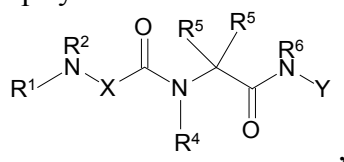
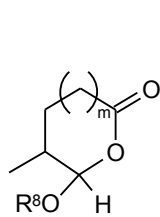


1. Сполука, представлена формулою I:

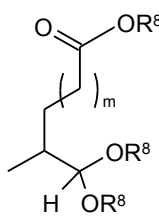


де:

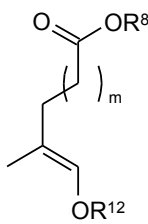
Y є:



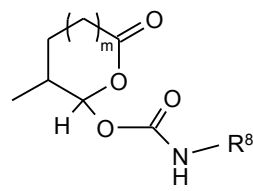
, (c)



, (d)

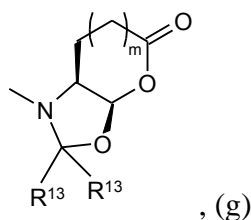


(e) або



, (f)

R⁶ є H чи R⁶ і Y, разом з азотом, до якого вони приєднані, утворюють кільце (g):



, (g)

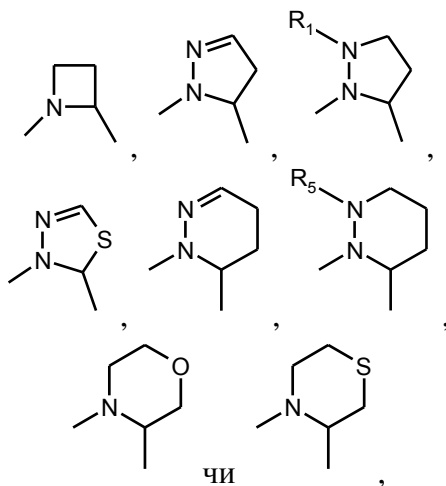
X є -C(R³)₂- чи -N(R³)-;

m дорівнює 0 чи 1;

R¹ є H, -C(O)R⁸, -C(O)C(O)R⁸, -S(O)₂R⁸, -S(O)R⁸, -C(O)OR⁸, -C(O)N(H)R⁸, -S(O)₂N(H)-R⁸, S(O)N(H)-R⁸, -C(O)C(O)N(H)R⁸, -C(O)CH=CHR⁸, -C(O)CH₂OR⁸, -C(O)CH₂N(H)R⁸, -C(O)N(R⁸)₂, -S(O)₂N(R⁸)₂, -S(O)N(R⁸)₂, -C(O)C(O)N(R⁸)₂, -C(O)CH₂N(R⁸)₂, -CH₂R⁸, -CH₂-алкеніл-R⁸ чи -CH₂-алкініл-R⁸;

R² є -H і кожен R³ незалежно є -H, амінокислотним боковим ланцюгом, -R⁸, алкеніл-R⁹ чи алкініл-R⁹, чи R² і один R³ разом із атомами, до яких вони приєднані, утворюють 3-7-членну циклічну чи гетероциклічну кільцеву систему, де атом водню, зв'язаний з будь-яким алкілним чи циклоалкілним атомом вуглецю, необов'язково заміщений -R¹⁰, атом водню, зв'язаний з будь-яким арильним чи гетероарильним атомом вуглецю, необов'язково заміщений -R¹¹, атом водню, зв'язаний з будь-яким атомом азоту кільцевої системи, необов'язково заміщений -R¹;

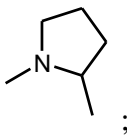
R⁴ є -H і кожен R⁵ незалежно є -H, амінокислотним боковим ланцюгом, -R⁸, -алкеніл-R⁹ чи -алкініл-R⁹, чи R⁴ і один R⁵ разом з атомами, до яких вони приєднані, утворюють кільцеву систему, вибрану з:



чи

де атом водню, зв'язаний з будь-яким алкілним чи циклоалкілним атомом вуглецю,

необов'язково заміщений R^{10} , атом водню, зв'язаний з будь-яким арильним чи гетероарильним атомом вуглецю, необов'язково заміщений R^{11} і атом водню, зв'язаний з будь-яким атомом азоту кільцевої системи, необов'язково заміщений R^1 , чи R^4 і один R^5 разом з атомами, до яких вони приєднані, утворюють кільцеву систему:



кожен R^8 незалежно являє собою -алкіл, циклоалкіл, -арил, -гетероарил, -гетероцикліл, алкілциклоалкіл, -алкіларил, -алкілгетероарил чи алкілгетероцикліл, де атом водню, зв'язаний з будь-яким алкільним чи циклоалкільним атомом вуглецю, необов'язково заміщений R^{10} , атом водню, зв'язаний з будь-яким арильним чи гетероарильним атомом вуглецю, необов'язково заміщений R^{11} і атом водню, зв'язаний з будь-яким атомом азоту, необов'язково заміщений R^1 ;

кожен R^9 незалежно являє собою -арил, -гетероарил, циклоалкіл чи -гетероцикліл, де атом водню, зв'язаний з будь-яким алкільним чи циклоалкільним атомом вуглецю, необов'язково заміщений R^{10} , атом водню, зв'язаний з будь-яким арильним чи гетероарильним атомом вуглецю, необов'язково заміщений R^{11} і атом водню, зв'язаний з будь-яким атомом азоту, необов'язково заміщений R^1 ;

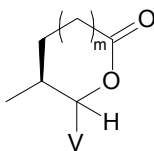
кожен R^{10} незалежно являє собою -OH, -SH, -F, -Cl, -Br, -I, -NO₂, -CN, -NH, -CO₂H, -C(O)NH₂, -N(H)C(O)H, -N(H)C(O)NH₂, -перфторалкіл, -O-алкіл, -O-арил, -O-алкіларил, -N(H)алкіл, -N(H)арил, -N(H)-алкіларил, -N(алкіл)₂, -C(O)N(H)алкіл, -C(O)N(алкіл)₂, -N(H)C(O)алкіл, -N(H)C(O)N(H)алкіл, -N(H)C(O)N(алкіл)₂, -S-алкіл, -S-арил, -S-алкіларил, -S(O)₂алкіл, -S(O)алкіл, -C(O)алкіл, -CH₂NH₂, -CH₂N(H)алкіл чи -CH₂N(алкіл)₂, -алкіл, -циклоалкіл, -арил, -гетероарил, -гетероцикліл, -алкілциклоалкіл, -алкіларил, -алкілгетероарил чи алкілгетероцикліл, де атом водню, зв'язаний з будь-яким арильним чи гетероарильним атомом вуглецю, необов'язково заміщений R^{11} і атом водню, зв'язаний з будь-яким атомом азоту, необов'язково заміщений R^1 ; і

кожен R^{11} незалежно являє собою -OH, -SH, -F, -Cl, -Br, -I, -NO₂, -CN, -NH₂, -CO₂H, -C(O)NH₂, -N(H)C(O)H, -N(H)C(O)NH₂, -алкіл, -циклоалкіл, перфторалкіл, -O-алкіл, -O-арил, -O-алкіларил, -N(H)алкіл, -N(H)арил, -N(H)-алкіларил, -N(алкіл)₂, -C(O)N(H)алкіл, -C(O)N(алкіл)₂, -N(H)C(O)алкіл, -N(H)C(O)N(H)алкіл, -N(H)C(O)N(алкіл)₂, -S-алкіл, -S-арил, -S-алкіларил, S(O)₂алкіл, -S(O)алкіл, -C(O)алкіл, -CH₂NH₂, -CH₂N(H)алкіл чи -CH₂N(алкіл)₂;

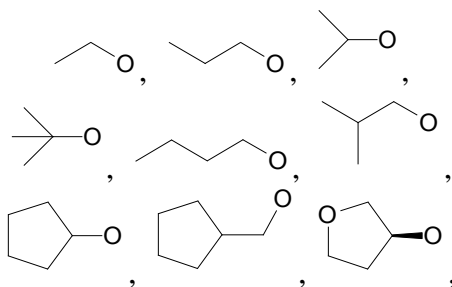
R^{12} являє собою -C(O)алкіл, -C(O)циклоалкіл, -C(O)алкіларил, -C(O)алкілгетероарил, -C(O)гетероцикліл чи -C(O)алкілгетероцикліл; і

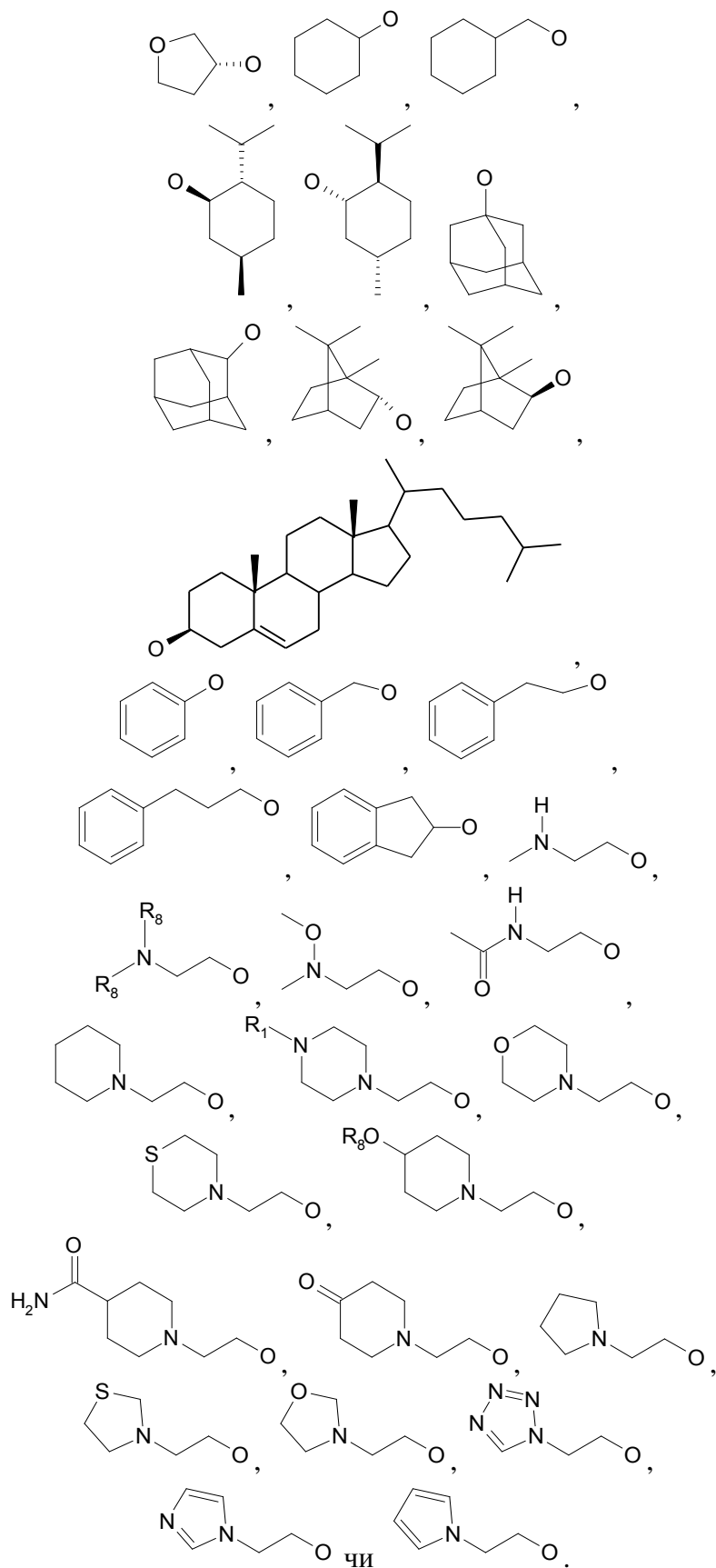
R^{13} являє собою -H, -алкіл, -арил, -алкіларил чи -алкілгетероарил.

2. Сполука за п. 1, де Y є:

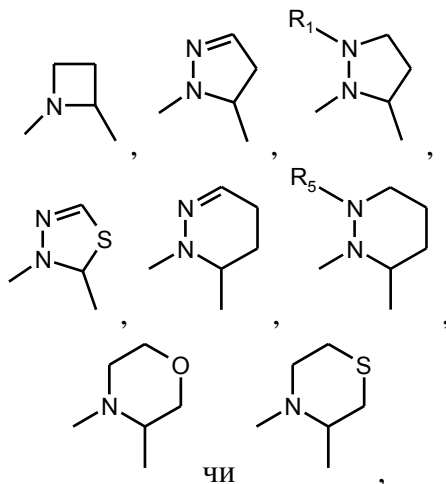


і V являє собою: CH₃O,

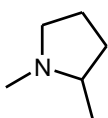




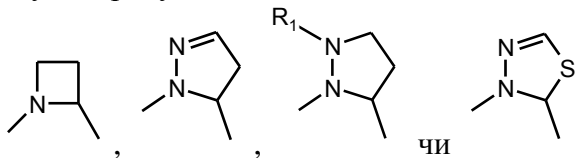
3. Сполука за будь-яким із пп. 1, 2, де R^4 і один R^5 разом з атомами, до яких вони приєднані, утворюють кільцеву систему, вибрану з:



чи
де атом водню, зв'язаний з будь-яким алкільним чи циклоалкільним атомом вуглецю, необов'язково заміщений R^{10} , чи R^4 і один R^5 разом з атомами, до яких вони приєднані, утворюють кільцеву систему:

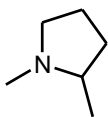


4. Сполука за п. 3, де один R^3 є -H, а інший R^3 є метил, ізопропіл, трет-бутил, -CH₂Салкіл, -CH₂SO₂алкіл, -CH₂CH₂Салкіл чи -CH₂CH₂SO₂алкіл.
5. Сполука за п. 4, де один R^3 є -H, а інший R^3 є метил.
6. Сполука за п. 5, де R^1 є -C(O) R^8 чи -C(O)C(O) R^8 .
7. Сполука за п. 3, де R^4 і один R^5 разом з атомами, до яких вони приєднані, утворюють кільцеву систему, вибрану з:



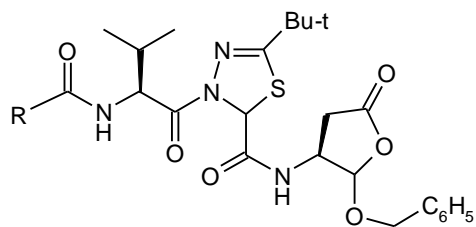
чи
і інший R^5 являє собою H, де атом водню, зв'язаний з будь-яким алкільним чи циклоалкільним атомом вуглецю, необов'язково заміщений R^{10} .

8. Сполука за п. 7, де один R^3 є -H, а інший R^3 є метил, ізопропіл, трет-бутил, -CH₂Салкіл, -CH₂SO₂алкіл, -CH₂CH₂Салкіл чи -CH₂CH₂SO₂алкіл.
9. Сполука за п. 8, де один R^3 є -H, а інший R^3 є метил.
10. Сполука за п. 9, де R^1 є -C(O) R^8 чи -C(O)C(O) R^8 .
11. Сполука за п. 3, де один R^4 і один R^5 разом з атомами, до яких вони приєднані, утворюють кільцеву систему:

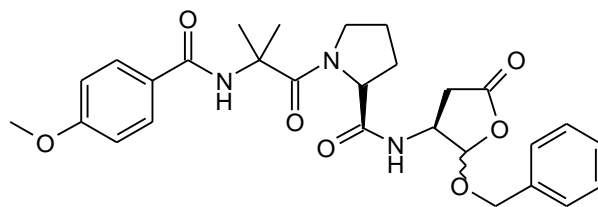


а інший R^5 є H.

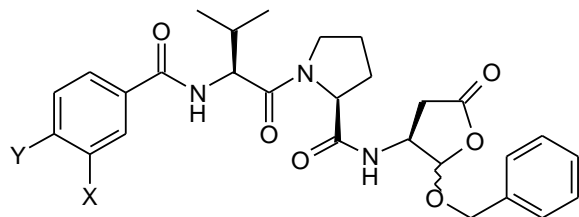
12. Сполука за п. 11, де один R^3 є -H, а інший R^3 є метил, ізопропіл, трет-бутил, -CH₂Салкіл, -CH₂SO₂алкіл, -CH₂CH₂Салкіл чи -CH₂CH₂SO₂алкіл.
13. Сполука за п. 12, де один R^3 є -H, а інший R^3 є метил.
14. Сполука за п. 13, де R^1 є -C(O) R^8 чи -C(O)C(O) R^8 .
15. Сполука за п. 3, де $m=0$.
16. Сполука за п. 1, яка вибрана з групи, що складається зі сполук 41, 45, 51, 56, 60, 64, 68, 72, 76-93, 98a-z, 98aa-az, 98ba і 98bb, 110, 111, 120a і 120b:



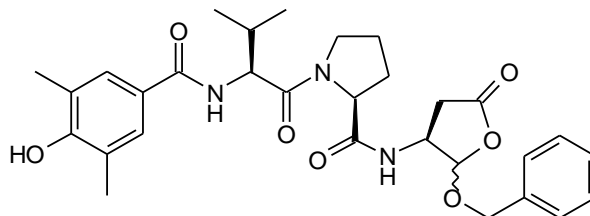
41, R=CH₃
45, R=4-MeOPh-



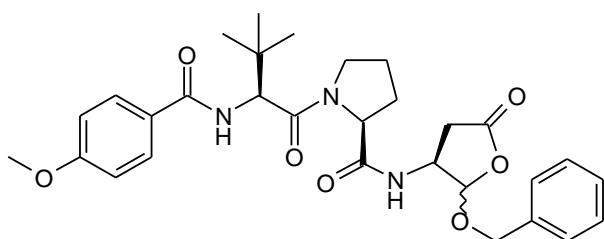
51



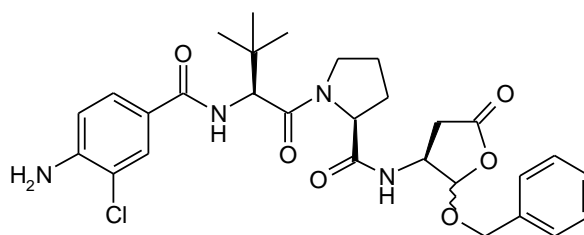
56, X=H, Y=MeO
60, X=Cl, Y=NH₂



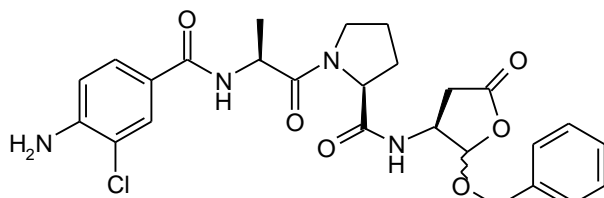
64



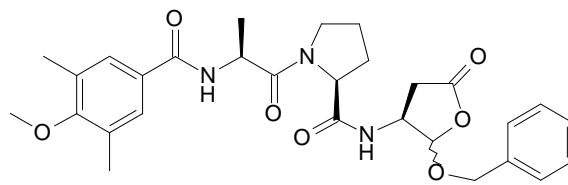
68



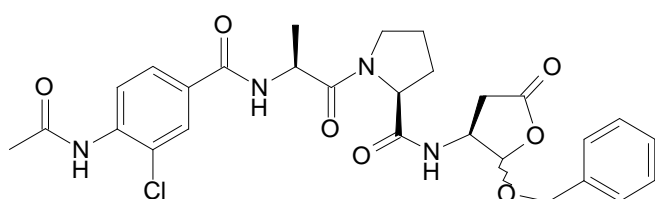
72



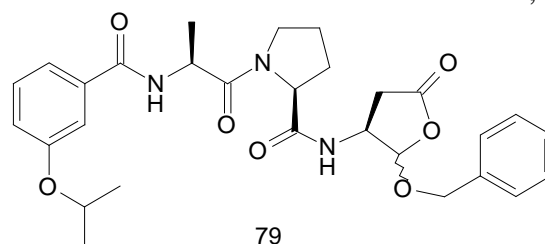
76



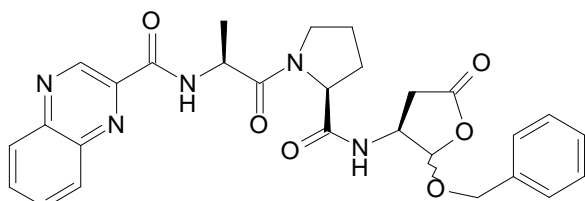
77



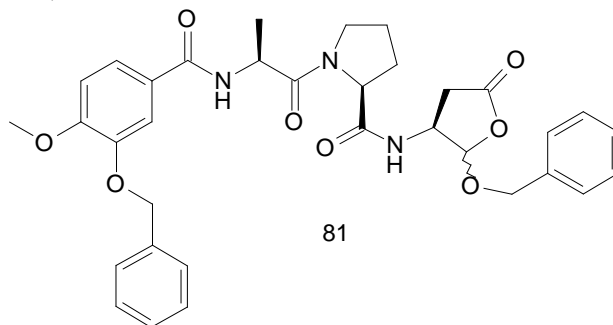
78



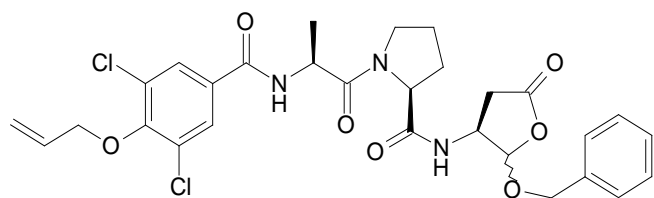
79



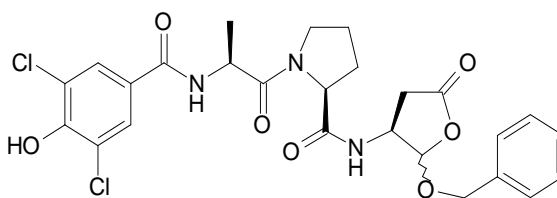
80



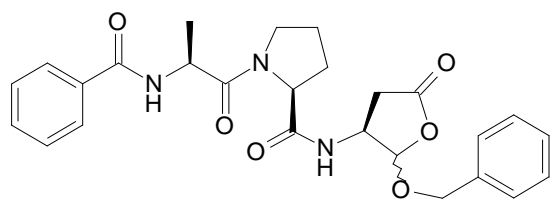
81



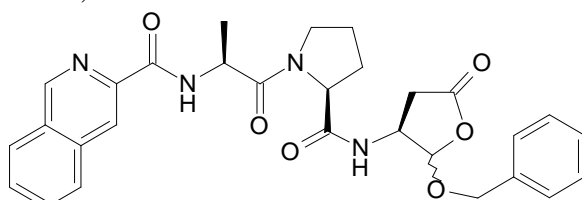
82



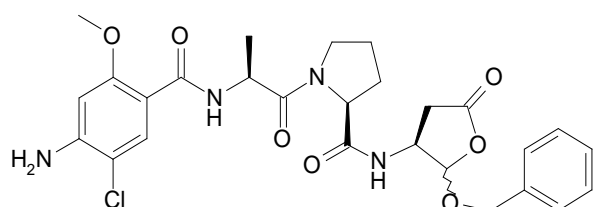
83



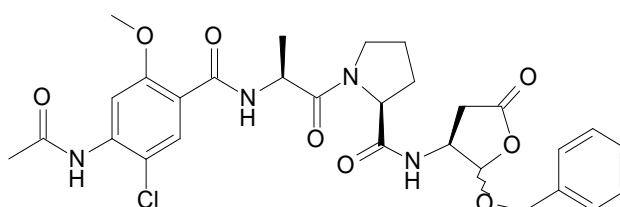
84



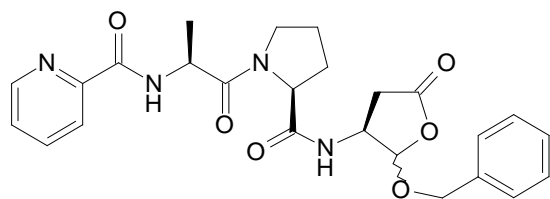
85



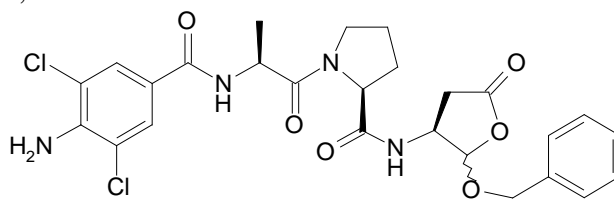
86



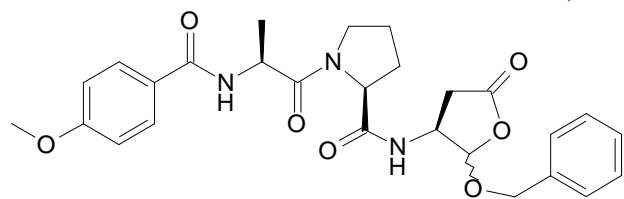
87



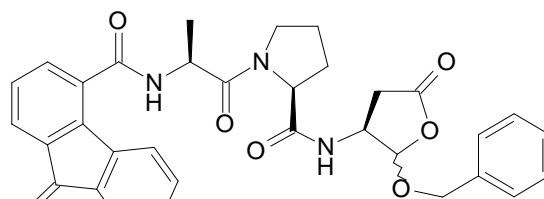
88



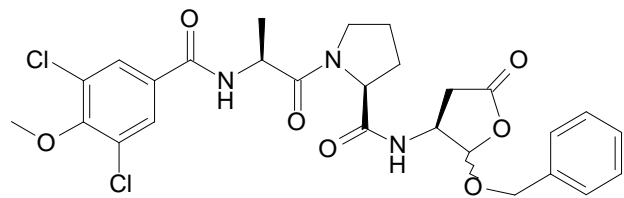
89



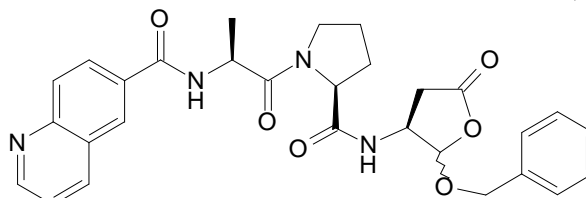
90



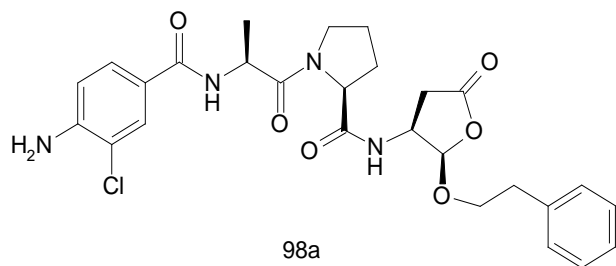
91



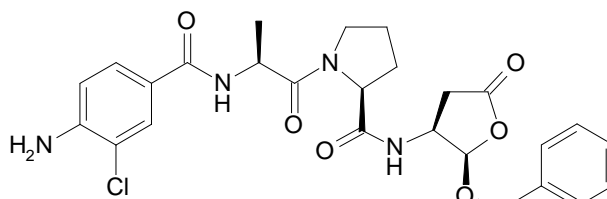
92



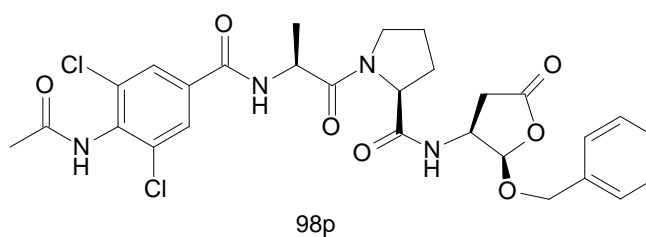
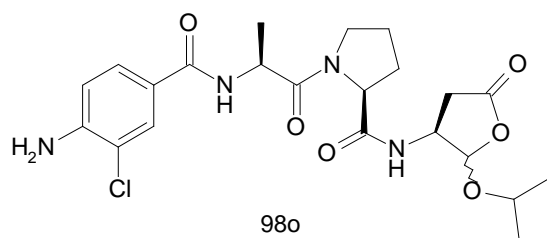
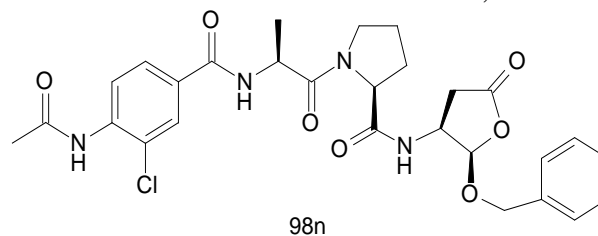
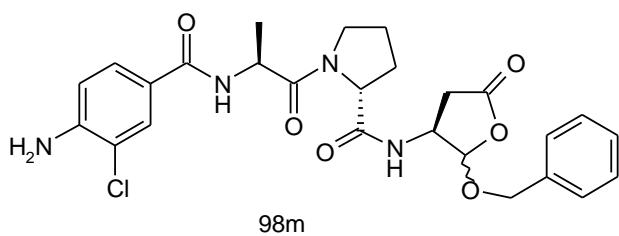
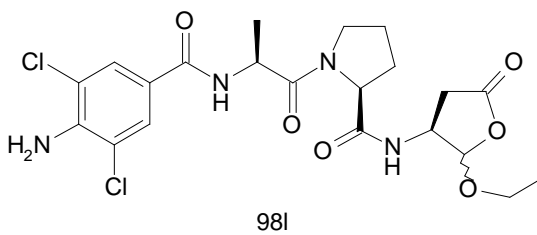
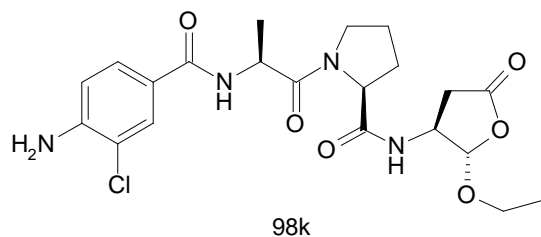
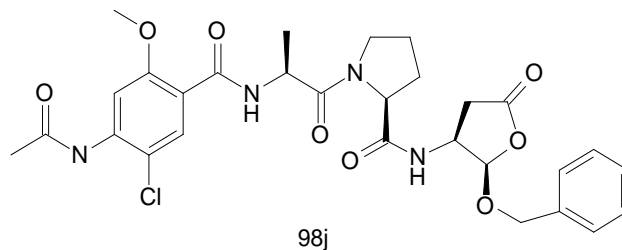
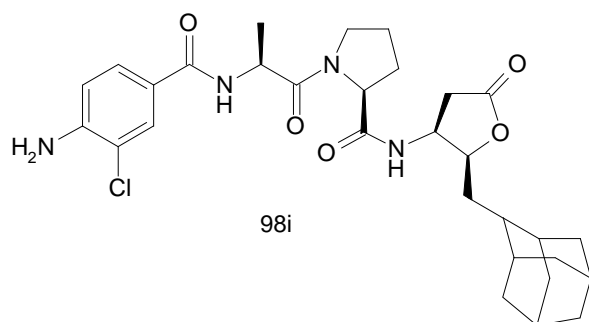
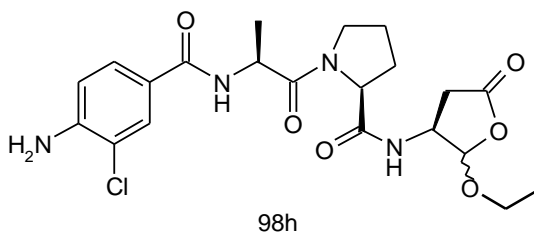
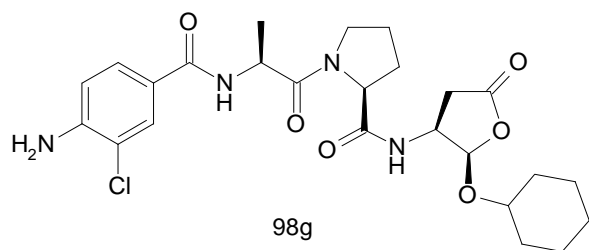
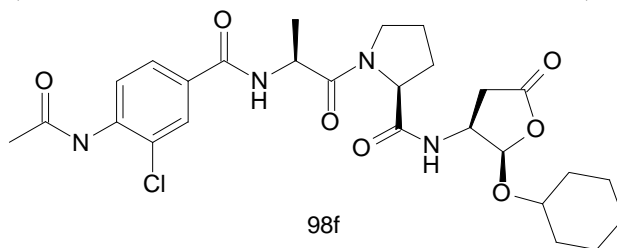
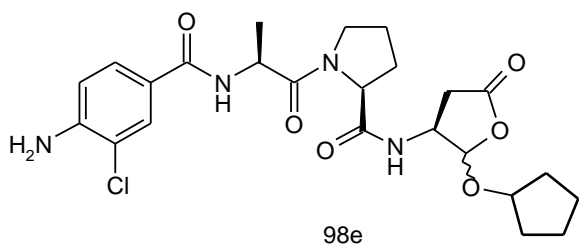
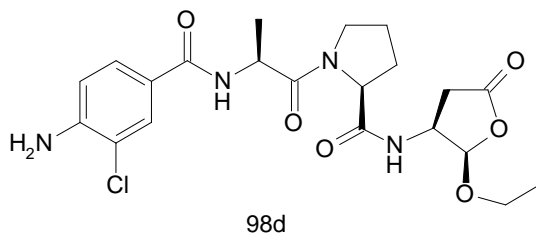
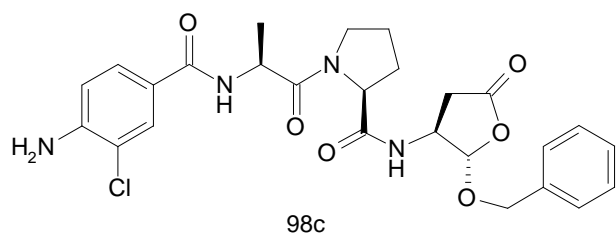
93

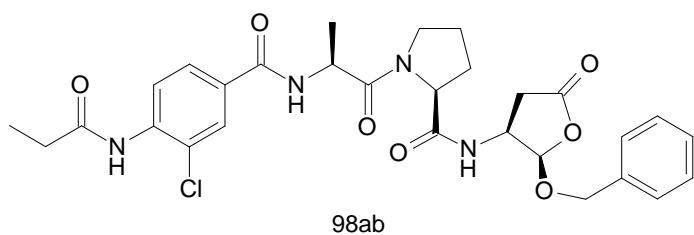
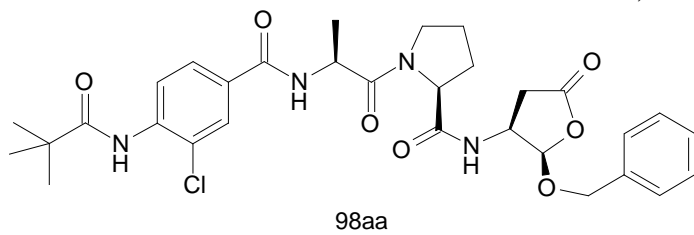
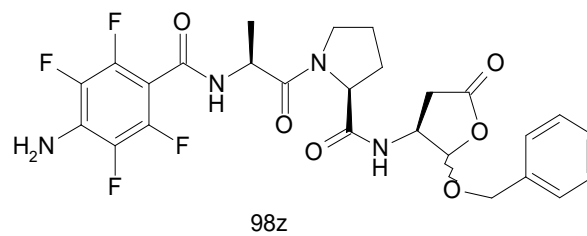
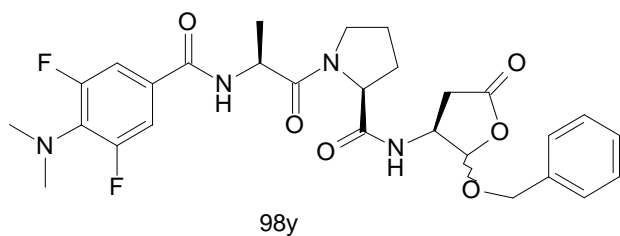
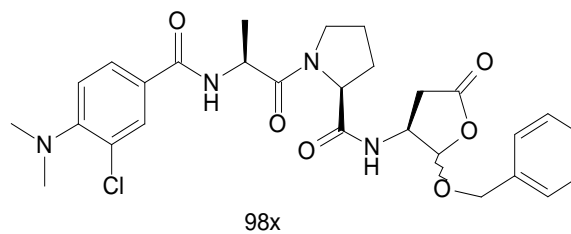
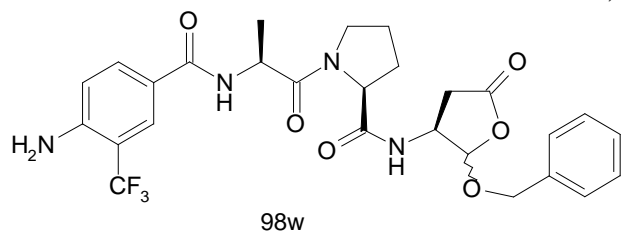
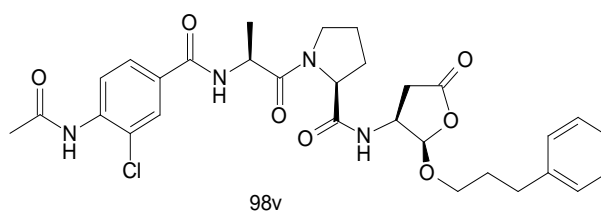
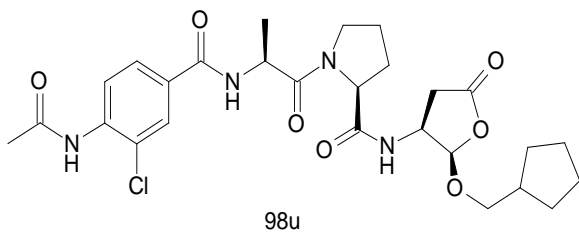
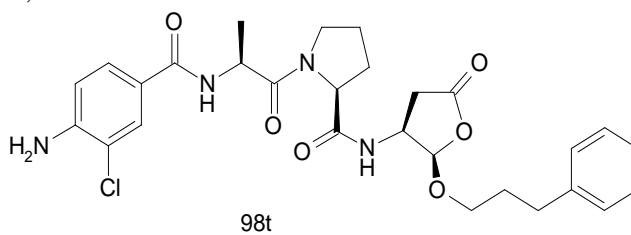
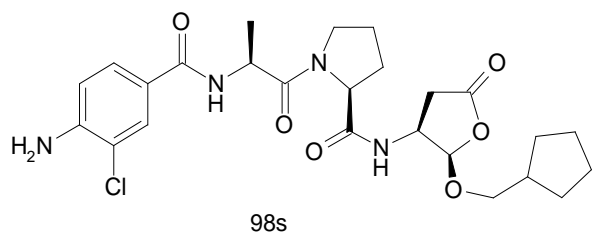
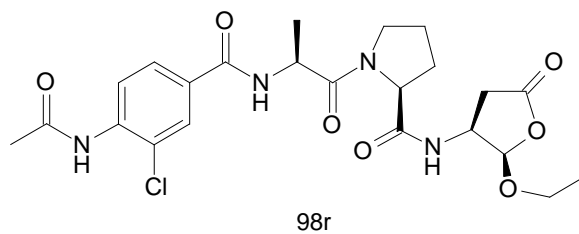
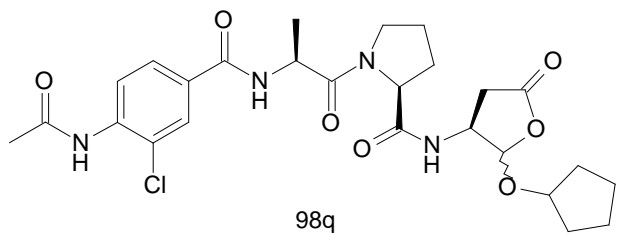


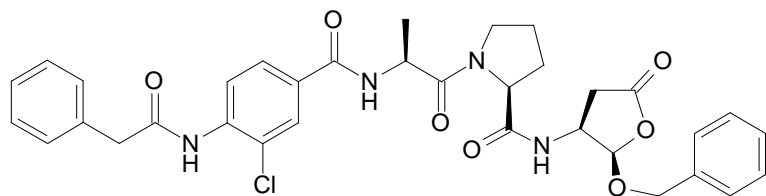
98a



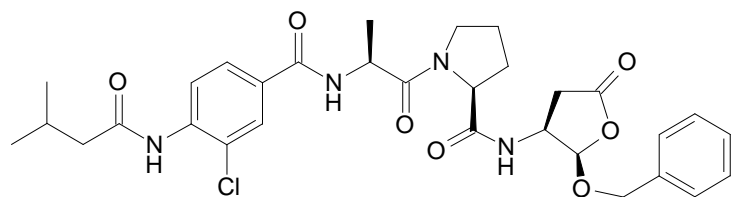
98b



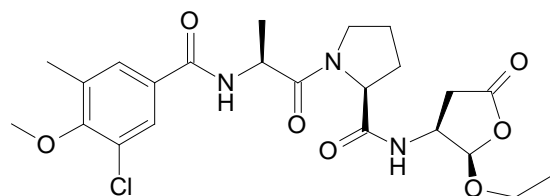




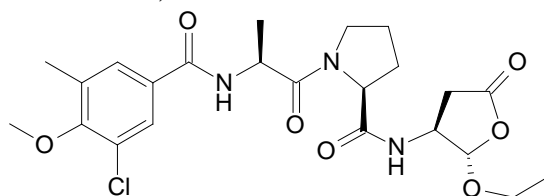
98ac



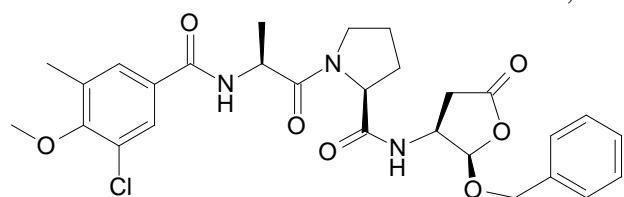
98ad



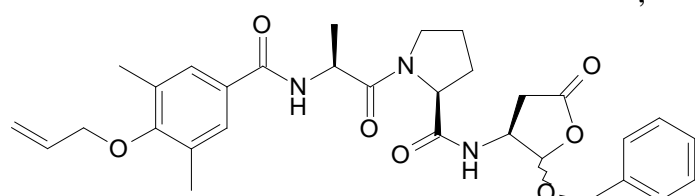
98ae



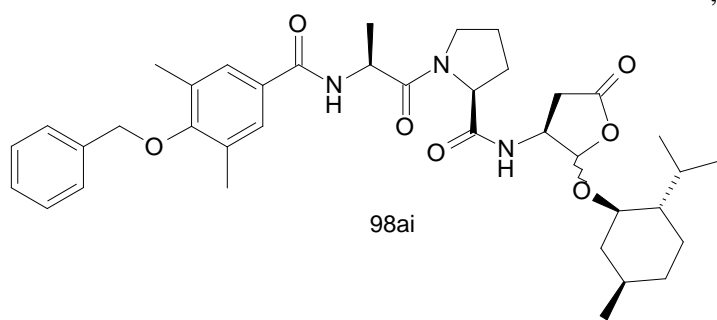
98af



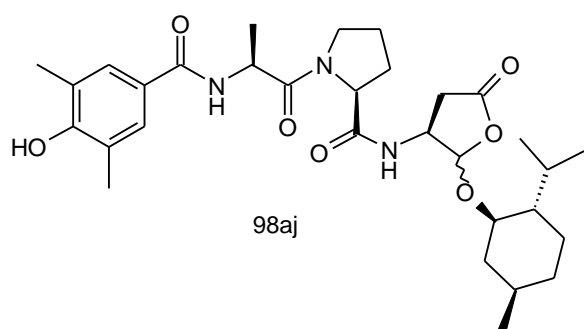
98ag



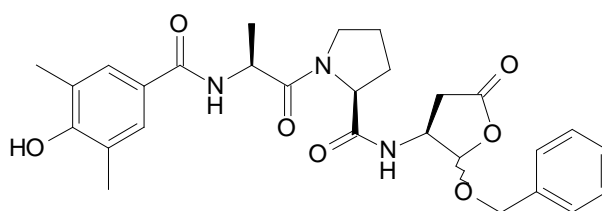
98ah



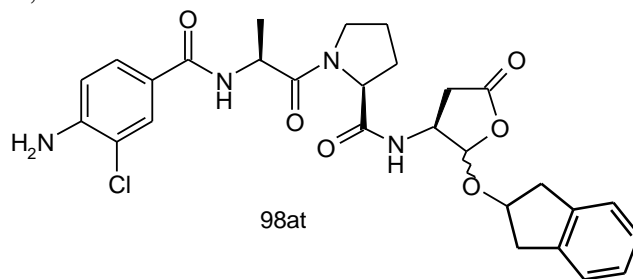
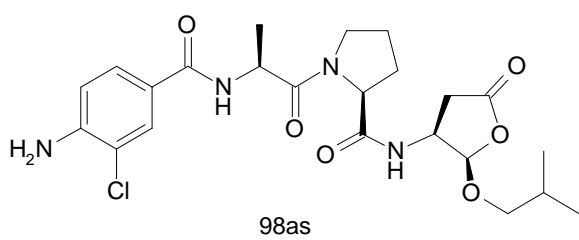
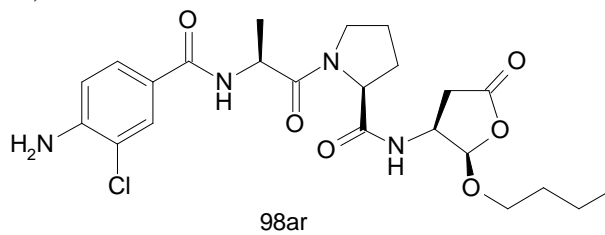
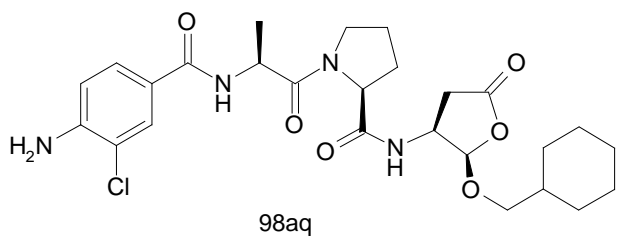
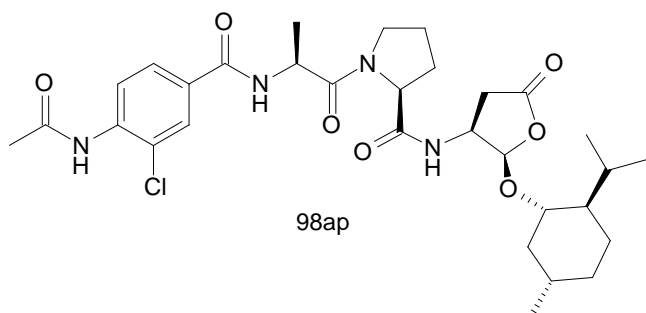
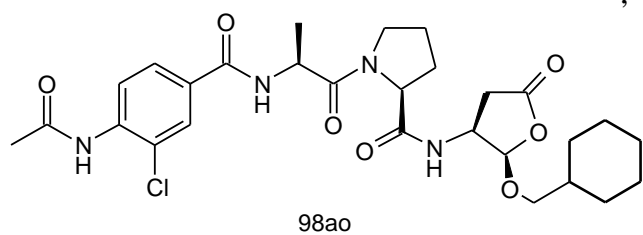
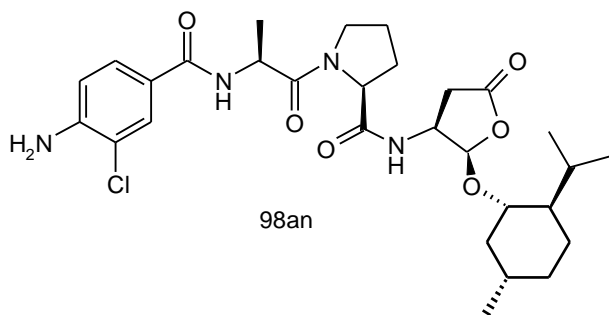
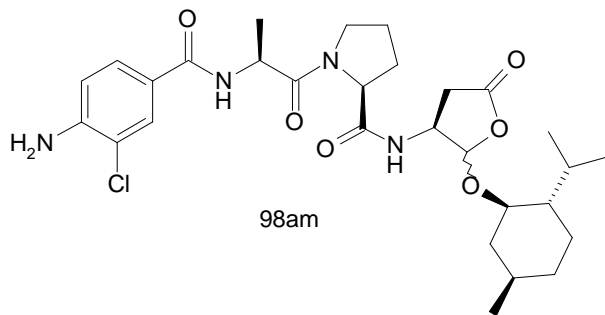
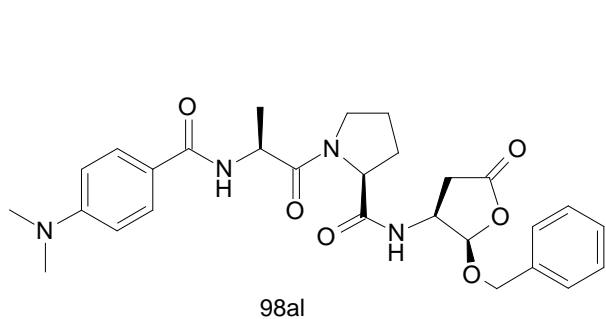
98ai

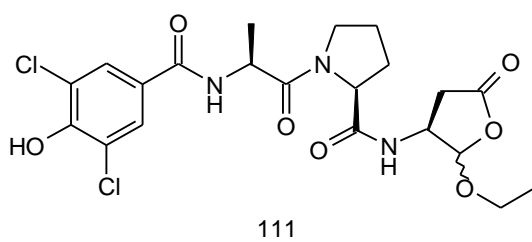
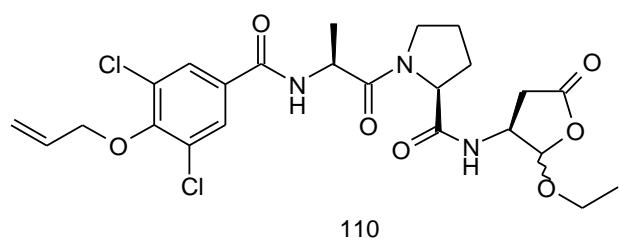
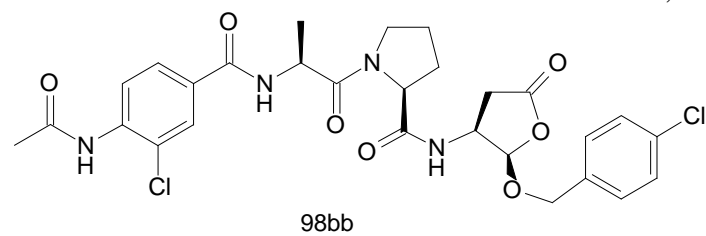
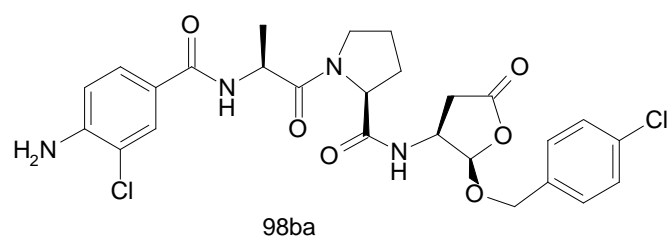
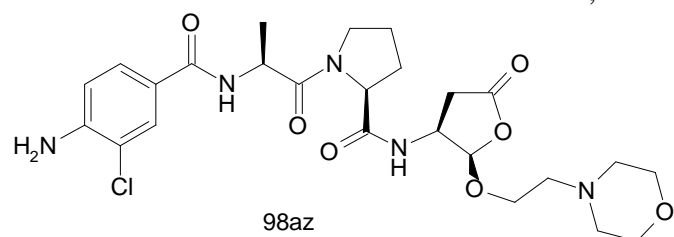
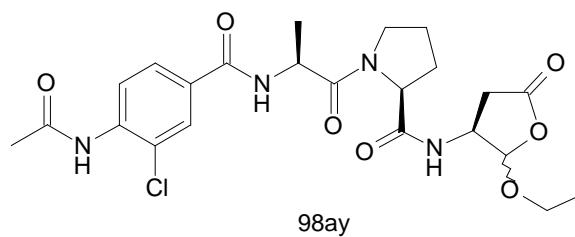
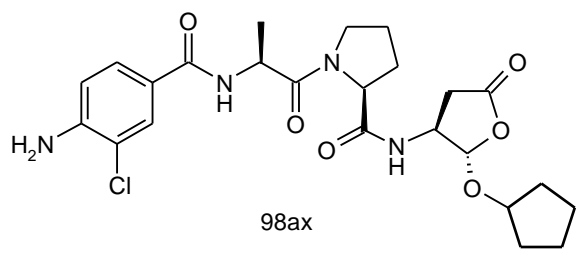
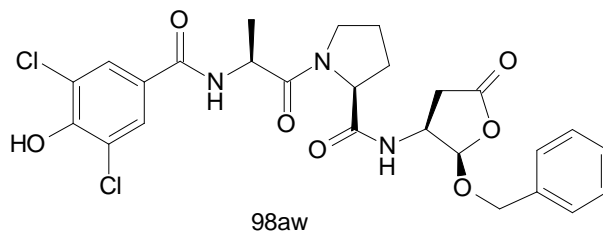
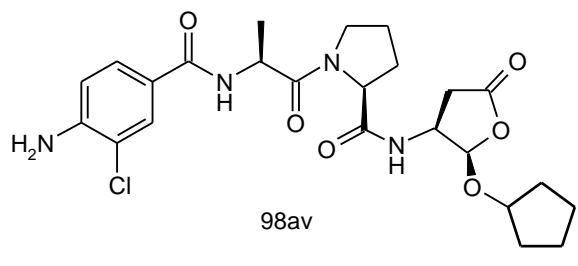
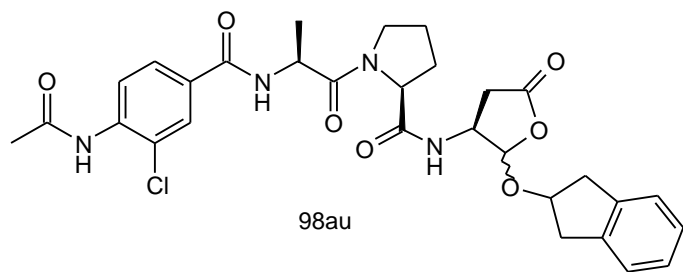


98aj

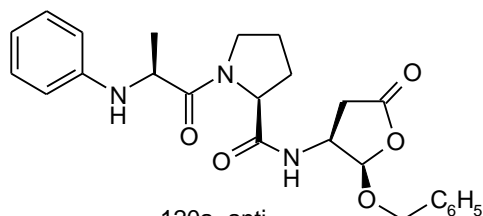


98ak



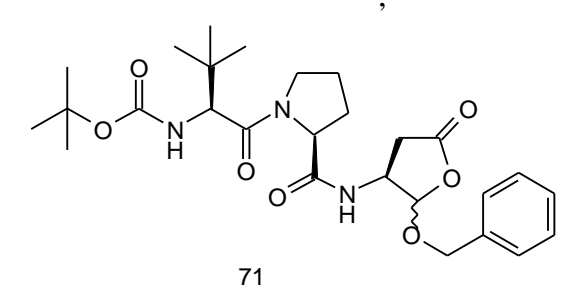
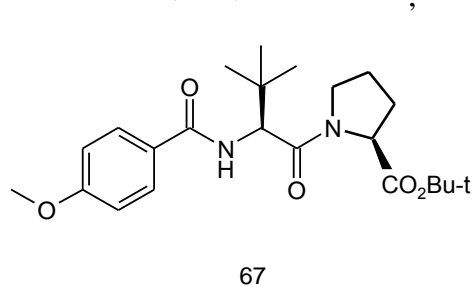
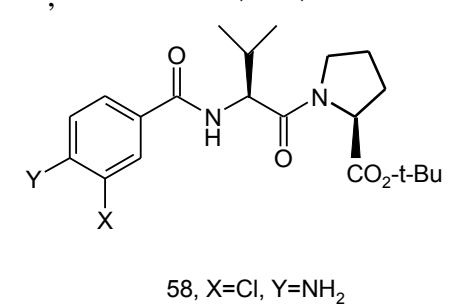
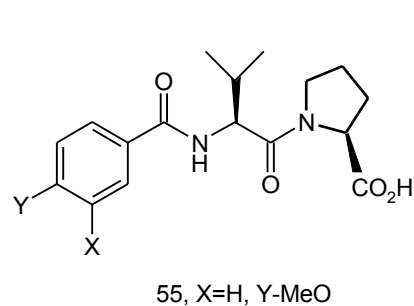
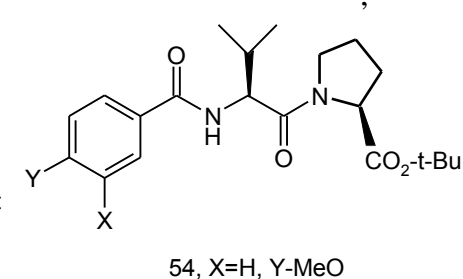
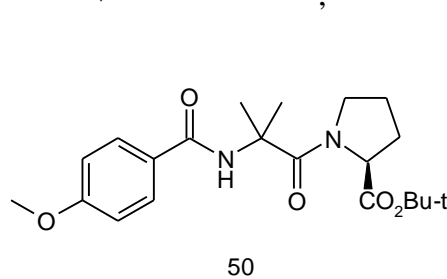
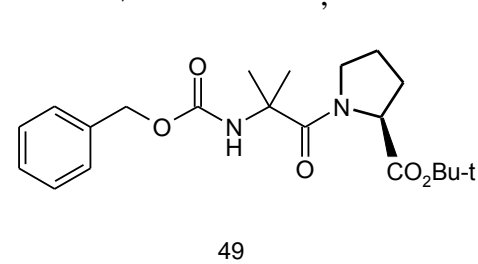
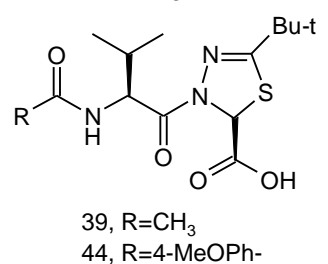
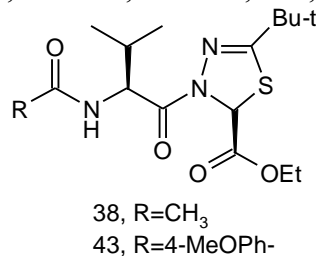
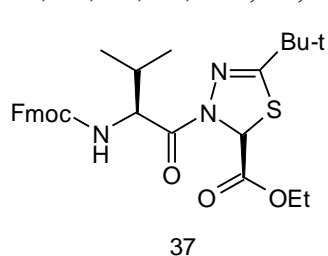


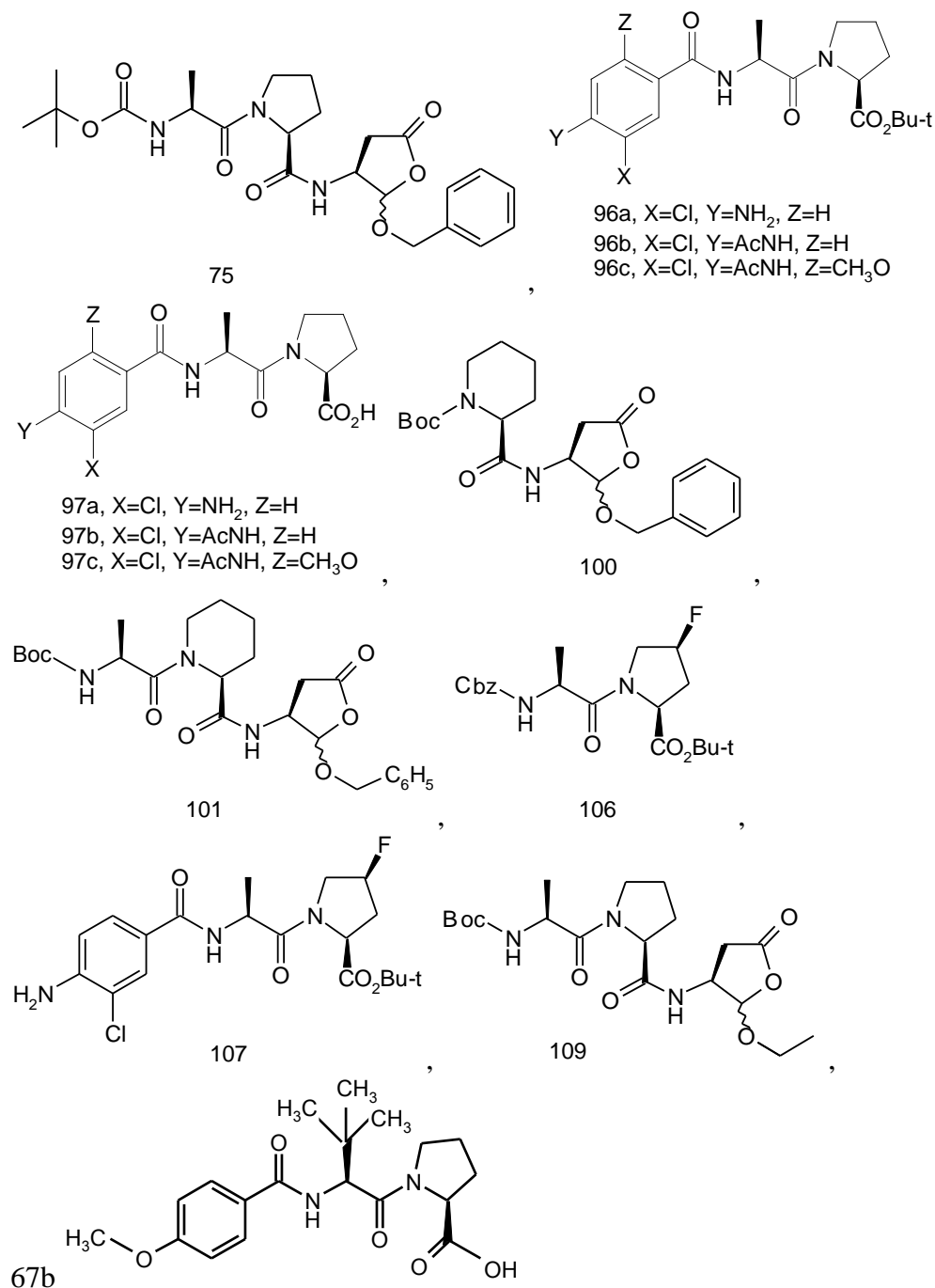
i



120a=anti
120b=syn

17. Сполука, яка вибрана з групи, що складається зі сполук 37, 38, 39, 43, 44, 49, 50, 54, 55, 58, 67, 67b, 71, 75, 96a-96c, 97a-97c, 100, 101, 106, 107 та 109:





18. Фармацевтична композиція, що містить: а) сполуку за будь-яким із пп. 1-16; і б) фармацевтично прийнятний носій, ад'ювант чи наповнювач.

19. Спосіб лікування чи профілактики захворювання, вибраного з захворювання, опосередкованого IL-1, захворювання, опосередкованого апоптозом, запального захворювання, аутоімунного захворювання, деструктивного захворювання кісток, порушення проліферації, інфекційного захворювання, дегенеративного захворювання, некротичного захворювання, захворювання, обумовленого надлишковим вживанням алкоголю, захворювання, опосередкованого вірусами, запального перитоніту, остеоартриту, панкреатиту, астми, синдрому респіраторного дистресу дорослих, гломерулонефриту, ревматоїдного артрити, системного червоного вовчака, склеродерми, хронічного тиреоїдиту, хвороби Грейвса, аутоімунного гастриту, інсулінозалежного цукрового діабету (тип I), аутоімунної геолітичної анемії, аутоімунної нейтропенії, тромбоцитопенії, хронічного активного гепатиту, псевдопаралітичної міастенії, запального захворювання кишечника, хвороби Крона, псоріазу, атрофічного дерматиту, реакції трансплантата проти хазяїна,

остеопорозу, лейкемій і споріднених ним захворювань, мієлодиспластичного синдрому, множинних порушень кісток, пов'язаних з мієломою, гострої мієлогенної лейкемії, хронічної мієлогенної лейкемії, метастазуючої меланоми, саркоми Капоші, множинної мієломи, сепсису, септичного шоку, шигельозу, хвороби Альцгеймера, хвороби Паркінсона, ішемії головного мозку, ішемії міокарда, атрофії спінальних м'язів, множинного склерозу, енцефаліту, пов'язаного зі СНІДом, енцефаліту, пов'язаного з ВІЛ, старіння, облісіння, нейрологічного порушення, пов'язаного з крововиливом у мозок, виразкового коліту, травматичного ушкодження мозку, відторгнення трансплантованих органів, гепатиту-В, гепатиту-С, гепатиту-Г, жовтої лихоманки, лихоманки денге чи японського енцефаліту, у хворого, який включає стадію введення зазначеному хворому сполуки відповідно до будь-якого з пп. 1-16 чи фармацевтичної композиції за п. 18.

20. Спосіб за п. 19, у якому захворювання являє собою ревматоїдний артрит, запальне захворювання кишечника, хворобу Крона, виразковий коліт, запальний перитоніт, септичний шок, панкреатит, травматичне ушкодження мозку, відторгнення трансплантованих органів, остеоартрит, астму, псоріаз, хворобу Альцгеймера, атрофічний дерматит, лейкемії і споріднені ним захворювання, мієлодиспластичний синдром чи множинну мієлому.

21. Застосування сполуки за будь-яким із пп. 1-16 для виробництва ліків для лікування чи профілактики захворювання, вибраного з захворювання, опосередкованого ІІ-1, захворювання, опосередкованого апоптозом, запального захворювання, аутоімунного захворювання, деструктивного захворювання кісток, порушення проліферації, інфекційного захворювання, дегенеративного захворювання, некротичного захворювання, захворювання, обумовленого надлишковим вживанням алкоголю, захворювання, опосередкованого вірусами, запального перитоніту, остеоартриту, панкреатиту, астми, синдрому респіраторного дистресу дорослих, гломерулонефриту, ревматоїдного артрит, системного червоного вовчака, склеродерми, хронічного тиреоїдиту, хвороби Грейвса, аутоімунного гастриту, інсулінозалежного цукрового діабету (тип І), аутоімунної гемолітичної анемії, аутоімунної нейтропенії, тромбоцитопенії, хронічного активного гепатиту, псевдопаралітичної міастенії, запального захворювання кишечника, хвороби Крона, псоріазу, атрофічного дерматиту, реакції трансплантата проти хазяїна, остеопорозу, лейкемій і споріднених ним захворювань, мієлодиспластичного синдрому, множинних порушень кісток, пов'язаних з мієломою, гострої мієлогенної лейкемії, хронічної мієлогенної лейкемії, метастазуючої меланоми, саркоми Капоші, множинної мієломи, сепсису, септичного шоку, шигельозу, хвороби Альцгеймера, хвороби Паркінсона, ішемії головного мозку, ішемії міокарда, атрофії спінальних м'язів, множинного склерозу, енцефаліту, пов'язаного зі СНІДом, енцефаліту, пов'язаного з ВІЛ, старіння, облісіння, нейрологічного порушення, пов'язаного з крововиливом у мозок, виразкового коліту, травматичного ушкодження мозку, відторгнення трансплантованих органів, гепатиту-В, гепатиту-С, гепатиту-Г, жовтої лихоманки, лихоманки денге чи японського енцефаліту, у хворого.

22. Застосування фармацевтичної композиції за п. 18 для виробництва ліків для лікування чи профілактики захворювання, вибраного з захворювання, опосередкованого ІІ-1, захворювання, опосередкованого апоптозом, запального захворювання, аутоімунного захворювання, деструктивного захворювання кісток, порушення проліферації, інфекційного захворювання, дегенеративного захворювання, некротичного захворювання, захворювання, обумовленого надлишковим вживанням алкоголю, захворювання, опосередкованого вірусами, запального перитоніту, остеоартриту, панкреатиту, астми, синдрому респіраторного дистресу дорослих, гломерулонефриту, ревматоїдного артрит, системного червоного вовчака, склеродерми, хронічного тиреоїдиту, хвороби Грейвса, аутоімунного гастриту, інсулінозалежного цукрового діабету (тип І), аутоімунної гемолітичної анемії, аутоімунної нейтропенії, тромбоцитопенії, хронічного активного гепатиту, псевдопаралітичної міастенії, запального захворювання кишечника, хвороби Крона, псоріазу, атрофічного дерматиту, реакції трансплантата проти хазяїна, остеопорозу,

лейкемії і споріднених ним захворювань, мієлодиспластичного синдрому, множинних порушень кісток, пов'язаних з мієломою, гострої мієлогенної лейкемії, хронічної мієлогенної лейкемії, метастазуючої меланоми, саркоми Капоші, множинної мієломи, сепсису, септичного шоку, шигельозу, хвороби Альцгеймера, хвороби Паркінсона, ішемії головного мозку, ішемії міокарда, атрофії спінальних м'язів, множинного склерозу, енцефаліту, пов'язаного зі СНІДом, енцефаліту, пов'язаного з ВІЛ, старіння, облісіння, неврологічного порушення, пов'язаного з крововиливом у мозок, виразкового коліту, травматичного ушкодження мозку, відторгнення трансплантованих органів, гепатиту-В, гепатиту-С, гепатиту-Г, жовтої лихоманки, лихоманки денге чи японського енцефаліту, у хворого.

23. Застосування за п. 21, у якому захворювання являє собою ревматоїдний артрит, запальне захворювання кишечника, хворобу Крона, виразковий коліт, запальний перитоніт, септичний шок, панкреатит, травматичне ушкодження мозку, відторгнення трансплантованих органів, остеоартрит, астму, псоріаз, хворобу Альцгеймера, атрофічний дерматит, лейкемії і споріднені ним захворювання, мієлодиспластичний синдром чи множинну мієлому.

24. Застосування за п. 22, у якому захворювання являє собою ревматоїдний артрит, запальне захворювання кишечника, хворобу Крона, виразковий коліт, запальний перитоніт, септичний шок, панкреатит, травматичне ушкодження мозку, відторгнення трансплантованих органів, остеоартрит, астму, псоріаз, хворобу Альцгеймера, атрофічний дерматит, лейкемії і споріднені ним захворювання, мієлодиспластичний синдром чи множинну мієлому.