



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21), (22) Заявка: 2008114378/04, 12.09.2006

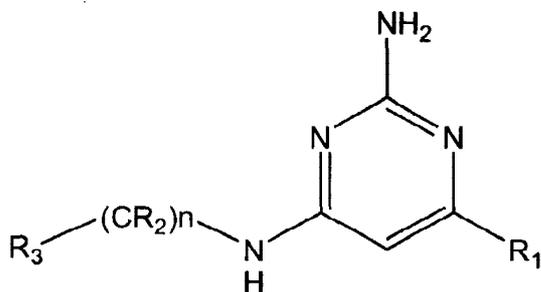
(30) Конвенционный приоритет:
13.09.2005 EP 05380195.7
09.06.2006 EP 06381027.9

(43) Дата публикации заявки: 20.10.2009 Бюл. № 29

(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную
фазу: 14.04.2008(86) Заявка РСТ:
EP 2006/066303 (12.09.2006)(87) Публикация РСТ:
WO 2007/031529 (22.03.2007)Адрес для переписки:
129090, Москва, ул.Б.Спасская, 25, стр.3,
ООО "Юридическая фирма Городисский и
Партнеры", пат.пов. А.В.Мицу, рег.№ 364(71) Заявитель(и):
ПАЛАУ ФАРМА, С.А. (ES)(72) Автор(ы):
КАРСЕЛЬЕР ГОНСАЛЕС Элена (ES),
САЛАС СОЛАНА Хорхе (ES),
СОЛИВА СОЛИВА Роберт (ES),
МЕДИНА ФУЭНТЕС Эва Мария (ES),
МАРТИ ВИЯ Хосеп (ES)(54) ПРОИЗВОДНЫЕ 2-АМИНОПИРИМИДИНА КАК МОДУЛЯТОРЫ АКТИВНОСТИ
H4-РЕЦЕПТОРА ГИСТАМИНА

(57) Формула изобретения

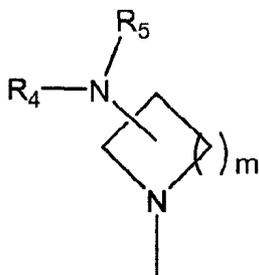
1. Соединение формулы I



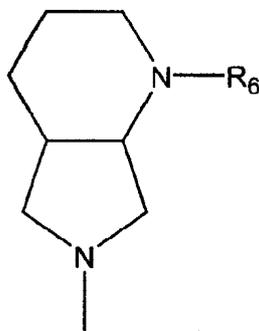
(I)

в которой

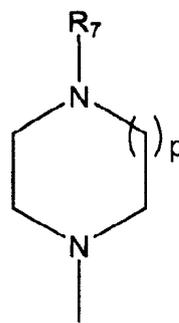
R₁ представляет собой группу, выбранную из (a), (b) и (c):



(a)



(b)



(c)

R_2 представляет собой H или C_{1-4} -алкил;

R_3 представляет собой фенил, необязательно конденсированный с 5- или 6-членным ароматическим, насыщенным или частично ненасыщенным циклом, который может быть карбоциклическим или гетероциклическим с 1 или 2 гетероатомами, выбранными из N, O и S; причем R_3 может быть замещен одним или более заместителями R_8 ;

R_4 представляет собой H или C_{1-4} -алкил;

R_5 представляет собой H или C_{1-4} -алкил;

R_6 представляет собой H или C_{1-4} -алкил;

R_7 представляет собой H или C_{1-4} -алкил;

каждый R_8 независимо друг от друга представляет собой C_{1-4} -алкил, галоген, -OH, C_{1-4} -алкоксигруппу, C_{1-4} -алкилтиогруппу, C_{1-4} -галогеноалкил, C_{1-4} -галогеноалкоксигруппу, -COR₉, -CO₂R₉, -CONR₉R₉, -NR₉R₉, -NHCOR₁₀, -CN, C_{2-4} -алкинил или -CH₂OH, и дополнительно один из заместителей R_8 может представлять собой фенил, необязательно замещенный одной или более группами, выбранными из C_{1-4} -алкила, галогена, -OH, C_{1-4} -алкоксигруппы, C_{1-4} -алкилтиогруппы, C_{1-4} -галогеноалкила, C_{1-4} -галогеноалкоксигруппы, -COR₉, -CO₂R₉, -CONR₉R₉, -NR₉R₉, -NHCOR₁₀, -CN, C_{2-4} -алкинила и -CH₂OH;

R_9 представляет собой H или C_{1-4} -алкил;

R_{10} представляет собой C_{1-4} -алкил;

m представляет собой 1, 2 или 3;

n представляет собой 0 или 1; и

p представляет собой 1 или 2;

или его соль.

2. Соединение по п.1, в котором n равно 0.

3. Соединение по п.1, в котором R_2 представляет собой H или метил.

4. Соединение по п.1, в котором R_3 представляет собой фенил или нафтил, которые могут быть замещены одним или более заместителями R_8 .

5. Соединение по п.2, в котором R_3 представляет собой фенил или нафтил, которые могут быть замещены одним или более заместителями R_8 .

6. Соединение по п.4, в котором R_3 представляет собой фенил, необязательно замещенный одним или более заместителями R_8 .

7. Соединение по п.5, в котором R_3 представляет собой фенил, необязательно замещенный одним или более заместителями R_8 .

8. Соединение по любому из пп.1-7, в котором каждый R_8 независимо друг от друга представляет собой C_{1-4} -алкил, галоген, -OH, C_{1-4} -алкоксигруппу,

C_{1-4} -галогеноалкил, C_{1-4} -галогеноалкоксигруппу, -CN или C_{2-4} -алкинил, и дополнительно один из заместителей R_8 может представлять собой фенил, необязательно замещенный одной или более группами, выбранными из C_{1-4} -алкила, галогена, -ОН, C_{1-4} -алкоксигруппы, C_{1-4} -галогеноалкила, C_{1-4} -галогеноалкоксигруппы, -CN и C_{2-4} -алкинила.

9. Соединение по п.8, в котором каждый R_8 независимо друг от друга представляет собой C_{1-4} -алкил, галоген, -ОН, C_{1-4} -алкоксигруппу, C_{1-4} -галогеноалкил, C_{1-4} -галогеноалкоксигруппу, -CN или C_{2-4} -алкинил.

10. Соединение по любому из пп. 1-7 или 9, в котором R_1 представляет собой (а) или (b).

11. Соединение по п.10, в котором R_1 представляет собой (а).

12. Соединение по п.10, в котором R_1 представляет собой (b).

13. Соединение по любому из пп. 1-7 или 9, в котором R_1 представляет собой (с).

14. Соединение по любому из пп. 1-7, 9 или 11, в котором m представляет собой 1 или 2.

15. Соединение по любому из пп. 1-7 или 9, в котором p представляет собой 2.

16. Соединение по любому из пп. 1-7, 9 или 11, в котором R_4 представляет собой Н или C_{1-2} -алкил.

17. Соединение по п.16, в котором R_5 представляет собой Н или C_{1-2} -алкил.

18. Соединение по любому из пп. 1-7, 9 или 11, в котором R_4 представляет собой Н и R_5 представляет собой метил или этил, или R_4 и R_5 представляют собой Н, или R_4 и R_5 представляют собой метил.

19. Соединение по п.16, в котором m представляет собой 1 или 2.

20. Соединение по п.18, в котором m представляет собой 1 или 2.

21. Соединение по любому из пп. 1-7, 9 или 12, в котором R_6 представляет собой Н или метил.

22. Соединение по любому из пп. 1-7 или 9, в котором R_7 представляет собой Н или метил.

23. Фармацевтическая композиция, которая содержит соединение формулы I по любому из пп. 1-22 или его фармацевтически приемлемую соль и один или несколько фармацевтически приемлемых наполнителей.

24. Применение соединения формулы I по одному из пп. 1-22 или его фармацевтически приемлемой соли для изготовления лекарственного препарата для лечения или предупреждения заболеваний, опосредованных H_4 -рецептором гистамина.

25. Применение по п.24, в котором заболевание, опосредованное H_4 -рецептором гистамина, представляет собой иммунологическое или воспалительное заболевание.