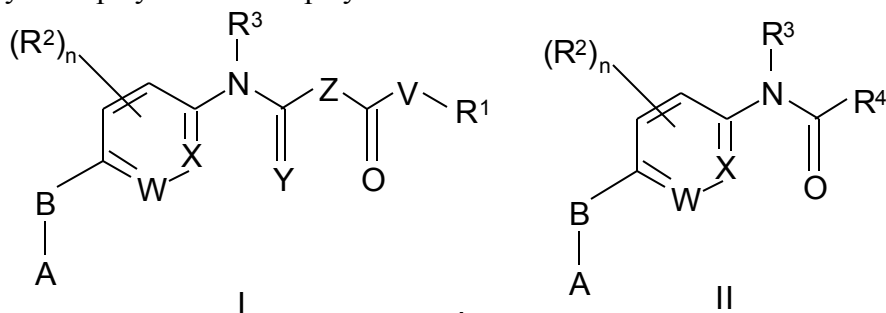


1. Сполука Формули I або Формули II:



або її енантіомер, діастереомер, гідрат, сольват або фармацевтично прийнятна сіль, де:

$R^1$  являє собою H, алкіл, заміщений алкіл, циклоалкіл, заміщений циклоалкіл, арилалкіл, заміщений арилалкіл, арил, заміщений арил, алкеніл, заміщений алкеніл, алкініл, заміщений алкініл, гетероарил, заміщений гетероарил, гетероцикло, заміщений гетероцикло, гетероарилалкіл, заміщений гетероарилалкіл, гетероциклоалкіл або заміщений гетероциклоалкіл;

кожен  $R^2$  незалежно являє собою H, галоген, ціано,  $\text{NO}_2$ ,  $\text{OR}^5$ ,  $\text{NR}^6\text{R}^7$ , алкіл, заміщений алкіл, циклоалкіл, заміщений циклоалкіл, арил, заміщений арил, гетероарил, заміщений гетероарил, гетероцикло, заміщений гетероцикло, арилалкіл, заміщений арилалкіл, гетероциклоалкіл або заміщений гетероциклоалкіл;

B являє собою O,  $\text{NR}^8$ ,  $\text{NR}^8\text{CH}_2$ , S, SO,  $\text{SO}_2$  або  $\text{CR}^9\text{R}^{10}$ ;

V являє собою  $\text{NR}^{11}$  або  $-(\text{CR}^{37}\text{R}^{38})_p-$  за умови, що якщо  $\text{VR}^{11}$  являє собою N,  $R^1$  являє собою алкіл або циклоалкіл;

кожен з W та X незалежно являє собою C або N;

Y вибраний з O, S та  $\text{NR}^{12}$ ;

Z являє собою  $-\text{CR}^{13}\text{R}^{14}-$  або  $-(\text{CR}^{13}\text{R}^{14})_i\text{NR}^{15}-$ ;

i дорівнює цілому числу від 0 до 2;

p дорівнює цілому числу від 0 до 4, якщо W та X обидва являють собою C, від 0 до 3, якщо один з X або W являє собою N, та від 0 до 2, якщо X та W обидва являють собою N;

r дорівнює цілому числу від 1 до 4;

$R^3$ ,  $R^5$ ,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^8$ ,  $R^{11}$  та  $R^{15}$  незалежно вибрані з наступного: H, алкіл, заміщений алкіл, алкеніл, заміщений алкеніл, алкініл, заміщений алкініл, циклоалкіл, заміщений циклоалкіл, арил, заміщений арил, гетероарил, заміщений гетероарил, гетероцикло, заміщений гетероцикло;

$R^4$  вибраний з наступного: арил, заміщений арил, гетероарил, заміщений гетероарил, гетероциклоалкіл та заміщений гетероциклоалкіл, за умови, що

(a) якщо  $R^4$  являє собою феніл;

(i)  $R^4$  не є заміщеним гідрокси та амідом; та

(ii)  $R^4$  не є заміщеним  $-\text{NRSO}_2\text{R}-$ , де R являє собою алкіл або арил;

(b) якщо  $R^4$  являє собою піридил,  $R^4$  не є заміщеним гідрокси та метокси; та

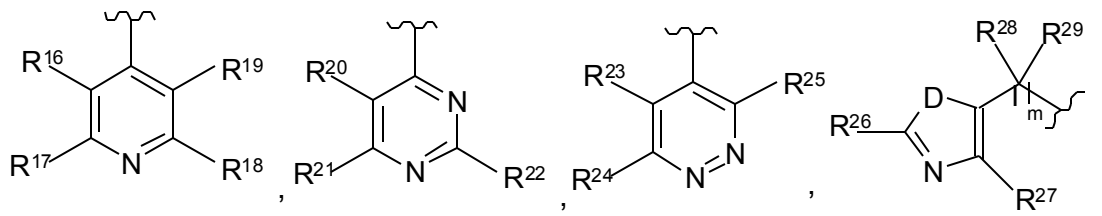
(c) якщо  $R^4$  являє собою піримідиніл, він не є заміщеним  $=\text{O}$ ;

$R^9$  та  $R^{10}$  незалежно вибрані з наступного: H, галоген, алкіл, заміщений алкіл, циклоалкіл, заміщений циклоалкіл, арил, заміщений арил, гетероарил, заміщений гетероарил, гетероциклоалкіл або заміщений гетероциклоалкіл;

$R^{12}$  вибраний з наступного: H, алкіл, заміщений алкіл, алкеніл, заміщений алкеніл, алкініл, заміщений алкініл, CN,  $\text{NO}_2$  або  $\text{SO}_2\text{NH}_2$ ;

$R^{13}$  та  $R^{14}$  незалежно вибрані з наступного: H, галоген, алкіл, заміщений алкіл, алкеніл, заміщений алкеніл, алкініл, заміщений алкініл, циклоалкіл, заміщений циклоалкіл, арил, заміщений арил, гетероарил, заміщений гетероарил, гетероциклоалкіл, заміщений гетероциклоалкіл або разом утворюють карбоциклічне або гетероциклічне кільце, що містить від 3 до 8 атомів;

A вибраний як одне з наступного:



де

D являє собою S або O;

m дорівнює числу від 0 до 6;

$R^{16}$ ,  $R^{17}$ ,  $R^{18}$ ,  $R^{19}$ ,  $R^{20}$ ,  $R^{21}$ ,  $R^{22}$ ,  $R^{23}$ ,  $R^{24}$ ,  $R^{25}$ ,  $R^{26}$  та  $R^{27}$  незалежно вибрані з наступного: H, галоген,  $NR^{30}R^{31}$ ,  $OR^{32}$ ,  $CO_2R^{33}$ ,  $CONR^{34}R^{35}$ ,  $SO_2R^{36}$ , алкіл, заміщений алкіл, циклоалкіл, заміщений циклоалкіл, алкеніл, заміщений алкеніл, алкініл, заміщений алкініл, -CN, арил, заміщений арил, гетероарил, заміщений гетероарил, гетероциклоалкіл або заміщений гетероциклоалкіл;

$R^{28}$  та  $R^{29}$  незалежно вибрані з наступного: H, алкіл, заміщений алкіл, циклоалкіл, заміщений циклоалкіл, арил, заміщений арил або разом утворюють карбоциклічне або гетероциклічне кільце, що містить від 3 до 8 атомів;

$R^{30}$ ,  $R^{31}$ ,  $R^{32}$ ,  $R^{33}$ ,  $R^{34}$ ,  $R^{35}$  та  $R^{36}$  незалежно вибрані з наступного: H, алкіл, заміщений алкіл, алкеніл, заміщений алкеніл, алкініл, заміщений алкініл, циклоалкіл, заміщений циклоалкіл, алкоксикарбоніл, арил, заміщений арил, гетероарил, заміщений гетероарил, гетероцикло, заміщений гетероцикло, гетероциклоалкіл або заміщений гетероциклоалкіл; та кожен з  $R^{37}$  та  $R^{38}$  незалежно являє собою H, галоген або алкіл.

2. Сполука за п. 1, яка **відрізняється** тим, що  $R^1$  являє собою заміщений або незаміщений феніл, заміщений або незаміщений  $C_1$ - $C_4$  алкіл або заміщений або незаміщений  $C_3$ - $C_8$  циклоалкіл.

3. Сполука за п. 2, яка **відрізняється** тим, що  $R^1$  являє собою фторфеніл, заміщений метил, циклогексил або цикlopентил.

4. Сполука за п. 1, яка **відрізняється** тим, що  $R^2$  являє собою  $C_1$ - $C_4$  алкіл, галоген або галогеналкіл.

5. Сполука за п. 1, яка **відрізняється** тим, що  $R^4$  являє собою необов'язково заміщений феніл, піридинон, піридил, піридил-N-оксид, піразоліл або піролідил.

6. Сполука за п. 5, яка **відрізняється** тим, що  $R^4$  заміщений киснем, фенілом,  $C_1$ - $C_4$  алкілом або галогеном.

7. Сполука за п. 1, яка **відрізняється** тим, що B являє собою O,  $NHCH_2$ ,  $CH_2$  або  $CH(OH)$ ; Y являє собою O або S та Z являє собою  $-CR^{13}R^{14}$  або  $-NR^{15}$ , де  $R^{13}$ , кожен з  $R^{14}$  та  $R^{15}$  являє собою H.

8. Сполука за п. 1, яка **відрізняється** тим, що A являє собою необов'язково заміщений піридин або піримідин.

9. Сполука за п. 8, яка **відрізняється** тим, що замісник являє собою алкіл, алкеніл, алкініл, галоген, циклоалкіл, гетероциклоалкіл,  $-NR^{39}COR^{40}$ ,  $-NR^{39}C(O)_2R^{40}$ ,  $-NR^{41}R^{42}$  або  $-C(O)NR^{43}R^{44}$ , де  $R^{39}$ ,  $R^{40}$ ,  $R^{41}$ ,  $R^{42}$ ,  $R^{43}$  та  $R^{44}$  незалежно являють собою H, нижчий алкіл, заміщений нижчий алкіл, гідроксialкіл, аміноалкіл, циклоалкіл, заміщений циклоалкіл, гетероциклоалкіл, заміщений гетероциклоалкіл, циклоалкеніл, заміщений циклоалкеніл, арил, заміщений арил, гетероарил, заміщений гетероарил або  $-NR^{43}R^{44}$  утворюють гетероциклоалкіл.

10. Сполука за п. 7, яка **відрізняється** тим, що A являє собою піридин, заміщений  $-NR^{41}R^{42}$ ,  $-NR^{39}COR^{40}$ ,  $-C(O)NR^{43}R^{44}$ , галоген,  $C_1$ - $C_4$  алкіл,  $-C=C-R^{45}$ ,  $-C\equiv C-R^{46}$ , арил або гетероарил, де  $R^{45}$  та  $R^{46}$  являють собою алкіл, гідроксialкіл, аміноалкіл, циклоалкіл, гетероциклоалкіл,  $-C(O)R^{47}$ ,  $-NR^{39}COR^{40}$ , арил або гетероарил.

11. Сполука за п. 10, яка **відрізняється** тим, що вказаний  $C_1$ - $C_4$  алкіл є заміщеним гідрокси, гідроксialкіламіно, алкіламіно, аміноалкіламіно або гетероарил алкілом.

12. Сполука за п. 8, яка **відрізняється** тим, що кожен з  $R^{41}$  та  $R^{42}$  незалежно являє собою H, метил, етил, пропіл, бутіл, феніл або бензил та  $R^{39}$  являє собою H та  $R^{40}$  являє собою метил, циклоалкіл або гетероциклоалкіл.

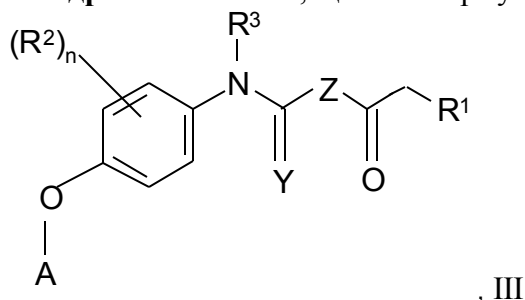
13. Сполука за п. 8, яка **відрізняється** тим, що  $R^{43}$  та  $R^{44}$  являють собою Н та кожен з  $R^{45}$  та  $R^{46}$  являє собою циклогексен, азетидин, піперазин, піперидин, піролідин або піридин, необов'язково заміщений  $C_1$ - $C_4$  алкілом,  $-CH_2NH_2$ ,  $-NH_2$  або піролідином.

14. Сполука за п. 8, яка **відрізняється** тим, що піридин заміщений фенільною групою, яка необов'язково є заміщеною  $CONH_2$ , метилом, аміноетилом, гідроксїєтилом,  $-CONHCH_2CH_2NHCH$  або  $CH_2CONH_2$ ; піридином або піперазином.

15. Сполука за п. 8, яка **відрізняється** тим, що А являє собою піримідин, заміщений with- $NR^{41}R^{42}$  або  $-NR^{39}CO_2R^{40}$ .

16. Сполука за п. 15, яка **відрізняється** тим, що  $R^{41}$  та  $R^{42}$  являють собою Н або метил та  $R^{39}$  та  $R^{40}$  незалежно являють собою Н або алкіл.

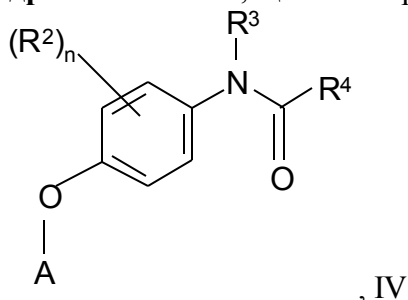
17. Сполука за п. 1, яка **відрізняється** тим, що має Формулу III:



де  $R^1$  являє собою необов'язково заміщений феніл або алкіл; Z являє собою NH або  $NCH_3$ ;  $R^2$  являє собою F, Cl,  $CH_3$  або  $CF_3$ ;  $R^3$  являє собою Н; та Y являє собою О або S.

18. Сполука за п. 17, яка **відрізняється** тим, що  $R^1$  являє собою  $C_3$ - $C_7$  циклоалкіл, заміщений або незаміщений феніл або  $-(CH_2)_n-R^{50}$ , де n дорівнює цілому числу від 1 до 3,  $R^{50}$  являє собою Н, заміщений або незаміщений феніл, аміно, амідно, CN,  $-C(O)_2H$  або  $-C(O)_2CH_3$ .

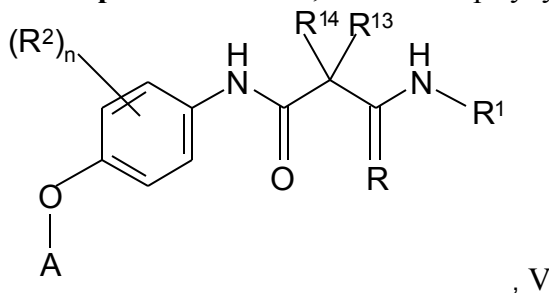
19. Сполука за п. 1, яка **відрізняється** тим, що має Формулу IV:



де  $R^2$  являє собою галоген або Н;  $R^3$  являє собою Н;  $R^4$  являє собою необов'язково заміщений феніл, необов'язково заміщений піразол або необов'язково заміщений піридил; та А являє собою необов'язково заміщений піридил.

20. Сполука за п. 19, яка **відрізняється** тим, що  $R^4$  являє собою необов'язково заміщений піридинон або піридин-N-оксид.

21. Сполука за п. 1, яка **відрізняється** тим, що має Формулу V:



де  $R^1$  являє собою необов'язково алкіл або циклоалкіл; А являє собою необов'язково заміщений піримідин або піридин; та  $R^2$  являє собою галоген або Н; та  $R^{13}$  та  $R^{14}$  або являють собою Н, або разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, утворюють циклопропіл.

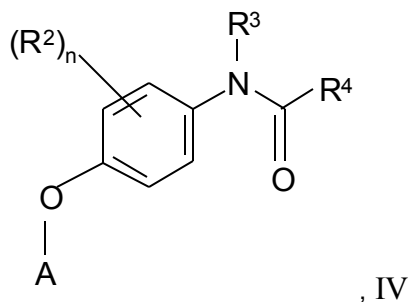
22. Сполука за п. 1, яка **відрізняється** тим, що має значення  $IC_{50}$  менше приблизно

1,0 $\mu$  M.

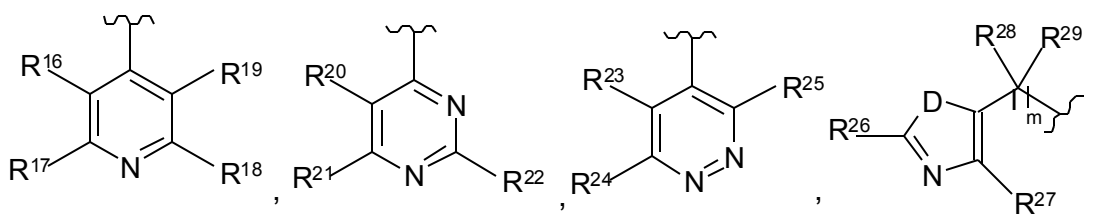
23. Спосіб лікування раку у пацієнта, який потребує такого лікування, який **відрізняється** тим, що включає введення пацієнту терапевтично ефективної кількості сполуки за п. 1.

24. Фармацевтична композиція, яка **відрізняється** тим, що містить терапевтично ефективну кількість сполуки за п. 1 та фармацевтично прийнятний носій.

25. Сполука Формули IV:



де А є



де

$R^{16}$ ,  $R^{17}$ ,  $R^{18}$ ,  $R^{19}$ ,  $R^{20}$ ,  $R^{21}$ ,  $R^{22}$ ,  $R^{23}$ ,  $R^{24}$ ,  $R^{25}$ ,  $R^{26}$  та  $R^{27}$  незалежно вибрані з наступного: H, галоген,  $NR^{30}R^{31}$ ,  $OR^{32}$ ,  $CO_2R^{33}$ ,  $CONR^{34}R^{35}$ ,  $SO_2R^{36}$ , алкіл, заміщений алкіл, циклоалкіл, заміщений циклоалкіл, алкеніл, заміщений алкеніл, алкініл, заміщений алкініл, -CN, арил, заміщений арил, гетероарил, заміщений гетероарил, гетероциклоалкіл або заміщений гетероциклоалкіл;

$R^{28}$  та  $R^{29}$  незалежно вибрані з наступного: H, алкіл, заміщений алкіл, циклоалкіл, заміщений циклоалкіл, арил, заміщений арил або разом утворюють карбоциклічне або гетероциклічне кільце, що містить від 3 до 8 атомів;

$R^2$  являє собою галоген або H;

$R^3$  являє собою H; та

$R^4$  являє собою необов'язково заміщений феніл, необов'язково заміщений піразол або необов'язково заміщений піридил, піридинон, або піридин-N-оксид.