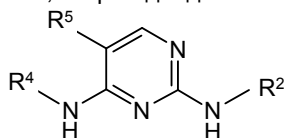


1. 2,4-Піримідиндіамінова сполука структурної формули (I):



і її солі, гідрати, сольвати, N-оксиди і проліки, де:

R^2 вибраний із групи, що складається з фенілу, монозаміщеного в 3- або 5-положенні групою R^8 , фенілу, ди- або тризаміщеного однією або більше однаковими або різними групами R^8 , і 5-15-членного гетероарилу, можливо заміщеного однією або більше однаковими або різними групами R^8 ;

R^4 вибраний із групи, що складається з фенілу, заміщеного однією або більше однаковими або різними групами R^8 , і 5-15-членного гетероарилу, можливо заміщеного однією або більше однаковими або різними групами R^8 , R^5 вибраний із групи, що складається з -CN, -NC, фтору, (C1-C3)галогеноалкілу, (C1-C3)пергалогеноалкілу, (C1-C3)фторалкілу, (C1-C3)перфторалкілу, -CF₃, (C1-C3)галогеноалкокси, (C1-C3)пергалогеноалкокси, (C1-C3)фторалкокси, (C1-C3)перфторалкокси, -OCF₃, -C(O)R^a, -C(O)OR^a, -C(O)CF₃ і -C(O)OCF₃;

R^8 вибраний із групи, що складається з R^a , R^b , R^c , заміщеного одним або більше однаковими або різними R^a або R^b , -OR^a, заміщеного одним або більше однаковими або різними R^a або R^b , -B(OR^a)₂, -B(NR^cR^c)₂, -(CH₂)_m-R^b, -(CHR^a)_m-R^b, -O-(CH₂)_m-R^b, -S-(CH₂)_m-R^b, -O-CH(R^a)R^b, -O-CR^a(R^b)₂, -O-(CHR^a)_m-R^b, -O-(CH₂)_m-CH[(CH₂)_mR^b]R^b, -S-(CHR^a)_m-R^b, -C(O)NH-(CH₂)_m-R^b, -C(O)NH-(CHR^a)_m-R^b, -O-(CH₂)_m-C(O)NH-(CH₂)_m-R^b, -S-(CH₂)_m-C(O)NH-(CH₂)_m-R^b, -O-(CHR^a)_m-C(O)NH-(CHR^a)_m-R^b, -S-(CHR^a)_m-C(O)NH-(CHR^a)_m-R^b, -NH-(CH₂)_m-R^b, -NH-(CHR^a)_m-R^b, -NH[(CH₂)_mR^b], -N[(CH₂)_mR^b]₂, -NH-C(O)-NH-(CH₂)_m-R^b, -NH-C(O)-(CH₂)_m-CH(R^b)R^b і -NH-(CH₂)_m-C(O)-NH-(CH₂)_m-R^b;

кожний R^a незалежно вибраний із групи, що складається з водню, (C1-C6)алкілу, (C3-C8)циклоалкілу, циклогексилу, (C4-C11)циклоалкілалкілу, (C5-C10)арилу, фенілу, (C6-C16)арилалкілу, бензилу, 2-6-членного гетероалкілу, 3-8-членного циклогетероалкілу, морфолінілу, піперазинілу, гомопіперазинілу, піперидинілу, 4-11-членного циклогетероалкілалкілу, 5-10-членного гетероарилу і 6-16-членного гетероарилалкілу;

кожний R^b являє собою придатну групу, незалежно вибрану з групи, що складається з =O, -OR^d, (C1-C3)галогеноалкілокси, -OCF₃, =S, -SR^d, =NR^d, =NOR^d, -NR^cR^c, галогену, -CF₃, -CN, -NC, -OCN, -SCN, -NO, -NO₂, =N₂, -N₃, -S(O)R^d, -S(O)₂R^d, -S(O)₂OR^d, -S(O)NR^cR^c, -S(O)₂NR^cR^c, -OS(O)R^d, -OS(O)₂R^d, -OS(O)₂OR^d, -OS(O)₂NR^cR^c, -C(O)R^d, -C(O)OR^d, -C(O)NR^cR^c, -C(NH)NR^cR^c, -C(NR^a)NR^cR^c, -C(NOH)R^a, -C(NOH)NR^cR^c, -OC(O)R^d, -OC(O)OR^d, -OC(O)NR^cR^c, -OC(NH)NR^cR^c, -OC(NR^a)NR^cR^c, -[NHC(O)]_nR^d, -[NRa(O)]_nR^d, -[NHC(O)]_nOR^d, -[NRa(O)]_nOR^d, -[NHC(O)]_nNR^cR^c, -[NRa(O)]_nNR^cR^c, -[NHC(NH)]_nNR^cR^c і -[NRa(NR^a)]_nNR^cR^c;

кожний R^c незалежно являє собою захисну або групу R^a або, альтернативно, два R^c разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, утворюють 5-8-членний циклогетероалкіл або гетероарил, що може включати один або більше однакових або різних додаткових гетероатомів і який може бути заміщений однією або більше однаковими або різними групами R^a ;

кожний R^d незалежно являє собою захисну або групу R^a ;

кожний R^e незалежно вибраний із групи, що складається з (C1-C6)алкілу, (C3-C8)циклоалкілу, циклогексилу, (C4-C11)циклоалкілалкілу, (C5-C10)арилу, фенілу, (C6-C16)арилалкілу, бензилу, 2-6-членного гетероалкілу, 3-8-членного циклогетероалкілу, морфолінілу, піперазинілу, гомопіперазинілу, піперидинілу, 4-11-членного циклогетероалкілалкілу, 5-10-членного гетероарилу і 6-16-членного гетероарилалкілу;

кожний m незалежно являє собою ціле число від 1 до 3; і

кожний n незалежно являє собою ціле число від 0 до 3, за умови, що:

(1) коли R^2 являє собою заміщений феніл, то R^5 не є ціано;

(2) коли R^2 і R^4 кожний незалежно являють собою заміщений або незаміщений пірол або індол, то R^2 і R^4 приєднані до молекули, що залишилася, через кільцевий атом кільця; і

(3) сполука не є

N2,N4-біс(3-метилфеніл)-5-фтор-2,4-піримідиндіаміном (R092788);

N2,N4-біс(3-хлорфеніл)-5-фтор-2,4-піримідиндіаміном (R067962);

N2,N4-біс(2,5-диметилфеніл)-5-фтор-2,4-піримідиндіаміном (R067963);

N2,N4-біс(3,4-диметилфеніл)-5-фтор-2,4-піримідиндіаміном (R067964);

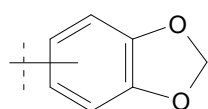
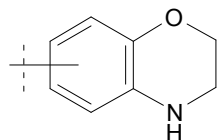
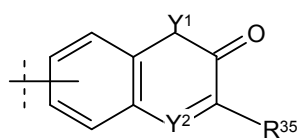
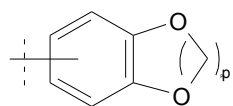
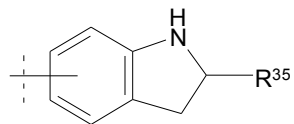
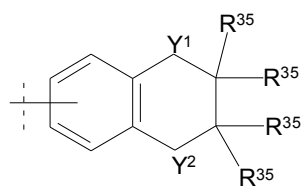
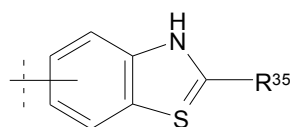
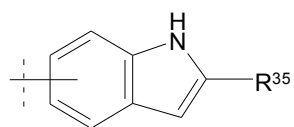
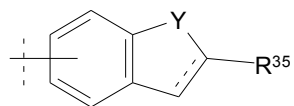
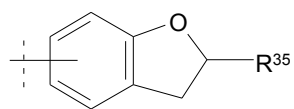
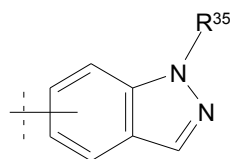
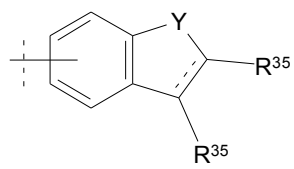
N2,N4-біс(2,4-диметилфеніл)-5-фтор-2,4-піримідиндіаміном (R070791);

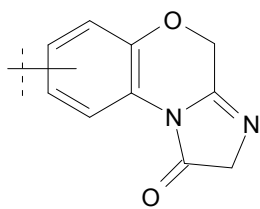
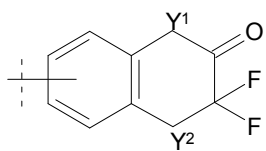
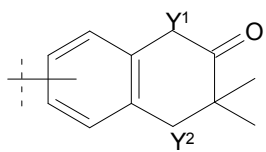
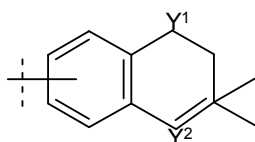
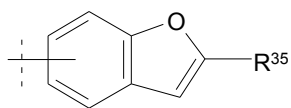
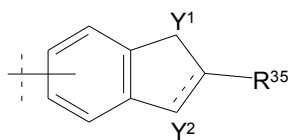
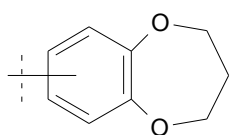
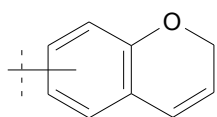
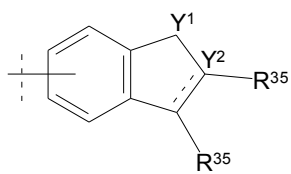
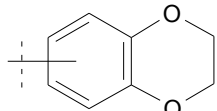
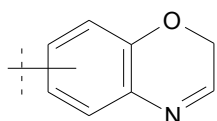
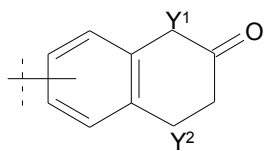
N2,N4-біс(3-бромфеніл)-5-фтор-2,4-піримідиндіаміном (R008958); або

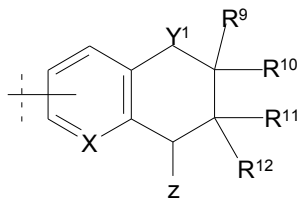
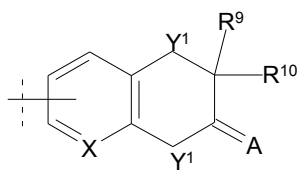
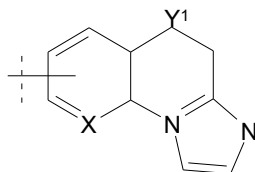
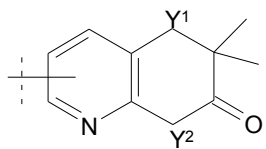
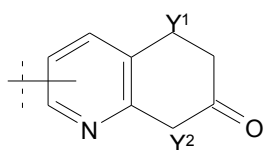
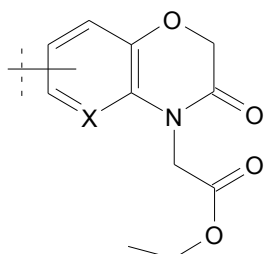
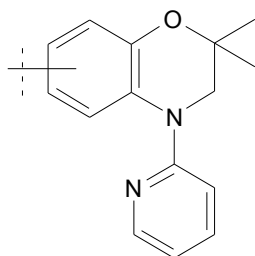
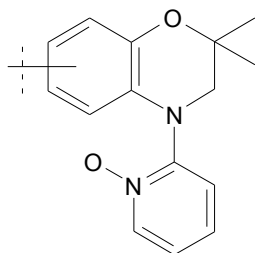
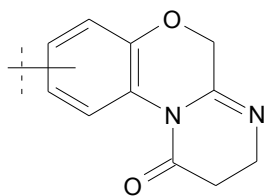
N2,N4-біс(3-хлор-4-метоксифеніл)-5-фтор-2,4-піримідиндіаміном.

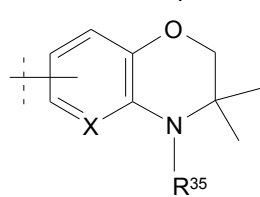
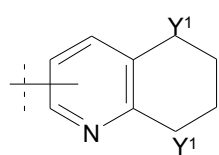
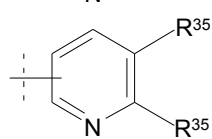
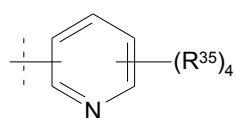
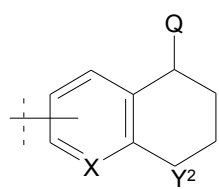
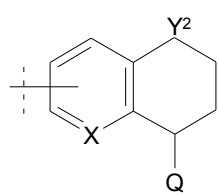
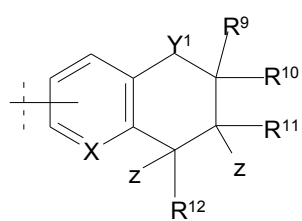
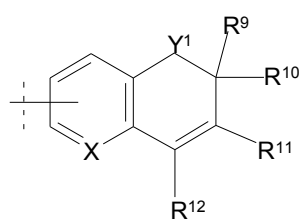
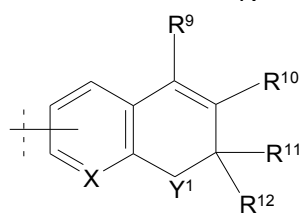
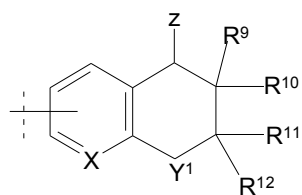
2. Сполука за п. 1, де R^2 вибраний із групи, що складається з 5-10-членного гетероарилу, бензодіоксанілу, 1,4-бензодіоксан-(5 або 6)-ілу, бензодіоксолілу, 1,3-бензодіоксол-(4 або 5)-ілу, бензоксазинілу, 1,4-бензоксазин-(5,6,7 або 8)-ілу, бензоксазолілу, 1,3-бензоксазол-(4,5,6 або 7)ілу, бензопіранілу, бензопіран-(5,6,7 або 8)-ілу, бензотриазолілу, бензотриазол-(4,5,6 або 7)-ілу, 1,4-бензоксазиніл-2-ону, 1,4-бензоксазин-(5,6,7 або 8)-іл-2-ону, 2H-1,4-бензоксазиніл-3(4H)-ону, 2H-1,4-бензоксазин-(5,6,7 або 8)-іл-3(4H)-ону, 2H-1,3-бензоксазиніл-2,4(3H)-діону, 2H-1,3-бензоксазин-(5,6,7 або 8)-іл-2,4(3H)-діону, бензоксазоліл-2-ону, бензоксазол-(4,5,6 або 7)-іл-2-ону, дигідрокумаринілу, дигідрокумарин-(5,6,7 або 8)-ілу, 1,2-бензопіронілу, 1,2-бензопірон-(5,6,7 або 8)-ілу, бензофуранілу, бензофуран-(4,5,6 або 7)-ілу, бензо[b]фуранілу, бензо[b]фуран-(4,5,6 або 7)-ілу, індолілу, індол-(4,5,6 або 7)-ілу, піролілу і пірол-(1 або 2)-іолу, кожний з яких може бути заміщений однією або більше однаковими або різними групами R^8 , де R^8 такий, як визначено в п. 1.

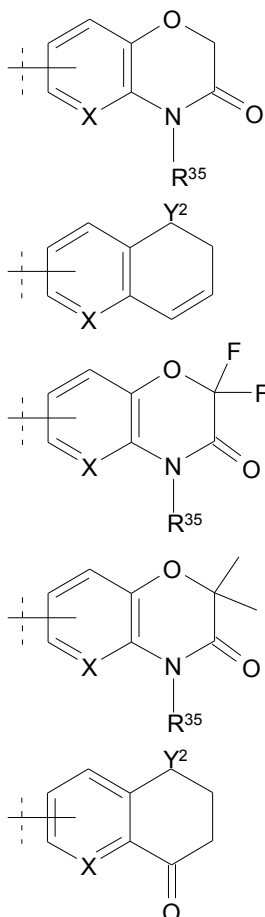
3. Сполука за п. 1, де один або обидва з R^2 і R^4 незалежно один від одного являють собою гетероарил, вибраний із групи, що складається з:











де:

r являє собою ціле число від одного до трьох;

кожне $--$ незалежно являє собою простий зв'язок або подвійний зв'язок;

R^{35} являє собою водень або R^8 , де R^8 такий, як визначено в п. 1;

X вибраний із групи, що складається з CH , N і $N-O$;

кожен Y незалежно вибраний із групи, що складається з O , S і NH ;

кожен Y^1 незалежно вибраний із групи, що складається з O , S , SO , SO_2 , $SONR^{36}$, NH і NR^{37} ;

кожен Y^2 незалежно вибраний із групи, що складається з CH , CH_2 , O , S , N , NH і NR^{37} ;

R^{36} являє собою водень або алкіл;

R^{37} вибраний із групи, що складається з водню і прогруппи;

R^{38} вибраний із групи, що складається з алкілу й арилу;

A вибраний із групи, що складається з O , NH і NR^{38} ;

R^9 , R^{10} , R^{11} і R^{12} кожний, незалежно один від одного, вибраний із групи, що складається з алкілу, алкокси, галогену, галогеноалкокси, аміноалкілу і гідроксипалкілу або, альтернативно, R^9 і R^{10} або R^{11} і R^{12} , або R^9 і R^{10} і R^{11} і R^{12} разом утворюють оксогруппу;

кожний Z вибраний із групи, що складається з гідроксиду, алкокси, арилокси, складного ефіру і карбамату;

Q вибраний із групи, що складається з $-OH$, $-OR^a$, $-NR^cR^c$, $-NHR^{39}-C(O)R^a$, $-NHR^{39}-C(O)OR^a$, $-NR^{39}-CHR^{40}-R^b$, $-NR^{39}-(CH_2)_m-R^b$ і $-NR^{39}-C(O)-CHR^{40}-NR^cR^c$;

R^{39} і R^{40} кожний, незалежно один від одного, вибраний із групи, що складається з водню, алкілу, арилу,

алкілурилу, арилалкілу і NHR^8 ; і

R^a , R^b і R^c такі, як визначено в п. 1.

4. Сполука за п. 3, де R^2 і R^4 однакові.

5. Сполука за п. 3, де кожний R^{35} незалежно вибраний із групи, що складається з водню, R^d , $-NR^cR^c$, $-(CH_2)_m-NR^cR^c$, $-C(O)NR^cR^c$, $-(CH_2)_m-C(O)NR^cR^c$, $-C(O)OR^d$, $-(CH_2)_m-C(O)OR^d$ і $-(CH_2)_m-OR^d$, де m , R^c і R^d такі, як визначено в п. 1.

6. Сполука за п. 5, де кожний m являє собою одиницю.

7. Сполука за п. 1, де R^2 являє собою можливо заміщений гетероарил, приєднаний до частини молекули, що залишилася, через кільцевий атом вуглецю.

8. Сполука за п. 1, де R^4 являє собою можливо заміщений гетероарил, приєднаний до частини молекули, що залишилася, через кільцевий атом вуглецю.

9. Сполука за п. 1, де один або обое R^2 і R^4 незалежно один від одного являють собою феніл, заміщений однією, двома або трьома групами R^8 , де R^8 такий, як визначено в п. 1.

10. Сполука за п. 9, де кожний з R^2 і R^4 являє собою однакові або різні заміщені феніли.

11. Сполука за п. 9, де феніл є монозаміщеним.

12. Сполука за п. 11, де феніл R^4 заміщений в орто-, мета- або пара-положенні.

13. Сполука за п. 12, де R^8 вибраний із групи, що складається з (C1-C10)алкілу, (C1-C10)розгалуженого алкілу, $-OR^d$, $-O-(CH_2)_m-NR^cR^c$, $-O-C(O)NR^cR^c$, $-O-(CH_2)_m-C(O)NR^cR^c$, $-O-C(O)OR^a$, $-O-(CH_2)_m-C(O)OR^a$, $-O-C(NH)NR^cR^c$, $-O-(CH_2)_m-C(NH)NR^cR^c$, $-NH-(CH_2)_m-NR^cR^c$, $-NH-C(O)NR^cR^c$ і $-NH-(CH_2)_m-C(O)NR^cR^c$, де m , R^a , R^c і R^d такі, як визначено в п. 1.

14. Сполука за п. 9, де феніл є дизаміщеним.

15. Сполука за п. 14, де замісники R^8 знаходяться в позиціях 2,3-; 2,4-; 2,5-; 2,6-; 3,4- або 3,5-.

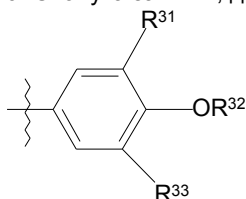
16. Сполука за п. 14, де кожний R^8 незалежно вибраний із групи, що складається з (C1-C10)алкілу, (C1-C10)розгалуженого алкілу, $-OR^a$, можливо заміщеного однією або більше однаковими або різними групами R^a або R^b , $-O-(CH_2)_m-NR^cR^c$, $-O-C(O)NR^cR^c$, $-O-(CH_2)_m-C(O)NR^cR^c$, $-O-C(O)OR^a$, $-O-(CH_2)_m-C(O)OR^a$, $-O-C(NH)NR^cR^c$, $-O-(CH_2)_m-C(NH)NR^cR^c$, $-NH-(CH_2)_m-NR^cR^c$, $-NH-C(O)NR^cR^c$ і $-NH-(CH_2)_m-C(O)NR^cR^c$, де m , R^a , R^b і R^c такі, як визначено в п. 1.

17. Сполука за п. 9, де феніл є тризаміщеним.

18. Сполука за п. 17, де замісники R^8 знаходяться в позиціях 2,3,4-; 2,3,5-; 2,3,6-; 2,4,5-; 2,4,6-; 2,5,6- або 3,4,5-.

19. Сполука за п. 18, де кожний R^8 незалежно вибраний із групи, що складається з (C1-C10)алкілу, (C1-C10)розгалуженого алкілу, $-OR^a$, можливо заміщеного однією або більше однаковими або різними групами R^a або R^b , $-O-(CH_2)_m-NR^cR^c$, $-O-C(O)NR^cR^c$, $-O-(CH_2)_m-C(O)NR^cR^c$, $-O-C(O)OR^a$, $-O-C(NH)NR^cR^c$, $-O-(CH_2)_m-C(O)OR^a$, $-O-C(NH)NR^cR^c$, $-NH-(CH_2)_m-NR^cR^c$, $-NH-C(O)NR^cR^c$ і $-NH-(CH_2)_m-C(O)NR^cR^c$, де m , R^a , R^b і R^c такі, як визначено в п. 1.

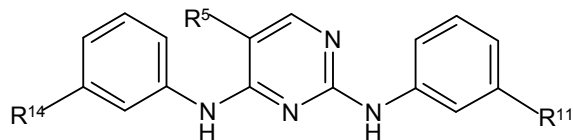
20. Сполука за п. 17, де феніл має формулу:



де: R^{31} являє собою метил або (C1-C6)алкіл; R^{32} являє собою водень або метил(C1-C6)алкіл; і R^{33} являє собою галогенову групу.

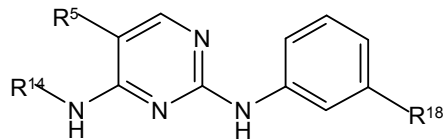
21. Сполука за п. 10, де R^2 і R^4 однакові.

22. Сполука за п. 1, що має структуру відповідно до формули (Ib):



і її солі, гідрати, сольвати, N-оксиди і проліки, де R^{11} і R^{14} кожний, незалежно один від одного, вибраний із групи, що складається з гідрокси, (C1-C6)алкокси і $-NR^cR^c$; і R^5 і R^c такі, як визначено в п. 1.

23. Сполука за п. 1, що має структуру відповідно до формули (Ic):



і її солі, гідрати, сольвати, N-оксиди і/або проліки, де:

R^{14} являє собою феніл, заміщений 1-3 однаковими або різними групами R^8 , або 5-14-членний гетероарил, можливо заміщений 1-4 однаковими або різними групами R^8 , де R^8 визначений за п. 1;

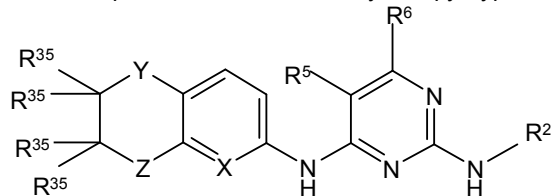
R^5 такий, як визначений у п. 1; і

R^{18} являє собою $-O(CH_2)_m-R^b$, де m і R^b такі, як визначено в п. 1.

24. Сполука за п. 23, де R^{14} являє собою можливо заміщений гетероарил.

25. Сполука за п. 23, де R^{18} являє собою $-O-CH_2-C(O)-NHCH_3$.

26. 2,4-Піримідиндіамінова сполука структурної формули (II):



включаючи її солі, гідрати, сольвати, N-оксиди і/або проліки, де:

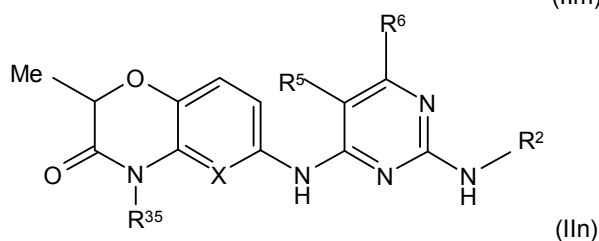
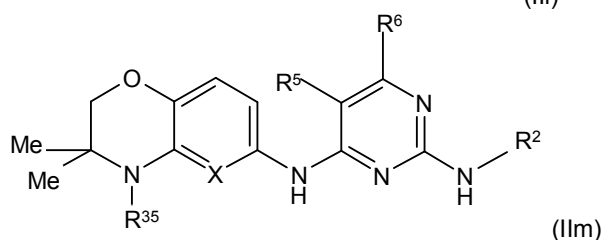
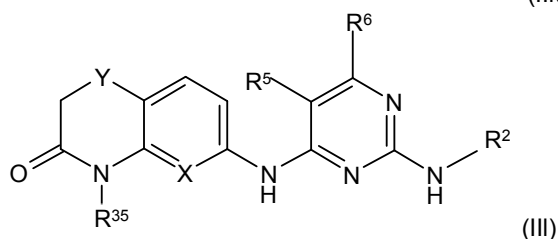
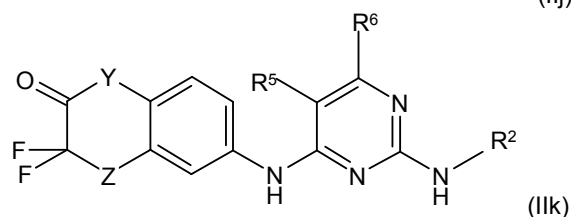
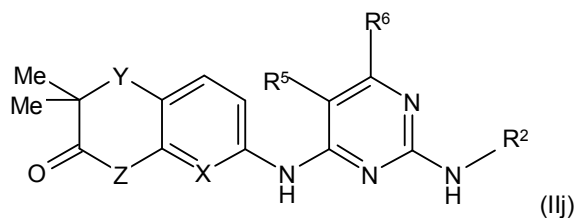
X вибраний із групи, що складається з N і CH;

Y вибраний із групи, що складається з O, S, SO, SO₂, SONR³⁶, NH, NR³⁵ і NR³⁷;

Z вибраний із групи, що складається з O, S, SO, SO₂, SONR³⁶, NH, NR³⁵ і NR³⁷;

R^2 вибраний із групи, що складається з (C1-C6)алкілу, можливо заміщеного однією або більше однаковими або різними групами R^8 , (C3-C8)циклоалкілу, можливо заміщеного однією або більше однаковими або різними групами R^8 , циклогексила, можливо заміщеного однією або більше однаковими або різними групами R^8 , 3-8-членного циклогетероалкілу, можливо заміщеного однією або більше однаковими або різними групами R^8 , (C5-

C15)ари́лу, можливо заміщеного однією або більше однаковими або різними групами R^8 , фенілу, можливо заміщеного однією або більше однаковими або різними групами R^8 , і 5-15-членного гетероари́лу, можливо заміщеного однією або більше однаковими або різними групами R^8 ;
 R^5 ви́браний із групи, що складається з R^6 , (C1-C6)алкі́лу, можливо заміщеного однією або більше однаковими або різними групами R^8 , (C1-C4)алка́нілу, можливо заміщеного однією або більше однаковими або різними групами R^8 , (C2-C4)алке́нілу, можливо заміщеного однією або більше однаковими або різними групами R^8 , і (C2-C4)алкі́нілу, можливо заміщеного однією або більше однаковими або різними групами R^8 ;
 R^6 незалежно ви́браний із групи, що складається з водню, електронегативної групи, $-OR^d$, $-SR^d$, (C1-C3)галогеноалкілокси, (C1-C3)пергалогеноалкілокси, $-NR^cR^c$, галогену, (C1-C3)галогеноалкі́лу, (C1-C3)пергалогеноалкі́лу, $-CF_3$, $-CH_2CF_3$, $-CF_2CF_3$, $-CN$, $-NC$, $-OCN$, $-SCN$, $-NO$, $-NO_2$, $-N_3$, $-S(O)R^d$, $-S(O)_2R^d$, $-S(O)_2OR^d$, $-S(O)NR^cR^c$, $-S(O)_2NR^cR^c$, $-OS(O)R^d$, $-OS(O)_2R^d$, $-OS(O)_2OR^d$, $-OS(O)NR^cR^c$, $-OS(O)_2NR^cR^c$, $-C(O)R^d$, $-C(O)OR^d$, $-C(O)NR^cR^c$, $-C(NH)NR^cR^c$, $-OC(O)R^d$, $-SC(O)R^d$, $-OC(O)OR^d$, $-SC(O)OR^d$, $-OC(O)NR^cR^c$, $-SC(O)NR^cR^c$, $-OC(NH)NR^cR^c$, $-SC(NH)NR^cR^c$, $-[NHC(O)]_nR^d$, $-[NHC(O)]_nOR^d$, $-[NHC(O)]_nNR^cR^c$ і $-[NHC(NH)]_bNR^cR^c$, (C5-C10)ари́лу, можливо заміщеного однією або більше однаковими або різними групами R^8 , фені́лу, можливо заміщеного однією або більше однаковими або різними групами R^8 , (C6-C16)ари́лалкі́лу, можливо заміщеного однією або більше однаковими або різними групами R^8 , 5-10-членного гетероари́лу, можливо заміщеного однією або більше однаковими або різними групами R^8 , і 6-16-членного гетероари́лалкі́лу, можливо заміщеного однією або більше однаковими або різними групами R^8 ;
 R^8 ви́браний із групи, що складається з R^a , R^b , R^a , заміщеного одним або більше однаковими або різними R^a або R^b , $-OR^a$, заміщеної одним або більше однаковими або різними R^a або R^b , $-B(OR^a)_2$, $-B(NR^cR^c)_2$, $-(CH_2)_m-R^b$, $-(CHR^a)_m-R^b$, $-O-(CH_2)_m-R^b$, $-S-(CH_2)_m-R^b$, $-O-CHR^aR^b$, $-O-CR^a(R^b)_2$, $-O-(CHR^a)_m-R^b$, $-O-(CH_2)_m-CH[(CH_2)_mR^b]R^b$, $-S-(CHR^a)_m-R^b$, $-C(O)NH-(CH_2)_m-R^b$, $-C(O)NH-(CHR^a)_m-R^b$, $-O-(CH_2)_m-C(O)NH-(CH_2)_m-R^b$, $-S-(CH_2)_m-C(O)NH-(CH_2)_m-R^b$, $-O-(CHR^a)_m-C(O)NH-(CHR^a)_m-R^b$, $-S-(CHR^a)_m-C(O)NH-(CHR^a)_m-R^b$, $-NH-(CH_2)_m-R^b$, $-NH-(CHR^a)_m-R^b$, $-NH[(CH_2)_mR^b]$, $-N[(CH_2)_mR^b]_2$, $-NH-C(O)-NH-(CH_2)_m-R^b$, $-NH-C(O)-(CH_2)_m-CHR^aR^b$ і $-NH-(CH_2)_m-C(O)-NH-(CH_2)_m-R^b$;
кожний R^{35} незалежно від інших ви́браний із групи, що складається з водню і R^8 , або, альтернативно, два R^{35} , зв'язані з тим самим атомом вуглецю, разом утворюють оксо ($=O$), NH або групу NR^{38} , а інші два R^{35} кожний незалежно один від одного ви́брані з групи, що складається з водню і R^6 ;
кожний R^{36} незалежно ви́браний із групи, що складається з водню і (C1-C6)алкі́лу;
кожний R^{37} незалежно ви́браний із групи, що складається з водню і прогруппи;
 R^{38} ви́браний із групи, що складається з (C1-C6)алкі́лу і (C5-C14)ари́лу;
кожний R^c незалежно ви́браний із групи, що складається з водню, (C1-C6)алкі́лу, (C3-C8)циклоалкі́лу, циклогекси́лу, (C4-C11)циклоалкі́лалкі́лу, (C5-C10)ари́лу, фені́лу, (C6-C16)ари́лалкі́лу, бензи́лу, 2-6-членного гетероалкі́лу, 3-8-членного циклогетероалкі́лу, морфоліні́лу, піперазині́лу, гомопіперазині́лу, піперидині́лу, 4-11-членного циклогетероалкі́лалкі́лу, 5-10-членного гетероари́лу і 6-16-членного гетероари́лалкі́лу;
кожний R^b являє собою придатну групу, незалежно ви́брану із групи, що складається з $=O$, $-OR^d$, (C1-C3)галогеноалкілокси, $-OCF_3$, $=S$, $-SR^d$, $=NR^d$, $=NOR^d$, $-NR^cR^c$, галогену, $-CF_3$, $-CN$, $-NC$, $-OCN$, $-SCN$, $-NO$, $-NO_2$, $=N_2$, $-N_3$, $-S(O)R^d$, $-S(O)_2R^d$, $-S(O)_2OR^d$, $-S(O)NR^cR^c$, $-S(O)_2NR^cR^c$, $-OS(O)R^d$, $-OS(O)_2R^d$, $-OS(O)_2OR^d$, $-OS(O)_2NR^cR^c$, $-C(O)R^d$, $-C(O)OR^d$, $-C(O)NR^cR^c$, $-C(NH)NR^cR^c$, $-C(NR^a)NR^cR^c$, $-C(NOH)R^a$, $-C(NOH)NR^cR^c$, $-OC(O)R^d$, $-OC(O)OR^d$, $-OC(O)NR^cR^c$, $-OC(NH)NR^cR^c$, $-OC(NR^a)NR^cR^c$, $-[NHC(O)]_nR^d$, $-[NRa(O)]_nR^d$, $-[NHC(O)]_nOR^d$, $-[NRa(O)]_nOR^d$, $-[NHC(O)]_nNR^cR^c$, $-[NRa(O)]_nNR^cR^c$, $-[NHC(NH)]_nNR^cR^c$ і $-[NRa(NR^a)]_nNR^cR^c$;
кожний R^c незалежно являє собою захисну групу або R^a , або, альтернативно, кожен R^c разом з атомом азоту, з яким він зв'язаний, утворює 5-8-членний циклогетероалкі́л або гетероари́л, що може включати один або більше однакових або різних додаткових гетероатомів, і який може бути заміщений однією або більше однаковими або різними R^a або придатними групами R^b ;
кожний R^d незалежно являє собою захисну або групу R^a ;
кожний R^e незалежно ви́браний із групи, що складається з (C1-C6)алкі́лу, (C3-C8)циклоалкі́лу, циклогекси́лу, (C4-C11)циклоалкі́лалкі́лу, (C5-C10)ари́лу, фені́лу, (C6-C16)ари́лалкі́лу, бензи́лу, 2-6-членного гетероалкі́лу, 3-8-членного циклогетероалкі́лу, морфоліні́лу, піперазині́лу, гомопіперазині́лу, піперидині́лу, 4-11-членного циклогетероалкі́лалкі́лу, 5-10-членного гетероари́лу і 6-16-членного гетероари́лалкі́лу;
кожний m незалежно являє собою ціле число від 1 до 3; і
кожний n незалежно являє собою ціле число від 0 до 3.
27. Сполука за п. 26, де R^6 являє собою водень.
28. Сполука за п. 26, де Y і Z кожний незалежно один від одного ви́браний із групи, що складається з O і NH .
29. Сполука за п. 28, де X являє собою CH .
30. Сполука за п. 29, де кожний із Y і Z являє собою O .
31. Сполука за п. 30, де кожний R^{35} являє собою водень.
32. Сполука за п. 29, де Y являє собою O , і Z являє собою NH .
33. Сполука за п. 32, де два R^{35} , зв'язані з тим самим атомом вуглецю, разом утворюють оксогрупу.
34. Сполука за п. 33, де кожний із двох інших R^{35} являє собою водень, метил або фтор.
35. Сполука за п. 26, де R^2 являє собою феніл, заміщений однією або більше однаковими або різними групами R^8 .
36. Сполука за п. 35, де феніл є монозаміщеним групою R^8 .
37. Сполука за п. 35, де феніл є дизаміщеним двома однаковими або різними групами R^8 .
38. Сполука за п. 35, де феніл є тризаміщеним трьома однаковими або різними групами R^8 .
39. Сполука за п. 38, де групи R^8 розташовані в 3-, 4- і 5-позиціях фенільного кільця.
40. Сполука за п. 39, де кожна з груп R^8 незалежно одна від іншої ви́брана з групи, що складається з (C1-C6)алкі́лу і (C1-C6)алкокси.
41. Сполука за п. 26, ви́брана з групи, що складається із сполук (IIa), (IIb), (IIc), (IIId), (IIe), (IIIf), (IIIg), (IIH), (IIi), (IIj), (IIk), (IIl), (IIm) і (IIn):



42. Сполука за п. 41, де R^{35} являє собою водень.

43. Сполука за будь-яким із пп. 26-42, де R^6 являє собою водень.

44. Сполука за будь-яким із пп. 1-43, де R^5 вибраний із групи, що складається з фтору, $-CF^3$ і $-OCF^3$.

45. Сполука за п. 44, де R^5 являє собою фтор.

46. Сполука за будь-яким із пп. 1-45, що інгібує дегрануляцію тучних клітин або базофілів, із середньою інгібуючою концентрацією IC_{50} приблизно 20 μM або менше, обмірюваною в аналізі *in vitro*.

47. N2,N4-біс(3-гідроксифеніл)-5-фтор-2,4-піримідиндіамін і його солі, гідрати, сольвати, N-оксиди і/або проліки.

48. N4-(1,4-бензоксазин-6-іл)-5-фтор-N2-[3-(N-метиламіно)карбоніл-метиленоксифеніл]-2,4-піримідиндіамін і його солі, гідрати, сольвати, N-оксиди і/або проліки.

49. N4-[(2,2-дифтор-4Н-бензо[1,4]оксазин-3-он)-6-іл]-5-фтор-N2-[3-(метиламінокарбонілметиленокси)феніл]-2,4-піримідиндіамін і його солі, гідрати, сольвати, N-оксиди і/або проліки.

50. N4-[(2,2-диметил-4Н-бензо[1,4]оксазин-3-он)-6-іл]-5-фтор-N2-[3-(метиламінокарбонілметиленокси)феніл]-2,4-піримідиндіамін і його солі, гідрати, сольвати, N-оксиди і/або проліки.

51. N-[(2,2-дифтор-4Н-бензо[1,4]оксазин-3-он)-6-іл]-5-фтор-N-(3-гідроксифеніл)-2,4-піримідиндіамін і його солі, гідрати, сольвати, N-оксиди і/або проліки.

52. N4-[2Н-піrido[3,2-b]-1,4-оксазин-3(4Н)-он-6-іл]-5-фтор-N2-(3-метил-амінокарбонілметиленоксифеніл)-2,4-піримідиндіамін і його солі, гідрати, сольвати, N-оксиди і/або проліки.

53. Фармацевтична композиція, що містить сполуку за будь-яким із пп. 1-52 і/або її сіль, гідрат, сольват, N-оксид і/або проліки, і фармацевтично прийнятний носій, розріджувач і/або ексципієнт.

54. Композиція за п. 53, де сполука знаходиться у формі фармацевтично прийнятної солі.

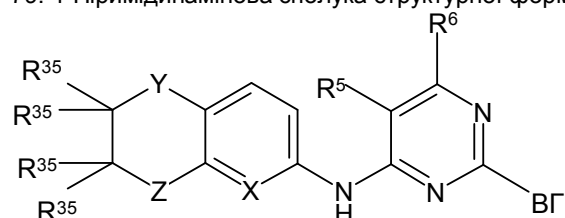
55. Композиція за п. 54, де сіль являє собою гідрохлорид, гідросульфат, сульфат, фосфат, алкансульфонат, метансульфонат, етансульфонат або пара-толуолсульфонат.

56. Спосіб інгібування дегрануляції клітини *in vitro*, при якому клітину, здатну зазнавати дегрануляції, приводять у контакт із кількістю сполуки за будь-яким із пп. 1-52 і/або її солі, гідрату, сольвату, N-оксиду і/або проліків, ефективною для інгібування дегрануляції клітини.

57. Спосіб за п. 56, де клітина являє собою людську гладку клітину, базофіл, нейтрофіл або еозинофіл.

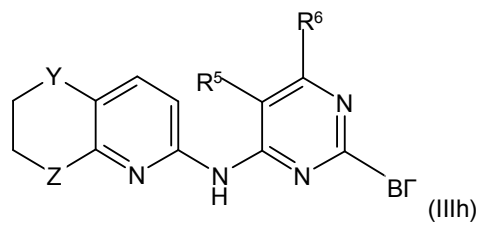
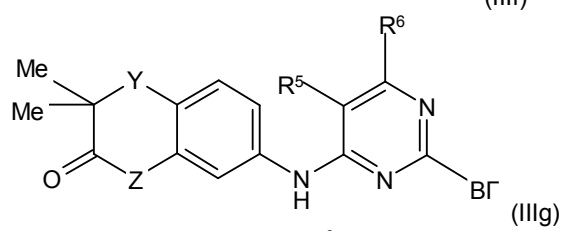
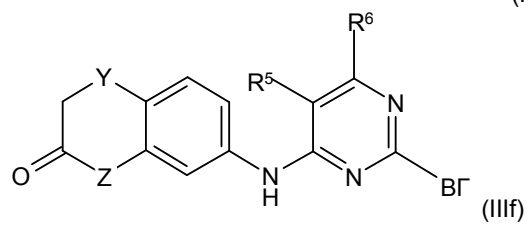
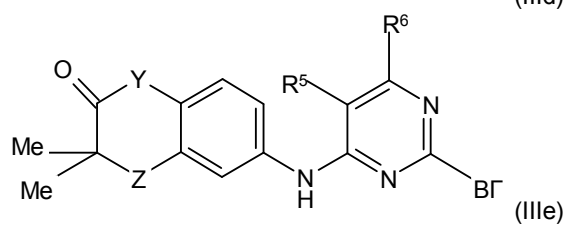
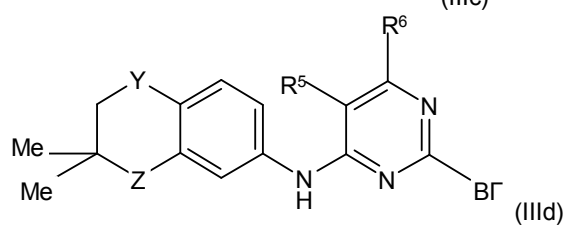
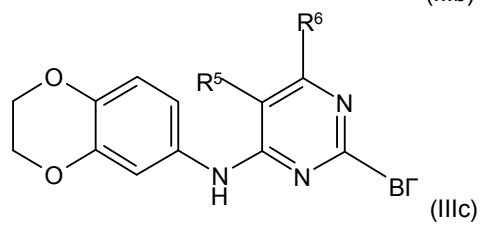
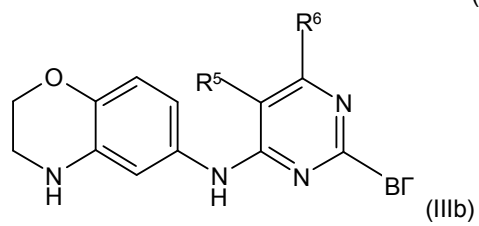
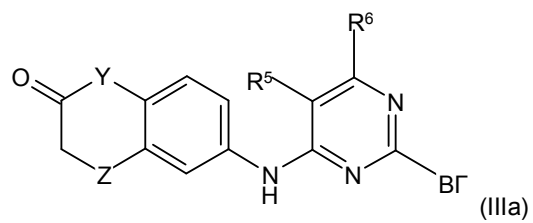
58. Застосування сполуки за будь-яким із пп. 1-52 і/або її солі, гідрату, сольвату, N-оксиду і/або проліків при виготовленні лікарського засобу для інгібування дегрануляції клітини тварини, здатної зазнавати дегрануляції.

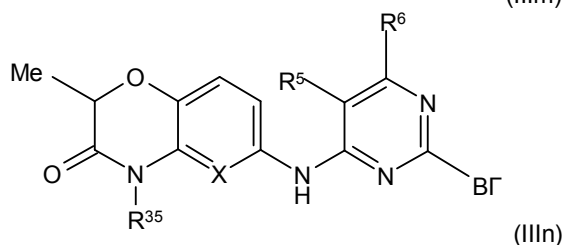
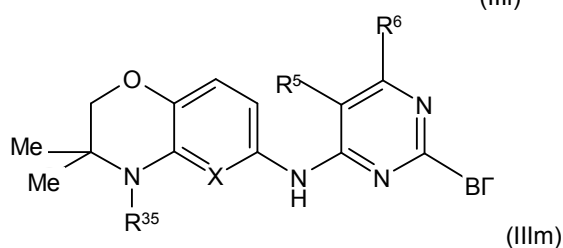
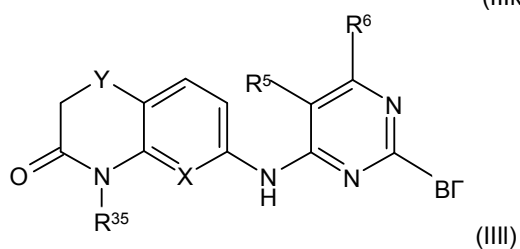
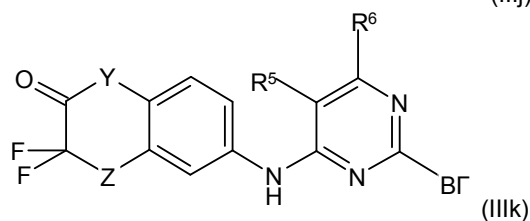
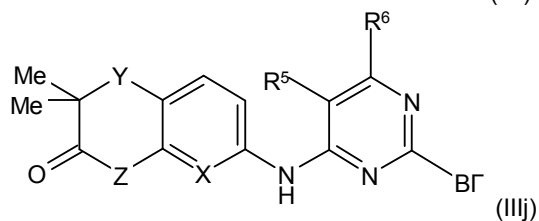
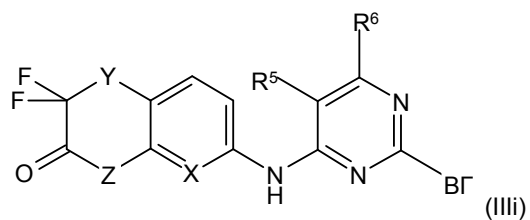
59. Застосування за п. 58, де клітина являє собою людську гладку клітину, базофіл, нейтрофіл або еозинофіл.
60. Спосіб інгібування Сук кінази *in vitro*, при якому здійснюють стадію приведення в контакт Сук кінази або її активного фрагмента з ефективною кількістю сполуки за будь-яким із пп. 1-52 і/або її сіллю, гідратом, сольватом, N-оксидом і/або проліками.
61. Спосіб за п. 60, що здійснюють з виділеною або рекомбінантною Сук кіназою, або клітиною або клітинною популяцією, що експресують ендogenous або рекомбінантну Сук кіназу.
62. Застосування сполуки за будь-яким із пп. 1-52 і/або її солі, гідрату, сольвату, N-оксиду і/або проліків при виготовленні лікарського засобу для інгібування Сук кінази.
63. Спосіб інгібування каскаду передачі сигналу через рецептор Fc *in vitro*, при якому здійснюють стадію приведення в контакт клітини, що містить рецептор Fc, що має гамма-гомодимер, із кількістю сполуки за будь-яким із пп. 1-52 і/або її солі, гідрату, сольвату, N-оксиду і/або проліків, ефективною для інгібування каскаду передачі в ній сигналу.
64. Спосіб за п. 63, де рецептор Fc вибраний з Fc α RI, Fc γ RI, Fc γ RIII і Fc ϵ RI.
65. Застосування сполуки за будь-яким із пп. 1-52 і/або її солі, гідрату, сольвату, N-оксиду і/або проліків, при виготовленні лікарського засобу для інгібування каскаду передачі сигналу через рецептор Fc.
66. Застосування за п. 65, де рецептор Fc вибраний з Fc α RI, Fc γ RI, Fc γ RIII і Fc ϵ RI.
67. Застосування сполуки за будь-яким із пп. 1-52 і/або його солі, гідрату, сольвату, N-оксиду і/або проліків при виготовленні лікарського засобу для лікування захворювання, що характеризується, викликане або асоційоване з дегрануляцією тучних клітин або базофілів у тварини.
68. Застосування за п. 67, де тварина являє собою людину.
69. Застосування за п. 68, де захворювання вибране з алергійних захворювань, слабковираженого рубцювання, захворювань, асоційованих з руйнуванням тканини, захворювань, асоційованих із запаленням тканини, запалення і рубцювання.
70. Застосування за п. 69, де алергійне захворювання вибране з кон'юнктивіту, риніту, астми, atopічного дерматиту і харчових алергій.
71. Застосування за п. 69, де слабковиражене рубцювання вибране зі склеродерми, збільшеного фіброзу, келоїдів, постхірургічних рубців, легеневого фіброзу, спазмів судин, мігрені, реперфузійного ушкодження і постінфаркту міокарда.
72. Застосування за п. 69, де захворювання, асоційоване з руйнуванням тканини, вибрано із хронічного обструктивного захворювання легені (ХОЗЛ), кардіобронхіту і постінфаркту міокарда.
73. Застосування за п. 69, де захворювання, асоційоване із запаленням тканини, вибране із захворювання подразненої кишки, спастичної товстої кишки і збудженої товстої кишки.
74. Застосування за будь-яким із пп. 69-73, де сполука являє собою N2,N4-біс(3-гідроксифеніл)-5-фтор-2,4-піримідиндіамін і/або його сіль, гідрат, сольват і/або N-оксид.
75. Застосування за будь-яким із пп. 69-73, де сполука являє собою N4-(1,4-бензоксазин-6-іл)-5-фтор-N2-[3-(N-метиламіно)карбонілметиленоксибеніл]-2,4-піримідиндіамін і/або його сіль, гідрат, сольват і/або N-оксид.
76. Застосування за п. 67, де захворювання являє собою анафілактичну реакцію або реакцію гіперчутливості.
77. Застосування за п. 67, де захворювання являє собою астму.
78. Застосування за п. 76 або 77, де сполука являє собою N4-[(2,2-дифтор-4Н-бензо[1,4]оксазин-3-он)-6-іл]-5-фтор-N2-[3-(метиламінокарбонілметиленокси)беніл]-2,4-піримідиндіамін і/або його сіль, гідрат, сольват і/або N-оксид.
79. 4-Піримідинамінова сполука структурної формули (III):



включаючи її солі, гідрати, сольвати і N-оксиди, де X, Y, Z, R⁵, R⁶ і R³⁵ такі, як визначено в п. 26, і BG являє собою вихідну групу.

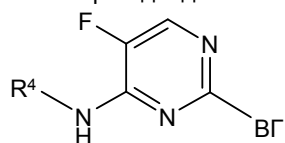
80. Сполука за п. 79, де BG являє собою хлор.
81. Сполука за п. 80, де R⁵ являє собою фтор.
82. Сполука за п. 81, де R⁶ являє собою водень.
83. Сполука за п. 79, де Y і Z кожний, незалежно один від одного, вибрані з групи, що складається з O і NH.
84. Сполука за п. 83, де X являє собою CH.
85. Сполука за п. 83, де X являє собою N.
86. Сполука за п. 84 або 85, де Y і Z кожний являють собою O.
87. Сполука за п. 86, де кожний R³⁵ являє собою водень.
88. Сполука за п. 84 або 85, де Y являє собою O, і Z являє собою NH.
89. Сполука за п. 88, де два R³⁵, зв'язані з тим самим атомом вуглецю, разом утворюють оксогрупу.
90. Сполука за п. 89, де кожний з інших двох R³⁵ являє собою водень, метил або фтор.
91. Сполука за п. 79, вибрана із групи, що складається із сполук (IIIa), (IIIb), (IIIc), (IIId), (IIIe), (IIIf), (IIIg), (IIIh), (IIIi), (IIIj), (IIIk), (IIIl), (IIIm) і (IIIn):





92. Сполука за п. 91, вибрана із групи, що складається з 2-хлор-N4-[(2,2-диметил-4Н-бензо[1,4]оксазин-3-он)-6-іл]-5-фтор-4-піримідинаміну, 2-хлор-N4-[(2,2-дифтор-4Н-бензо[1,4]оксазин-3-он)-6-іл]-5-фтор-4-піримідинаміну і 2-хлор-4N-(2Н-піrido[3,2-b]-1,4-оксазин-6-іл)-5-фтор-4-піримідинаміну та їхніх солей, сольватів і N-оксидів.

93. 4-Піримідиндіамінова сполука структурної формули (IV):



і її солі, гідрати, сольвати і N-оксиди, де:

R⁴ вибраний із групи, що складається з фенілу, монозаміщеного в 3-позиції групою R⁸, фенілу, дизаміщеного в 3,4- або 3,5-позиціях однією і тією ж або різними групами R⁸, і фенілу, тризаміщеного в 2,3,4-, 2,3,5- або 3,4,5-позиціях однією і тією ж або різними групами R⁸;

R⁸ такий, як визначено в п. 1; і

Br являє собою вихідну групу.

94. Сполука за п. 93, де Br являє собою галоген або -OS(O)₂R²⁶, де R²⁶ являє собою нижчий алкіл або феніл, можливо заміщений однією або більше однаковими або різними групами R⁸.

95. Сполука за п. 93, де Br являє собою хлор.

96. Сполука за п. 93, де Br являє собою хлор, і R⁴ являє собою феніл, монозаміщений у 3-позиції -OR^d, де R^d

такий, як визначено в п. 1.

97. Сполука за п. 96, де R^d являє собою водень, ацетил, етил, бутил, гексил, трифторметил або бензил.

98. Сполука за п. 93, вибрана із групи, що складається з 2-хлор-N4-(3-гідроксифеніл)-5-фтор-4-піримідинаміну, 2-хлор-5-фтор-N4-(3-трифторметоксифеніл)-4-піримідинаміну, 2-хлор-N4-(3-трифторметоксифеніл)-5-фтор-4-піримідинаміну і 2-хлор-N4-(3-бензилоксифеніл)-5-фтор-4-піримідинаміну.

99. Сполука за п. 93, що являє собою 2-хлор-N4-(3-гідроксифеніл)-5-фтор-4-піримідинамін.

100. Сполука за п. 93, де ВГ являє собою хлор, і R^4 являє собою феніл, дизаміщений у 3,4- або 3,5-позиціях однією і тією ж або різними групами R^8 .

101. Сполука за п. 100, вибрана із групи, що складається з 2-хлор-N4-(3-хлор-4-трифторметоксифеніл)-5-фтор-4-піримідинаміну, 2-хлор-N4-(4-хлор-3-метоксифеніл)-5-фтор-4-піримідинаміну, N4-(3-(N-трет-бутоксикарбоніл-N-ізопропіламінометил)-4-метоксифеніл)-2-хлор-5-фтор-4-піримідинаміну, 2-хлор-5-фтор-N4-(3-метилоксикарбоніл-4-метоксифеніл)-4-піримідинаміну, 2-хлор-5-фтор-N4-(3-метиламінокарбоніл-4-метоксифеніл)-4-піримідинаміну, N2-хлор-5-фтор-N4-[3-(N-морфолінометил)-4-метоксифеніл]-4-піримідинаміну, N4-(3-(N-трет-бутоксикарбоніл-N-ізопропіламінометил)-4-метоксифеніл)-2-хлор-5-фтор-4-піримідинаміну, 2-хлор-N4-(3-карбокси-4-гідроксифеніл)-5-фтор-2,4-піримідинаміну, 2-хлор-N4-(3-гідроксиметил-4-метоксифеніл)-5-фтор-4-піримідинаміну, 2-хлор-5-фтор-N4-(3-гідрокси-4-метоксикарбонілметиленоксифеніл)-4-піримідинаміну і 2-хлор-N4-(3-аміно-4-етоксифеніл)-5-фтор-4-піримідинаміну.

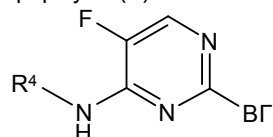
102. Сполука за п. 93, де ВГ являє собою хлор, і R^4 являє собою феніл, тризаміщений у 2,3,4-, 2,3,5- або 3,4,5-позиціях однією і тією ж або різними групами R^8 .

103. Сполука за п. 102, що являє собою 2-хлор-N4-(2,3-диметил-4-гідроксифеніл)-5-фтор-4-піримідинамін.

104. Спосіб одержання 2,4-піримідиндіамінової сполуки, при якому 4-піримідинамінову сполуку за будь-яким із пп. 93-103 приводять у контакт з аміном формули H_2N-R^2 , де R^2 такий, як визначено за п. 1, і, можливо, є захищеним, за умов, при яких амін і 4-піримідинамінова сполука реагують, даючи 2,4-піримідиндіамінову сполуку.

105. Спосіб одержання 2,4-піримідиндіамінової сполуки, при якому 4-піримідинамінову сполуку за будь-яким із пп. 79-92 приводять у контакт з аміном формули H_2N-R^2 , де R^2 такий, як визначено в п. 26, і, можливо, є захищеним, за умов, при яких амін і 4-піримідинамін реагують, даючи 2,4-піримідиндіамінову сполуку.

106. Спосіб одержання 2,4-піримідиндіамінової сполуки за п. 1, при якому 4-піримідинамінову сполуку структурної формули (V):



і її солі, гідрати, сольвати і N-оксиди, де R^4 і R^5 такі, як визначено в п. 1 і, можливо, є захищеними, а ВГ являє собою вихідну групу, приводять у контакт з аміном формули H_2N-R_2 , де R_2 такий, як визначено в п. 1 і, можливо, є захищеним, за умов, при яких амін і 4-піримідинамін приводять у реакцію з одержанням 2,4-піримідиндіамінової сполуки за п. 1.