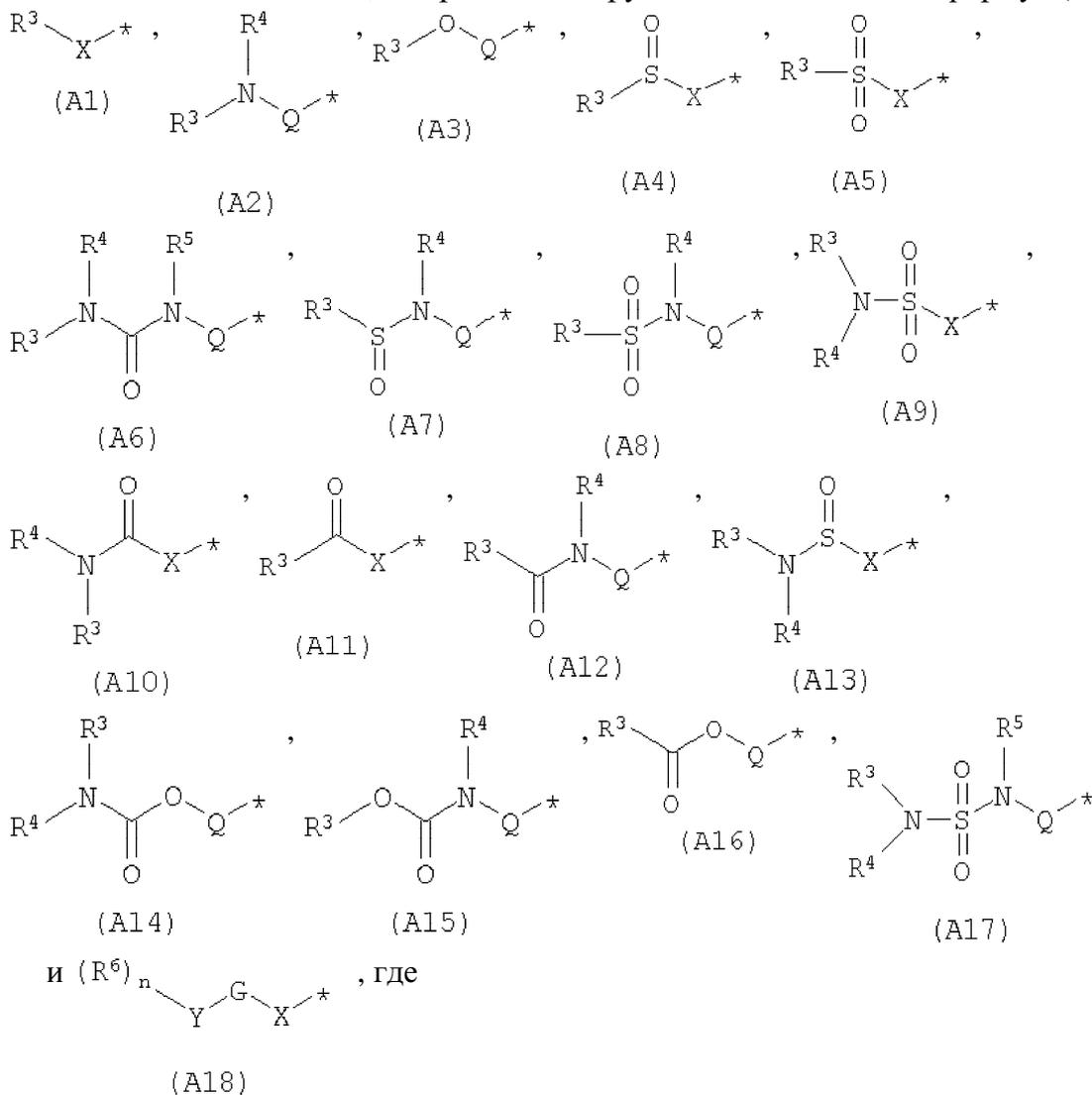
одинаковыми или разными остатками, выбранными из группы, включающей галоген, NH₂, OH, CN, C₁-C₆алкил, OMe, -NH(CO)-алкил и -(CO)O-алкил,

R² обозначает водород или остаток, выбранный из группы, включающей C₁-C₈алкил, C₃-C₈циклоалкил, C₂-C₈алкенил, C₃-C₈циклоалкенил, C₁-C₆галоалкил, C₆-C₁₄арил, C₆-C₁₄арил-C₁-C₅алкил-, C₅-C₁₀гетероарил, C₃-C₈циклоалкил-C₁-C₄алкил-, C₃-C₈циклоалкенил-C₁-C₄алкил-, C₅-C₁₀гетероарил-C₁-C₆алкил-, C₉-C₁₃спиросистему, C₃-C₈гетероциклоалкил, C₃-C₈гетероциклоалкил-C₁-C₆алкил- и C₆-C₁₄арил-C₁-C₆алкил-, каждый из которых необязательно может быть замещен одним или несколькими одинаковыми или разными остатками, выбранными из группы, включающей галоген, NH₂, OH, CN, C₁-C₆алкил, OMe, -NH(CO)-алкил, =O, COOH и -(CO)O-алкил, или

R¹ и R² совместно образуют пяти-, шести- либо семичленное кольцо, которое состоит из атомов углерода и необязательно 1 или 2 гетероатомов, выбранных из группы, включающей кислород, серу и азот, и которое необязательно может быть замещено одним или несколькими одинаковыми или разными остатками, выбранными из группы, включающей галоген, NH₂, OH, CN, C₁-C₆алкил, OMe, -NH(CO)-C₁-C₄алкил и -(CO)O-C₁-C₄алкил, или

R¹ и R² совместно образуют необязательно замещенную девяти-тринадцатичленную спироциклическую систему или

R² обозначает остаток, выбранный из группы остатков общих формул (A1)-(A18)



R³, R⁴, R⁵ имеют одинаковые или разные значения и обозначают водород или

остаток, выбранный из группы, включающей C₁-C₈алкил, C₃-C₈циклоалкил, C₂-C₆галоалкил, C₁-C₄алкил-C₃-C₈циклоалкил-, C₃-C₈циклоалкил-C₁-C₄алкил-, NR⁷R⁸, NR⁷R⁸-C₁-C₄алкил-, C₁-C₄алкоксигруппу, C₁-C₄алкокси-C₁-C₄алкил-, C₆-C₁₄арил и C₅-C₁₀гетероарил, каждый из которых необязательно может быть замещен одним или несколькими одинаковыми или разными остатками, выбранными из группы, включающей галоген, NH₂, OH, CN, NR⁹R¹⁰, -NH(CO)-C₁-C₄алкил и MeO, или

по два заместителя из числа R³, R⁴, R⁵ совместно образуют пяти-, шести- либо семичленное кольцо, которое состоит из атомов углерода и необязательно 1 или 2 гетероатомов, выбранных из группы, включающей кислород, серу и азот, и которое необязательно может быть замещено одним или несколькими одинаковыми или разными остатками, выбранными из группы, включающей галоген, NH₂, OH, CN, NR⁹R¹⁰, -NH(CO)-C₁-C₄алкил и MeO,

R⁶ в каждом случае независимо обозначает водород, остаток, выбранный из группы, включающей C₁-C₈алкил, C₂-C₆алкенил, C₃-C₈циклоалкил, C₂-C₆галоалкил, C₆-C₁₄арил, C₅-C₁₀гетероарил и C₃-C₈гетероциклоалкил, каждый из которых необязательно может быть замещен одним или несколькими одинаковыми или разными остатками, выбранными из группы, включающей NH₂, NHMe, NMe₂, OH, OMe, CN, -C₁-C₃алкил-C₆-C₁₄арил, -NH-CO-NH-C₁-C₃алкил, C₁-C₆алкил и -(CO)O-C₁-C₆алкил, или остаток, выбранный из группы, включающей =O, NR⁷R⁸, OR⁷, -CO-C₁-C₃алкил-NR⁷R⁸, -O-C₁-C₃алкил-NR⁷R⁸, CONR⁷R⁸, NR⁷COR⁸, -CO-C₁-C₃алкил-NR⁷(CO)OR⁸, -O(CO)NR⁷R⁸, NR⁷(CO)NR⁸R⁹, NR⁷(CO)OR⁸, (CO)OR⁷, -O(CO)R⁷, COR⁷, (SO)R⁷, (SO₂)R⁷, (SO₂)NR⁷R⁸, NR⁷(SO₂)R⁸, NR⁷(SO₂)NR⁸R⁹, CN и галоген, n обозначает 1, 2 или 3,

R⁷, R⁸, R⁹ имеют одинаковые или разные значения и обозначают водород или остаток, выбранный из группы, включающей C₁-C₈алкил, C₃-C₈циклоалкил, C₂-C₆галоалкил, C₁-C₄алкил-C₃-C₈циклоалкил-, C₃-C₈циклоалкил-C₁-C₃алкил-, C₆-C₁₄арил, C₁-C₄алкил-C₆-C₁₄арил-, C₆-C₁₄арил-C₁-C₄алкил-, C₃-C₈гетероциклоалкил, C₁-C₅алкил-C₃-C₈гетероциклоалкил-, C₃-C₈гетероциклоалкил-C₁-C₄алкил-, C₁-C₄алкил(CO)- и C₁-C₄алкил-O(CO)-, каждый из которых необязательно может быть замещен одним или несколькими одинаковыми или разными остатками, выбранными из группы, включающей галоген, NH₂, OH, CN, OMe, NHMe, NMe₂, C₁-C₆алкил и (CO)O-C₁-C₆алкил, или

по два заместителя из числа R⁷, R⁸, R⁹ совместно образуют пяти-, шести- либо семичленное кольцо, которое состоит из атомов углерода и необязательно 1 или 2 гетероатомов, выбранных из группы, включающей кислород, серу и азот, и которое необязательно может быть замещено одним или несколькими одинаковыми или разными остатками, выбранными из группы, включающей галоген, NH₂, OH, CN, OMe, NHMe, NMe₂, C₁-C₆алкил и (CO)O-C₁-C₆алкил.

3. Соединения по п.1, в которых R^a и R¹-R¹² могут иметь указанные выше значения, а R^b обозначает водород.

4. Соединения по одному из пп.1 или 2, в которых

R¹-R¹² могут иметь указанные выше значения, а

R^a обозначает C₆-C₁₄арил или насыщенную кольцевую систему из 5 или 6 C-атомов, до 4 из которых необязательно могут быть заменены на атомы азота, и необязательно может быть замещен одним или несколькими одинаковыми или разными остатками, выбранными из группы, включающей C₁-C₆алкил, C₁-C₆алкенил, C₂-C₆алкинил, C₃-C₈циклоалкил, C₁-C₆галоалкил, галоген, OH, C₁-C₄алкоксигруппу, CN, NO₂,

NR¹⁰R¹¹, OR¹⁰, COR¹⁰, COOR¹⁰, CONR¹⁰R¹¹, NR¹⁰COR¹¹, NR¹⁰(CO)NR¹¹R¹²,
O(CO)NR¹⁰R¹¹, NR¹⁰(CO)OR¹¹, SO₂R¹⁰, SOR¹⁰, SO₂NR¹⁰R¹¹, NR¹⁰SO₂NR¹¹R¹² и
NR¹⁰SO₂R¹¹,

R^b обозначает водород, NH₂, OH или остаток, выбранный из группы, включающей C₃-C₈циклоалкил, C₆-C₁₄арил, C₅-C₁₀гетероарил, C₆-C₁₄арил-NH-, C₁-C₈алкил, C₂-C₈алкенил, C₂-C₈алкинил и C₁-C₆галоалкил, каждый из которых необязательно может быть замещен одним или несколькими одинаковыми или разными остатками, выбранными из группы, включающей C₁-C₆алкил, C₂-C₆алкенил, C₂-C₆алкинил, C₃-C₈циклоалкил, C₁-C₆галоалкил, галоген, OH, OMe, CN, NH₂, NHMe и NMe₂.

5. Соединения по одному из пп.1-3, в которых

R^a и R^b могут иметь указанные выше значения, а

R¹ обозначает водород, C₁-C₅алкил или C₃-C₈циклоалкил,

R² обозначает водород или необязательно замещенный остаток, выбранный из группы, включающей C₁-C₅алкил, C₆-C₁₄арил-C₁-C₅алкил-, C₃-C₈циклоалкил-C₁-C₄алкил-, C₅-C₁₀гетероарил-C₁-C₆алкил-, C₃-C₈гетероциклоалкил и C₃-C₈гетероциклоалкил-C₁-C₆алкил-, или

R¹ и R² совместно образуют необязательно замещенное пяти- либо шестичленное кольцо, состоящее из атомов углерода и необязательно 1 или 2 атомов азота, или

R¹ и R² совместно образуют необязательно замещенную девяти-тринадцатичленную спироциклическую систему или

R¹, R² имеют одинаковые или разные значения и обозначают остаток, выбранный из группы остатков общих формул (A2), (A3), (A8), (A10), (A11) и (A12), где

X обозначает связь или необязательно замещенный C₁-C₃алкилен или

X совместно с R¹, R³ или R⁴ могут образовывать 5- или 6-членный гетероцикл,

Q обозначает необязательно замещенный C₁-C₃алкилен,

Q совместно с R¹, R³ или R⁴ могут образовывать C₁-C₇алкиленовый мостик,

R³, R⁴, R⁵ имеют одинаковые или разные значения и обозначают водород или необязательно замещенный остаток, выбранный из группы, включающей C₁-C₄алкил, C₁-C₄алкоксигруппу, C₃-C₆циклоалкил и C₅-C₁₀гетероарил, или

по два заместителя из числа R³, R⁴, R⁵ совместно образуют необязательно замещенное пяти- либо шестичленное кольцо, состоящее из атомов углерода и необязательно 1 или 2 гетероатомов, выбранных из группы, включающей кислород и азот.

6. Соединения по одному из пп.1-3, в которых

R^a и R^b могут иметь указанные выше значения, а

R¹ обозначает H или Me,

R² обозначает водород или остаток общей формулы (A18), где

X обозначает связь или необязательно замещенный остаток, выбранный из группы, включающей C₁-C₇алкилен, C₃-C₇алкенилен и C₃-C₇алкинилен, или

X совместно с R¹ могут образовывать C₁-C₇алкиленовый мостик,

Y обозначает связь, метилен или этилен,

X и Y могут быть соединены с одним и тем же или с разными атомами заместителя G,

G обозначает насыщенную, частично насыщенную либо ненасыщенную кольцевую систему из 3-10 C-атомов, до 6 из которых необязательно заменены на гетероатомы, выбранные из группы, включающей азот, кислород и серу,

R⁶ в каждом случае независимо обозначает водород, необязательно замещенный

остаток, выбранный из группы, включающей =O, C₁-C₄алкил, C₂-C₆алкенил, C₃-C₆циклоалкил, C₆-C₁₄арил, C₅-C₆гетероциклоалкил и C₅-C₆гетероарил, или остаток, выбранный из группы, включающей NR⁷R⁸, OR⁷, -O-C₁-C₃алкил-NR⁷R⁸, CONR⁷R⁸, CO-C₁-C₃алкил-NR⁷R⁸, NR⁷COR⁸, NR⁷(CO)OR⁸,

-CO-C₁-C₃алкил-NR⁷(CO)OR⁸, NR⁷(CO)NR⁸R⁹, NR⁷(CO)OR⁸, (CO)OR⁷, COR⁷, (SO₂)R⁷, -C₁-C₃алкил-C₆-C₁₄арил, -NH-CO-NH-C₁-C₃алкил и CN,

n обозначает 1 или 2,

R⁷, R⁸, R⁹ имеют одинаковые или разные значения и обозначают водород или необязательно замещенный остаток, выбранный из группы, включающей C₁-C₃алкил, C₁-C₄алкил-C₆-C₁₄арил-, C₃-C₆гетероциклоалкил и C₁-C₅алкил-C₃-C₈гетероциклоалкил-, или

по два заместителя из числа R⁷, R⁸, R⁹ совместно образуют необязательно замещенное пяти- либо шестичленное кольцо, состоящее из атомов углерода и необязательно 1 или 2 гетероатомов, выбранных из группы, включающей кислород и азот.

7. Соединения по одному из пп.1-3 для применения в качестве лекарственных средств.

8. Применение соединений по одному из пп.1-6 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.

9. Применение по п.8, отличающееся тем, что под указанными заболеваниями подразумеваются воспалительные и аллергические заболевания дыхательных путей.

10. Применение по п.9, отличающееся тем, что речь идет о заболевании, выбранном из группы, включающей хронический бронхит, острый бронхит, бронхит вследствие бактериальной или вирусной инфекции либо поражения грибками 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.

11. Применение по п.8, отличающееся тем, что под указанными заболеваниями подразумеваются воспалительные и аллергические кожные болезни.

12. Применение по п.11, отличающееся тем, что речь идет о заболевании, выбранном из группы, включающей псориаз, контактный дерматит, атопический дерматит, круговую алопецию, экссудативную многоформную эритему (синдром Стивена-Джонсона), герпетиформный дерматит, склеродермию, витилиго, крапивницу (Urticaria), красную волчанку, фолликулярную и поверхностную пиодермию, эндогенные и экзогенные угри, розовые угри, а также иные воспалительные, аллергические и пролиферативные кожные болезни.

13. Применение по п.8, отличающееся тем, что под указанными заболеваниями подразумеваются воспалительные заболевания глаз.

14. Применение по п.13, 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.

15. Применение по п.8, отличающееся тем, что под указанными заболеваниями подразумеваются заболевания слизистой оболочки носа.

16. Применение по п.15, отличающееся тем, что речь идет о заболевании, выбранном из группы, включающей аллергический ринит, аллергический синусит и полипы носа.

17. Применение по п.8, отличающееся тем, что под указанными заболеваниями подразумеваются воспалительные или аллергические болезненные состояния, в которых участвуют аутоиммунные реакции.

18. Применение по п.17, отличающееся тем, что речь идет о заболевании, выбранном из группы, включающей болезнь Крона, язвенный колит, системную красную волчанку, хронический гепатит, множественный склероз, ревматоидный артрит, псориаз, псориатический артрит, остеоартрит и ревматоидный спондилит.

19. Применение по п.8, отличающееся тем, что под указанными заболеваниями подразумеваются воспаления почек.

20. Применение по п.19, отличающееся тем, что речь идет о заболевании, выбранном из группы, включающей гломерулонефрит, интерстициальный нефрит и идиопатический нефротический синдром.

21. Фармацевтическая композиция, содержащая соединение формулы (I) по одному из пп.1-6.

22. Вводимая в организм путем ингаляции фармацевтическая композиция по п.21, содержащая соединение формулы (I) по одному из пп.1-6.

23. Перорально вводимая в организм фармацевтическая композиция по п.21, содержащая соединение формулы (I) по одному из пп.1-6.

24. Комбинации лекарственных средств, которые наряду с одним или несколькими соединениями формулы (I) по одному из пп.1-6 содержат в качестве другого действующего вещества одно или несколько соединений, выбранных из классов бета-агонистов, антихолинэргических 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.