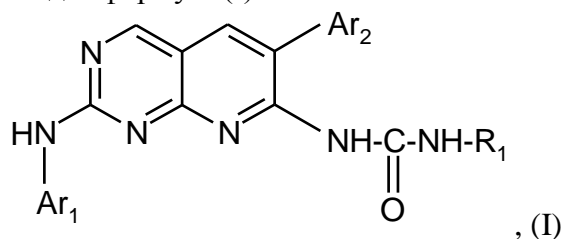


1. Сполука, що відповідає формулі (I):

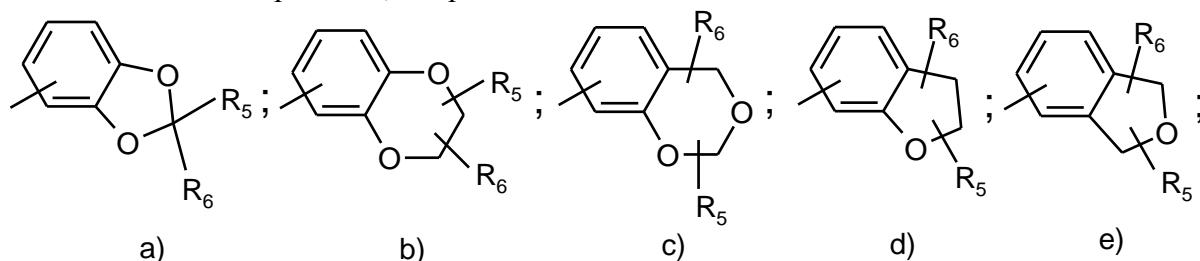


в якій:

-  $R_1$  вибраний із групи, яка складається з  $(C_1-C_6)$ алкілу,  $(C_3-C_7)$ циклоалкілу,  $CH_2COR_4$ , фенілу або фенілу, заміщеного гідроксилом і/або галогеном, і/або  $(C_1-C_6)$ алкілом;

-  $R_4$  означає гідроксильну групу,  $(C_1-C_4)$ алкоксигрупу, аміногрупу,  $(C_1-C_4)$ алкіламіногрупу, ді $(C_1-C_4)$ алкіламіногрупу;

-  $Ar_1$  означає радикал, вибраний із:



-  $R_5$  означає ціаногрупу, гідроксі $(C_1-C_4)$ алкіл,  $(C_1-C_6)$ алкоксі $(C_1-C_6)$ алкіл або групу  $(CH_2)_nNR_7R_8$ ,  $CO_2R_7$ ,  $CONHNR_7R_8$ ,  $CONR_7R_8$ ,  $CONR_8OR_9$ ,  $(CH_2)_nNR_7COR_8$ ,  $(CH_2)_nNR_7COOR_8$ ;

-  $R_6$  означає атом водню,  $(C_1-C_4)$ алкіл або одне із значень  $R_5$ ; або

-  $R_5$  і  $R_6$ , такі як визначені перед цим, пов'язані разом з утворенням циклу, від чотиричленного до семичленного, що містить від 0 до 2 гетероатомів, вибраних із N і O, причому зазначений цикл, що складається із 4-7 ланок, може бути заміщений одним або декількома замісниками, незалежно вибраними з наступних груп: галоген,  $(C_1-C_4)$ алкіл, галогенований  $(C_1-C_4)$ алкіл, гідроксі $(C_1-C_4)$ алкіл,  $(C_1-C_4)$ алкоксі $(C_1-C_4)$ алкіл,  $(CH_2)_mNR_7R_8$ , трет-бутоксикарбоніль;

-  $R_7$  і  $R_8$  означають, кожен незалежно один від іншого, замісник, вибраний із наступних: H,  $(C_1-C_4)$ алкіл,  $(C_1-C_4)$ алкіл-OH,  $(C_3-C_7)$ циклоалкіл,  $(C_3-C_7)$ циклоалкіл- $NH_2$ ,  $(C_1-C_4)$ алкіл- $(C_3-C_7)$ циклоалкіл,  $C(=NH)NH_2$ ,  $SO_2(C_1-C_6)$ алкіл,  $SO_2$ -феніл,  $R_8$  може також означати трет-бутоксикарбонільну групу або бензилоксикарбонільну групу; або

-  $R_7$  і  $R_8$  разом з атомом азоту, з яким вони зв'язані, утворюють радикал азетидиніл, піролідиніл, піперидиніл, піперазиніл або морфолініл, причому зазначений радикал є незаміщеним або заміщеним, один або декілька разів,  $(C_1-C_6)$ алкілом,  $(C_1-C_4)$ алкіл-OH,  $COO(C_1-C_6)$ алкілом, F;

-  $R_9$  означає атом водню або  $(C_1-C_4)$ алкіл;

-  $Ar_2$  означає фенільну групу, незаміщену або заміщену від 1 до 5 разів однаковими або різними замісниками, вибраними з атома галогену,  $(C_1-C_4)$ алкільної групи, трифторметильної групи або  $(C_1-C_4)$ алкоксигрупи;

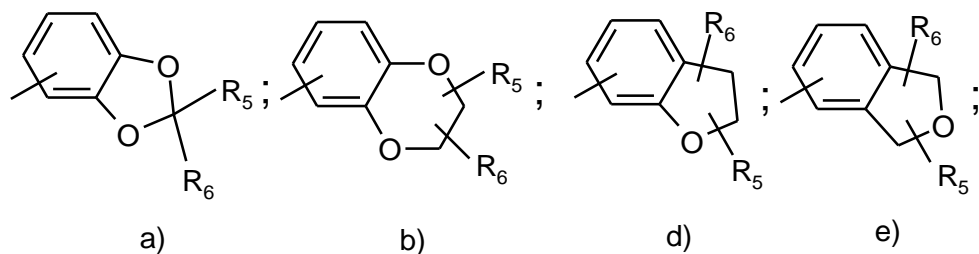
- n означає 1, 2 або 3;

- m означає 0, 1, 2 або 3.

2. Сполука формули (I) за п. 1, яка **відрізняється** тим, що:

-  $R_1$  означає трет-бутил, етил або феніл; і/або

- Ar означає радикал, вибраний із:



-  $R_5$  означає групу  $(CH_2)_nNR_7R_8$ ,  $CONHNR_7R_8$ ,  $CONR_7R_8$ , гідроксі $(C_1-C_4)$ алкіл або  $(CH_2)_nNR_7COR_8$ ; і/або

-  $R_6$  означає атом водню, метил або групу  $(CH_2)_nNR_7R_8$ , або гідроксиметил; і/або

-  $Ar_2$  означає фенільну групу, заміщену 1-2 замісниками, незалежно вибраними з галогену,  $(C_1-C_4)$ алкілу,  $(C_1-C_4)$ алкоксигрупи;

-  $n$ ,  $R_7$  і  $R_8$  такі, як визначені перед цим для сполук формули (I);

у формі основи або солі приєднання з кислотою, а також у формі гідрату або сольвату.

3. Сполука за будь-яким із попередніх пунктів, яка **відрізняється** тим, що  $R_5$  вибраний із  $(CH_2)_nNR_7R_8$ ,  $CONR_7R_8$  і  $(CH_2)_nNR_7COR_8$ .

4. Сполука за будь-яким із попередніх пунктів, яка **відрізняється** тим, що вона знаходиться у формі:

нехіральний або

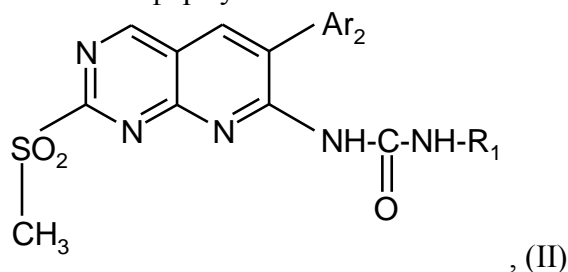
рацемічний, або

збагачений одним стереоізомером, або

збагачений одним енантіомером;

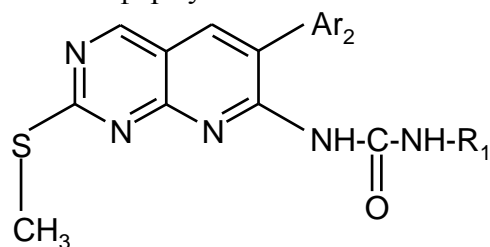
і тим, що вона може бути сольватована або гідратована, і тим, що вона може бути перетворена у сіль.

5. Проміжний продукт синтезу для одержання продуктів згідно з будь-яким із пп. 1-4, який відповідає наступній загальній формулі:



в якій  $R_1$  і  $Ar_2$  такі, як визначено в одному з пп. 1-4.

6. Проміжний продукт синтезу для одержання продуктів згідно з будь-яким із пп. 1-5, який відповідає наступній загальній формулі:

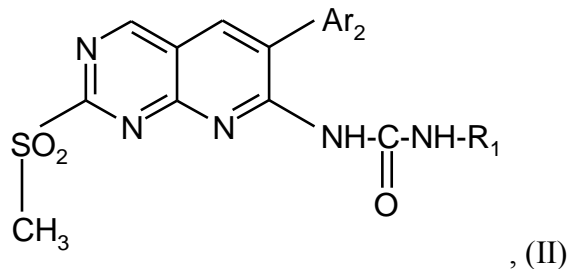


в якій  $R_1$  і  $Ar_2$  такі, як визначено в одному з пп. 1-5.

7. Проміжний продукт синтезу за п. 5 або п. 6, який **відрізняється** тим, що замісник  $Ar_2$  вибраний із наступних: феніл, 2-метоксифеніл, 2,6-дихлорфеніл, 3,5-диметоксифеніл, 3,4-диметоксифеніл, 2,6-дибромфеніл, 2-бром-6-хлорфеніл, 2,4-дихлорфеніл і 3,5-дихлорфеніл.

8. Проміжний продукт синтезу за п. 5 або п. 6, який **відрізняється** тим, що замісник  $R_1$  вибраний із наступних: етил, трет-бутил і феніл.

9. Спосіб одержання сполуки формули (I) за будь-яким із пп. 1-3, який **відрізняється** тим, що вводять у реакцію зі сполукою формули:



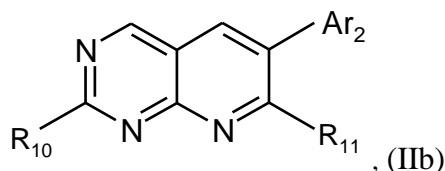
в якій  $R_1$  і  $Ar_2$  такі, як визначені для сполуки формули (I), амін формули



в якій  $Ar'_1$  являє собою  $Ar_1$ , такий як визначений для (I); за необхідності перетворюють групу  $Ar'_1$  сполуки, одержаної таким чином, у групу  $Ar_1$ .

10. Спосіб одержання сполуки формули (I) за будь-яким із пп. 1-3, який **відрізняється** тим, що вводять у реакцію:

i) сполуку формули:



в якій  $Ar_2$  має значення, визначені для сполуки формули (I);

$R_{10}$  означає групу, що видаляється, таку як (a) галоген, зокрема Cl або Br, або (b) алкіл- $S(O)_m$ -, в якій  $m=0, 1$  або  $2$ ; в якій  $R_{11}$  означає  $NHC(=R_{12})-NH-R_1$ , з  $R_{12}=O$  або  $S$ ; і

ii) амін формули



в якій  $Ar'_1$  являє собою  $Ar_1$ , такий як визначений для сполуки формули (I); за необхідності перетворюють групу  $Ar'_1$  сполуки, одержаної таким чином, у групу  $Ar_1$ ; в якому:

(a) коли  $R_{10}$  являє собою галоген або алкіл- $S(O)_m$ - з  $m=2$ , реакцію здійснюють у розчиннику, переважно полярному:

(i) наприклад, тетрагідрофурані, диметилсульфоксиді або етанолі, у відомих випадках, у присутності слідової кількості кислоти, такої як соляна кислота; або

(ii) у диметилсульфоксиді в присутності сильної основи, такої як  $t\text{-BuOK}$ ;

при температурі, що знаходиться в інтервалі від кімнатної температури до температури кипіння розчинника;

(b) коли  $R_{10}$  являє собою алкіл- $S(O)_m$ - з  $m=0$  або  $1$ , реакцію здійснюють з



у розплавленому стані при  $200\text{ }^\circ\text{C}$ ;

у разі необхідності, аміногрупи, присутні в групі  $Ar'_1$  сполуки (III), заздалегідь перетворюють у сольові або захищають.

11. Лікарський засіб, який **відрізняється** тим, що він містить сполуку формули (I) за будь-яким із пп. 1-2 або її сіль приєднання з фармацевтично прийнятною кислотою або гідратом, або сольват сполуки формули (I).

12. Фармацевтична композиція, яка **відрізняється** тим, що містить сполуку формули (I) за будь-яким із пп. 1-3 або фармацевтично прийнятну сіль, гідрат або сольват згаданої сполуки, а також принаймні один фармацевтично прийнятний ексципієнт.

13. Фармацевтична композиція за п. 12, яка **відрізняється** тим, що вона додатково містить один (або декілька) інший(их) цитостатично(их) активний(их) компонент (компонентів).

14. Застосування сполуки формули (I) за будь-яким із пп. 1-3 для одержання лікарського засобу, призначеного для лікування і профілактики захворювань, що викликаються або загострюються проліферацією клітин.

15. Застосування за п. 14 для профілактики і лікування лейкозу, первинних і метастатичних солідних пухлин, карцином і раку.