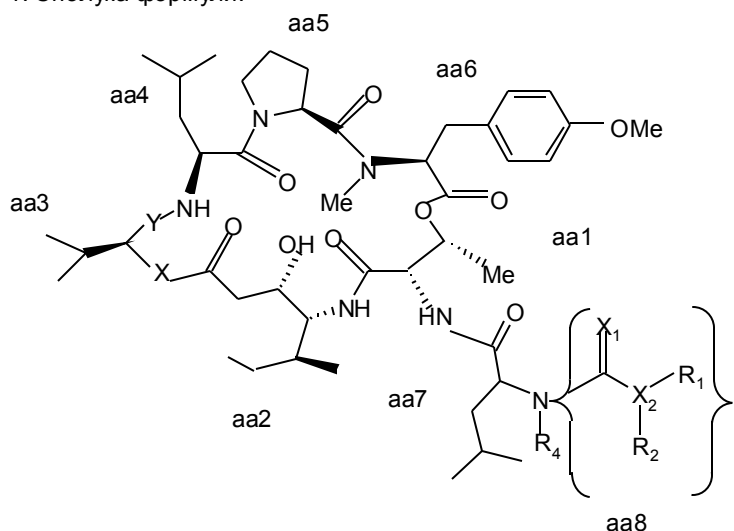


1. Сполука формули:



де:

X незалежно означає $-CR_2$, $-O$, $-S$ або $-NR$, де R незалежно означає H або органічну групу, вибрану з алкільної групи, алкенільної групи, арильної групи, аралкільної групи і їх заміщених похідних, які заміщені однією або більше гетероциклічною групою, алкоксигрупою, гідроксигрупою, меркаптогрупою, необов'язково захищеною аміногрупою, гуанідиногрупою або галогеновою групою;

Y означає CO або $-COCHCH_3CO$;

R_4 означає H або органічну групу, вибрану з алкільної групи, алкенільної групи, арильної групи, аралкільної групи, амідогрупи $RCONH$ -, RSO_2 -групи або ацильної групи RCO -, де R означає алкільну групу, алкенільну групу, арильну групу, аралкільну групу і заміщені похідні, які заміщені однією або більше гетероциклічною групою, алкоксигрупою, гідроксигрупою, меркаптогрупою, необов'язково захищеною аміногрупою, гуанідиногрупою або галогеновою групою;

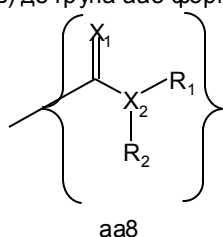
X_1 являє собою O або S; і

коли Y означає CO, тоді

а) X_2 незалежно означає CR, O (і R_2 відсутній), S (і R_2 відсутній) або N, де R незалежно означає H або органічну групу, вибрану з алкільної групи, алкенільної групи, арильної групи, аралкільної групи і їх заміщених похідних, які заміщені однією або більше гетероциклічною групою, алкоксигрупою, гідроксигрупою, меркаптогрупою, необов'язково захищеною аміногрупою, гуанідиногрупою або галогеновою групою; і

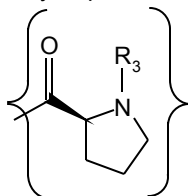
R_1 і R_2 кожен незалежно означає H або органічну групу, вибрану з алкільної групи, алкенільної групи, арильної групи, аралкільної групи, амідогрупи $RCONH$ - або ацильної групи RCO -, де R означає алкільну групу, алкенільну групу, арильну групу, аралкільну групу і заміщені похідні, що заміщені однією або більше алкоксигрупою, гідроксигрупою, меркаптогрупою, необов'язково захищеною аміногрупою, гуанідиногрупою або галогеновою групою, і R_1 або R_2 , коли X_2 означає N, додатково можуть означати $-SO_2R$, де R приймає вищевказані значення; або

в) де група aa8 формули



aa8

що утворює необов'язково N-заміщений пролін формули



aa8

де R_3 незалежно означає H або органічну групу, вибрану з алкільної групи, алкенільної групи, арильної групи, аралкільної групи, групи RSO_2 - або ацильної групи RCO -, де R означає алкільну групу, алкенільну групу, арильну групу, аралкільну групу і заміщені похідні, що заміщені однією або більше меркаптогрупою, необов'язково захищеною аміногрупою, гуанідиногрупою або галогеновою групою; або

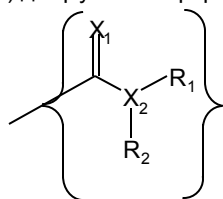
с) R_1 і R_2 можуть утворювати з X_2 необов'язково заміщену циклоалкілну, необов'язково заміщену арильну або необов'язково заміщену гетероциклічну групу, де необов'язкові замісники вибирають з алкільної групи, алкенільної групи, арильної групи, аралкільної групи і їх заміщених похідних, що заміщені однією або більше карбонільною групою, гідроксигрупою, меркаптогрупою, необов'язково захищеною аміногрупою, гуанідиногрупою або галогеновою групою; або

д) аа8 є заміщеною органічною групою, вибраною з арильної групи, аралкільної групи, групи RSO_2 - або ацильної групи RCO -, де R означає алкілну групу, арильну групу, аралкілну групу і заміщені похідні, що заміщені однією або більше карбонільною групою, алкоксигрупою, гідроксигрупою, меркаптогрупою, аміногрупою, гуанідиногрупою або галогеновою групою;

коли Y означає $-COCHCH_3CO-$, тоді

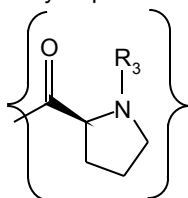
а) X_2 означає N, і R_1 і R_2 кожен незалежно означає H або органічну групу, вибрану з алкільної групи, алкенільної групи, арильної групи, аралкільної групи, амідогрупи $CONH$ -, $-SO_2R$ група або ацильної групи RCO -, де R означає алкілну групу, алкенільну групу, арильну групу, аралкілну групу і заміщені похідні, що заміщені однією або більше гетероциклічною групою, алкоксигрупою, гідроксигрупою, меркаптогрупою, необов'язково захищеною аміногрупою, гуанідиногрупою або галогеновою групою, або

в) де група аа8 формули



аа8

яка утворює N-заміщений пролін формули



аа8

де R_3 означає групу RSO_2 -, де R означає алкілну групу, R_3 означає алкенільну групу, аралкілну групу і заміщені похідні, що заміщені однією або більше карбонільною групою, гідроксигрупою, меркаптогрупою, необов'язково захищеною аміногрупою, гуанідиногрупою або галогеновою групою;

с) R_1 і R_2 можуть утворювати з X_2 необов'язково заміщену циклоалкілну, необов'язково заміщену арильну або необов'язково заміщену гетероциклічну групи, де необов'язкові замісники вибирають з алкільної групи, алкенільної групи, арильної групи, аралкільної групи і їх заміщених похідних, що заміщені однією або більше карбонільною групою, гідроксигрупою, меркаптогрупою, необов'язково захищеною аміногрупою, гуанідиногрупою або галогеновою групою; або

д) аа8 є заміщенням органічною групою, вибраною з арильної групи, аралкільної групи, групи RSO_2 -, де R означає алкілну групу, арильну групу, аралкілну групу і заміщені похідні, що заміщені однією або більше алкоксигрупою, гідроксигрупою, меркаптогрупою, аміногрупою, гуанідиногрупою або галогеновою групою; і її фармацевтично прийнятні солі.

2. Сполука за п.1, де X означає $-NR$ -, у якому R приймає вказані значення.

3. Сполука за п.2, де X означає $-NH$ - або $-NMe$ -.

4. Сполука за п.3, де X означає $-NH$ -.

5. Сполука за п.1, де X означає $-O$ -.

6. Сполука за будь-яким з пунктів 1-5, де Y означає $-CO$ -.

7. Сполука за п.1, де X означає $-NH$ - або O і Y означає $-COCHCH_3CO-$ або $-CO$ -.

8. Сполука за будь-яким з попередніх пунктів, де R_4 означає метил.

9. Сполука за будь-яким з попередніх пунктів, де X_1 означає O.

10. Сполука за будь-яким з попередніх пунктів, де X_2R_1 означає необов'язково заміщену аралкілоксигрупу.

11. Сполука за п.10, де X_2R_1 означає бензілоксигрупу.

12. Сполука за будь-яким з пунктів 1-9, де X_2R_1 означає необов'язково заміщену аміногрупу.

13. Сполука за п.12, де X_2R_1 означає групу $-NHR_1$, де R_1 означає необов'язково заміщену алкілну групу, алкенільну групу, арильну групу або аралкілну групу.

14. Сполука за п.13, де R_1 означає алкілну групу або арильну групу.

15. Сполука за п.14, де R_1 означає фенільну групу або бутильну групу.

16. Сполука за будь-яким з пп. 1-9, де X_2R_1 означає необов'язково заміщену алкілну групу.

17. Сполука за п.16, де X_2R_1 означає пропільну групу,

ізопропільну групу, пентильну або групу біотину.

18. Сполука за будь-яким з пп. 1-9, де $-C(=O)X_2R_1R_2$ утворює необов'язково заміщену ацильну групу амінокислоти.

19. Сполука по п.18, де необов'язково заміщеною ацильною групою амінокислоти є необов'язково заміщений пролін.

20. Сполука за п.19, де необов'язково заміщений пролін означає необов'язково заміщений норвалінпролін, необов'язково заміщений аланінпролін, Вос-пролін, необов'язково заміщений алкілпролін.
21. Сполука за п.19, де необов'язково заміщений пролін означає норвалінпролін, Z-норвалінпролін, аланінпролін, Z-аланінпролін, Вос-аланінпролін, ізобутирилпролін або необов'язково захищений D-лактилпролін.
22. Сполука за будь-яким з пп. 1-8, де X_1 означає S і X_2R_1 означає групу $-NHR_1$, де R_1 означає заміщену алкільну групу, алкенільну групу, арильну групу або аралкільну групу.
23. Сполука за п.22, де R_1 означає алкільну групу або арильну групу.
24. Сполука за п.23, де R_1 означає фенільну групу або бутильну групу.
25. Сполука за будь-яким з пп. 1-9, де R_1 і R_2 разом з X_2 утворює необов'язково заміщену гетероциклічну групу.
26. Сполука за п.25, де гетероциклічна група означає кумарин.
27. Сполука за кожним з пп. 1-8, де aa8 заміщений органічною групою RSO_2 , де R приймає вказані значення.
28. Сполука за п.27, де R означає метил.
29. Сполука за п.1, яку вибирають із групи, що включає:
- 8-[фенілсечовина]дидемнін A,
 - 8-[бутилсечовина]дидемнін A,
 - 3-[val]-8-[ізобутирил]амплідин A,
 - 3-[Hiv]-9-[ізобутирил]амплідин,
 - 3-[Val]-9-[ізобутирил]амплідин,
 - 3-[Hiv]-8-[ізобутирил]дидемнін A,
 - 3-[Hiv]-9-[Ala]амплідин,
 - 3-[Hiv]-9-[Nva-Pro]амплідин,
 - 8-[фенілтіосечовина]дидемнін A,
 - 8-[кумарин]дидемнін A,
 - 8-[бутилтіосечовина]дидемнін A,
 - 8-[метилсульфоніл]дидемнін A,
 - 3-[val]-Z-дидемнін A,
 - 3-[Hiv]-8-[Val]дидемнін A,
 - 3-[Hiv]-8-[бутирил]дидемнін A,
 - 3-[Hiv]-9-[Z-ala]амплідин,
 - 3-[Hiv]-Z-дидемнін A,
 - 3-[Hiv]-9-[Z-Nva-Pro]амплідин,
 - 3-[Hiv]-9-[Boc-Ala]амплідин,
 - 3-[Hiv]-8-[Boc-Val]дидемнін A,
 - 3-[Hiv]-8-[Val]-9-[ізобутирил]дидемнін A,
 - 3-[Hiv]-8-[гексаноїл]дидемнін A,
 - 3-[Hiv]-8-[Pro]дидемнін A,
 - 9-[метилсульфоніл]амплідин.
30. Сполука за будь-яким з попередніх пунктів у формі фармацевтично прийнятної солі.