



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21), (22) Заявка: 2009110261/04, 21.08.2007

(30) Конвенционный приоритет:
23.08.2006 US 60/823,311
18.05.2007 US 60/938,776

(43) Дата публикации заявки: 27.09.2010 Бюл. № 27

(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную
фазу: 23.03.2009(86) Заявка РСТ:
GB 2007/003179 (21.08.2007)(87) Публикация РСТ:
WO 2008/023161 (28.02.2008)Адрес для переписки:
101000, Москва, М.Златоустинский пер., 10,
кв.15, "ЕВРОМАРКПАТ", пат.пов.
И.А.Веселицкой, рег. № 11

(71) Заявитель(и):

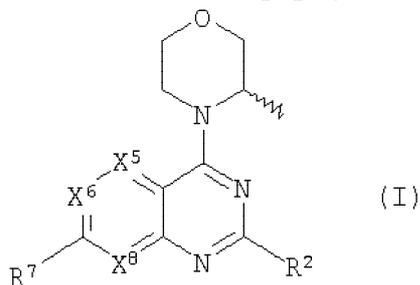
КУДОС ФАРМАСЬЮТИКЛЗ
ЛИМИТЕД (GB)

(72) Автор(ы):

ДАГГАН Хитер Мэри Эллен (GB),
ЛЕРУ Фредерик Жорж Мари (GB),
МАЛАГУ Карин (GB),
МАРТИН Нилл Морриссон Барр (GB),
МЕНИР Кейт Аллан (GB),
СМИТ Грейм Камерон Марри (GB)(54) ПРОИЗВОДНЫЕ 2-МЕТИЛМОРФОЛИН-, ПИРАЗО- И ПИРИМИДО-ПИРИМИДИНА В
КАЧЕСТВЕ ИНГИБИТОРОВ mTOR

(57) Формула изобретения

1. Соединение формулы I



или его фармацевтически приемлемая соль, где
один или два из X⁵, X⁶ и X⁸ представляет собой N, а остальные представляют собой
CH;

R⁷ выбирают из галогена, OR¹, SR^{S1}, NR^{N1}R^{N2}, NR^{N7a}C(O)R^{C1}, NR^{N7b}SO₂R^{S2a},
необязательно замещенной 5-20-членной гетероарильной группы, или необязательно
замещенной C₅₋₂₀арильной группы,

где R^{O1} и R^{S1} выбирают из H, необязательно замещенной C₅₋₂₀арильной группы,

необязательно замещенной 5-20-членной гетероарильной группы, или необязательно замещенной C₁₋₇алкильной группы; R^{N1} и R^{N2} независимо выбирают из H, необязательно замещенной C₁₋₇алкильной группы, необязательно замещенной 5-20-членной гетероарильной группы, необязательно замещенной C₅₋₂₀арильной группы или R^{N1} и R^{N2} вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют необязательно замещенное гетероциклическое кольцо, содержащее от 3 до 8 кольцевых атомов;

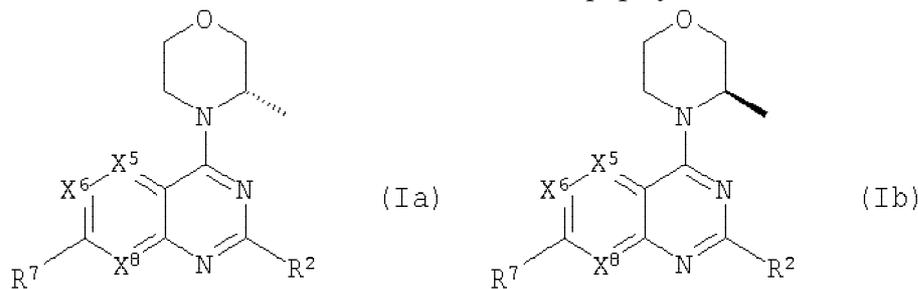
R^{C1} выбирают из H, необязательно замещенной C₅₋₂₀арильной группы, необязательно замещенной 5-20-членной гетероарильной группы, необязательно замещенной C₁₋₇алкильной группы или NR^{N8}R^{N9}, где R^{N8} и R^{N9} независимо выбирают из H, необязательно замещенной C₁₋₇алкильной группы, необязательно замещенной 5-20-членной гетероарильной группы, необязательно замещенной C₅₋₂₀арильной группы или R^{N8} и R^{N9} вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют необязательно замещенное гетероциклическое кольцо, содержащее от 3 до 8 кольцевых атомов;

R^{S2a} выбирают из H, необязательно замещенной C₅₋₂₀арильной группы, необязательно замещенной 5-20-членной гетероарильной группы, или необязательно замещенной C₁₋₇алкильной группы;

R^{N7a} и R^{N7b} выбирают из H и C₁₋₄алкильной группы;

R² выбирают из H, галогена, OR^{O2}, SR^{S2b}, NR^{N5}R^{N6}, необязательно замещенной 5-20-членной гетероарильной группы, и необязательно замещенной C₅₋₂₀арильной группы, где R^{O2} и R^{S2b} выбирают из H, необязательно замещенной C₅₋₂₀арильной группы, необязательно замещенной 5-20-членной гетероарильной группы, или необязательно замещенной C₁₋₇алкильной группы; R^{N5} и R^{N6} независимо выбирают из H, необязательно замещенной C₁₋₇алкильной группы, необязательно замещенной 5-20-членной гетероарильной группы, и необязательно замещенной C₅₋₂₀арильной группы, или R^{N5} и R^{N6} вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют необязательно замещенное гетероциклическое кольцо, содержащее от 3 до 8 кольцевых атомов.

2. Соединение по п.1, где соединение формулы I это соединение формулы Ia или Ib



или его фармацевтически приемлемая соль, где один или два из X⁵, X⁶ и X⁸ представляет собой N, а остальные представляют собой CH;

R⁷ выбирают из галогена, OR^{O1}, SR^{S1}, NR^{N1}R^{N2}, NR^{N7a}C(O)R^{C1}, NR^{N7b}SO₂R^{S2a}, необязательно замещенной 5-20-членной гетероарильной группы, или необязательно замещенной C₅₋₂₀арильной группы,

где R^{O1} и R^{S1} выбирают из H, необязательно замещенной C₅₋₂₀арильной группы, необязательно замещенной 5-20-членной гетероарильной группы, или необязательно замещенной C₁₋₇алкильной группы; R^{N1} и R^{N2} независимо выбирают из H, необязательно замещенной C₁₋₇алкильной группы, необязательно замещенной 5-20-

членной гетероарильной группы, необязательно замещенной C₅₋₂₀арильной группы или R^{N1} и R^{N2} вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют необязательно замещенное гетероциклическое кольцо, содержащее от 3 до 8 кольцевых атомов;

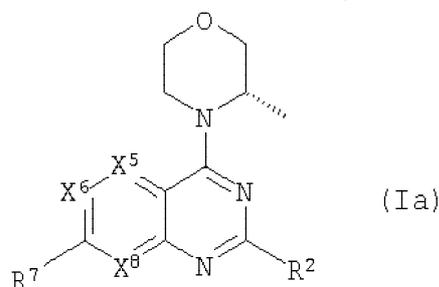
R^{O1} выбирают из H, необязательно замещенной C₅₋₂₀арильной группы, необязательно замещенной 5-20-членной гетероарильной группы, необязательно замещенной C₁₋₇алкильной группы или NR^{N8}R^{N9}, где R^{N8} и R^{N9} независимо выбирают из H, необязательно замещенной C₁₋₇алкильной группы, необязательно замещенной 5-20-членной гетероарильной группы, необязательно замещенной C₅₋₂₀арильной группы или R^{N8} и R^{N9} вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют необязательно замещенное гетероциклическое кольцо, содержащее от 3 до 8 кольцевых атомов;

R^{S2a} выбирают из H, необязательно замещенной C₅₋₂₀арильной группы, необязательно замещенной 5-20-членной гетероарильной группы, или необязательно замещенной C₁₋₇алкильной группы;

R^{N7a} и R^{N7b} выбирают из H и C₁₋₄алкильной группы;

R² выбирают из H, галогена, OR^{O2}, SR^{S2b}, NR^{N5}R^{N6}, необязательно замещенной 5-20-членной гетероарильной группы, и необязательно замещенной C₅₋₂₀арильной группы, где R^{O2} и R^{S2b} выбирают из H, необязательно замещенной C₅₋₂₀арильной группы, необязательно замещенной 5-20-членной гетероарильной группы, или необязательно замещенной C₁₋₇алкильной группы; R^{N5} и R^{N6} независимо выбирают из H, необязательно замещенной C₁₋₇алкильной группы, необязательно замещенной 5-20-членной гетероарильной группы, и необязательно замещенной C₅₋₂₀арильной группы, или R^{N5} и R^{N6} вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют необязательно замещенное гетероциклическое кольцо, содержащее от 3 до 8 кольцевых атомов.

3. Соединение по п.1, где соединение формулы I это соединение формулы Ia



или его фармацевтически приемлемая соль, где один или два из X⁵, X⁶ и X⁸ представляет собой N, а остальные представляют собой CH;

R⁷ выбирают из галогена, OR^{O1}, SR^{S1}, NR^{N1}R^{N2}, NR^{N7a}C(O)R^{C1}, NR^{N7b}SO₂R^{S2a}, необязательно замещенной 5-20-членной гетероарильной группы, или необязательно замещенной C₅₋₂₀арильной группы,

где R^{O1} и R^{S1} выбирают из H, необязательно замещенной C₅₋₂₀арильной группы, необязательно замещенной 5-20-членной гетероарильной группы, или необязательно замещенной C₁₋₇алкильной группы; R^{N1} и R^{N2} независимо выбирают из H, необязательно замещенной C₁₋₇алкильной группы, необязательно замещенной 5-20-членной гетероарильной группы, необязательно замещенной C₅₋₂₀арильной группы или R^{N1} и R^{N2} вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют необязательно замещенное гетероциклическое кольцо, содержащее от 3 до 8

кольцевых атомов;

R^{C1} выбирают из H, необязательно замещенной C_{5-20} арильной группы, необязательно замещенной 5-20-членной гетероарильной группы, необязательно замещенной C_{1-7} алкильной группы или $NR^{N8}R^{N9}$, где R^{N8} и R^{N9} независимо выбирают из H, необязательно замещенной C_{1-7} алкильной группы, необязательно замещенной 5-20-членной гетероарильной группы, необязательно замещенной C_{5-20} арильной группы или R^{N8} и R^{N9} вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют необязательно замещенное гетероциклическое кольцо, содержащее от 3 до 8 кольцевых атомов;

R^{S2a} выбирают из H, необязательно замещенной C_{5-20} арильной группы, необязательно замещенной 5-20-членной гетероарильной группы, или необязательно замещенной C_{1-7} алкильной группы;

R^{N7a} и R^{N7b} выбирают из H и C_{1-4} алкильной группы;

R^2 выбирают из H, галогена, OR^{O2} , SR^{S2b} , $NR^{N5}R^{N6}$, необязательно замещенной 5-20-членной гетероарильной группы, и необязательно замещенной C_{5-20} арильной группы, где R^{O2} и R^{S2b} выбирают из H, необязательно замещенной C_{5-20} арильной группы, необязательно замещенной 5-20-членной гетероарильной группы, или необязательно замещенной C_{1-7} алкильной группы; R^{N5} и R^{N6} независимо выбирают из H, необязательно замещенной C_{1-7} алкильной группы, необязательно замещенной 5-20-членной гетероарильной группы, и необязательно замещенной C_{5-20} арильной группы, или R^{N5} и R^{N6} вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют необязательно замещенное гетероциклическое кольцо, содержащее от 3 до 8 кольцевых атомов.

4. Соединение по п.3, где только один из X^5 , X^6 и X^8 представляет собой N.

5. Соединение по п.3, где X^6 представляет собой CH и X^5 и X^8 представляют собой N.

6. Соединение по п.4, где X^8 представляет собой N.

7. Соединение по п.6, где R^7 выбирают из необязательно замещенной C_{5-20} арильной группы, OR^{O1} , $NR^{N1}R^{N2}$, $NR^{N7a}C(O)R^{C1}$ и $NR^{N7b}SO_2R^{S2a}$

8. Соединение по п.6, где R^7 представляет собой необязательно замещенную фенильную или пиридинную группу.

9. Соединение по п.6, где R^7 представляет собой OR^{O1} и R^{O1} представляет собой C_{1-7} алкильную группу, которая может быть замещена.

10. Соединение по п.6, где R^7 представляет собой $NR^{N1}R^{N2}$ и R^{N2} представляет собой H.

11. Соединение в соответствии с пунктом 10, где R^{N1} представляет собой C_{3-7} циклоалкил.

12. Соединение в соответствии с пунктом 10, где R^{N1} представляет собой C_{5-6} арил.

13. Соединение по п.6, где R^7 представляет собой $NR^{N7a}C(O)R^{C1}$, и R^{N7a} предпочтительно представляет собой H.

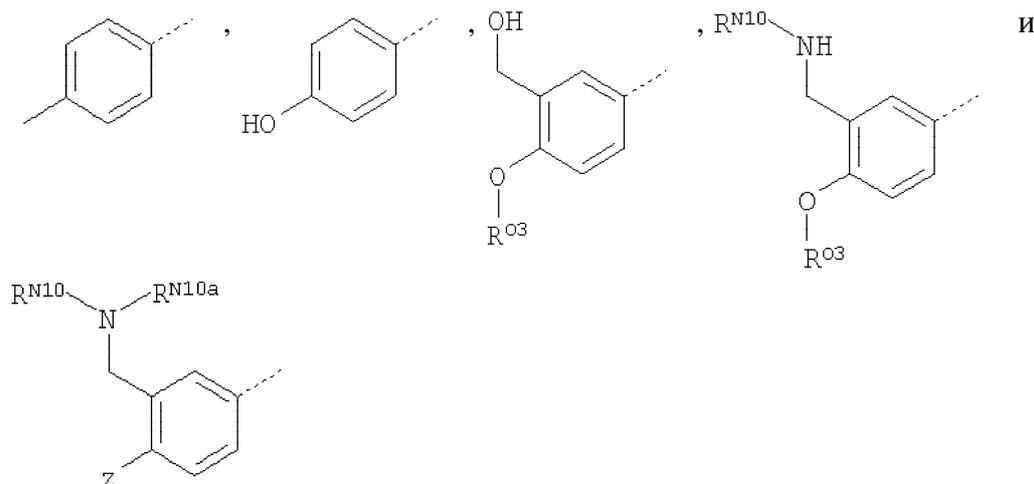
14. Соединение по п.13, где R^{C1} выбирают из необязательно замещенной C_{5-20} арильной группы, C_{3-20} гетероциклила, C_{1-7} алкила и $NR^{N8}R^{N9}$, где R^{N8} представляет собой водород и R^{N9} представляет собой C_{1-7} алкил.

15. Соединение по п.6, где R^7 представляет собой $NR^{N7b}SO_2R^{S2a}$ и R^{N7b} представляет собой H.

16. Соединение по п.15, где R^{S2a} представляет собой C_{1-7} алкил.

17. Соединение по п.8, где R^7 представляет собой необязательно замещенную фенильную группу, где необязательные заместители предпочтительно выбирают из галогена, гидроксила, циано, C_{1-7} алкила, C_{1-7} алкокси, сульфонамино (например $-NHS(=O)_2C_{1-7}$ алкил) amino (например $-NH_2$, C_{5-6} ариламино, C_{1-7} алкиламино, и ди- $(C_{1-7}$ алкил)амино), и амидо (например $-CONH_2$, $-CONHC_{1-7}$ алкил, $-COH(C_{1-7}$ алкил) $_2$ и $-CONH$ гетероцикл) и где замещающие алкильные, алкокси, или арильные группы необязательно могут быть дополнительно замещены одной или несколькими группами, выбранными из галогена, гидроксила, C_{1-7} алкила, C_{1-7} алкокси, C_{5-6} арила, $-NHS(=O)_2C_{1-7}$ алкила, C_{5-6} ариламино, ди- $(C_{1-7}$ алкил)амино и C_{1-7} алкиламино.

18. Соединение по п.8, где R^7 представляет собой необязательно замещенную фенильную группу, выбранную из



где Z представляет собой H, F или OR^{O3} ;

R^{O3} выбирают из водорода или необязательно замещенной C_{1-6} алкильной группы;

R^{N10} выбирают из водорода, $C(O)R^{C2}$, $C(S)R^{C3}$, SO_2R^{S3} , необязательно замещенной C_{5-20} гетероциклической группы, необязательно замещенной C_{5-20} арильной группы, или необязательно замещенной C_{1-10} алкильной группы, где R^{C2} и R^{C3} выбирают из H, необязательно замещенной C_{5-20} арильной группы, необязательно замещенной C_{5-20} гетероциклической группы, необязательно замещенной C_{1-7} алкильной группы или $NR^{N11}R^{N12}$, где R^{N11} и R^{N12} независимо выбирают из H, необязательно замещенной C_{1-7} алкильной группы, необязательно замещенной C_{5-20} гетероциклической группы, необязательно замещенной C_{5-20} арильной группы или R^{N11} и R^{N12} вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют гетероциклическое кольцо, содержащее от 3 до 8 кольцевых атомов; и R^{S3} выбирают из H, необязательно замещенной C_{5-20} арильной группы, необязательно замещенной C_{5-20} гетероарильной группы, или необязательно замещенной C_{1-7} алкильной группы;

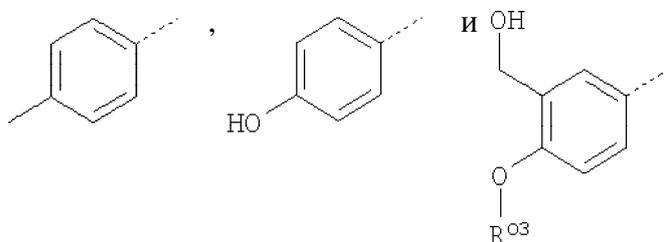
R^{N10a} выбирают из водорода или необязательно замещенной C_{1-10} алкильной группы; или

R^{N10} и R^{N10a} вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют необязательно замещенное гетероциклическое кольцо, содержащее от 3 до 8 кольцевых атомов.

19. Соединение по п.8, где R^7 представляет собой необязательно замещенную фенильную группу, выбранную из

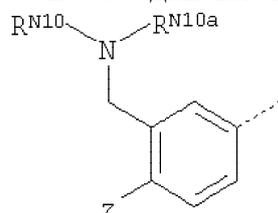
RU 2009110261 A

RU 2009110261 A



где R^{O3} выбирают из водорода или необязательно замещенной C_{1-6} алкильной группы.

20. Соединение по п.8, где R^7 представляет собой



где Z представляет собой H, F или OR^{O3} ;

R^{N10} выбирают из водорода,-

$C(O)CH_3$, $-C(O)CH_2OH$, $-CH_3$, $-CH_2CH_3$, $-CH_2CH_2OH$, $-CH(CH_3)_2$, $-CH_2CH_2OMe$, $-CH_2C(CH_3)_2$, $-CH_2CH_2C(CH_3)_2$, $-CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_2$, $-CH_2CH_2CH_2N(CH_3)_2$, циклопроила, циклопентила, циклогексила, циклогептила, $-CH_2$ циклопропила, метилциклогексила, цианоциклогексила, пиразолила, гидроксипирролидинила, $-CH_2$ имидазола;

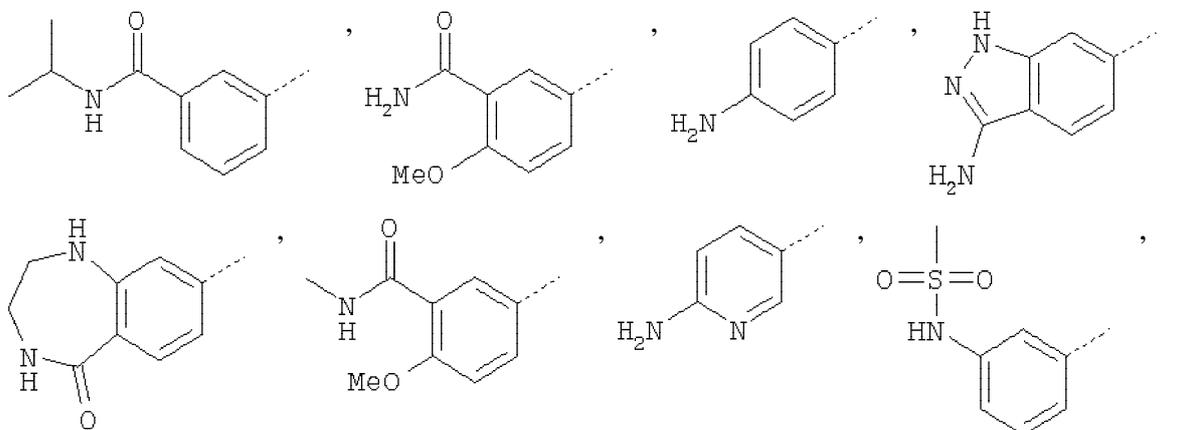
R^{N10a} представляет собой водород; или

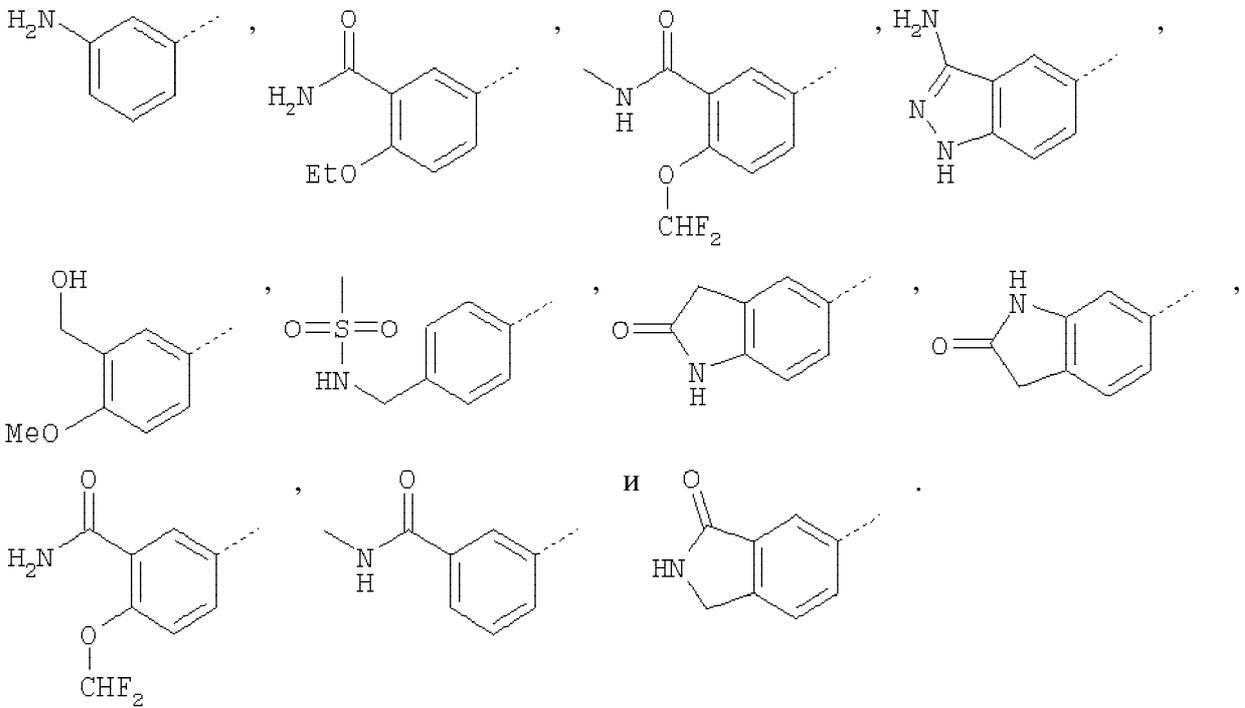
R^{N10} и R^{N10a} вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют необязательно замещенное гетероциклическое кольцо, содержащее 5 или 6 кольцевых атомов;

и где необязательные заместители выбирают из галогена, гидроксила, C_{1-7} алкилокси.

21. Соединение по п.8, где R^7 представляет собой необязательно замещенную фенильную группу, где необязательные заместители выбирают из фтора, гидроксила, циано, нитро, метила, метокси, $-OCH_2CH_3$, $-NH_2$, $-NHSO_2CH_3$, $-CH_2NHSO_2CH_3$, $-OCHF_2$, $-CH_2OH$, $-CO_2H-CONH_2$, $-CONHMe$, $-CONHEt$, $-CONHCH(CH_3)_2$, $-CONHCH_2CH_2F$, $-CONHCH_2CHF_2$, $-CONHCH_2CH_2OH$, $-CONMeEt$, $-CONMe_2$, N-метилпиперазинилкарбонила и 4-гидроксипиперидинилкарбонила

22. Соединение по п.7, где R^7 выбирают из

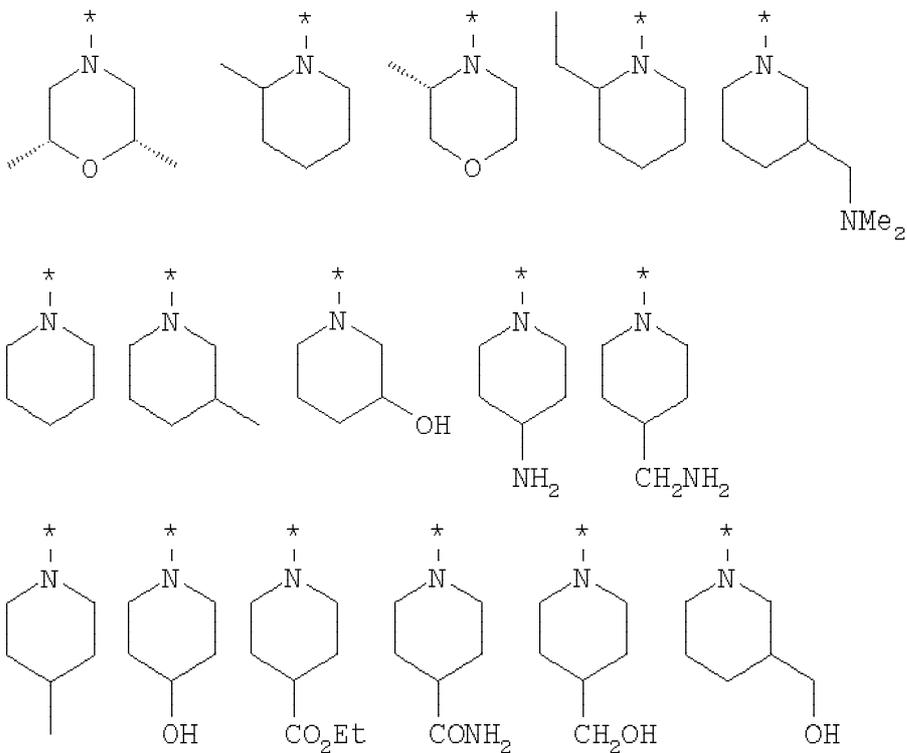


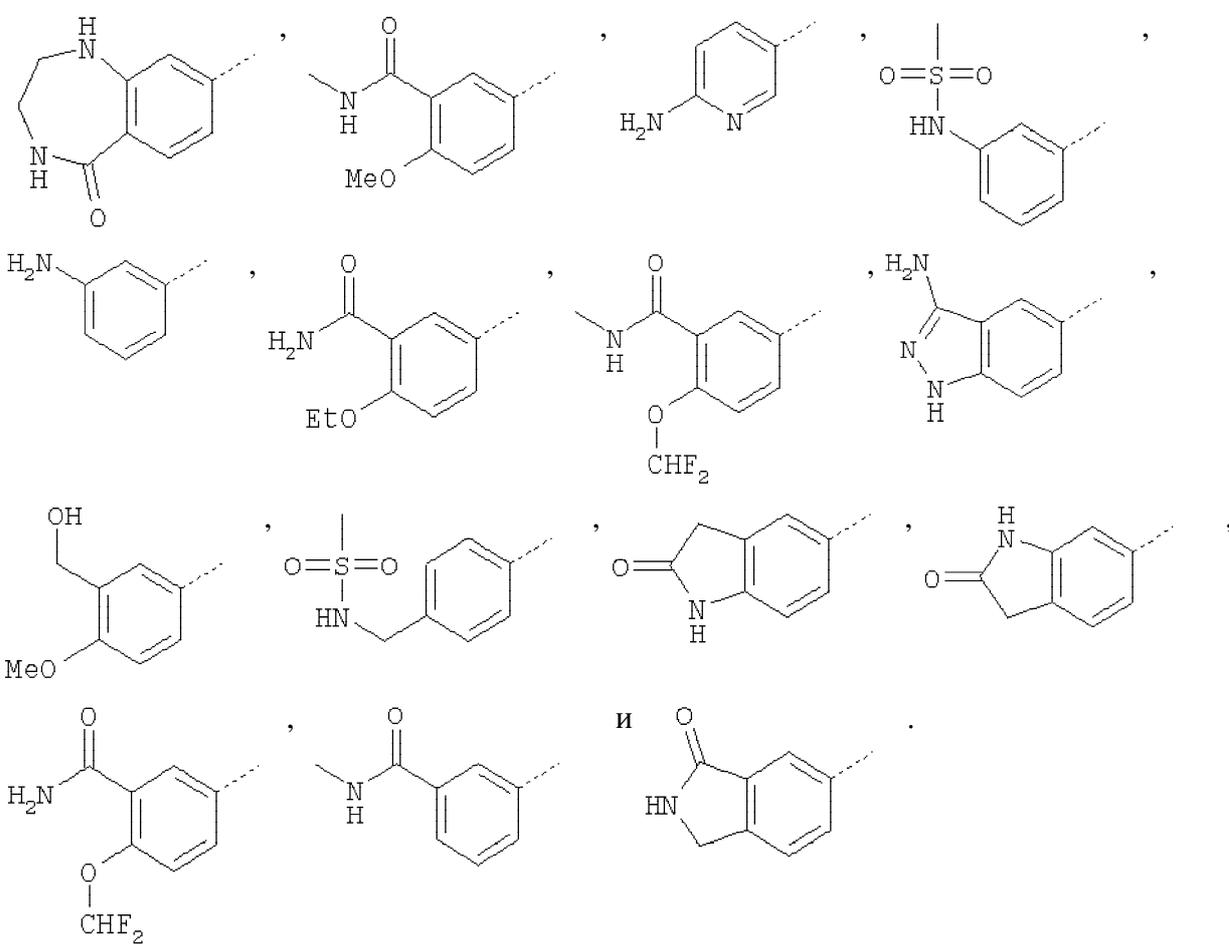


23. Соединение по п.6, где R^2 представляет собой $NR^{N5}R^{N6}$, где R^{N5} и R^{N6} вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют гетероциклическое кольцо, содержащее от 3 до 8 кольцевых атомов, которое может быть необязательно замещено.

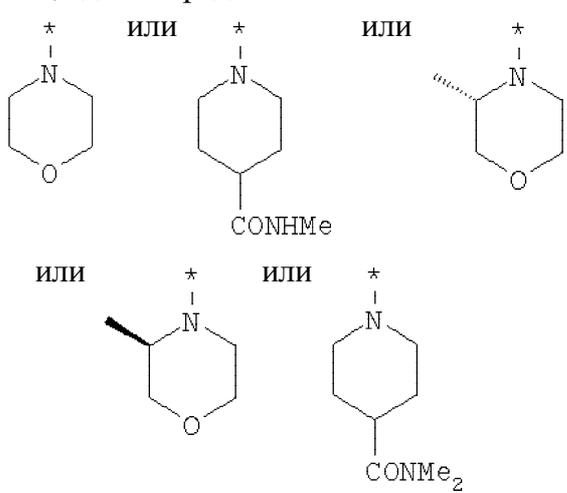
24. Соединение по п.23, где R^2 выбирают из морфолино, тиоморфолино, пиперадина, пиперазина, гомопиперазина и пирролидина.

25. Соединение по п.23, где R^2 , где R^2 представляет собой





и, где R² представляет собой



28. Соединение по п.1, выбранное из любого соединения из Примеров.
29. Соединение по п.1, выбранное из любого соединения из Примеров 1bu, 1ce, 12b, 18de, 18dg, 18j, 1ar, 19e, 19h, 19i, 19l, 19m, 19n, 19o, 18n, 18o, 18z, 18aa, 18ag, 18ai, 18al, 1v, 18az, 1ah, 7e, 7i, 7j, 5d, 5f, 4v, 4ab, 4aj, 5t, 5u, 5w, 5x, 5y, 5z, 3f, 3g, 18bp, 18bs, 18bv, 18by, 18cb, 18cv, 1aw, 3u, 1bf, 18ct, 19q, 19s, 19u, 19v, 19w, 1au, 5r, 4t, 18dj, 1cl, 2d, 2e, 1cs, 2h, 2j, 1cw, 1bo, 1bp, 1j, 1bx, 1by, 1cf, 1ci, 1cj, 4an, 4ap, 4av, 12d, 18dh, 18di, 6a, 1n, 1p, 1q, 18e, 18h, 19b, 19c, 19f, 19k, 18p, 1bd, 18w, 18ab, 18af, 18aj, 18aq, 18as, 18av, 18ay, 18bb, 18bc, 18bf, 18bl, 1ab, 4p, 9a, 1av, 3a, 5b, 5c, 5e, 5g, 4aa, 4ad, 4ah, 5v, 3e, 18bq, 18bt, 18bz, 18ca, 18cd, 18cg, 18ci, 18bx, 5n, 1am, 1ao, 18cn, 18cx, 1bk, 13b, 4g, 5s, 4q, 18dd, 1cp, 1cq, 2f, 2g, 13g, 1cv, 1ct, 1b, 1a, 1c, 1d, 1bl, 1bm, 1f, 1i, 1g, 1h, 1br, 1bs, 1bv, 1e, 1bz, 1cc, 1k, 1cg, 1l, 4al, 4am, 4ao, 4aq, 4as, 4at, 4au, 4aw, 4ax, 4ay, 4az, 4ba, 4bb, 4bc, 4bd, 4be, 4bf, 12c, 12a, 18a, 1as, 1s, 18c, 18d, 18f, 18g, 18i, 18k, 19j, 18m, 18q, 18r, 18s, 18t, 18u, 18v, 18x, 18y, 18ac, 18ad, 18ae, 18ah, 18ak, 18am, 18an, 18ap, 18ar, 18au, 18aw, 18ax,

18ba, 18bd, 18be, 18bg, 18bi, 18bk, 18bh, 18bj, 18bm, 1bg, 8b, 4h, 1ba, 8a, 1aa, 1ac, 1ae, 1af, 1ag, 14b, 1bc, 4i, 4j, 4k, 4l, 4m, 4n, 4o, 18bn, 18bo, 4u, 1bb, 1at, 7b, 7c, 7d, 7f, 7g, 7k, 5a, 4w, 4x, 4y, 4z, 4ac, 4af, 4ai, 18br, 18bw, 18cc, 18cf, 18ch, 18cj, 18ck, 18d, 4ak, 18cm, 4a, 3i, 3y, 1ak, 1al, 1ap, 1be, 18co, 18cr, 18cs, 18db, 19p, 3l, 1u, 4b, 5q, 4c, 4e, 4f, 4d, 1az, 4r, 4s, 1cn, 1co, 3ad, 1cr, 1ew, 1cy, 1dv, 15c, 1cl, 1cm, 1cn, 1cq, 1ev, 1ex, 1di, 1dj, 1eb, 1ej, 1ck, 1et, 1eu, 1cz, 1db, 1dc, 1dd, 1de, 1dg, 1dh, 1dk, 1dl, 1dm, 1dn, 1do, 1dp, 1dq, 1dt, 1du, 1dw, 1dy, 1dz, 1ea, 1ee, 1ed, 1ee, 18dm, 18dn и 18do.

30. Соединение по п.1, выбранное из любого соединения из Примеров 1bo, 1bp, 1j, 1bx, 1by, 1cf, 1ei, 1ej, 4an, 4ap, 4av, 12d, 18dh, 18di, 6a, 1n, 1p, 1q, 18e, 18h, 19b, 19c, 19f, 19k, 18p, 1bd, 18w, 18ab, 18af, 18aj, 18aq, 18as, 18av, 18ay, 18bb, 18bc, 18bf, 18bl, 1ab, 4p, 9a, 1av, 3a, 5b, 5c, 5e, 5g, 4aa, 4ad, 4ah, 5v, 3e, 18bq, 18bt, 18bz, 18ca, 18cd, 18cg, 18ci, 18bx, 5n, 1am, 1ao, 18cn, 18cx, 1bk, 13b, 4g, 5s, 4q, 18dd, 1cp, 1cq, 2f, 2g, 13g, 1ev, 1et, 1b, 1a, 1c, 1d, 1bl, 1bm, 1f, 1i, 1g, 1h, 1br, 1bs, 1bv, 1e, 1bz, 1cc, 1k, 1cg, 1l, 4al, 4am, 4ao, 4aq, 4as, 4at, 4au, 4aw, 4ax, 4ay, 4az, 4ba, 4bb, 4bc, 4bd, 4be, 4bf, 12c, 12a, 18a, 1as, 1s, 18c, 18d, 18f, 18g, 18i, 18k, 19j, 18m, 18q, 18r, 18s, 18t, 18u, 18v, 18x, 18y, 18ac, 18ad, 18ae, 18ah, 18ak, 18am, 18an, 18ap, 18ar, 18au, 18aw, 18ax, 18ba, 18bd, 18be, 18bg, 18bi, 18bk, 18bh, 18bj, 18bm, 1bg, 8b, 4h, 1ba, 8a, 1aa, 1ac, 1ae, 1af, 1ag, 14b, 1bc, 4i, 4j, 4k, 4l, 4m, 4n, 4o, 18bn, 18bo, 4u, 1bb, 1at, 7b, 7c, 7d, 7f, 7g, 7k, 5a, 4w, 4x, 4y, 4z, 4ac, 4af, 4ai, 18br, 18bw, 18cc, 18cf, 18ch, 18cj, 18ck, 18cl, 4ak, 18cm, 4a, 3i, 3y, 1ak, 1al, 1ap, 1be, 18co, 18cr, 18cs, 18db, 19p, 3l, 1u, 4b, 5q, 4c, 4e, 4f, 4d, 1az, 4r, 4s, 1cn, 1co, 3ad, 1d, 1cm, 1cn, 1cq, 1cv, 1cx, 1di, 1dj, 1eb, 1cj, 1ck, 1ct, 1cu, 1cz, 1db, 1dc, 1dd, 1de, 1dg, 1dh, 1dk, 1dl, 1dm, 1dn, 1do, 1dp, 1dq, 1dt, 1du, 1dw, 1dy, 1dz, 1ea, 1ec, 1ed, 1ee, 18dm, 18dn и 18do.

31. Соединение по п.1, выбранное из любого соединения из Примеров 1b, 1a, 1c, 1d, 1bl, 1bm, 1f, 1i, 1g, 1h, 1br, 1bs, 1bv, 1e, 1bz, 1cc, 1k, 1cg, 1l, 4al, 4am, 4ao, 4aq, 4as, 4at, 4au, 4aw, 4ax, 4ay, 4az, 4ba, 4bb, 4bc, 4bd, 4be, 4bf, 12c, 12a, 18a, 1as, 1s, 18c, 18d, 18f, 18g, 18i, 18k, 19j, 18m, 18q, 18r, 18s, 18t, 18u, 18v, 18x, 18y, 18ac, 18ad, 18ae, 18ah, 18ak, 18am, 18an, 18ap, 18ar, 18au, 18aw, 18ax, 18ba, 18bd, 18be, 18bg, 18bi, 18bk, 18bh, 18bj, 18bm, 1bg, 8b, 4h, 1ba, 8a, 1aa, 1ac, 1ae, 1af, 1ag, 14b, 1bc, 4i, 4j, 4k, 4l, 4m, 4n, 4o, 18bn, 18bo, 4u, 1bb, 1at, 7b, 7c, 7d, 1f, 7g, 7k, 5a, 4w, 4x, 4y, 4z, 4ac, 4af, 4ai, 18br, 18bw, 18cc, 18cf, 18ch, 18cj, 18ck, 18cl, 4ak, 18cm, 4a, 3i, 3y, 1ak, 1al, 1ap, 1be, 18co, 18cr, 18cs, 18db, 19p, 3l, 1u, 4b, 5q, 4c, 4e, 4f, 4d, 1az, 4r, 4s, 1cn, 1co, 3ad, 1cj, 1ck, 1ct, 1cu, 1cz, 1db, 1dc, 1dd, 1de, 1dg, 1dh, 1dk, 1dl, 1dm, 1dn, 1do, 1dp, 1dq, 1dt, 1du, 1dw, 1dy, 1dz, 1ea, 1ec, 1ed, 1ee, 18dm, 18dn и 18do.

32. Соединение по п.1, выбранное из любого соединения из Примеров 1a, 1u, 1al, 1ap, 1at, 1az, 1co, 1de, 1dg, 1dh, 1dk, 1dl, 1dp, 1dq, 1dr, 1ds, 1dt, 1du, 1dy, 1ec, 1ee, 12d, 14b, или 18do.

33. Фармацевтическая композиция, которая содержит соединение по любому из пп.1-32, и фармацевтически приемлемый носитель или разбавитель.

34. Соединение по п.1, или его фармацевтически приемлемая соль, для применения в качестве лекарственного средства.

35. Применение соединения по любому из пп.1-32 или его фармацевтически приемлемой соли, для приготовления лекарственного средства для применения для получения ингибирующего действия по отношению к mTOR у теплокровного животного, такого как человек.

36. Применение соединения по любому из пп.1-32 или его фармацевтически приемлемой соли, для приготовления лекарственного средства для применения для получения противоракового действия у теплокровного животного, такого как человек.

37. Способ получения ингибирующего действия по отношению к mTOR у теплокровного животного, такого как человек, нуждающегося в таком лечении, который включает введение указанному животному эффективного количества

соединения по любому из пп.1-32 или его фармацевтически приемлемой соли.

38. Способ получения противоракового действия у теплокровного животного, такого как человек, нуждающегося в таком лечении, который включает введение указанному животному эффективного количества соединения по любому из пп.1-32 или его фармацевтически приемлемой соли.

RU 2009110261 A

RU 2009110261 A