



УКРАЇНА

(19) **UA**

(11) **111191**

(13) **C2**

(51) МПК

C07H 17/08 (2006.01)

A61K 31/7048 (2006.01)

A61P 31/04 (2006.01)

ДЕРЖАВНА СЛУЖБА
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ
УКРАЇНИ

(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД

(21) Номер заявки: **а 2013 11232**
(22) Дата подання заявки: **20.02.2012**
(24) Дата, з якої є чинними права на винахід: **11.04.2016**
(31) Номер попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції: **2011-034578**
(32) Дата подання попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції: **21.02.2011**
(33) Код держави-учасниці Паризької конвенції, до якої подано попередню заявку: **JP**
(41) Публікація відомостей про заявку: **25.02.2014, Бюл.№ 4**
(46) Публікація відомостей про видачу патенту: **11.04.2016, Бюл.№ 7**
(86) Номер та дата подання міжнародної заявки, поданої відповідно до Договору РСТ: **РСТ/JP2012/054677, 20.02.2012**

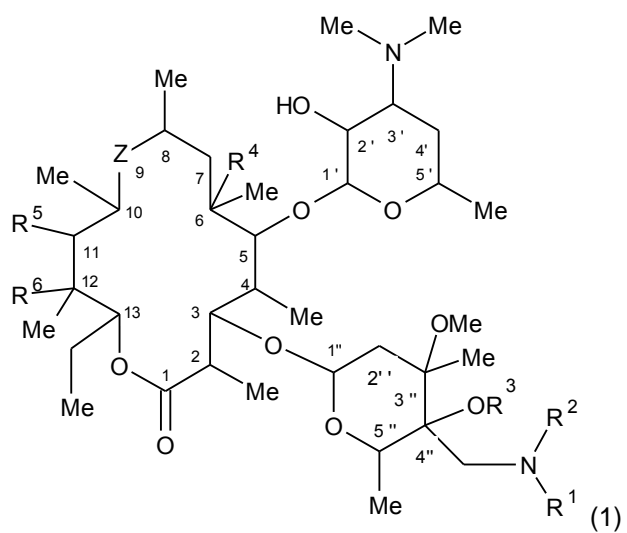
(72) Винахідник(и):
Сугімото Томохіро (JP),
Сасамото Наокі (JP),
Куросака Дзун (JP),
Хаясі Масато (JP),
Ямамото Канако (JP),
Касімура Масато (JP),
Усікі Ясунобу (JP),
Огіта Харухіса (JP),
Міура Томоакі (JP),
Канемото Кеніті (JP),
Кумура Коу (JP),
Йосіда Сатосі (JP),
Тамура Кейдзі (JP),
Сітара Єікі (JP)
(73) Власник(и):
ТАЙСО ФАРМАСЬЮТІКАЛ КО., ЛТД.,
24-1, Takada 3-chome, Toshima-ku, Tokyo
1708633, Japan (JP),
МЕЙДЗІ СЕЙКА ФАРМА КО., ЛТД.,
4-16, Kyobashi 2-chome, Chuo-Ku, Tokyo
1048002, Japan (JP)
(74) Представник:
Мошинська Ніна Миколаївна, реєстр.
№115
(56) Перелік документів, взятих до уваги експертизою:
WO 98/56801 A1, 17.12.1998
WO 2008/106224 A1, 04.09.2008
WO 98/09978 A1, 12.03.1998

(54) МАКРОЛІДНЕ ПОХІДНЕ, ЗАМІЩЕНЕ ПО С-4"-ПОЛОЖЕННЮ

(57) Реферат:

Макролідна сполука, представлена формулою (I), ефективна відносно резистентних до еритроміцину бактерій (наприклад, резистентні пневмококи, стрептококи й мікоплазми).

UA 111191 C2



Галузь техніки, до якої належить винахід

Даний винахід стосується нового антибіотика, який характеризується подібною до еритроміцину структурою. Більш конкретно, даний винахід стосується макролідної сполуки, що містить в 4"-положенні кладинози метильну групу, заміщену замісником, який містить атом азоту, і проміжного продукту його синтезу.

Передумови створення даного винаходу

Еритроміцин А являє собою антибіотик, який широко використовувався як терапевтичний засіб для лікування інфекційних захворювань, викликаних грампозитивними бактеріями, мікоплазмами й т. п. Однак еритроміцин характеризується недостатньо стійкою фармакокінетикою внаслідок його розщеплення шлунковим соком. Тому були досліджені похідні еритроміцину, які мають більшу стійкість до кислот. У результаті були розроблені макроліди, які мають стабільну фармакокінетику, такі як кларитроміцин, азитроміцин (патентні документи 1 і 2) і рокситроміцин. Вказані макролідні засоби застосовувалися в терапії респіраторних інфекційних захворювань в амбулаторних пацієнтів, а тому потрібно, щоб вони мали потужну антибактеріальну активність, особливо відносно пневмококів, стрептококів і *Haemophilus influenzae*, які часто виділяються в клініці. Крім того, оскільки в пацієнтів із набутою пневмонією дуже часто виділялися резистентні до макролідів пневмококи, украй важливим вважається той факт, що вони ефективні відносно резистентних пневмококів.

У результаті різних досліджень протягом останніх років, Agouridas et al. в 1995 році виявили HMR3647 (телітроміцин, патентний документ 3), а потім Or et al. в 1998 році виявили ABT-773 (цетроміцин, патентний документ 4), як макроліди, ефективні відносно як резистентних до еритроміцину пневмококів, так і резистентних до еритроміцину стрептококів. Потім повідомлялося про 2-фторкетолід (патентний документ 5), ефективність якого була ще більш посилена.

Однак більша частина макролідних сполук, що містять в 4"-положенні кладинози метильну групу, заміщену замісником, який містить атом азоту, являють собою сполуки азалідного типу, які структурно характеризуються наявністю атома азоту в лактоновому кільці (патентний документ 6), і майже не повідомлялося про сполуки, що характеризуються структурою, відмінною від азалідної.

Документи попереднього рівня техніки

Патентні документи

Патентний документ 1: Патент США № 4474768

Патентний документ 2: Патент США № 4517359

Патентний документ 3: EP 680967

Патентний документ 4: WO 98/09978

Патентний документ 5: WO 02/32919

Патентний документ 6: WO 98/56801

Розкриття даного винаходу

Мета, поставлена в даному винаході

Метою даного винаходу є надання структурно нової сполуки, яка є ефективною відносно резистентних до еритроміцину бактерій (наприклад, резистентні пневмококи, стрептококи й мікоплазми), а також відносно бактерій, традиційно чутливих до еритроміцину.

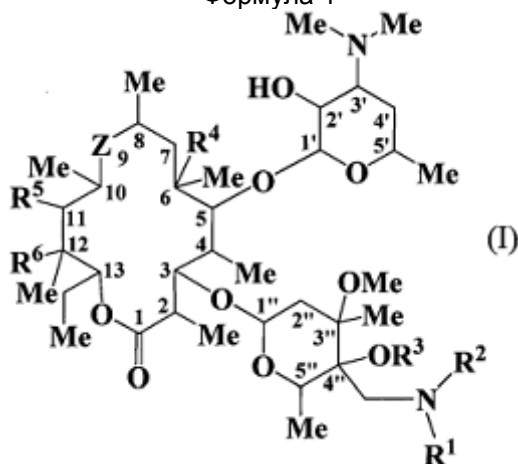
Засоби досягнення поставленої мети

Автори даного винаходу провели різні дослідження нових макролідних сполук, і в результаті виявили, що описані нижче сполуки мають поліпшену антибактеріальну активність, оформивши тим самим даний винахід.

Таким чином, даний винахід надає:

(1) Сполуку, представлену наступною формулою (I):

Формула 1



де у формулі

Me являє собою метильну групу,

5 R^1 являє собою атом водню, C_{1-6} алкільну групу (C_{1-6} алкільна група може бути заміщена одним або двома замісниками, вибраними з гідроксигрупи, C_{1-6} алкоксигрупи, аміногрупи, C_{1-6} алкіламіногрупи й групи, представленої формулою $-NR^{78}COR^{79}$ або формулою $-NR^{80}SO_2R^{81}$, де R^{78} і R^{80} , які можуть бути однаковими або різними, являють собою атом водню або C_{1-6} алкільну групу, і де R^{79} і R^{81} , які можуть бути однаковими або різними, являють собою C_{1-6} алкільну групу) або C_{1-6} алкілсульфонільну групу,

10 R^2 являє собою атом водню, 4-8-членну насичену гетероциклічну групу (насичена гетероциклічна група може бути заміщена одним або двома замісниками, вибраними з C_{7-12} аралкільної групи й C_{1-6} алкільної групи), C_{1-6} алканойльну групу (C_{1-6} алканойльна група може бути заміщена аміногрупою або C_{1-6} алкіламіногрупою) або C_{1-6} алкільну групу, яка може бути заміщена 1-3 замісниками, вибраними із групи замісників 1, або

15 R^1 і R^2 можуть бути об'єднані разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, з утворенням 4-8-членної насиченої азотовмісної гетероциклічної групи (насичена азотовмісна гетероциклічна група може бути заміщена 1-3 замісниками, вибраними з гідроксигрупи, аміногрупи, C_{1-6} алкіламіногрупи й C_{1-6} алкільної групи (C_{1-6} алкільна група може бути заміщена аміногрупою або C_{1-6} алкіламіногрупою)),

20 група замісників 1 являє собою групу, яка складається з C_{1-6} алкілсульфонільної групи, C_{1-6} алкоксигрупи, C_{3-6} циклоалкільної групи, гідроксигрупи, фенільної групи (фенільна група може бути заміщена 1-3 C_{1-6} алкоксигрупами), 4-8-членної насиченої гетероциклічної групи (насичена гетероциклічна група може бути заміщена 1-3 C_{1-6} алкільними групами), і групу, представлену формулою $-CONR^7R^8$, формулою $-SO_2NR^9R^{10}$, формулою $-NR^{11}COR^{12}$, формулою $-NR^{13}CO_2R^{14}$, формулою $-NR^{15}SO_2R^{16}$ або формулою $-NR^{17}R^{18}$,

25 R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , R^{11} , R^{13} , R^{14} і R^{15} , які можуть бути однаковими або різними, являють собою атом водню або C_{1-6} алкільну групу,

30 R^{12} являє собою фенільну групу (фенільна група може бути заміщена 1-3 C_{1-6} алкоксигрупами),

R^{16} являє собою C_{1-6} алкільну групу або фенільну групу (фенільна група може бути заміщена 1-3 C_{1-6} алкоксигрупами),

35 R^{17} і R^{18} , які можуть бути однаковими або різними, являють собою атом водню, C_{1-6} алкільну групу (C_{1-6} алкільна група може бути заміщена 1-3 замісниками, вибраними з гідроксигрупи, C_{1-6} алкоксигрупи й C_{3-6} циклоалкільної групи), C_{2-6} алкенільну групу, C_{3-6} циклоалкільну групу, C_{1-6} алканойльну групу, C_{7-12} аралкільну групу (C_{7-12} аралкільна група може бути заміщена 1-3 C_{1-6} алкоксигрупами) або гетероаралкільну групу (гетероаралкільна група може бути заміщена 1-3 C_{1-6} алкоксигрупами), або

40 R^{17} і R^{18} можуть бути об'єднані разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, з утворенням 4-8-членної насиченої азотовмісної гетероциклічної групи, яка може бути заміщена 1-3 замісниками, вибраними із групи замісників 2, або 6-членної частково насиченої азотовмісної гетероциклічної групи, яка може бути заміщена 1-3 замісниками, вибраними із групи замісників 2,

45 група замісників 2 являє собою групу, яка складається з гідроксигрупи, C_{1-6} алкоксигрупи, оксогрупи, C_{1-6} алкоксіаміногрупи, аміногрупи, C_{1-6} алкіламіногрупи, групи, представленої формулою $-CONR^{19}R^{20}$ (R^{19} і R^{20} , які можуть бути однаковими або різними, являють собою атом

водню або C_{1-6} алкільну групу), C_{1-6} галогеналкільної групи й C_{1-6} алкільної групи (C_{1-6} алкільна група може бути заміщена 1-3 замісниками, вибраними з гідроксигрупи, C_{1-6} алкоксигрупи, аміногрупи й C_{1-6} алкіламіногрупи),

R^3 являє собою атом водню, або

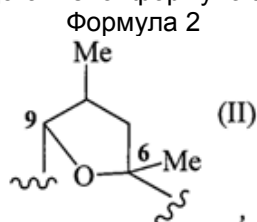
5 R^3 і R^1 можуть бути об'єднані разом з утворенням карбонільної групи,

R^4 являє собою гідроксигрупу, C_{1-6} алкоксигрупу або групу, представлену формулою $CONR^{21}R^{22}$ (R^{21} і R^{22} , які можуть бути однаковими або різними, являють собою атом водню, C_{1-6} алкільну групу або C_{2-6} алкенільну групу, заміщену однією гетероарильною групою),

10 Z являє собою групу, представлену формулою CHR^{23} (R^{23} являє собою гідроксильну групу або аміногрупу), формулою $C(=O)$ або формулою $C(=N-OR^{24})$,

R^{24} являє собою атом водню, C_{1-6} алкільну групу (C_{1-6} алкільна група може бути заміщена C_{1-6} алкоксигрупою, аміногрупою або C_{1-6} алкіламіногрупою) або 4-8-членну насичену гетероциклічну групу, або

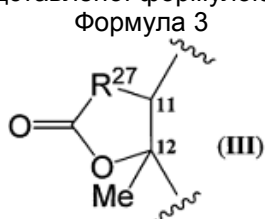
15 R^4 і Z можуть бути об'єднані разом з атомами вуглецю, до яких вони приєднані, з утворенням циклічної структури, представленної формулою (II):



20 R^5 являє собою гідроксигрупу, C_{1-6} алкоксигрупу або групу, представлену формулою $CONR^{25}R^{26}$ (R^{25} і R^{26} , які можуть бути однаковими або різними, являють собою атом водню або C_{1-6} алкільну групу),

R^6 являє собою атом водню або гідроксигрупу, або

R^5 і R^6 можуть бути об'єднані разом з атомами вуглецю, до яких вони приєднані, з утворенням циклічної структури, представленної формулою (III):



25 R^{27} являє собою атом кисню або групу, представлену формулою CHR^{28} або формулою NR^{29} , R^{28} являє собою атом водню, ціаногрупу або C_{1-6} алкілсульфанільну групу (C_{1-6} алкілсульфанільна група може бути заміщена гетероарильною групою, яка може бути заміщена однією аміногрупою),

30 R^{29} являє собою атом водню, гідроксигрупу, C_{1-6} алкоксигрупу (C_{1-6} алкоксигрупа може бути заміщена фенільною групою), 4-8-членну насичену гетероциклічну групу (насичена гетероциклічна група може бути заміщена C_{1-6} алкілсульфонільною групою або дифенілметильною групою), групу, представлену формулою $-NR^{30}R^{31}$, формулою $-NR^{32}CSNR^{33}R^{34}$, формулою $-NR^{32}CO_2R^{35}$, формулою $-NR^{32}COR^{36}$, формулою $-NR^{32}SO_2R^{37}$, формулою $-NR^{32}CONR^{38}R^{39}$, формулою $-NR^{32}SO_2NR^{40}R^{41}$ або формулою $-N=C-NR^{42}R^{43}$, або C_{1-6} алкільну групу, яка може бути заміщена 1-3 замісниками, вибраними із групи замісників 3,

R^{30} і R^{31} , які можуть бути однаковими або різними, являють собою атом водню або C_{1-6} алкільну групу (C_{1-6} алкільна група може бути заміщена C_{1-6} алкілсульфонільною групою, фенільною групою або гетероарильною групою),

40 R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{37} , R^{40} , R^{41} , R^{42} і R^{43} , які можуть бути однаковими або різними, являють собою атом водню або C_{1-6} алкільну групу,

R^{35} являє собою атом водню, C_{1-6} алкільну групу або C_{7-12} аралкільну групу,

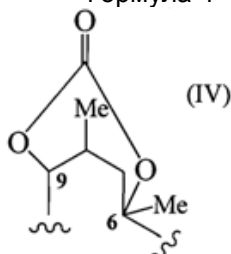
R^{36} являє собою атом водню, C_{1-6} алкільну групу (C_{1-6} алкільна група може бути заміщена C_{1-6} алкілсульфонільною групою) або C_{7-12} аралкільну групу,

45 R^{38} і R^{39} , які можуть бути однаковими або різними, являють собою атом водню, C_{1-6} алкільну групу (C_{1-6} алкільна група може бути заміщена C_{3-6} циклоалкільною групою), C_{2-6} алкенільну групу, C_{7-12} аралкільну групу (C_{7-12} аралкільна група може бути заміщена 1-3 замісниками, вибраними з атома галогену, C_{1-6} алкільної групи й C_{1-6} алкоксигрупи) або гетероаралкільну групу,

50 група замісників 3 являє собою групу, яка складається з гідроксигрупи, C_{1-6} алкоксигрупи, C_{3-6} циклоалкільної групи, C_{1-6} алкілсульфанільної групи, C_{1-6} алкілсульфінільної групи, C_{1-6}

₆алкілсульфонільної групи, фенільної групи, феноксигрупи, бензилоксигрупи, фенілсульфанільної групи, фенілсульфонільної групи, ціаногрупи, C₇₋₁₂аралкільної групи, 4-8-членної насиченої гетероциклічної групи (насичена гетероциклічна група може бути заміщена C₁₋₆алкілсульфонільною групою або дифенілметильною групою), гетероарильної групи (гетероарильна група може бути заміщена 1-3 замісниками, вибраними з C₁₋₆алкільної групи, C₇₋₁₂аралкільної групи, фенільної групи й гетероарильної групи) і групи, представлені формулою -NR⁴⁴CO₂R⁴⁵, формулою -OSO₂NR⁴⁶R⁴⁷, формулою -NR⁴⁹SO₂NR⁵⁰R⁵¹, формулою -CONR⁵²SO₂NR⁵³R⁵⁴, формулою -OCONR⁵⁵R⁵⁶, формулою -NR⁵⁷COR⁵⁸, формулою -CONR⁵⁹R⁶⁰, формулою -NR⁶¹CONR⁶²R⁶³, формулою -OCOR⁶⁴, формулою -SO₂NR⁶⁵R⁶⁶, формулою -NR⁶⁷SO₂R⁶⁸, формулою -NR⁶⁹R⁷⁰ або формулою CONR⁷¹SO₂R⁷², R⁴⁴ - R⁵⁷, R⁶¹, R⁶⁷, R⁷¹ і R⁷², які можуть бути однаковими або різними, являють собою атом водню або C₁₋₆алкільну групу, R⁵⁸ являє собою C₁₋₆алкільну групу, C₁₋₆галогеналкільну групу або фенільну групу, R⁵⁹ і R⁶⁰, які можуть бути однаковими або різними, являють собою атом водню, C₁₋₆алкільну групу, фенільну групу, C₇₋₁₂аралкільну групу або гетероаралкільну групу, R⁶² і R⁶³, які можуть бути однаковими або різними, являють собою атом водню або C₁₋₆алкільну групу (C₁₋₆алкільна група може бути заміщена аміногрупою або C₁₋₆алкіламіногрупою), R⁶⁴ являє собою C₁₋₆алкільну групу або фенільну групу, R⁶⁵ і R⁶⁶, які можуть бути однаковими або різними, являють собою атом водню, C₁₋₆алкільну групу або фенільну групу, R⁶⁸ являє собою C₁₋₆алкільну групу, C₁₋₆галогеналкільну групу, C₃₋₆циклоалкільну групу, фенільну групу (фенільна група може бути заміщена 1-3 замісниками, вибраними з C₁₋₆алкільної групи, C₁₋₆алкілсульфонільної групи, C₁₋₆алкоксигрупи, ціаногрупи й карбоксигрупи) або гетероарильну групу, яка може бути заміщена 1-3 C₁₋₆алкільними групами, R⁶⁹ і R⁷⁰, які можуть бути однаковими або різними, являють собою атом водню, C₁₋₆алкільну групу, фенільну групу, гетероарильну групу, яка може бути заміщена однієї ціаногрупою, C₇₋₁₂аралкільну групу або гетероаралкільну групу, або R⁶⁹ і R⁷⁰ можуть бути об'єднані разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, з утворенням 4-8-членної насиченої азотовмісної гетероциклічної групи (насичена азотовмісна гетероциклічна група може бути заміщена 1-3 замісниками, вибраними з C₁₋₆алкільної групи й оксогрупи), якщо R²⁷ являє собою атом кисню, то R⁴ і Z можуть бути об'єднані разом з атомами вуглецю, до яких вони приєднані, з утворенням циклічної структури, представлені формулою (IV):

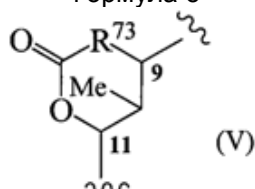
Формула 4



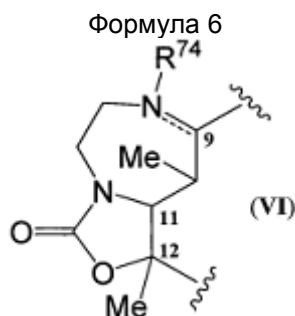
або

R⁵ і Z можуть бути об'єднані разом з одержанням циклічної структури, представлені формулою (V):

Формула 5



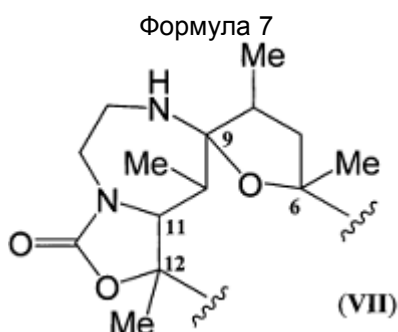
R⁷³ являє собою атом кисню або групу, представлену формулою NH, або R⁵, R⁶ і Z можуть бути об'єднані разом з одержанням циклічної структури, представлені формулою (VI):



подвійний зв'язок, що містить переривчасту лінію, являє собою простий зв'язок або подвійний зв'язок,

R^{74} існує тільки якщо подвійний зв'язок, що містить переривчасту лінію, являє собою простий зв'язок з наявністю атома водню, або

R^5 , R^6 , Z і R^4 можуть бути об'єднані разом з одержанням циклічної структури, представлені формулою (VII):



за умови, що якщо R^1 і R^3 обидва являють собою атоми водню, R^4 являє собою метоксигрупу, Z являє собою групу, представлену формулою $C(=O)$, і R^5 і R^6 обидва являють собою гідроксигрупи, то R^2 не являє собою 2-аміноетильну групу, 2-(N-2-метоксибензиламіно)етильну групу або 2-(N-ізобутил-N-метоксибензиламіно)етильну групу, або її сіль, або її гідрат або сольват.

Відповідно до переважних варіантів здійснення вищезгаданого винаходу, надані:

(2) Згадана вище сполука згідно з пунктом (1) або її сіль, або її гідрат або сольват, де R^1 являє собою атом водню, C_{1-6} алкільну групу або C_{1-6} алкілсульфонільну групу,

R^2 являє собою 4-8-членну насичену гетероциклічну групу (насичена гетероциклічна група може бути заміщена одним або двома замісниками, вибраними з C_{7-12} аралкільної групи й C_{1-6} алкільної групи), C_{1-6} алканойльну групу (C_{1-6} алканойльна група може бути заміщена аміногрупою або C_{1-6} алкіламіногрупою) або C_{1-6} алкільну групу, яка може бути заміщена 1-3 замісниками, вибраними із групи замісників 1, або R^1 і R^2 можуть бути об'єднані разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, з утворенням 4-8-членної насиченої азотовмісної гетероциклічної групи (насичена азотовмісна гетероциклічна група може бути заміщена 1-3 замісниками, вибраними з гідроксигрупи, аміногрупи, C_{1-6} алкіламіногрупи й C_{1-6} алкільної групи (C_{1-6} алкільна група може бути заміщена аміногрупою або C_{1-6} алкіламіногрупою)), і

R^{38} і R^{39} , які можуть бути однаковими або різними, являють собою атом водню, C_{1-6} алкільну групу (C_{1-6} алкільна група може бути заміщена C_{3-6} циклоалкільною групою), C_{7-12} аралкільну групу (C_{7-12} аралкільна група може бути заміщена 1-3 замісниками, вибраними з атома галогену, C_{1-6} алкільної групи й C_{1-6} алкоксигрупи) або гетероаралкільну групу;

(3) Згадана вище сполука згідно з пунктами (1) або (2) або її сіль, або її гідрат або сольват, де R^2 являє собою C_{1-6} алкільну групу, заміщену 1-3 замісниками, вибраними із групи замісників 1;

(4) Згадана вище сполука згідно з пунктами (1) або (2) або її сіль, або її гідрат або сольват, де R^2 являє собою C_{1-6} алкільну групу, заміщену 1-3 замісниками, вибраними із групи замісників 4, і група замісників 4 являє собою групу, яка складається з гідроксигрупи й групи, представлені формулою $-NR^{17}R^{18}$;

(5) Згадана вище сполука згідно з пунктом (4) або її сіль, або її гідрат або сольват, де R^{17} і R^{18} , які можуть бути однаковими або різними, являють собою атом водню або C_{1-6} алкільну групу (C_{1-6} алкільна група може бути заміщена C_{3-6} циклоалкільною групою);

(6) Згадана вище сполука згідно з будь-яким з пунктів (1)-(5) або її сіль, або її гідрат або сольват, де R^5 і R^6 утворюють разом з атомами вуглецю, до яких вони приєднані, циклічну структуру, представлену формулою (III);

5 (7) Згадана вище сполука згідно з пунктом (6) або її сіль, або її гідрат або сольват, де R^{29} являє собою групу, представлену формулою NR^{29} ;

(8) Згадана вище сполука згідно з пунктом (7) або її сіль, або її гідрат або сольват, де R^{29} являє собою атом водню, групу, представлену формулою $-NR^{30}R^{31}$, формулою $-NR^{32}CO_2R^{35}$, формулою $-NR^{32}SO_2R^{37}$, формулою $-NR^{32}CONR^{38}R^{39}$ або формулою $-NR^{32}SONR^{40}R^{41}$, або C_{1-6} алкілну групу, заміщену 1-3 замісниками, вибраними із групи замісників 3;

10 (9) Згадана вище сполука згідно з пунктом (7) або її сіль, або її гідрат або сольват, де R^{29} являє собою C_{1-6} алкілну групу, заміщену 1-3 замісниками, вибраними із групи замісників 5, і група замісників 5 являє собою групу, яка складається з гідроксигрупи, C_{1-6} алкілсульфонільної групи, 4-8-членної насиченої гетероциклічної групи (насичена гетероциклічна група може бути заміщена C_{1-6} алкілсульфонільною групою) і групи, представлені формулою $-OSO_2NR^{46}R^{47}$, формулою $-NR^{49}SO_2NR^{50}R^{51}$, формулою $-CONR^{59}R^{60}$, формулою $-SO_2NR^{65}R^{66}$, формулою $-NR^{67}SO_2R^{68}$ або формулою $-NR^{69}R^{70}$;

20 (10) Згадана вище сполука згідно з пунктом (7) або її сіль, або її гідрат або сольват, де R^{29} являє собою C_{1-6} алкілну групу, заміщену 1-3 замісниками, вибраними із групи замісників 6, і група замісників 6 являє собою групу, яка складається з C_{1-6} алкілсульфонільної групи й групи, представлені формулою $-OSO_2NR^{46}R^{47}$, формулою $-SO_2NR^{65}R^{66}$ або формулою $-NR^{67}SO_2R^{68}$;

(11) Згадана вище сполука згідно з пунктом (7) або її сіль, або її гідрат або сольват, де R^{29} являє собою C_{1-6} алкілну групу, заміщену C_{1-6} алкілсульфонільною групою;

(12) Згадана вище сполука згідно з будь-яким з пунктів (1)-(11) або її сіль, або її гідрат або сольват, де R^1 являє собою C_{1-6} алкілну групу;

25 (13) Згадана вище сполука згідно з будь-яким з пунктів (1)-(12) або її сіль, або її гідрат або сольват, де R^4 являє собою гідроксигрупу або C_{1-6} алкоксигрупу;

(14) Згадана вище сполука згідно з будь-яким з пунктів (1)-(12) або її сіль, або її гідрат або сольват, де R^4 являє собою метоксигрупу;

30 (15) Згадана вище сполука згідно з будь-яким з пунктів (1)-(14) або її сіль, або її гідрат або сольват, де R^3 являє собою атом водню;

(16) Згадана вище сполука згідно з будь-яким з пунктів (1)-(15) або її сіль, або її гідрат або сольват, де Z являє собою групу, представлену формулою $C(=O)$, або групу, представлену формулою $C(=N-OR^{24})$; і

35 (17) Згадана вище сполука згідно з будь-яким з пунктів (1)-(15) або її сіль, або її гідрат або сольват, де Z являє собою групу, представлену формулою $C(=O)$.

Згідно з іншим аспектом даного винаходу, надані:

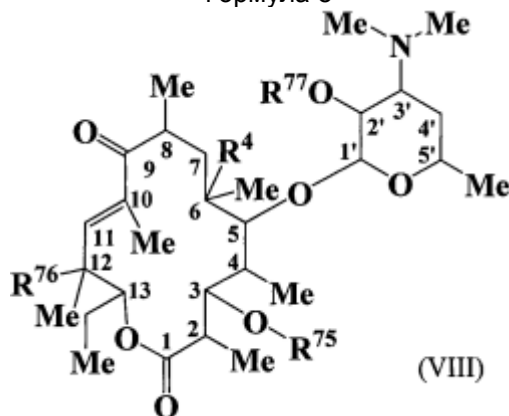
(18) Лікарський засіб, що містить як активний інгредієнт речовину, вибрану із групи, яка складається зі згаданої вище сполуки згідно з будь-яким з пунктів (1)-(17), її солі, її гідрату й сольвату; і

40 (19) Згаданий вище лікарський засіб згідно з пунктом (18), який використовують для профілактичного і/або терапевтичного лікування інфекційного захворювання.

Крім того, надана сполука, представлена наступною формулою (VIII), або її сіль, її гідрат або сольват, як проміжна сполука для одержання згаданої вище сполуки згідно з пунктом (1) або її солі, або її гідрату або сольвату.

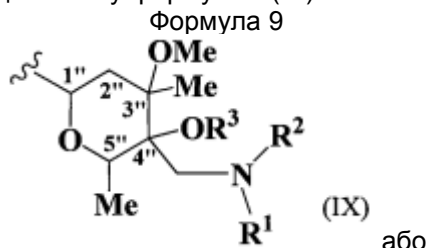
45 (20) Сполука, представлена наступною формулою (VIII):

Формула 8

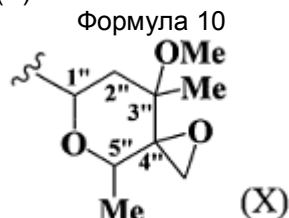


де у формулі

R^{75} являє собою групу, представлену формулою (IX):



групу, представлену формулою (X):



R^{76} являє собою гідроксигрупу або імідазолілкарбонілоксигрупу,

R^{77} являє собою атом водню або захисну групу гідроксигрупи, і

Me, R^1 , R^2 , R^3 і R^4 характеризуються тими ж значеннями, що й визначені в пункті 1, або її сіль, або її гідрат або сольват.

Відповідно до згаданих вище переважних варіантів здійснення винаходу згідно з пунктом (20), також надані згадані нижче пункти (21) і (22):

(21) Згадана вище сполука згідно з пунктом (20) або її сіль, або її гідрат або сольват, де R^1 являє собою атом водню, C_{1-6} алкільну групу або C_{1-6} алкілсульфонільну групу,

R^2 являє собою 4-8-членну насичену гетероциклічну групу (насичена гетероциклічна група може бути заміщена одним або двома замісниками, вибраними з C_{7-12} аралкільної групи й C_{1-6} алкільної групи), C_{1-6} алканоїльну групу (C_{1-6} алканоїльна група може бути заміщена аміногрупою або C_{1-6} алкіламіногрупою) або C_{1-6} алкільну групу, яка може бути заміщена 1-3 замісниками, вибраними із групи замісників 1, або

R^1 і R^2 можуть бути об'єднані разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, з утворенням 4-8-членної насиченої азотовмісної гетероциклічної групи (насичена азотовмісна гетероциклічна група може бути заміщена 1-3 замісниками, вибраними з гідроксигрупи, аміногрупи, C_{1-6} алкіламіногрупи й C_{1-6} алкільної групи (C_{1-6} алкільна група може бути заміщена аміногрупою або C_{1-6} алкіламіногрупою)); і

(22) Згадана вище сполука згідно з пунктами (20) або (21) або її сіль, або її гідрат або сольват, де R^{77} являє собою триметилсилільну групу, триетилсилільну групу, трет-бутилдиметилсилільну групу, ацетильну групу, пропіонільну групу, бензоїльну групу, бензилоксикарбонільну групу або трет-бутилоксикарбонільну групу.

Згідно з іншим аспектом даного винаходу, наданий макролідний антибіотик, який містить речовину, вибрану із групи, яка складається зі сполуки, представлені вищезгаданою формулою (I), її фізіологічно прийнятної солі, її гідрату й сольвату. Даний винахід також надає лікарський засіб, переважно, лікарський засіб для профілактичного і/або терапевтичного лікування інфекційного захворювання, що містить як активний інгредієнт речовину, вибрану із групи, яка складається зі сполуки, представлені вищезгаданою формулою (I), її фізіологічно прийнятної солі, її гідрату й сольвату.

Крім того, даний винахід надає протимікробний засіб, що містить як активний інгредієнт речовину, вибрану із групи, яка складається зі сполуки, представлені вищезгаданою формулою (I), її фізіологічно прийнятної солі, її гідрату й сольвату, і засіб для профілактики і/або терапії інфекційного захворювання, що містить як активний інгредієнт речовину, вибрану із групи, яка складається зі сполуки, представлені вищезгаданою формулою (I), її фізіологічно прийнятної солі, її гідрату й сольвату.

На додаток до цього, даний винахід також забезпечує використання речовини, вибраної із групи, яка складається зі сполуки, представлені вищезгаданою формулою (I), її фізіологічно прийнятної солі, її гідрату й сольвату, для виготовлення вищезгаданого лікарського засобу, і спосіб профілактичного і/або терапевтичного лікування інфекційного захворювання, який передбачає стадію введення ссавцеві, включаючи людину, ефективної кількості речовини, вибраної із групи, яка складається зі сполуки, представлені вищезгаданою формулою (I), її фізіологічно прийнятної солі, її гідрату й сольвату.

Ефект даного винаходу

Сполуки згідно із даним винаходом, їх солі, сольвати й гідрати характеризуються антибактеріальною активністю відносно широкого спектра мікроорганізмів, переважно аеробних або анаеробних бактерій, таких як грампозитивні або грамнегативні бактерії, мікоплазми, хламідії й т. п., і, зокрема, характеризуються тим, що також мають поліпшену антибактеріальну активність відносно резистентних до еритроміцину бактерій (наприклад, резистентні пневмококи, стрептококи й мікоплазми) і т. п., відносно яких традиційні макролідні антибіотики не можуть продемонструвати значну антибактеріальну активність.

Найкращий спосіб здійснення даного винаходу

Згідно із даним винаходом, позначення «C_{x-y}» означає, що згадана після нього група містить від x до y атомів вуглецю.

«Атом галогену» являє собою фтор, хлор, бром або йод.

«Алکیلна група» являє собою нерозгалужену або розгалужену алکیلну групу, і приклади містять у собі, наприклад, метильну групу, етильну групу, н-пропільну групу, ізопропільну групу, н-бутильну групу, 2-бутильну групу, трет-бутильну групу, н-пентильну групу, ізопентильну групу, 1,1-диметилпропільну групу, н-гексильну групу, і т. п. У даному описі метильна група іноді може бути позначена як «Me».

«Алкенільна група» являє собою нерозгалужену або розгалужену алкенільну групу, що відповідає вищезгаданій «алکیلній групі», що містить один або декілька подвійних зв'язків у довільних положеннях, і приклади містять у собі, наприклад, вінільну групу, 1-пропенільну групу, 2-пропенільну групу, 1-бутенільну групу, 1,3-бутадієнільну групу, 2-пентенільну групу, 3-пентенільну групу, 2-гексенільну групу, і т. п.

«Алкоксигрупа» являє собою нерозгалужену або розгалужену алкоксигрупу, і приклади містять у собі, наприклад, метоксигрупу, етоксигрупу, 1-пропоксигрупу, ізопропоксигрупу, 1-бутоксигрупу, 1-пропоксигрупу, трет-бутоксигрупу, 1-пентилоксигрупу, і т. п.

«Алкоксіміногрупа» являє собою нерозгалужену або розгалужену алкоксіміногрупу, і приклади містять у собі, наприклад, метоксіміногрупу, етоксіміногрупу, 1-пропоксіміногрупу, ізопропоксіміногрупу, 1-бутоксіміногрупу, 1-пропоксіміногрупу, трет-бутоксіміногрупу, 1-пентилоксіміногрупу, і т. п.

«Галогеналکیلна група» являє собою алکیلну групу, що відповідає вищезгаданій «алکیلній групі», у якій один або два або більше атомів водню заміщені одним або двома або більше атомами галогену, і приклади містять у собі, наприклад, фторметильну групу, дифторметильну групу, трифторметильну групу, 2,2,2-трифторетильну групу, 2,2,2-трихлоретильну групу, пентафторетильну групу, 3,3,3-трифторпропільну групу, перфторпропільну групу, 4-фторбутильну групу, 4-хлорбутильну групу, 4-бромбутильну групу, перфторгексильну групу, і т. п.

«Алкіламіногрупа» являє собою групу, утворену зв'язуванням однієї або двох вищезгаданих «алکیلних груп» і аміногрупи, і приклади містять у собі, наприклад, метиламіногрупу, диметиламіногрупу, діетиламіногрупу, N-етил-N-метиламіногрупу, і т. п.

«Алкілсульфанільна група» являє собою нерозгалужену або розгалужену алкілсульфанільну групу, і приклади містять у собі, наприклад, метилсульфанільну групу, етилсульфанільну групу, 1-пропілсульфанільну групу, ізопропілсульфанільну групу, 1-бутилсульфанільну групу, 1-пропілсульфанільну групу, трет-бутилсульфанільну групу, 1-пентилсульфанільну групу, і т. п.

«Алкілсульфінільна група» являє собою нерозгалужену або розгалужену алкілсульфінільну групу, і приклади містять у собі, наприклад, метилсульфінільну групу, етилсульфінільну групу, 1-пропілсульфінільну групу, ізопропілсульфінільну групу, 1-бутилсульфінільну групу, 1-пропілсульфінільну групу, трет-бутилсульфінільну групу, 1-пентилсульфінільну групу, і т. п.

«Алкілсульфонільна група» являє собою нерозгалужену або розгалужену алкілсульфонільну групу, і приклади містять у собі, наприклад, метилсульфонільну групу, етилсульфонільну групу, 1-пропілсульфонільну групу, ізопропілсульфонільну групу, 1-бутилсульфонільну групу, 1-пропілсульфонільну групу, трет-бутилсульфонільну групу, 1-пентилсульфонільну групу, і т. п.

Приклади «циклоалکیلної групи» містять у собі, наприклад, циклопропільну групу, циклобутильну групу, циклопентильну групу, циклогексильну групу, і т. п.

«Аралکیلна група» являє собою алکیلну групу, що відповідає вищезгаданій «алکیلній групі», у якій один атом водню заміщений фенільною групою або нафтильною групою, і приклади містять у собі, наприклад, бензильну групу, фенетильну групу, нафтален-1-ілметильну групу, нафтален-2-ілметильну групу, і т. п.

«Гетероарильна група» містить від 1 до 4 атомів, довільно вибраних з атома азоту, атома кисню й атома сірки, як атомів, які складають кільце, і приклади містять у собі, наприклад, піридинільну групу, піридазинільну групу, піримідинільну групу, піразинільну групу, хінолінільну групу (наприклад, 2-хінолінільну групу, 3-хінолінільну групу, 4-хінолінільну групу, 5-хінолінільну

[illegible]

«4-8-членна насичена гетероциклічна група» являє собою 8-членну насичену гетероциклічну групу, що містить від 1 до 3 атомів, довільно вибраних з атома азоту, атома кисню й атома сірки (який може бути окиснений), як атомів, які складають кільце, і можуть мати структуру з

поперечними зв'язками, і приклади містять у собі азетидинільну групу, оксетанільну групу, піролідинільну групу, імідазолідинільну групу, піразолідинільну групу, оксоланільну групу, тіоланільну групу, тетрагідротієнільну групу, діоксотетрагідротієнільну групу, ізотіазолідинільну групу, діоксоізотіазолідинільну групу, оксазолідинільну групу, тіадіазолідинільну групу, діоксотіадіазолідинільну групу, тетрагідропіранільну групу, тетрагідротіопіранільну групу, діоксотетрагідротіопіранільну групу, піперидинільну групу, піперазинільну групу, морфолінільну групу, тіоморфолінільну групу, діоксотіоморфолінільну групу, 7-азабіцикло[2.2.1]гептанільну групу, 8-азабіцикло[3.2.1]октанільну групу, і т. п. «4-8-членна насичена гетероциклічна група» може бути заміщена оксогрупою, і приклади містять у собі, наприклад, 2, 5-діоксоімідазолідинільну групу, 2-оксооксазолідинільну групу й 2-оксоімідазолідинільну групу.

«4-8-членна насичена азотовмісна гетероциклічна група» являє собою вищезгадану «4-8-членну насичену гетероциклічну групу», що містить щонайменше один атом азоту як атом, який складає кільце.

«6-членна частково насичена азотовмісна гетероциклічна група» являє собою 6-членну частково насичену азотовмісну гетероциклічну групу, що містить від 1 до 3 атомів азоту атомів, які складають кільце, і приклади містять у собі, наприклад, тетрагідропіридинільну групу, і т. п.

«Гетероаралкільна група» являє собою алкільну групу, що відповідає вищезгаданій «алкільній групі», у якій один атом водню заміщений вищезгаданою «гетероарильною групою». Приклади «гетероаралкільної групи» містять у собі, наприклад, піридилметильну групу, і т. п.

«Алканойльна група» являє собою групу, що містить атом водню або алкільну групу, зв'язану за допомогою карбонільної групи, і приклади містять у собі, наприклад, формільну групу, ацетильну групу, пропіонільну групу, бутирильну групу, ізобутирильну групу, півалоїльну групу, і т. п.

«Алкіленова група» являє собою нерозгалужену або розгалужену алкіленову групу, і приклади містять у собі, наприклад, $-\text{CH}_2-$, $-(\text{CH}_2)_2-$, $-(\text{CH}_2)_3-$, $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$, $-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2-$, $-(\text{CH}(\text{CH}_3))_2-$, $-(\text{CH}_2)_2-\text{CH}(\text{CH}_3)-$, $-(\text{CH}_2)_3-\text{CH}(\text{CH}_3)-$, $-\text{CH}(\text{CH}(\text{CH}_3)_2)-\text{CH}_2-$, $-(\text{CH}_2)_2-\text{CH}(\text{C}_2\text{H}_5)-$, $-(\text{CH}_2)_6-$, і т. п.

У вищезгаданій формулі (I) переважні приклади R^1-R^6 і Z є наступними. Сполуки, у яких один з R^1-R^6 і Z відповідає будь-якому із представлених нижче переважних прикладів R^1-R^6 і Z, являють собою переважні сполуки, а сполуки із двома або більше прикладами R^1-R^6 і Z являють собою більш переважні сполуки. Однак обсяг даного винаходу не обмежується наступними переважними прикладами.

Переважно, якщо R^1 являє собою C_{1-6} алкільну групу, і більш переважно, якщо R^1 являє собою метильну групу.

Переважно, якщо R^2 являє собою C_{1-6} алкільну групу, заміщену 1-3 замісниками, вибраними із групи замісників 1, більш переважно, якщо R^2 являє собою C_{1-6} алкільну групу, заміщену 1-3 замісниками, вибраними із групи замісників 4, і ще більш переважно, якщо R^2 являє собою C_{1-6} алкільну групу, заміщену групою, представленою формулою $-\text{NR}^{17}\text{R}^{18}$. У цьому випадку, переважно, якщо R^{17} і R^{18} , які можуть бути однаковими або різними, являють собою атом водню або C_{1-6} алкільну групу (C_{1-6} алкільна група може бути заміщена C_{3-6} циклоалкільною групою).

Переважно, якщо R^3 являє собою атом водню.

Переважно, якщо R^4 являє собою гідроксигрупу або C_{1-6} алкоксигрупу, і більш переважно, якщо R^4 являє собою метоксигрупу.

Переважно, якщо R^5 і R^6 об'єднані разом з атомами вуглецю, до яких вони приєднані, з утворенням циклічної структури, представленої формулою (III). У цьому випадку, переважно, якщо R^{27} являє собою групу, представлену формулою NR^{29} , і переважно, якщо R^{29} являє собою атом водню, групу, представлену формулою $-\text{NR}^{30}\text{R}^{31}$, формулою $-\text{NR}^{32}\text{CO}_2\text{R}^{35}$, формулою $-\text{NR}^{32}\text{SO}_2\text{R}^{37}$, формулою $-\text{NR}^{32}\text{CONR}^{38}\text{R}^{39}$ або формулою $-\text{NR}^{32}\text{SO}_2\text{NR}^{40}\text{R}^{41}$, або C_{1-6} алкільну групу, заміщену 1-3 замісниками, вибраними із групи замісників 3, більш переважно C_{1-6} алкільну групу, заміщену 1-3 замісниками, вибраними із групи замісників 5, ще більш переважно C_{1-6} алкільну групу, заміщену C_{1-6} алкілсульфонільною групою.

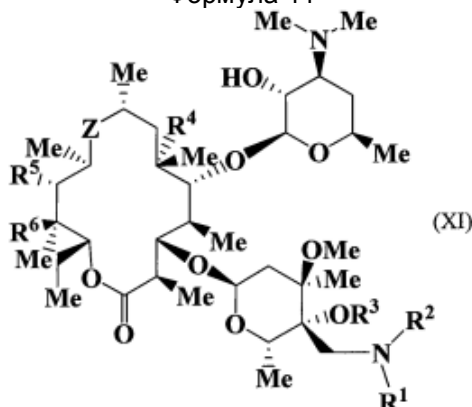
Переважно, якщо Z являє собою групу, представлену формулою $\text{C}(=\text{O})$.

Сіль сполуки, представленої вищезгаданою формулою (I), може являти собою кислотно-адитивну сіль або основно-адитивну сіль. Приклади кислотно-адитивної солі містять у собі, наприклад, солі кислоти, наприклад, такої як оцтова кислота, пропіонова кислота, масляна кислота, мурашина кислота, трифтороцтова кислота, малеїнова кислота, виннокам'яна кислота, лимонна кислота, стеаринова кислота, бурштинова кислота, етилбурштина кислота, лактобіонова кислота, глюконова кислота, глюкогептонова кислота, бензойна кислота, метансульфонова кислота, етансульфонова кислота, 2-гідроксіетансульфонова кислота, бензолсульфонова кислота, парантолуолсульфонова кислота, лаурилсірчана кислота, яблучна

кислота, аспарагінова кислота, глутамінова кислота, адипінова кислота, цистеїн, N-ацетилцистеїн, соляна кислота, бромистоводнева кислота, фосфорна кислота, сірчана кислота, йодистоводнева кислота, нікотинава кислота, щавлева кислота, пікринова кислота, тіоціанова кислота, ундеканова кислота, полімер акрилової кислоти й карбоксивініловий полімер, і
 5 приклади основно-адитивної солі містять у собі солі неорганічного основи, такі як солі натрію, солі калію й солі кальцію, солі органічного аміну, такого як морфолін і піперидин, і солі амінокислот, однак вказаними солями солі не обмежуються. Серед них переважними є фізіологічно прийнятні солі.

Сполуки згідно із даним винаходом, представлені вищезгаданою формулою (I), і їх солі
 10 можуть існувати у вигляді гідратів або довільно вибраних сольватів, і такі гідрати й сольвати також підпадають під обсяг даного винаходу. Крім того, сполуки згідно із даним винаходом, представлені вищезгаданою формулою (I), містять два або більше асиметричних атомів вуглецю, і такі асиметричні атоми вуглецю можуть знаходитися в довільно вибраних конфігураціях. Стереοізомери, такі як оптичні ізомери й діастереοізомери в чистому вигляді на
 15 основі таких асиметричних атомів вуглецю, довільні суміші стереοізомерів, рацематів і т. п., охоплюються обсягом даного винаходу. Більше того, сполуки згідно із даним винаходом, представлені вищезгаданою формулою (I), можуть містити один або декілька подвійних зв'язків, і також можуть існувати їхні геометричні ізомери, що виникають по подвійному зв'язку або в кільцевій структурі. Слід розуміти, що будь-які геометричні ізомери в чистому вигляді або
 20 довільні суміші геометричних ізомерів підпадають під обсяг даного винаходу. Нижче представлений один клас переважних стереοізомерів. Однак сполуки згідно із даним винаходом не обмежуються наступним конкретним типом стереοізомерів. Представлені в наступних структурних формулах конфігурації є абсолютними конфігураціями, і представлені зі звичайними показниками.

Формула 11



Сполуки згідно із даним винаходом, представлені вищезгаданою формулою (I), їх солі, їхні гідрати й сольвати характеризуються поліпшеною безпекою. Безпека може бути визначена в різних тестах, наприклад, у цитотоксичному тесті, тесті з hERG, тесті інгібування активності
 30 цитохрому P-450 (CYP), і т. п.

Сполуки згідно із даним винаходом, представлені вищезгаданою формулою (I), їх солі, їхні гідрати й сольвати характеризуються поліпшеною метаболічною стабільністю. Метаболічна стабільність може бути визначена в різних тестах, наприклад, у тесті метаболічної стабільності до дії мікросом гепатоцитів людини, і т. п.

Сполуки згідно із даним винаходом можуть бути синтезовані, наприклад, такими способами. Однак способи одержання сполук згідно із даним винаходом не обмежуються представленими способами.

Хоча всі сполуки згідно із даним винаходом є новими сполуками й не були описані в літературі, вони можуть бути отримані способами, описаними в літературі відомими, або
 40 подібними способами. Приклади такої літератури містять у собі S.R. Sandler et al., Organic Functional Group Preparations, Academic Press Inc., New York and London, 1968; S.R. Wagner et al., Synthetic Organic Chemistry, John Wiley, 1961; R.C. Larock, Comprehensive Organic Transformations, 1989; L.A. Paquette et al., Encyclopedia of Reagents for Organic Synthesis, 1995; Compendium of Organic Synthetic Methods, і т. п.

Якщо не вказане інше, то в наступних поясненнях термін «основа» означає, наприклад, органічна основа (наприклад, амін, такий як триетиламін, діізопропілетиламін, 1,8-діазабіцикло[5.4.0]-7еундецен, піридин і 4-диметиламінопіридин, алкоксид металу, такий як метоксид натрію, і т. п.) або неорганічна основа (наприклад, карбонат лужного металу, такий як

карбонат натрію й карбонат калію, карбонат лужноземельного металу, такий як карбонат кальцію, гідроксид металу, такий як гідроксид натрію й гідроксид калію, і т. п.), однак основа не обмежується вказаними основами.

5 Якщо не вказане інше, то термін «розчинник» означає, наприклад, полярний розчинник (наприклад, воду, спиртовий розчинник, такий як метанол, і т. п.), інертний розчинник (наприклад, галогенований вуглеводневий розчинник, такий як хлороформ і хлористий метилен, ефірний розчинник, такий як діетиловий ефір, тетрагідрофуран і діоксан, амідний розчинник, такий як диметилформамід і диметилацетамід, апротонний розчинник, такий як диметилсульфоксид і ацетонітрил, ароматичний вуглеводневий розчинник, такий як толуол, вуглеводень, такий як циклогексан, і т. п.) або змішані з них розчинники, але розчинник не

10 обмежується вказаними розчинниками.
Якщо не вказане інше, то «конденсуючий агент» означає, наприклад, складний ефір хлормурашиної кислоти (наприклад, ізобутилхлорформіат, етилхлорформіат, метилхлорформіат, і т. п.), хлорангідрид (наприклад, півалоїлхлорид, оксалілхлорид, 2,4,6-трихлорбензоїлхлорид, і т. п.), агент дегідратації-конденсації (наприклад, карбодіімідний реагент, такий як гідрохлорид 1-етил-3-(3-диметиламінопропіл)карбодііміду й дициклогексилкарбодіімід, 1,1'-карбонілдіімідазол, йодид 2-хлор-1-метилпіридинію, і т. п.), і т. п., але конденсуючий агент не обмежується вказаними агентами.

У наступних поясненнях R являє собою атом водню або захисну групу. Як захисна група
20 переважними є силільна захисна група, така як триметилсилільна група, триетилсилільна група й трет-бутилдиметилсилільна група, ацильна захисна група, така як ацетильна група, пропіонільна група й бензоїльна група, ефірна захисна група, така як бензильна група, параметоксибензильна група й 2-хлорбензильна група, ацетальна захисна група, така як тетрагідропіранільна група, тетрагідрофуранільна група й 1-етоксіетильна група, карбонатна захисна група, така як бензилоксикарбонільна група й трет-бутилоксикарбонільна група, і т. п., і
25 більш переважні приклади містять у собі ацетильну групу, пропіонільну групу, бензоїльну групу, триметилсилільну групу й триетилсилільну групу. Однак захисна група не обмежується вищезгаданими захисними групами й містить у собі захисні групи, описані в Protective Groups in Organic Synthesis (Third Edition, 1999, Ed. by p. G.M. Wuts, T. Green), і т. п.

30 Згадуваний у формулах сполук R може бути бажаним чином взаємно перетворений між атомом водню й захисною групою способами, описаними нижче. Однак способи перетворення не обмежуються вказаними способами.

Якщо R являє собою ацильну захисну групу, то група може бути перетворена в атом водню наступним чином. Більш конкретно, захисна група може бути перетворена в атом водню
35 шляхом проведення реакції в спиртовому розчиннику (наприклад, переважним є метанол) у присутності або під час відсутності основи (приклади містять у собі, наприклад, 1,8-діазабіцікло[5.4.0]-7-ундецен, і т. п.). Температуру реакції вибирають із діапазону, наприклад, від 0 °C до температури кипіння розчинника, і переважною є температура в діапазоні від кімнатної температури до температури кипіння розчинника.

40 Якщо R являє собою атом водню, то атом водню може бути перетворений в ацильну захисну групу наступним чином. Більш конкретно, водень може бути перетворений в ацильну захисну групу шляхом здійснення взаємодії з ангідридом карбонової кислоти або галогенідом карбонової кислоти в розчиннику (приклади містять у собі, наприклад, ацетон, хлороформ, дихлорметан, і т. п.) у присутності або під час відсутності основи (приклади містять у собі, наприклад, триетиламін, діізопропіламін, піридин, і т. п.) і в присутності або під час відсутності 4-диметиламінопіридину. Температуру реакції вибирають із діапазону, наприклад, від -20 °C до температури кипіння розчинника, і переважною є температура в діапазоні від 0 °C до кімнатної температури.

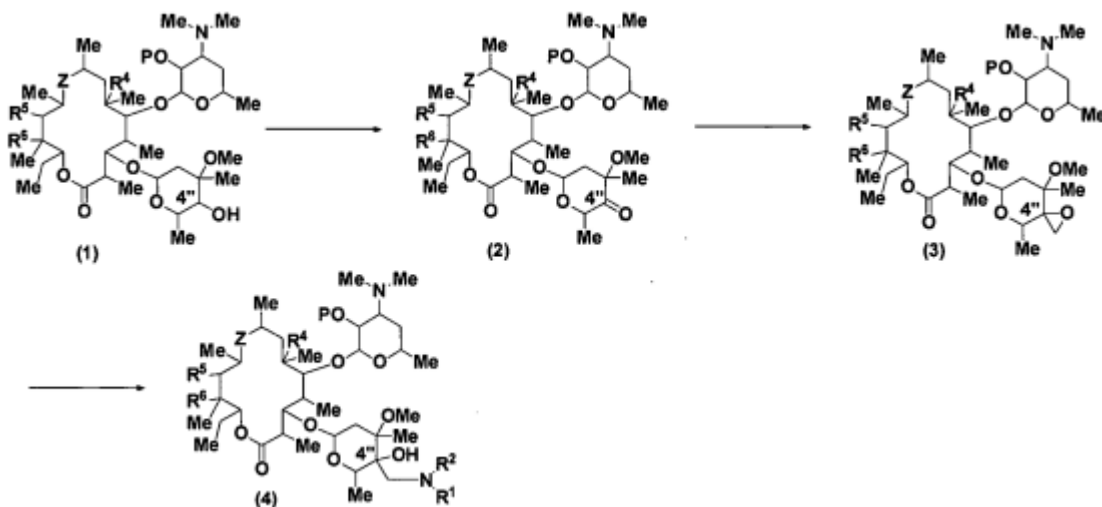
Якщо R являє собою силільну захисну групу, то група може бути перетворена в атом водню
50 наступним чином. Більш конкретно, захисна група може бути перетворена в атом водню шляхом проведення реакції у фторуючому агенті (приклади містять у собі, наприклад, фтороводень, фторид тетрабутиламонію, і т. п.) і розчиннику (приклади містять у собі, наприклад, тетрагідрофуран, і т. п.). Температуру реакції вибирають із діапазону, наприклад, від -20 °C до температури кипіння розчинника, і переважною є температура в діапазоні від 0 °C до кімнатної температури.

55 Якщо R являє собою атом водню, то атом водню може бути перетворений у силільну захисну групу наступним чином. Більш конкретно, атом водню може бути перетворений у силільну захисну групу шляхом здійснення взаємодії із силільним галогенідом у розчиннику (приклади містять у собі, наприклад, хлороформ, диметилформамід, і т. п.) у присутності або під час відсутності основи (приклади містять у собі, наприклад, імідазол, триетиламін, і т. п.).
60

Температуру реакції вибирають із діапазону, наприклад, від -20 °C до температури кипіння розчинника, і переважно є температура в діапазоні від 0 °C до кімнатної температури.

Схема 1
Формула 12

5



(позначення Me, R¹, R², R⁴, R⁵, R⁶, P і Z характеризуються у формулах тими ж значеннями, що й визначені вище).

10 Сполуки, представлені формулою (1), можуть бути синтезовані, наприклад, способом, подібним до описаних у літературі (наприклад, Journal of Medicinal Chemistry, 2003, vol. 46, p. 2706; Tetrahedron, 2003, vol. 59, p. 7033; Journal of Organic Chemistry, 1988, vol. 53, p. 2340; The Journal of Antibiotics, 1984, vol. 37, p. 182; The Journal of Antibiotics, 1990, vol. 43, p. 544; The Journal of Antibiotics, 1993, vol. 46, p. 647; The Journal of Antibiotics, 2001, vol. 54, p. 664; The Journal of Antibiotics, 2003, vol. 56, p. 1062; Polish Journal of Chemistry, 1979, vol. 53, p. 2551; міжнародна патентна публікація WO 97/31929, нерозглянута японська патентна публікація № 6/247996, міжнародні патентні публікації WO 99/21867, WO 02/016380, WO 04/106354, європейські патенти №№ 284203, 216169, 180415, 248279, і т. п.).

20 Сполуки, представлені формулою (2), можуть бути отримані з використанням сполуки, представлені формулою (1), як вихідної речовини згідно зі способом, подібним до описаних в літературі (Tetrahedron, 1978, vol. 34, p. 1651; Journal of American Chemical Society, 1965, vol. 87, p. 5661; Journal of American Chemical Society, 1972, vol. 94, p. 7586), зокрема, шляхом окиснення сполуки по Свон, по Моффату або по Корі-Кім. Серед них особливо переважним є окиснення по Корі-Кім; і сполуки, представлені формулою (2), можуть бути отримані шляхом активації сульфідного реагенту (наприклад, переважними є диметилсульфід, додецилметилсульфід, і т. п.) активуючим агентом (наприклад, переважним є N-хлорсукцинімід, і т. п.) в інертному розчиннику (наприклад, переважними є хлороформ і дихлорметан), з наступним додаванням сполуки, представлені формулою (1) і органічної основи (наприклад, переважним є триетиламін, і т. п.) для проведення реакції. Температуру реакції вибирають із діапазону, наприклад, від -78 °C до кімнатної температури, і особливо переважно є температура від -40 °C до 0 °C.

35 Сполуки, представлені формулою (3), можуть бути отримані з використанням сполуки, представлені формулою (2), як вихідної речовини згідно зі способом, подібним до описаних в літературі (Journal of American Chemical Society, 1965, vol. 87, p. 1353; Journal of American Chemical Society, 1962, vol. 84, p. 867), зокрема, у реакції по Корі-Чайковському, і т. п.

40 Представлені формулою (3) сполуки, у яких стерична конфігурація 4''-положення являє собою (R)-конфігурацію, можуть бути отримані способом, подібним до описаних у літературі (наприклад, міжнародна патентна публікація WO 98/56801), зокрема, шляхом здійснення взаємодії сполуки, представлені формулою (2), з (CH₃)₃S(O)W¹ (приклад W¹ містять у собі, наприклад, галоген, -BF₄ і -PF₆, і переважним є йод) у розчиннику (приклад W¹ містять у собі, наприклад, тетрагідрофуран, діетиловий ефір, диметилформамід, диметилсульфоксид, і т. п., і два або більше із вказаних типів розчинників можуть бути використані у вигляді суміші) у присутності органічної основи або неорганічної основи (наприклад, переважним є гідрид натрію). Температуру вищезгаданої реакції вибирають із діапазону, наприклад, від 0 °C до 60 °C, і переважно є температура в діапазоні від 0 °C до кімнатної температури.

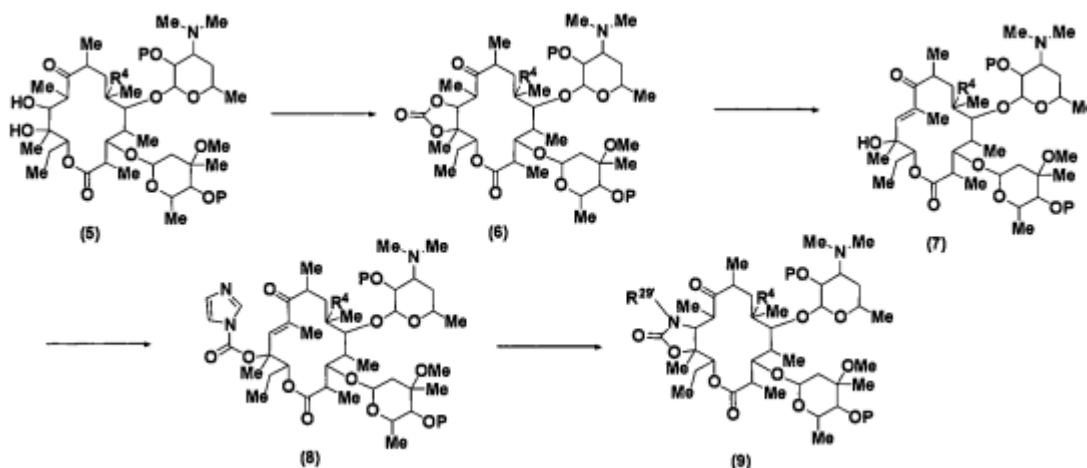
Представлені формулою (3) сполуки, у яких стерична конфігурація 4''-положення являє собою (S)-конфігурацію, можуть бути отримані способом, подібним до описаних у літературі (наприклад, міжнародна патентна публікація WO 98/56801), зокрема, шляхом здійснення взаємодії сполуки, представленої формулою (2), з $(\text{CH}_3)_3\text{S}(\text{O})\text{W}^2$ (приклади W^2 містять у собі, наприклад, галоген, $-\text{BF}_4$ і $-\text{PF}_6$, і переважним є $-\text{BF}_4$) у розчиннику (приклади містять у собі, наприклад, тетрагідрофуран, діетиловий ефір, диметилформамід, диметилсульфоксид, і т. п., і два або більше із вказаних типів розчинників можуть бути використані у вигляді суміші) у присутності органічної основи або неорганічної основи. Температуру вищезгаданої реакції вибирають із діапазону, наприклад, від -50 до 60 $^{\circ}\text{C}$, і переважною є температура в діапазоні від -30 $^{\circ}\text{C}$ до кімнатної температури.

Представлені формулою (4) сполуки можуть бути отримані шляхом здійснення взаємодії сполуки, представленої формулою (3), і відповідного аміну, у присутності або під час відсутності солі, що містить іон галогену (наприклад, йодид калію, хлорид амонію, гідрохлорид піридину, і т. п.) або кислоту Льюїса (наприклад, трифлат ітербію), у присутності або під час відсутності основи (наприклад, переважним є дізопропілетиламін, і т. п.), і в присутності або під час відсутності розчинника (наприклад, переважними є етанол, бутанол, диметилформамід, і т. п.). Температура реакції переважно знаходиться в діапазоні, наприклад, від кімнатної температури до 120 $^{\circ}\text{C}$. Хоча така реакція може бути проведена при звичайному тиску, вона також може бути проведена в герметично закритій пробірці. Вказану реакцію також можна проводити з використанням мікрохвильового обладнання, і в цьому випадку температура реакції переважно знаходиться в діапазоні, наприклад, від температури кипіння розчинника до 200 $^{\circ}\text{C}$. Використовуваний у вищезгаданій реакції амін може являти собою кислотно-адитивну сіль, і переважною кислотно-адитивною сіллю є, наприклад, сіль соляної кислоти, і т. п.

Сполуки, представлені на схемі 1 формулами (1), (2), (3) або (4), де R^4 являє собою групу, представлену формулою $-\text{CONR}^{21}\text{R}^{22}$ (R^{21} і R^{22} , які можуть бути однаковими або різними, являють собою атом водню, C_{1-6} алкільну групу або алкенільну групу, заміщену однією гетероарильною групою), можуть бути отримані шляхом здійснення взаємодії сполуки, представленої формулою (1), (2), (3) або (4), де R^4 являє собою гідроксигрупу, і відповідного ізоціанату в розчиннику в присутності основи. Вищезгадані сполуки, де R^4 являє собою групу, представлену формулою $-\text{CONH}_2$, можуть бути отримані шляхом здійснення взаємодії сполуки, представленої формулою (1), (2), (3) або (4), де R^4 являє собою гідроксигрупу, і трихлорацетилізоціанату в розчиннику (наприклад, переважними є хлороформ і дихлорметан), з наступним здійсненням взаємодії отриманої речовини зі спиртом (наприклад, переважним є метанол) у розчиннику (наприклад, переважним є змішаний з метанолу й води розчинник) у присутності основи (наприклад, переважним є триетиламін). Температуру реакції вибирають із діапазону, наприклад, від 0 $^{\circ}\text{C}$ до температури кипіння розчинника, і переважною є температура в діапазоні від кімнатної температури до температури кипіння розчинника.

Сполуки, представлені на схемі 1 формулами (1), (2), (3) або (4), де R^5 і R^6 об'єднані разом з атомами вуглецю, до яких вони приєднані, з утворенням циклічної структури, представленої формулою (III), і R^{27} являє собою атом кисню, можуть бути отримані, наприклад, шляхом здійснення взаємодії сполуки, представленої формулою (1), (2), (3) або (4), де R^5 і R^6 являють собою гідроксигрупи, способами, подібними до описаних в літературі (наприклад, Journal of Medicinal Chemistry, 2003, vol. 46, p. 2706). Зокрема, вони можуть бути отримані шляхом здійснення взаємодії сполуки в розчиннику (наприклад, переважними є хлороформ і дихлорметан) у присутності карбонуючого агента (наприклад, переважним є трифосген) і основи (наприклад, переважним є піридин). Температуру реакції вибирають із діапазону, наприклад, від -20 $^{\circ}\text{C}$ до температури кипіння розчинника, і переважною є температура в діапазоні від 0 $^{\circ}\text{C}$ до кімнатної температури.

Крім того, сполуки, представлені на схемі 2, із числа сполук, представлених на схемі 1 формулою (1), можуть бути отримані відповідно до стадій, представлених на схемі 2, а також відповідно до стадій, представлених на схемі 1.

Схема 2
Формула 13

5

(у формулах, R²⁹ являє собою гідроксигрупу, C₁₋₆алкоксигрупу (C₁₋₆алкоксигрупа може бути заміщена фенольною групою), групу, представлену формулою -NR³⁰R³¹, або C₁₋₆алкільну групу, яка може бути заміщена 1-3 замісниками, вибраними із групи замісників 3, і Me, R³⁰, R³¹, R⁴ і R характеризуються тими ж значеннями, що й визначені вище).

10 Сполуки, представлені формулою (6), можуть бути отримані шляхом здійснення взаємодії сполуки, представленної формулою (5), з карбонуючим агентом (приклади містять у собі, наприклад, трифосген і діетилкарбонат, і серед них переважним є трифосген) в інертному розчиннику (переважними є хлороформ і дихлорметан) у присутності або під час відсутності органічної основи (наприклад, переважним є амін, такий як піридин). Температуру реакції вибирають із діапазону, наприклад, від -20 °C до температури кипіння розчинника, і в межах цього діапазону переважною є температура від 0 °C до кімнатної температури.

15 Сполуки, представлені формулою (7), можуть бути отримані шляхом здійснення взаємодії сполуки, представленної формулою (6), у розчиннику (наприклад, переважним є диметилформамід) у присутності або під час відсутності основи (наприклад, переважним є 1,1,3,3-тетраметилгуанідин). Температуру реакції вибирають із діапазону, наприклад, від 0 °C до температури кипіння розчинника, і особливо переважною була температура від кімнатної температури до 100 °C.

20 Сполуки, представлені формулою (8), можуть бути отримані з використанням сполуки, представленної формулою (7), як вихідної речовини згідно зі способом, подібним до описаних в літературі (наприклад, Journal of Organic Chemistry, 1988, vol. 53, p. 2340; європейський патент № 248279, і т. п.), наприклад, шляхом здійснення взаємодії сполуки з 1,1'-карбонілдіімідазолом у розчиннику (приклади містять у собі, наприклад, тетрагідрофуран, діетиловий ефір, диметилформамід, диметилсульфоксид, і т. п., і два або більше із вказаних типів розчинників можуть бути використані у вигляді суміші) у присутності основи (наприклад, переважним є гідрид натрію). Температуру реакції вибирають із діапазону, наприклад, від -20 °C до температури кипіння розчинника, і переважною є температура від 0 °C до кімнатної температури.

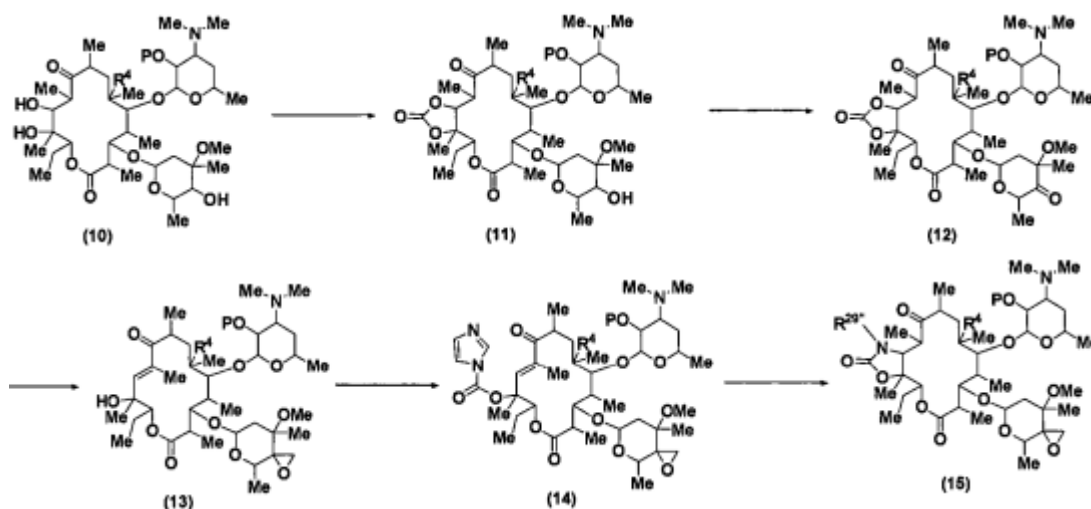
25 Як альтернатива, сполуки, представлені формулою (8), можуть бути отримані з використанням сполуки, представленної формулою (5), шляхом здійснення взаємодії сполуки, наприклад, з 1,1'-карбонілдіімідазолом у розчиннику (приклади містять у собі, наприклад, тетрагідрофуран, діетиловий ефір, диметилформамід, диметилсульфоксид, і т. п., і два або більше із вказаних типів розчинників можуть бути використані у вигляді суміші) в присутності або під час відсутності основи (приклади містять у собі, наприклад, гідрид натрію, 1,8-діазабіцикло[5.4.0]-7-ундецен і т. п.). Температуру реакції переважно знаходиться в діапазоні, наприклад, від кімнатної температури до температури кипіння розчинника.

30 Сполуки, представлені формулою (9), можуть бути отримані з використанням сполуки, представленної формулою (8), як вихідної речовини згідно зі способом, подібним до описаних в літературі (наприклад, Journal of Organic Chemistry, 1988, vol. 53, p. 2340; європейський патент № 248279, міжнародна патентна публікація WO 97/31929, і т. п.), зокрема, шляхом здійснення взаємодії сполуки з відповідним аміном, відповідною сполукою, представлену формулою H₂NOR²⁴ або формулою H₂NNR³⁰R³¹, у розчиннику (приклади містять у собі, наприклад,

ацетонітрил, диметилформамід, диметилформамід, етилацетат, і т. п.) у присутності або під час відсутності основи (наприклад, 1,8-дізабіцикло[5.4.0]-7-ундецен, 1,1,3,3-тетраметилгуанідин, і т. п.). Вищезгаданий амін, відповідна сполука, представлена формулою H_2NOR^{24} або формулою $H_2NNR^{30R^{31}}$, може являти собою кислотно-адитивну сіль, і переважною кислотно-адитивною сілью є, наприклад, сіль соляної кислоти, і т. п. Температуру вищезгаданої реакції вибирають у діапазоні, наприклад, від $-20\text{ }^{\circ}\text{C}$ до температури кипіння розчинника, і переважною є температура в діапазоні від $0\text{ }^{\circ}\text{C}$ до кімнатної температури.

Крім того, сполуки, представлені на схемі 3, із числа сполук, представлених на схемі 1 формулою (3), можуть бути отримані відповідно до стадій, представлених на схемі 3, а також відповідно до стадій, представлених на схемі 1.

Схема 3
Формула 14



(у формулах R^{29} являє собою гідроксигрупу, C_{1-6} алкоксигрупу (C_{1-6} алкоксигрупа може бути заміщена фенольною групою), групу, представлену формулою $-NR^{30R^{31}}$, або C_{1-6} алкільну групу, яка може бути заміщена 1-3 замісниками, вибраними із групи замісників 3, і Me, R^4 , R^{30} , R^{31} і R характеризуються тими ж значеннями, що й визначені вище).

Сполуки, представлені формулою (11), можуть бути отримані шляхом здійснення взаємодії сполуки, представленої формулою (10), з карбонуючим агентом (прикладі містять у собі, наприклад, трифосген і діетилкарбонат, і серед них переважним є трифосген) в інертному розчиннику (переважними є хлороформ і дихлорметан) у присутності або під час відсутності органічної основи (наприклад, переважним є амін, такий як піридин). Температуру реакції вибирають із діапазону, наприклад, від $-20\text{ }^{\circ}\text{C}$ до температури кипіння розчинника, і в межах цього діапазону переважною є температура від $0\text{ }^{\circ}\text{C}$ до кімнатної температури.

Сполуки, представлені формулою (12), можуть бути отримані з використанням сполуки, представленої формулою (11), як вихідної речовини згідно зі способом, подібним до описаних в літературі (Tetrahedron, 1978, vol. 34, p. 1651; Journal of American Chemical Society, 1965, vol. 87, p. 5661; Journal of American Chemical Society, 1972, vol. 94, p. 7586), зокрема, шляхом окиснення сполуки по Свон, по Моффату, по Копі-Кім, і т. п. Серед них особливо переважним є окиснення по Копі-Кім, і сполуки, представлені формулою (12), можуть бути отримані шляхом активації сульфідного реагенту (наприклад, переважними є диметилсульфід, додецилметилсульфід, і т. п.) активуючим агентом (наприклад, переважним є N-хлорсукцинімід, і т. п.) в інертному розчиннику (наприклад, переважними є хлороформ і дихлорметан), з наступним додаванням сполуки, представленої формулою (11), і органічної основи (наприклад, переважним є триетиламін, і т. п.) для проведення реакції. Температуру реакції вибирають із діапазону, наприклад, від $-78\text{ }^{\circ}\text{C}$ до кімнатної температури, і особливо переважною є температура від $-40\text{ }^{\circ}\text{C}$ до $0\text{ }^{\circ}\text{C}$.

Сполуки, представлені формулою (13), можуть бути отримані шляхом здійснення взаємодії сполуки, представленої формулою (12), з $(CH_3)_3S(O)W^3$ (прикладі W^3 містять у собі, наприклад, галоген, $-BF_4$ і $-PF_6$, і переважним є йод) у розчиннику (прикладі містять у собі, наприклад, тетрагідрофуран, діетиловий ефір, диметилформамід, диметилсульфоксид, і т. п., і два або більше із вказаних типів розчинників можуть бути використані у вигляді суміші) у присутності органічної основи або неорганічної основи (наприклад, переважним є гідрид натрію).

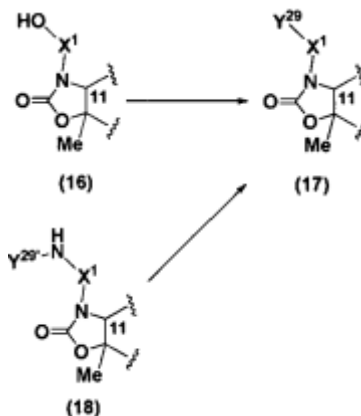
Температуру вищезгаданої реакції вибирають у діапазоні, наприклад, від -50°C до 60°C , і переважно є температура в діапазоні від -30°C до кімнатної температури.

Сполуки, представлені формулою (14), можуть бути отримані з використанням сполуки, представленої формулою (13), як вихідної речовини згідно зі способом, подібним до описаних в літературі (наприклад, Journal of Organic Chemistry, 1988, vol. 53, p. 2340; європейський патент № 248279, і т. п.), наприклад, шляхом здійснення взаємодії сполуки з 1,1'-карбонілдіімідазолом у розчиннику (приклади містять у собі, наприклад, тетрагідрофуран, діетиловий ефір, диметилформамід, диметилсульфоксид, і т. п., і два або більше із вказаних типів розчинників можуть бути використані у вигляді суміші) у присутності основи (наприклад, переважним є гідрид натрію). Температуру реакції вибирають із діапазону, наприклад, від -20°C до температури кипіння розчинника, і переважно є температура в діапазоні від 0°C до кімнатної температури.

Сполуки, представлені формулою (15), можуть бути отримані з використанням сполуки, представленої формулою (14), як вихідної речовини згідно зі способом, подібним до описаних в літературі (наприклад, Journal of Organic Chemistry, 1988, vol. 53, p. 2340; європейський патент № 248279; міжнародна патентна публікація WO 97/31929, і т. п.), зокрема, шляхом здійснення взаємодії сполуки з відповідним аміном, сполукою, представленою формулою $\text{H}_2\text{NOY}'$ або формулою $\text{H}_2\text{NNR}^{30}\text{R}^{31}$, у розчиннику (приклади містять у собі, наприклад, ацетонітрил, тетрагідрофуран, диметилформамід, етилацетат, і т. п.) у присутності або під час відсутності основи (приклади містять у собі, наприклад, 1,8-діазабіцикло[5.4.0]-7-ундецен, 1,1,3,3-тетраметилгуанідин, і т. п.). Вищезгаданий амін, сполука, представлена формулою $\text{H}_2\text{NOY}'$ або формулою $\text{H}_2\text{NNR}^{30}\text{R}^{31}$, може являти собою кислотно-адитивну сіль, і переважно кислотно-адитивною сіллю може бути, наприклад, сіль соляної кислоти, і т. п. Температуру вищезгаданої реакції вибирають у діапазоні, наприклад, від -20°C до температури кипіння розчинника, і переважно є температура в діапазоні від 0°C до 50°C . Y' являє собою атом водню або C_{1-6} алкільну групу (C_{1-6} алкільна група може бути заміщена фенільною групою).

Крім того, сполуки, представлені на схемі 4, із числа сполук, представлених на схемі 1 формулами (1)-(4), можуть бути отримані відповідно до стадій, представлених на схемі 4, а також відповідно до стадій, представлених на схемі 1.

Схема 4
Формула 15



(формулами (16)-(18) представлено перетворення структурного фрагмента циклічного карбамату в 11- і 12-положеннях сполук формул (1), (2), (3) і (4), представлених на схемі 1, де R^5 і R^6 формують, разом з атомами вуглецю, до яких вони приєднані, групу, представлену формулою (III), причому у формулах

X^1 являє собою C_{1-6} алкіленову групу або простий зв'язок,

якщо X^1 являє собою C_{1-6} алкіленову групу, то

Y^{29} являє собою C_{1-6} алкоксигрупу, феноксигрупу, бензилоксигрупу, групу, представлену формулою $-\text{OSO}_2\text{NR}^{46}\text{R}^{47}$, формулою $-\text{OCONR}^{55}\text{R}^{56}$, формулою OCOR^{64} , формулою $-\text{NR}^{44}\text{CO}_2\text{R}^{45}$, формулою $-\text{NR}^{49}\text{SO}_2\text{NR}^{50}\text{R}^{51}$, формулою $-\text{NR}^{57}\text{COR}^{58}$, формулою $-\text{NR}^{61}\text{CONR}^{62}\text{R}^{63}$, формулою $-\text{NR}^{67}\text{SO}_2\text{R}^{68}$ або формулою $-\text{NR}^{69}\text{R}^{70}$.

Y^{29} являє собою групу, представлену R^{44} , R^{49} , R^{57} , R^{61} , R^{67} або R^{69} , і якщо X^1 являє собою простий зв'язок, то

Y^{29} являє собою групу, представлену формулою $-NR^{30}R^{31}$; формулою $-NR^{32}CSNR^{33}R^{34}$; формулою $-NR^{32}CO_2R^{35}$; формулою $-NR^{32}COR^{36}$; формулою $-NR^{32}SO_2R^{37}$; формулою $-NR^{32}CONR^{38}R^{39}$; формулою $-NR^{32}SO_2NR^{40}R^{41}$ або формулою $-N=C-NR^{42}R^{43}$,

5 Y^{29} являє собою групу, представлену R^{30} або R^{32} , і $R^{30}, R^{31}, R^{32}, R^{33}, R^{34}, R^{35}, R^{36}, R^{37}, R^{38}, R^{39}, R^{40}, R^{41}, R^{42}, R^{43}, R^{44}, R^{45}, R^{46}, R^{47}, R^{49}, R^{50}, R^{51}, R^{55}, R^{56}, R^{57}, R^{58}, R^{61}, R^{62}, R^{63}, R^{64}, R^{67}, R^{68}, R^{69}$ і R^{70} характеризуються тими ж значеннями, що й визначені вище).

Сполуки, представлені формулою (17), де Y^{29} являє собою групу, представлену формулою $-OCOR^{64}$, можуть бути отримані з використанням сполуки, представлені формулою (16), як вихідної речовини шляхом здійснення взаємодії сполуки з відповідним галогенідом карбонової кислоти або ангідридом карбонової кислоти в розчиннику (переважними є хлороформ і дихлорметан) у присутності або під час відсутності 4-диметиламінопіридину й у присутності або під час відсутності основи (наприклад, переважним є триетиламін), або шляхом здійснення взаємодії сполуки з відповідної карбоновою кислотою в присутності агента дегідратації-конденсації. Температуру реакції вибирають із діапазону, наприклад, від $-20\text{ }^{\circ}\text{C}$ до $60\text{ }^{\circ}\text{C}$, і переважно є температура в діапазоні від $0\text{ }^{\circ}\text{C}$ до кімнатної температури.

Сполуки, представлені формулою (17), де Y^{29} являє собою групу, представлену формулою $-OCONR^{55}R^{56}$, можуть бути отримані з використанням сполуки, представлені формулою (16), як вихідної речовини шляхом здійснення взаємодії сполуки з відповідним ізоціанатом у розчиннику (наприклад, переважним є толуол) у присутності основи (переважним є 1,4-діазабіцикло[2.2.2]октан). Крім того, сполуки, де Y^{29} являє собою групу, представлену формулою $-OCONH_2$, можуть бути отримані з використанням сполуки, представлені формулою (16), як вихідної речовини шляхом здійснення взаємодії сполуки в розчиннику (наприклад, переважними є хлороформ і дихлорметан) у присутності трихлорацетилізоціанату, і шляхом здійснення взаємодії отриманої трихлорацетиламідної сполуки в розчиннику (приклади містять у собі метанол, воду, і т. п., і два або більше із вказаних типів розчинників можуть бути використані у вигляді суміші) у присутності основи (наприклад, переважним був карбонат калію або триетиламін). Температура реакції переважно знаходиться в діапазоні від $0\text{ }^{\circ}\text{C}$ до точки кипіння розчинника.

Сполуки, представлені формулою (17), де Y^{29} являє собою групу, представлену формулою $-OSO_2NR^{46}R^{47}$, можуть бути отримані з використанням сполуки, представлені формулою (16), як вихідної речовини шляхом здійснення взаємодії сполуки з відповідним сульфамойлхлоридом у розчиннику в присутності основи. Крім того, сполуки, де Y^{29} являє собою групу, представлену формулою $-OSO_2NH_2$, можуть бути отримані з використанням сполуки, представлені формулою (16), як вихідної речовини шляхом здійснення взаємодії сполуки із хлорсульфонілізоціанатом у розчиннику (наприклад, переважним є ацетонітрил або N,N-диметилацетамід) у присутності мурашиної кислоти. Температура реакції переважно знаходиться в діапазоні від $0\text{ }^{\circ}\text{C}$ до температури кипіння розчинника.

Сполуки, представлені формулою (17), де Y^{29} являє собою групу, представлену формулою $-NR^{57}COR^{58}$ або формулою $-NR^{32}COR^{26}$, можуть бути отримані з використанням сполуки, представлені формулою (18), як вихідної речовини шляхом здійснення реакції амідування сполуки в присутності відповідної карбонової кислоти й агента дегідратації-конденсації, або з використанням відповідного ангідриду карбонової кислоти або відповідного галогеніду карбонової кислоти. Приклади агента дегідратації-конденсації містять у собі 1-етил-3-(3-диметиламінопропіл)карбодіімід, гідрохлорид, дициклогексилкарбодіімід, дифенілфосфорилазид, 1,1'-карбонілдіімідазол, і т. п., і при необхідності може бути використаний активуючий агент, такий як 1-гідроксибензотриазол і гідроксисукцинімід. Приклади реакційного розчинника в такому випадку містять у собі дихлорметан, хлороформ, 1,2-дихлоретан, диметилформамід, тетрагідрофуран, діоксан, толуол, етилацетат, змішаний з них розчинник, і т. п. Ця реакція може бути проведена з використанням основи, і приклади основи містять у собі органічний амін, такий як триетиламін і діізопропілетиламін, сіль органічної кислоти, таку як 2-етилгексаноат натрію й 2-етилгексаноат калію, неорганічна основа, така як карбонат калію, і т. п. Крім того, реакція може бути проведена в присутності або під час відсутності 4-диметиламінопіридину. Температура реакції переважно знаходиться в діапазоні, наприклад, від $-50\text{ }^{\circ}\text{C}$ до температури кипіння реакційного розчинника. Крім того, ангідрид карбонової кислоти також може бути отриманий шляхом здійснення взаємодії відповідної карбонової кислоти і активуючого агента (наприклад, переважним є ізобутилхлороформіат), і сполуки можуть бути отримані шляхом здійснення взаємодії сполуки, представлені формулою (18), і ангідриду карбонової кислоти в основі (наприклад, переважним є триетиламін) і розчиннику (наприклад, переважним є тетрагідрофуран). Температуру реакції вибирають із

діапазону від -78°C до температури кипіння розчинника, і переважною є температура в діапазоні від -78°C до кімнатної температури. Крім того, при використанні галогеніду карбонової кислоти реакція може бути проведена в основі (наприклад, переважним є триетиламін) з використанням розчинника (наприклад, переважним є хлороформ) у присутності галогеніду карбонової кислоти. Температуру реакції вибирають із діапазону від -30°C до температури кипіння розчинника, і переважною є температура в діапазоні від 0°C до кімнатної температури.

Сполуки, представлені формулою (17), де Y^{29} являє собою групу, представлену формулою $-\text{NR}^{69}\text{R}^{70}$ або формулою $-\text{NR}^{30}\text{R}^{31}$, можуть бути отримані шляхом здійснення взаємодії сполуки, представлені формулою (18), і відповідного альдегіду у розчиннику (наприклад, переважними є хлороформ, метанол і т. п.) у присутності гібридного відновника (наприклад, триацетоксигорідрід натрію, ціаноборгідрід натрію, і т. п.). Температура вищезгаданої реакції переважно знаходиться в діапазоні, наприклад, від 0°C до 50°C .

Сполуки, представлені формулою (17), де Y^{29} являє собою групу, представлену формулою $-\text{NR}^{61}\text{CONR}^{62}\text{R}^{63}$ або формулою $-\text{NR}^{32}\text{CONR}^{38}\text{R}^{39}$, можуть бути отримані з використанням сполуки, представлені формулою (18), як вихідної речовини, і шляхом здійснення взаємодії сполуки з відповідним ізоціанатом або з відповідним аміном у присутності трифосгену. При використанні ізоціанату сполуки можуть бути отримані шляхом здійснення взаємодії сполук у розчиннику (переважним є толуол) у присутності основи (переважним є 1,4-діазабіцикло[2.2.2]октан). Температура реакції переважно знаходиться в діапазоні, наприклад, від 0°C до кімнатної температури. При використанні трифосгену сполуки можуть бути отримані шляхом здійснення взаємодії сполуки, представлені формулою (18), і трифосгену в розчиннику (переважним є хлороформ) у присутності основи (переважним є піридин), з наступним додаванням відповідного аміну. Температура реакції переважно знаходиться в діапазоні, наприклад, від 0°C до кімнатної температури.

Крім того, сполуки також можуть бути отримані з використанням сполуки, представлені формулою (18), як вихідної речовини шляхом активації сполуки в розчиннику (переважним є піридин) у присутності біс(4-нітрофеніл)карбонату з наступним додаванням відповідного аміну для проведення реакції. Температуру реакції вибирають із діапазону від 0°C до температури кипіння розчинника, і переважною була температура від кімнатної температури до 80°C . Використовуваний у вищезгаданій реакції амін може являти собою кислотно-адитивну сіль, і переважною кислотно-адитивною сіллю є, наприклад, сіль соляної кислоти.

Сполуки, представлені формулою (17), де Y^{29} являє собою групу, представлену формулою $-\text{NR}^{67}\text{SO}_2\text{R}^{68}$ або формулою $-\text{NR}^{32}\text{SO}_2\text{R}^{37}$, можуть бути отримані з використанням сполуки, представлені формулою (18), як вихідної речовини шляхом здійснення взаємодії сполуки в розчиннику (переважними є хлороформ і дихлорметан) у присутності відповідного сульфонілгалогеніду й у присутності або під час відсутності основи (наприклад, переважним є триетиламін). Температуру реакції вибирають із діапазону, наприклад, від 0°C до 60°C , і переважною є температура в діапазоні від 0°C до кімнатної температури.

Сполуки, представлені формулою (17), де Y^{29} являє собою групу, представлену формулою $-\text{NR}^{32}\text{CSNR}^{33}\text{R}^{34}$, можуть бути отримані з використанням сполуки, представлені формулою (18), як вихідної речовини шляхом здійснення взаємодії сполуки в розчиннику (переважним є толуол) у присутності відповідного тіоізоціанату й у присутності або під час відсутності основи (наприклад, переважними є піридин, 1,4-діазабіцикло[2.2.2]октан, і т. п., і вони можуть бути використані спільно). Температуру реакції вибирають із діапазону, наприклад, від 0°C до температури кипіння розчинника, і переважною є температура в діапазоні від кімнатної температури до 80°C .

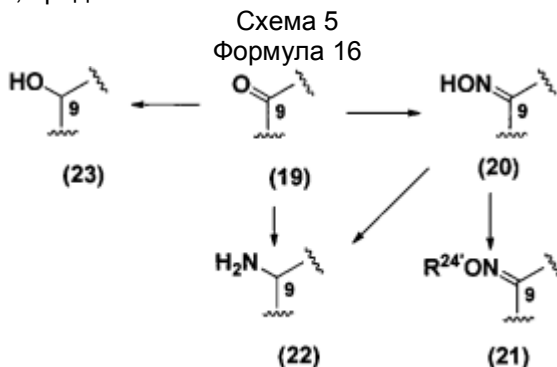
Сполуки, представлені формулою (17), де Y^{29} являє собою групу, представлену формулою $-\text{N}=\text{CNR}^{42}\text{R}^{43}$, можуть бути отримані з використанням сполуки, представлені формулою (18), як вихідної речовини шляхом здійснення взаємодії сполуки в розчиннику (переважним є толуол) у присутності відповідного формаміду й диметилсульфамойлхлориду й у присутності або під час відсутності основи (наприклад, переважним є 4-диметиламінопіридин) з наступним здійсненням взаємодії отриманої речовини у основі (переважним є 1,4-діазабіцикло[2.2.2]октан) і розчиннику (переважним є метанол). Температуру реакції вибирають із діапазону, наприклад, від 0°C до температури кипіння розчинника, і переважною є температура в діапазоні від кімнатної температури до 80°C .

Сполуки, представлені формулою (17), де Y^{29} являє собою групу, представлену формулою $-\text{NR}^{32}\text{SO}_2\text{NR}^{40}\text{R}^{41}$ або формулою $-\text{NR}^{49}\text{SO}_2\text{NR}^{50}\text{R}^{51}$, можуть бути отримані з використанням сполуки, представлені формулою (18), як вихідної речовини шляхом здійснення взаємодії сполуки в розчиннику (переважним є хлороформ) у присутності відповідного сульфамойлгалогеніду, у присутності або під час відсутності основи (переважним є триетиламін)

і в присутності або під час відсутності 4-диметиламінопіридину. Температуру реакції вибирають із діапазону, наприклад, від 0 °С до температури кипіння розчинника, і переважно є температура в діапазоні від 0 °С до кімнатної температури.

Сполуки, представлені формулою (17), де Y^{29} являє собою групу, представлену формулою -NR³²CO₂R³⁵ або формулою -NR⁴⁴CO₂R⁴⁵, можуть бути отримані з використанням сполуки, представлені формулою (18), як вихідної речовини шляхом здійснення взаємодії сполуки в розчиннику (переважним є тетрагідрофуран) у присутності відповідного складного ефіру галогенмурашиної кислоти й у присутності або під час відсутності основи (наприклад, переважним є піридин). Температуру реакції вибирають із діапазону, наприклад, від 0 °С до 60 °С, переважно є температура в діапазоні від 0 °С до кімнатної температури.

Крім того, сполуки, представлені на схемі 5, із числа сполук, представлених на схемі 1 формулами (1)-(4), можуть бути отримані відповідно до стадій, представлених на схемі 5, а також відповідно до стадій, представлених на схемі 1.



(формулами (19)-(23) представлене перетворення фрагмента Z сполук формул (1), (2), (3) і (4), представлених на схемі 1, де у формулі R^{24'} являє собою R²⁴, за винятком атома водню, і R²⁴ характеризується тим же значенням, що й визначене вище).

Сполуки, представлені формулою (20), можуть бути отримані шляхом здійснення взаємодії сполуки, представлені формулою (19), і гідроксиламіну в розчиннику (наприклад, переважним є метанол) у присутності або під час відсутності основи (наприклад, переважним є імідазол). Температура вищезгаданої реакції переважно знаходиться в діапазоні, наприклад, від кімнатної температури до температури кипіння розчинника. Використовуваний у вищезгаданій реакції гідроксиламін може являти собою кислотно-адитивну сіль, і переважною кислотно-адитивною сіллю є, наприклад, сіль соляної кислоти, і т. п.

Сполуки, представлені формулою (21), можуть бути отримані шляхом здійснення взаємодії сполуки, представлені формулою (19), і сполуки, представлені формулою H₂NOR^{24'}, у розчиннику (наприклад, переважним є метанол) у присутності або під час відсутності основи (наприклад, переважним є імідазол). Температура вищезгаданої реакції переважно знаходиться в діапазоні, наприклад, від кімнатної температури до температури кипіння розчинника. Використовувана у вищезгаданій реакції сполука, представлена формулою H₂NOR^{24'}, може являти собою кислотно-адитивну сіль, і переважною кислотно-адитивною сіллю є, наприклад, сіль соляної кислоти, і т. п. Крім того, сполуки, представлені формулою (21), також можуть бути отримані шляхом здійснення взаємодії сполуки, представлені формулою (20), і відповідного алкілгалогеніду, і т. п., у розчиннику (приклади містять у собі, наприклад, тетрагідрофуран, і т. п.) у присутності або під час відсутності основи (приклади містять у собі, наприклад, гідроксид калію, і т. п.). Температуру вищезгаданої реакції вибирають у діапазоні, наприклад, від -20 °С до температури кипіння розчинника, і переважно є температура в діапазоні від 0 °С до кімнатної температури.

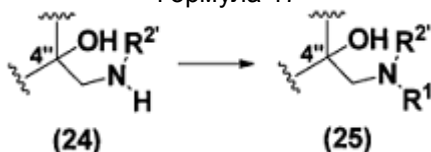
Сполуки, представлені формулою (22), можуть бути отримані шляхом здійснення взаємодії сполуки, представлені формулою (19), з відновником (приклади містять у собі, наприклад, триацетоксидборгідрид натрію, ціаноборгідрид натрію й боргідрид натрію, і переважним є ціаноборгідрид натрію) у розчиннику (наприклад, переважними є метанол, хлороформ і т. п.) у присутності солі амонію (приклади містять у собі, наприклад, ацетат амонію, карбонат амонію, хлорид амонію, і т. п., і переважним є ацетат амонію). Температура вищезгаданої реакції переважно знаходиться в діапазоні, наприклад, від кімнатної температури до температури кипіння розчинника. Як альтернатива, сполуки також можуть бути отримані з використанням сполуки, представлені формулою (19), як вихідної речовини згідно зі способом, подібним до описаних в літературі (Tetrahedron Letters, 1971, vol. 2, p. 195; Tetrahedron Letters, 1972, vol. 1, p. 29), зокрема, шляхом здійснення взаємодії карбонільної групи з гідразином у полярному

розчиннику для перетворення в гіdraзинову групу, і шляхом здійснення взаємодії гіdraзинової групи з нітритом натрію, і т. п., або з використанням сполуки, представленої формулою (20), як вихідної речовини шляхом здійснення взаємодії сполуки із хлоридом титану, і т. п., і шляхом відновлення отриманої іміносполуки гідридним відновником, і т. п.

Сполуки, представлені формулою (23), можуть бути отримані шляхом здійснення взаємодії сполуки, представленої формулою (19), і відновника (переважним є боргідрид натрію) у розчиннику (приклади містять у собі, наприклад, тетрагідрофуран, метил-трет-бутиловий ефір, метанол, і т. п., і два або більше із вказаних типів розчинників можуть бути використані у вигляді суміші). Температуру реакції вибирають із діапазону, наприклад, від -20°C до температури кипіння розчинника, і переважною є температура в діапазоні від 0°C до кімнатної температури.

Крім того, сполуки, представлені на схемі 6, із числа сполук, представлених на схемі 1 формулою (4), можуть бути отримані відповідно до стадії, представленої на схемі 6, а також відповідно до стадій, представлених на схемі 1.

Схема 6
Формула 17

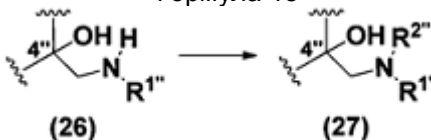


(формулами (24) і (25) представлено перетворення фрагмента в 4''-положенні сполук формули (4), представлених на схемі 1, причому у формулах $R^{1'}$ являє собою C_{1-6} алкілсульфонільну групу, $R^{2'}$ являє собою R^2 , за винятком C_{1-6} алканойльної групи (C_{1-6} алканойльна група може бути заміщена аміногрупою або C_{1-6} алкіламіногрупою), і R^2 характеризується тим же значенням, що і певне вище).

Сполуки, представлені формулою (25), можуть бути отримані з використанням сполуки, представленої формулою (24), як вихідної речовини шляхом здійснення взаємодії сполуки в розчиннику (переважними є хлороформ і дихлорметан) у присутності відповідного сульфонілгалогеніду й у присутності або під час відсутності основи (наприклад, переважним є триетиламін). Температуру реакції вибирають із діапазону, наприклад, від 0°C до 60°C , і переважною є температура в діапазоні від 0°C до кімнатної температури.

Крім того, сполуки, представлені на схемі 7, із числа сполук, представлених на схемі 1 формулою (4), можуть бути отримані відповідно до стадії, представленої на схемі 7, а також відповідно до стадій, представлених на схемі 1.

Схема 7
Формула 18



(формулами (26) і (27) представлено перетворення фрагмента в 4''-положенні сполук формули (4), представлених на схемі 1, де у формулах

$R^{1''}$ являє собою R^1 , за винятком C_{1-6} алкілсульфонільної групи,

$R^{2''}$ являє собою C_{1-6} алканойльну групу (C_{1-6} алканойльна група може бути заміщена аміногрупою або C_{1-6} алкіламіногрупою), і

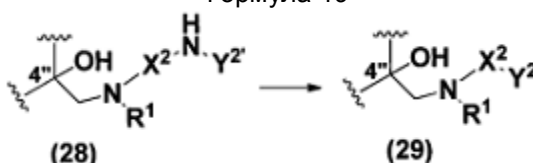
R^1 характеризується тим же значенням, що й визначене вище).

Сполуки, представлені формулою (27), можуть бути отримані з використанням сполуки, представленої формулою (26), як вихідної речовини шляхом здійснення реакції амідування сполуки в присутності відповідної карбонової кислоти й агента дегідратації-конденсації або з використанням відповідного ангідриду карбонової кислоти або відповідного галогеніду карбонової кислоти. Приклади агента дегідратації-конденсації містять у собі гідрохлорид 1-етил-3-(3-диметиламінопропіл)карбодііміду, дициклогексилкарбодіімід, дифенілфосфорилазид, 1,1'-карбонілдіімідазол, і т. п., і при необхідності може бути використаний активуючий агент, такий як 1-гідроксибензотриазол і гідроксисукцинімід. Приклади реакційного розчинника в такому випадку містять у собі дихлорметан, хлороформ, 1,2-дихлоретан, диметилформамід, тетрагідрофуран, діоксан, толуол, етилацетат, змішаний з них розчинник, і т. п. Ця реакція може бути проведена із застосуванням основи, і приклади основи містять у собі органічний амін, такий як триетиламін і діізопропілетиламін, сіль органічної кислоти, таку як 2-етилгексаноат натрію й 2-етилгексаноат калію, неорганічну основу, таку як карбонат калію, і т. п. Крім того, реакція може бути проведена в присутності або під час відсутності 4-диметиламінопіридину. Температура реакції переважно

знаходиться в діапазоні, наприклад, від -50°C до температури кипіння реакційного розчинника. Крім того, ангідрид карбонової кислоти також може бути отриманий шляхом здійснення взаємодії відповідної карбонової кислоти і активуючого агента (наприклад, переважним є ізобутилхлороформіат), і сполуки можуть бути отримані шляхом здійснення взаємодії сполуки, представлені формулою (26), і ангідриду карбонової кислоти в основі (наприклад, переважним є триетиламін) і розчиннику (наприклад, переважним є тетрагідрофуран). Температуру реакції вибирають із діапазону від -78°C до температури кипіння розчинника, і переважною є температура в діапазоні від -78°C до кімнатної температури. Крім того, при використанні галогеніду карбонової кислоти реакція може бути проведена в основі (наприклад, переважним є триетиламін) з використанням розчинника (наприклад, переважним є хлороформ) у присутності галогеніду карбонової кислоти. Температуру реакції вибирають із діапазону від -30°C до температури кипіння розчинника, і переважною є температура в діапазоні від 0°C до кімнатної температури.

Крім того, сполуки, представлені на схемі 8, із числа сполук, представлених на схемі 1 формулою (4), можуть бути отримані відповідно до стадії, представленої на схемі 8, а також відповідно до стадій, представлених на схемі 1.

Схема 8
Формула 19



(формулами (28) і (29) представлено перетворення фрагмента в 4''-положенні сполук формули (4), представлених на схемі 1, причому у формулах

X^2 являє собою C_{1-6} алкіленову групу,

Y^2 являє собою

групу, представлену формулою $-\text{NR}^{11}\text{COR}^{12}$,

групу, представлену формулою $-\text{NR}^{13}\text{CO}_2\text{R}^{14}$,

групу, представлену формулою $-\text{NR}^{15}\text{SO}_2\text{R}^{16}$ або

групу, представлену формулою $-\text{NR}^{17}\text{R}^{18}$,

Y^2 являє собою R^{11} , R^{13} , R^{15} або R^{17} і

R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{14} , R^{15} , R^{16} , R^{17} і R^{18} характеризуються тими ж значеннями, що й визначені вище).

Сполуки, представлені формулою (29), де Y^2 являє собою групу, представлену формулою $-\text{NR}^{11}\text{COR}^{12}$, можуть бути отримані з використанням сполуки, представленої формулою (28), де Y^2 являє собою R^{11} , як вихідної речовини шляхом здійснення реакції амідування сполуки в присутності відповідної карбонової кислоти й агента дегідратації-конденсації або з використанням відповідного ангідриду карбонової кислоти або відповідного галогеніду карбонової кислоти. Приклади агента дегідратації-конденсації містять у собі гідрохлорид 1-етил-3-(3-диметиламінопропіл)карбодіїмід, дициклогексилкарбодіїмід, дифенілфосфорилазид, 1,1'-карбонілдіїмідазол, і т. п., і при необхідності може бути використаний активуючий агент, такий як 1-гідроксibenзотриазол і гідроксисукцинімід. Приклади реакційного розчинника в такому випадку містять у собі дихлорметан, хлороформ, 1,2-дихлоретан, диметилформамід, тетрагідрофуран, діоксан, толуол, етилацетат, змішаний з них розчинник, і т. п. Ця реакція може бути проведена з використанням основи, і приклади основи містять у собі органічний амін, такий як триетиламін і діізопропілетиламін, сіль органічної кислоти, таку як 2-етилгексаноат натрію й 2-етилгексаноат калію, неорганічну основу, таку як карбонат калію, і т. п. Крім того, реакція може бути проведена в присутності або під час відсутності 4-диметиламінопіридину. Температуру реакції переважно знаходиться в діапазоні, наприклад, від -50°C до температури кипіння реакційного розчинника. Крім того, ангідрид карбонової кислоти також може бути отриманий шляхом здійснення взаємодії відповідної карбонової кислоти і активуючого агента (наприклад, переважним є ізобутилхлороформіат), і сполуки можуть бути отримані шляхом здійснення взаємодії сполуки, представлені формулою (28), і ангідриду карбонової кислоти в основі (наприклад, переважним є триетиламін) і розчиннику (наприклад, переважним є тетрагідрофуран). Температуру реакції вибирають із діапазону від -78°C до температури кипіння розчинника, і переважною є температура в діапазоні від -78°C до кімнатної температури. Крім того, при використанні галогеніду карбонової кислоти реакція може бути проведена в основі (наприклад, переважним є триетиламін) із застосуванням розчинника (наприклад, переважним є хлороформ) у присутності галогеніду карбонової кислоти. Температуру реакції вибирають із діапазону від -30°C до

температури кипіння розчинника, і переважною є температура в діапазоні від 0 °C до кімнатної температури.

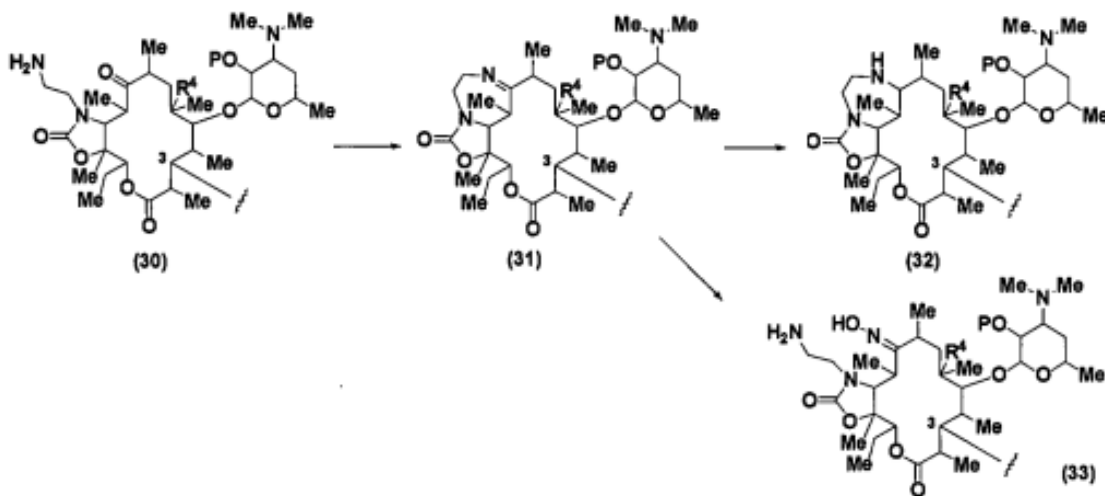
Сполуки, представлені формулою (29), де Y^2 являє собою групу, представлену формулою - $NR^{13}CO_2R^{14}$, можуть бути отримані з використанням сполуки, представленної формулою (28), де Y^2 являє собою R^{13} , як вихідної речовини шляхом здійснення взаємодії сполуки в розчиннику (переважними є хлороформ і дихлорметан) у присутності відповідного складного ефіру галогенмурашиної кислоти й у присутності або під час відсутності основи (наприклад, переважним є триетиламін). Температуру реакції вибирають із діапазону, наприклад, від 0 °C до 60 °C, і переважною є температура в діапазоні від 0 °C до кімнатної температури.

Сполуки, представлені формулою (29), де Y^2 являє собою групу, представлену формулою - $NR^{15}SO_2R^{16}$, можуть бути отримані з використанням сполуки, представленної формулою (28), де Y^2 являє собою R^{15} , як вихідної речовини шляхом здійснення взаємодії сполуки в розчиннику (переважними є хлороформ і дихлорметан) у присутності відповідного сульфонілгалогеніду й у присутності або під час відсутності основи (наприклад, переважним є триетиламін). Температуру реакції вибирають із діапазону, наприклад, від 0 °C до 60 °C, і переважною є температура в діапазоні від 0 °C до кімнатної температури.

Сполуки, представлені формулою (29), де Y^2 являє собою групу, представлену формулою - $NR^{17}R^{18}$, можуть бути отримані з використанням сполуки, представленної формулою (28), де Y^2 являє собою R^{17} , як вихідної речовини шляхом здійснення взаємодії сполуки з відповідним альдегідом у розчиннику (приклади містять у собі, наприклад, хлороформ, метанол, і т. п.) у присутності гібридного відновника (наприклад, триацетоксиборгідрид натрію, ціаноборгідрид натрію, і т. п.). Температура вищезгаданої реакції переважно знаходиться в діапазоні, наприклад, від 0 °C до 50 °C.

Крім того, сполуки, представлені на схемі 9, із числа сполук, представлених на схемі 1 формулами (1)-(4), можуть бути отримані відповідно до стадій, представлених на схемі 9, а також відповідно до стадій, представлених на схемі 1.

Схема 9
Формула 20



(формулами (30)-(33) представлене перетворення часткової структури в складі кожної зі сполук формул (1), (2), (3) і (4), представлених на схемі 1, за винятком замісника в 3-положенні, причому R^4 і P характеризуються у формулах тими ж значеннями, що й визначені вище).

Сполуки, представлені формулою (31), можуть бути отримані з використанням сполуки, представленної формулою (30), як вихідної речовини шляхом здійснення взаємодії сполуки в розчиннику (наприклад, переважним є толуол) у присутності або під час відсутності кислоти (наприклад, переважною є оцтова кислота, і т. п.). Температуру реакції вибирають із діапазону, наприклад, від 0 °C до температури кипіння розчинника, і переважною є температура в діапазоні від кімнатної температури до температури кипіння розчинника.

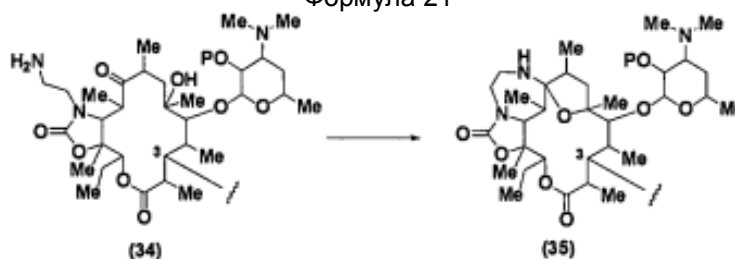
Сполуки, представлені формулою (32), можуть бути отримані з використанням сполуки, представленної формулою (31), як вихідної речовини шляхом здійснення взаємодії сполуки в розчиннику (наприклад, переважним є етанол, і т. п.) у присутності або під час відсутності відновника (наприклад, переважним є ціаноборгідрид натрію) і кислоти (наприклад, переважною є оцтова кислота, і т. п.). Температуру реакції вибирають із діапазону, наприклад, від 0 °C до

температури кипіння розчинника, і переважною є температура в діапазоні від кімнатної температури до температури кипіння розчинника.

Сполуки, представлені формулою (33), можуть бути отримані з використанням сполуки, представленої формулою (31), як вихідної речовини шляхом здійснення взаємодії сполуки з гідроксиламіном у розчиннику (наприклад, переважним є метанол) у присутності або під час відсутності основи (наприклад, переважним є імідазол). Використовуваний у вищезгаданій реакції гідроксиламін може являти собою кислотну-адитивну сіль, і переважною кислотну-адитивною сіллю є, наприклад, сіль соляної кислоти. Температура вищезгаданої реакції переважно знаходиться в діапазоні, наприклад, від кімнатної температури до температури кипіння розчинника.

Крім того, сполуки, представлені на схемі 10, із числа сполук, представлених на схемі 1 формулами (1)-(4), можуть бути отримані відповідно до стадії, представленої на схемі 10, а також відповідно до стадій, представлених на схемі 1.

Схема 10
Формула 21

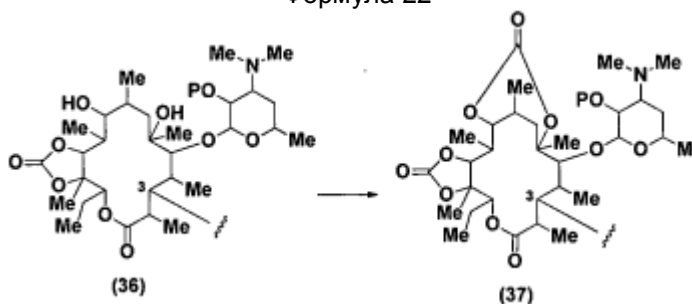


(формулами (34) і (35) представлено перетворення часткової структури в складі кожної зі сполук формул (1), (2), (3) і (4), представлених на схемі 1, за винятком замісника в 3-положенні, причому Р характеризується у формулах тим же значенням, що й визначене вище).

Сполуки, представлені формулою (35), можуть бути отримані, наприклад, способом, подібним до описаних у літературі (наприклад, Journal of Antibiotics, 2003, vol. 56, p. 1062). Зокрема, вони можуть бути отримані з використанням як вихідної речовини сполуки, представленої формулою (34), шляхом здійснення взаємодії сполуки в розчиннику (переважним є етанол) у присутності або під час відсутності кислоти (наприклад, переважною є оцтова кислота, і т. п.). Температуру реакції вибирають із діапазону, наприклад, від 0 °C до температури кипіння розчинника, і переважною є температура в діапазоні від кімнатної температури до 60 °C.

Крім того, сполуки, представлені на схемі 11, із числа сполук, представлених на схемі 1 формулами (1)-(4), можуть бути отримані відповідно до стадії, представленої на схемі 11, а також відповідно до стадій, представлених на схемі 1.

Схема 11
Формула 22



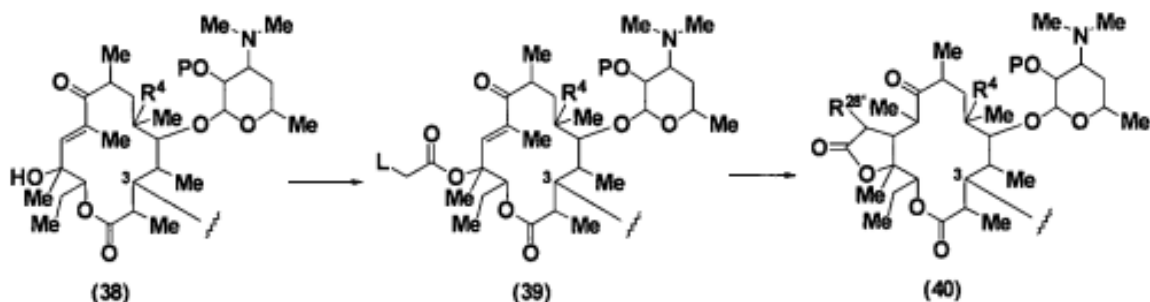
(формулами (36) і (37) представлено перетворення часткової структури в складі кожної зі сполук формул (1), (2), (3) і (4), представлених на схемі 1, за винятком замісника в 3-положенні, причому Р характеризується у формулах тим же значенням, що й визначене вище).

Сполуки, представлені формулою (37), можуть бути отримані, наприклад, способом, подібним до описаних у літературі (наприклад, Journal of Medicinal Chemistry, 2003, vol. 46, p. 2706). Зокрема, вони можуть бути отримані з використанням сполуки, представленої формулою (36), як вихідної речовини шляхом здійснення взаємодії сполуки в розчиннику (наприклад, переважними є хлороформ і дихлорметан) у присутності карбонуючого агента (наприклад, переважним є трифосген) і основи (наприклад, переважним є піридин). Температуру реакції вибирають із діапазону, наприклад, від -20 °C до температури кипіння розчинника, і переважною є температура в діапазоні від 0 °C до кімнатної температури.

Крім того, сполуки, представлені на схемі 12, із числа сполук, представлених на схемі 1 формулами (1)-(4), можуть бути отримані відповідно до стадій, представлених на схемі 12, а також відповідно до стадій, представлених на схемі 1.

Схема 12
Формула 23

5



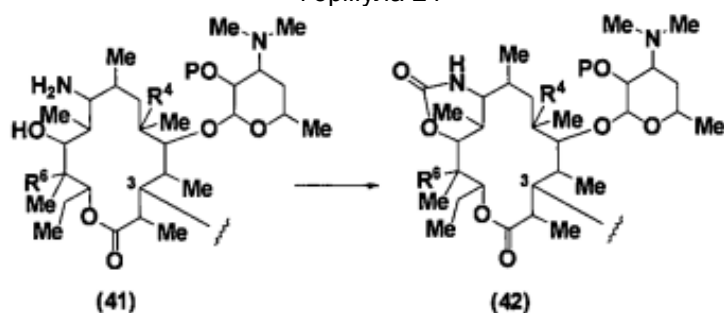
(формулою (40) представлена часткова структура в складі кожної зі сполук формул (1), (2), (3) і (4), представлених на схемі 1, за винятком замісника в 3-положенні, причому у формулі R^{28} являє собою R^{28} , за винятком атома водню, L являє собою атом галогену, і R^4 , R^{28} і P характеризуються тими ж значеннями, що й визначені вище).

Сполуки, представлені формулою (39), можуть бути отримані з використанням сполуки, представленої формулою (38), як вихідної речовини шляхом здійснення взаємодії сполуки в розчиннику (наприклад, переважним є дихлорметан) у присутності ангідриду галогеноцтової кислоти (наприклад, переважним є ангідрид хлороцтової кислоти), у присутності або під час відсутності основи (наприклад, переважним є піридин) і в присутності або під час відсутності 4-диметиламінопіридину. Температуру реакції вибирають із діапазону, наприклад, від -20°C до температури кипіння розчинника, і переважною є температура в діапазоні від 0°C до кімнатної температури.

Сполуки, представлені формулою (40), де R^{28} являє собою ціаногрупу, можуть бути отримані з використанням сполуки, представленої формулою (39), як вихідної речовини шляхом здійснення взаємодії α -ціанокетонної сполуки, яка може бути отримана шляхом здійснення взаємодії вихідного матеріалу й ціануючого агента (наприклад, переважним є ціанід натрію) у розчиннику (наприклад, переважним є диметилформамід), з основою (наприклад, переважним є трет-бутоксид калію) в розчиннику (прикладі містять у собі, наприклад, тетрагідрофуран, диметилформамід, і т. п., і переважним є змішаний з них розчинник, і т. п.). Температуру реакції вибирають із діапазону, наприклад, від -20°C до температури кипіння розчинника, і переважною є температура в діапазоні від 0°C до кімнатної температури.

Сполуки, представлені формулою (40) де R^{28} являє собою C_{1-6} алкілсульфанільну групу, можуть бути отримані з використанням сполуки, представленої формулою (39), як вихідної речовини шляхом здійснення взаємодії α -тіокетонної сполуки, яка може бути отримана шляхом здійснення взаємодії вихідного матеріалу з відповідним тіолом і основою (наприклад, переважним є гідрид натрію) у розчиннику (наприклад, переважним є диметилформамід), з основою (наприклад, переважним є гідрид натрію) у розчиннику (прикладі містять у собі, наприклад, тетрагідрофуран, диметилформамід, і т. п., і переважним є змішаний з них розчинник, і т. п.). Температуру реакції вибирають із діапазону, наприклад, від -20°C до температури кипіння розчинника, і переважною є температура в діапазоні від 0°C до кімнатної температури.

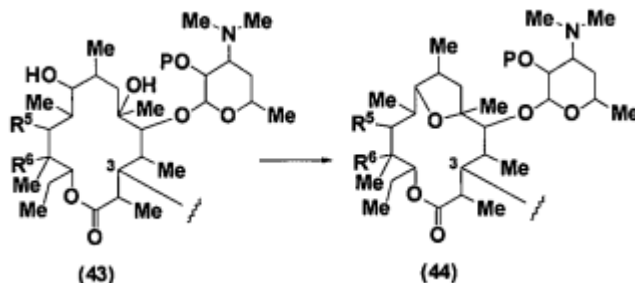
Крім того, сполуки, представлені на схемі 13, із числа сполук, представлених на схемі 1 формулами (1)-(4), можуть бути отримані відповідно до стадії, представленої на схемі 13, а також відповідно до стадій, представлених на схемі 1.

Схема 13
Формула 24

(формулами (41) і (42) представлена часткова структура в складі кожної зі сполук формул (1), (2), (3) і (4), представлених на схемі 1, за винятком замісника в 3-положенні, причому R^4 , R^6 і R характеризуються у формулах тими ж значеннями, що й визначені вище).

Сполуки, представлені формулою (42), можуть бути отримані з використанням сполуки, представлені формулою (41), як вихідної речовини шляхом здійснення взаємодії сполуки, яка може бути отримана шляхом здійснення взаємодії вихідної речовини з ди-трет-бутилдикарбонатом, бензилхлороформіатом, і т. п., у розчиннику (наприклад, переважним є змішаний із хлороформу й води розчинник) у присутності або під час відсутності основи (наприклад, переважним є гідрокарбонат натрію, і т. п.) у розчиннику (наприклад, переважним є ізопропанол), у присутності або під час відсутності основи (наприклад, переважним є карбонат калію). Температуру реакції вибирають із діапазону, наприклад, від 0 °С до температури кипіння розчинника, і переважною є температура в діапазоні від кімнатної температури до температури кипіння розчинника.

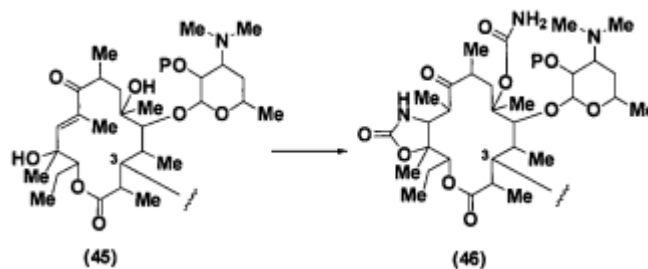
Крім того, сполуки, представлені на схемі 14, із числа сполук, представлених на схемі 1 формулами (1)-(4), можуть бути отримані відповідно до стадії, представлені на схемі 14, а також відповідно до стадій, представлених на схемі 1.

Схема 14
Формула 25

(формулами (43) і (44) представлена часткова структура в складі кожної зі сполук формул (1), (2), (3) і (4), представлених на схемі 1, за винятком замісника в 3-положенні, причому R^5 , R^6 і R характеризуються у формулах тими ж значеннями, що й визначені вище).

Сполуки, представлені формулою (44), можуть бути отримані з використанням сполуки, представлені формулою (43), як вихідної речовини шляхом здійснення взаємодії сполуки в розчиннику (наприклад, переважним є хлороформ) у присутності трифосгену й основи (наприклад, переважним є піридин). Температуру реакції вибирають із діапазону, наприклад, від -78 °С до кімнатної температури, і переважною є температура в діапазоні від -50 °С до 0 °С.

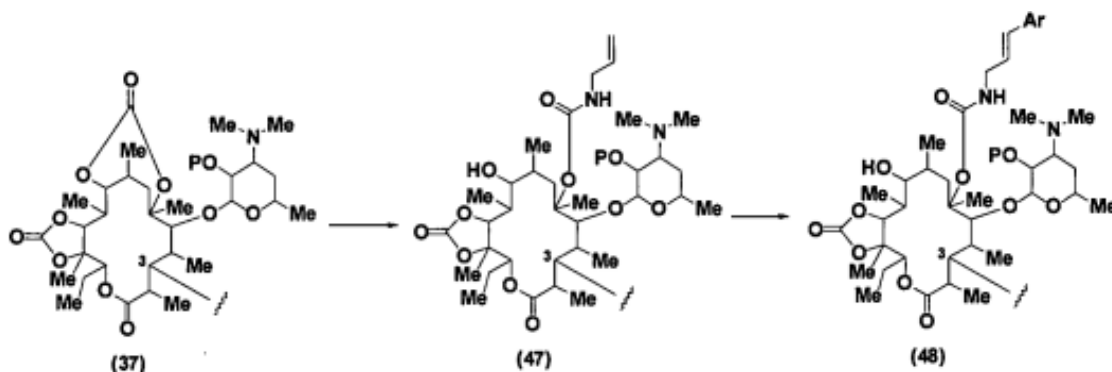
Крім того, сполуки, представлені на схемі 15, із числа сполук, представлених на схемі 1 формулами (1)-(4), можуть бути отримані відповідно до стадії, представлені на схемі 15, а також відповідно до стадій, представлених на схемі 1.

Схема 15
Формула 26

(формулою (46) представлена часткова структура в складі кожної зі сполук формул (1), (2), (3) і (4), представлених на схемі 1, за винятком замісника в 3-положенні, причому Р характеризується у формулі тим же значенням, що й визначене вище).

Сполуки, представлені формулою (46), можуть бути отримані, наприклад, з використанням сполуки, представленої формулою (45), одержуваної способом, подібним до описаних у літературі (наприклад, міжнародна патентна публікація WO 02/046204), як вихідної речовини шляхом здійснення взаємодії сполуки в розчиннику (наприклад, переважними є хлороформ і дихлорметан) у присутності трихлорацетилізоціанату й шляхом здійснення взаємодії отриманої речовини зі спиртом (наприклад, переважним є метанол) у розчиннику (наприклад, переважним є змішаний з метанолу й води розчинник) у присутності основи (наприклад, переважним є триетиламін). Температуру реакції вибирають із діапазону, наприклад, від 0 °С до температури кипіння розчинника, і переважною є температура в діапазоні від 0 °С до кімнатної температури.

Крім того, сполуки, представлені на схемі 16, із числа сполук, представлених на схемі 1 формулами (1)-(4), можуть бути отримані відповідно до стадій, представлених на схемі 16, а також відповідно до стадій, представлених на схемі 1.

Схема 16
Формула 27

(формулами (47) і (48) представлена часткова структура в складі кожної зі сполук формул (1), (2), (3) і (4), представлених на схемі 1, за винятком замісника в 3-положенні, причому у формулах Ar являє собою гетероарильну групу, і Р характеризується тим же значенням, що й визначене вище).

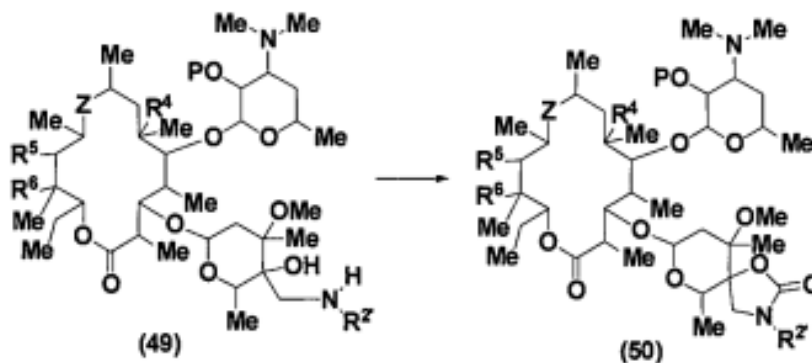
Сполуки, представлені формулою (47), можуть бути отримані з використанням сполуки, представленої формулою (37), як вихідної речовини шляхом здійснення взаємодії сполуки в розчиннику (наприклад, переважним є тетрагідрофуран) у присутності аліламіну. Температуру реакції вибирають із діапазону, наприклад, від 0 °С до температури кипіння розчинника, і переважною є температура в діапазоні від 0 °С до кімнатної температури.

Сполуки, представлені формулою (48), можуть бути отримані в реакції Мізорокі-Хека з використанням сполуки, представленої формулою (47), як вихідної речовини. Зокрема, вони можуть бути отримані шляхом здійснення взаємодії вихідної речовини з основою (наприклад, переважним є триетиламін) у розчиннику (наприклад, переважним є ацетонітрил) у присутності арилгалогеніду, паладію з нульовою валентністю або двовалентного паладію й фосфінового ліганду. Температуру реакції вибирають із діапазону, наприклад, від 0 °С до температури кипіння розчинника, і переважною є температура в діапазоні від кімнатної температури до температури кипіння розчинника. Крім того, ця реакція також може бути проведена з використанням мікрохвильового обладнання. Докладний огляд реакції Мізорокі-Хека

представлений в Angewandte Chemie International Edition, 1994, vol. 33, p. 2379 і Chemical Reviews, 2000, vol. 100, p. 3009.

Крім того, сполуки, представлені на схемі 17, із числа сполук, представлених на схемі 1 формулами (1)-(4), також можуть бути отримані відповідно до стадії, представленої на схемі 17, а також відповідно до стадій, представлених на схемі 1.

Схема 17
Формула 28



(позначення R^2 , R^4 , R^5 , R^6 , P і Z характеризуються у формулах тими ж значеннями, що й визначені вище, і P характеризується тим же значенням, що й визначене вище).

Сполуки, представлені формулою (50), можуть бути отримані з використанням сполуки, представленої формулою (49) як вихідної речовини шляхом здійснення взаємодії сполуки в розчиннику (наприклад, переважним є хлороформ або дихлорметан) у присутності карбонуючого агента (наприклад, переважним є трифосген, і т. п.) і в присутності або під час відсутності основи (наприклад, переважним є піридин). Температуру реакції вибирають із діапазону, наприклад, від $-20\text{ }^{\circ}\text{C}$ до температури кипіння розчинника, і переважною є температура в діапазоні від $0\text{ }^{\circ}\text{C}$ до кімнатної температури.

Гідроксигрупи, аміногрупи, карбоксигрупи й оксимні групи, які містяться в сполуках, представлених формулами (1)-(50), що згадуються в цих способах синтезу, можуть бути захищені захисними групами, які вибірково видаляються, відомими в даній галузі техніки, і шляхом їхнього видалення на необхідній стадії можуть бути отримані проміжні сполуки для синтезу сполук, представлених формулою (I). Приклади захисної групи містять у собі силільну захисну групу, таку як триметилсилільна група, триетилсилільна група й трет-бутилдиметилсилільна група, ацильну захисну групу, таку як ацетильна група, пропіонільна група й бензоїльна група, ефірну захисну групу, таку як бензильна група, 4-метоксибензильна група й 2-хлорбензильна група, ацетальну захисну групу, таку як тетрагідропіранільна група, тетрагідрофуранільна група й 1-етоксіетильна група, карбонатну захисну групу, таку як бензилоксикарбонільна група й трет-бутилоксикарбонільна група, і т. п. Проте, крім згаданих вище, також можуть бути використані захисні групи, описані в Protective Groups in Organic Syntheses (Third Edition, 1999, Ed. by p. G.M. Wuts, T. Green), і т. п. Крім того, згадані в описаних способах синтезу заступники сполук, представлених формулами (1)-(50), можуть бути взаємозамінно перетворені відомими способами.

Проміжні сполуки й цільові сполуки, згадані в згадані вище способах одержання, можуть бути виділені й очищені способами очищення, традиційно використовуваними в хімії органічного синтезу, наприклад, шляхом нейтралізації, фільтрування, екстрагування, промивання, сушіння, концентрування, перекристалізації з розчинником, таким як етилацетат, етилацетат/гексан, ізопропіловий спирт, етанол, водний етанол, ацетон, водний ацетон, і т. п., різними хроматографічними методиками, і т. п. Проміжні сполуки можуть бути також використані в наступних реакціях без окремого очищення.

Речовина, вибрана із групи, яка складається зі сполук, представлених вищезгаданою формулою (I), їх фізіологічно прийнятних солей і їх гідратів і сольватів, може бути використана як лікарський засіб для профілактичного і/або терапевтичного лікування мікробіального інфекційного захворювання, як новий макролідний антибіотик. Переважно, фармацевтична композиція, яка містить вищезгадану речовину разом з одним або декількома видами звичайно використовуваних фармацевтичних добавок, може бути приготована й уведена як профілактичне і/або терапевтичне лікування мікробіального інфекційного захворювання в ссавців, включаючи людину. Шлях введення конкретно не обмежений, і може бути вибраний пероральний шлях або парентеральний шлях введення. Приклади фармацевтичної композиції,

що підходить для перорального введення, включають, наприклад, таблетки, капсули, порошки, гранули, сиропи й т. п., і приклади фармацевтичної композиції, що підходить для парентерального введення, включають, наприклад, ін'єктовані препарати для підшкірної ін'єкції, внутрішньом'язової інфекції або внутрішньовенної ін'єкції, крапельниці, супозиторії й т. п., але фармацевтична композиція не обмежується вказаними прикладами. Ін'єктовані препарати й крапельниці можуть бути також приготовлені у вигляді фармацевтичної композиції у формі ліофілізованого препарату. Для виробництва твердих препаратів, таких як таблетки й капсули, можуть відповідним чином застосовуватися звичайно використовувані наповнювачі, стабілізатори, зв'язувальні речовини, покривні засоби й т. п., для виробництва ін'єкційних препаратів, крапельниць і т. п. можуть відповідним чином застосовуватися звичайно використовувані фармацевтичні добавки, наприклад, наповнювачі, модифікатори рН, заспокійливі засоби, стабілізатори, розчинювальні засоби й т. п., і вказані речовини можуть бути відповідним чином вибрані фахівцем у даній галузі техніки.

Хоча тип мікробіального інфекційного захворювання, як об'єкта застосування лікарського засобу згідно із даним винаходом, конкретно не обмежений, переважні приклади включають бактеріальні інфекційні захворювання, мікоплазмові інфекційні захворювання, хламідійні інфекційні захворювання й т. п. Приклади бактеріальних інфекційних захворювань включають грампозитивні або грамнегативні бактеріальні інфекційні захворювання, і лікарський засіб згідно із даним винаходом може використовуватися відносно вищевказаних захворювань тим же способом, що й традиційно використовувані макроліди. Однак лікарський засіб згідно із даним винаходом характеризується поліпшеною антибактеріальною активністю, зокрема, навіть відносно резистентних до еритроміцину бактерій (наприклад, резистентні пневмококи, стрептококи й мікоплазми), відносно яких традиційні макроліди не можуть продемонструвати значущу антибактеріальну активність, і має надзвичайно широкий антибактеріальний спектр. Тому лікарський засіб застосовний навіть при інфекційному захворюванні, коли бактерія, яка викликає захворювання, не визначена.

Лікарський засіб згідно із даним винаходом може бути використаний для профілактичного і/або терапевтичного лікування інфекційних захворювань, викликаних, наприклад, мікроорганізмами родів *Staphylococcus* і *Streptococcus*, пневмококами, *Moraxella* (*Branhamella*) *catarrhalis*, *Haemophilus influenzae*, мікроорганізмами родів *Legionella*, *Campylobacter*, *Peptostreptococcus*, *Prevotella*, *Chlamydia*, *Chlamydophila* і *Mycoplasma* і т. п., і може бути використаний без обмеження при поверхневій шкірній інфекції, глибокій шкірній інфекції, лімфангіті й лімфаденіті, хронічній піодермії, вторинній посттравматичній інфекції, термальному опіку, операційній рані й т. п., періанальному абсцесі, фарингіті й ларингіті (ларингофарингіті), тонзиліті, гострому бронхіті, пневмонії, абсцесі легені, вторинній інфекції при хронічних респіраторних захворюваннях (включаючи хронічний бронхіт і дифузійний панбронхіоліт), бронхієктазії, уретриті, цервіциті, інфекційному ентериті, запаленні середнього вуха, синуситі, скарлатині, коклюшу, періодонтиті, перікороніті, запаленні щелепи, супроводжувачому синдром набутого імунodefіциту (AIDS) дисемінованому захворюванні *Mycobacterium avium complex* (MAC), інфекційному захворюванні *Helicobacter pylori* при виразці шлунку й виразці дванадцятипалої кишки, і т. п.

Доза лікарського засобу згідно із даним винаходом конкретно не обмежена, і доза може бути відповідним чином вибрана залежно від типу інфекційного захворювання, мети введення (профілактичне або терапевтичне лікування), віку, ваги пацієнта й т. п., тяжкості інфекційного захворювання й т. п. Наприклад, у випадку перорального введення, як добова доза може бути введено від 100 до 1000 мг однократно або декілька раз у вигляді окремих порцій. Крім того, лікарський засіб згідно із даним винаходом може бути введений разом з одним або декількома видами інших антибактеріальних засобів або антибіотиків.

ПРИКЛАДИ

Даний винахід буде більш докладно роз'яснений з посиланням на довідкові приклади, приклади й тестовий приклад. Проте, обсяг даного винаходу не обмежується вказаними прикладами.

Довідковий приклад 1: Синтез N-метил-2-[(2R)-2-метилпіролідін-1-іл]етанаміну

(1) Складний трет-бутиловий ефір метил-(2-оксоетил)карбамінової кислоти (11,2 г) розчиняли в хлороформі (200 мл), до розчину додавали (R)-2-метилпіролідін (5,0 г) і триацетоксигоргідрид натрію (18,7 г), і перемішували суміш при кімнатній температурі протягом 2 годин. До реакційної суміші додавали насичений водний гідрокарбонат натрію, і розділяли шари. Органічний шар фільтрували з використанням фазового сепаратора для додаткового розділення шарів, і концентрували отриманий органічний шар в умовах зниженого тиску з одержанням залишку. Отриманий залишок очищали методом колонкової хроматографії на

силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 20/1/0,1→10/1/0,1) з одержанням алкільної сполуки (11,8 г).

(2) До сполуки (3,0 г), отриманої на описаній вище стадії (1), при охолодженні на льоді додавали 4М розчин соляної кислоти в етилацетаті (10,0 мл), і перемішували отриману суміш протягом 2 годин. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску, до отриманого залишку для нейтралізації додавали 15 % водний гідроксид натрію, і екстрагували суміш діоксаном. Отриманий органічний шар сушили над карбонатом калію й фільтрували, і концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску з одержанням залишку. Отриманий залишок очищали методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 20/1/0,1→5/1/0,1) з одержанням вказаної в заголовку сполуки (790 мг).

МС (ESI) m/z = 143,2 $[M+H]^+$

^1H -ЯМР (600 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 1,08 (д, $J=5,96$ Гц, 3H), 1,35-1,43 (м, 1H), 1,62-1,79 (м, 2H), 1,86-1,94 (м, 1H), 2,08 (кв, $J=8,71$ Гц, 1H), 2,12-2,19 (м, 1H), 2,25-2,33 (м, 1H), 2,45 (с, 3H), 2,63-2,75 (м, 2H), 2,91-2,99 (м, 1H), 3,12 (тд, $J=8,71$, 2,75 Гц, 1H)

Довідковий приклад 2: Синтез 2-(1,1-діоксидо-1,2-тіазолідин-2-іл)-N-метилетанаміну

(1) Складний трет-бутиловий ефір N-(2-аміноетил)-N-метилкарбамінової кислоти (1,0 г) розчиняли в тетрагідрофурані (60 мл), до розчину додавали діізопропілетиламін (1,2 мл), потім до суміші додавали 3-хлорпропансульфонілхлорид (768 мкл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 2 годин. До реакційної суміші додавали насичений водний гідрокарбонат натрію й етилацетат, розділяли шари, отриманий органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі з одержанням сульфонамідної сполуки (1,35 г).

(2) Сполуку (1,33 г), отриману на описаній вище стадії (1), розчиняли в диметилформаміді (42 мл), до розчину додавали 70 % гідрид натрію (173,8 мг), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 3 годин. До реакційної суміші додавали насичений водний гідрокарбонат натрію й етилацетат, розділяли шари, органічний шар тричі промивали дистильованою водою, а потім сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ → хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 10/1/0,1) з одержанням циклізованої сполуки (460 мг).

(3) Вказану в заголовку сполуку (89 мг) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 1, стадія (2), шляхом використання сполуки (460 мг), отриманої на описаній вище стадії (2), як вихідної речовини.

МС (ESI) m/z = 179,1 $[M+H]^+$

^1H -ЯМР (200 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 2,25-2,49 (м, 5H), 2,76-2,84 (м, 2H), 3,11-3,22 (м, 4H), 3,30 (т, $J=6,59$ Гц, 2H)

Довідковий приклад 3: Синтез N-бутил-N-етил-N'-метилетан-1,2-діаміну

Вказану в заголовку сполуку (2,38 г) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 1, шляхом використання N-етил-N-бутиламіну (2,34 г) як вихідної речовини.

МС (ESI) m/z = 159,2 $[M+H]^+$

^1H -ЯМР (200 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 0,83-1,06 (м, 6H), 1,19-1,50 (м, 4H), 2,35-2,67 (м, 11H)

(Довідковий приклад 4: Синтез N-етил-N'-метил-N-(пропан-2-іл)етан-1,2-діаміну

Вказану в заголовку сполуку (2,1 г) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 1, шляхом використання N-етил-N-ізопропіламіну (2,0 г) як вихідної речовини.

МС (ESI) m/z = 145,2 $[M+H]^+$

^1H -ЯМР (200 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 0,94-1,06 (м, 9H), 2,39-2,63 (м, 9H), 2,86-3,01 (м, 1H)

Довідковий приклад 5: Синтез N-(циклопропілметил)-N-етил-N'-метилетан-1,2-діаміну

(1) Алкільну сполуку (5,4 г) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 1, стадія (1), шляхом використання циклопропілметиламіну (4,85 г) як вихідної речовини.

(2) Вказану в заголовку сполуку (2,74 г) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 1, шляхом використання сполуки (5,4 г), отриманої на описаній вище стадії (1), і ацетальдегіду (6,35 мл) як вихідних речовин.

МС (ESI) m/z = 157,2 $[M+H]^+$

^1H -ЯМР (200 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 0,04-0,14 (м, 2H), 0,43-0,55 (м, 2H), 0,77-0,93 (м, 1H), 1,02 (т, $J=7,25$ Гц, 3H), 2,34 (д, $J=6,59$ Гц, 2H), 2,45 (с, 3H), 2,55-2,68 (м, 6H)

Довідковий приклад 6: N-метил-2-[2-(трифторметил)піролідін-1-іл]етанаміну

Вказану в заголовку сполуку (0,51 г) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 1, шляхом використання 2-(трифторметил)піролідину (500 мг) як вихідної речовини.

МС (ESI) $m/z = 197,2 [M+H]^+$

¹H-ЯМР (200 МГц, CDCl₃) δ (м. ч.): 1,74-2,01 (м, 4H), 2,36-2,53 (м, 1H), 2,59-2,77 (м, 1H), 2,88 (с, 3H), 2,98-3,44 (м, 5H)

Довідковий приклад 7: Синтез N,N-діетил-N'-метилгліцинаміду

(1) N-метилбензиламін (2,02 г) розчиняли в тетрагідрофурані (70 мл), до розчину додавали 2-хлор-N,N-діетилацетамід (1,0 г), і перемішували отриману суміш при 60 °С протягом 2 годин. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску, до отриманого залишку додавали етилацетат і насичений водний хлорид амонію, і розділяли шари. Органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували, і концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску. Отриманий залишок очищали методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 50/1/0,1→10/1/0,1) з одержанням алкільної сполуки (1,83 г).

(2) Сполуку (1,0 г), отриману на описаній вище стадії (1), розчиняли в метанолі (1 мл), до розчину додавали 20 % гідроксид паладію на вугіллі (100 мг), і перемішували отриману суміш протягом ночі при кімнатній температурі під тиском 1 атм водню. Реакційну суміш фільтрували, потім фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 50/1/0,1) з одержанням вказаної в заголовку сполуки (808 мг).

МС (ESI) $m/z = 145,2 [M+H]^+$

¹H-ЯМР (600 МГц, CDCl₃) δ (м. ч.): 1,13 (т, J=7,11 Гц, 3H), 1,18 (т, J=7,11 Гц, 3H), 2,44 (с, 3H), 3,26 (кв, J=7,34 Гц, 2H), 3,36 (с, 2H), 3,40 (кв, J=7,34 Гц, 2H)

Довідковий приклад 8: Синтез N-метил-2-(пропан-2-ілокси)етанаміну

(1) До розчину 2-аміноетилізопропілового ефіру (0,9 г) у хлороформі (9 мл) при кімнатній температурі додавали ди-трет-бутилдикарбонат (2,09 г), і перемішували суміш протягом 30 хвилин. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ → хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 20/1/0,1) з одержанням захищеної сполуки (2,3 г).

(2) Сполуку (2,3 г), отриману на описаній вище стадії (1), розчиняли в диметилформаміді (45 мл), до розчину додавали 70 % гідрид натрію (370 мг), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 15 хвилин. До реакційної суміші додавали метилйодид (672 мкл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 4 годин. До суміші додатково додавали 70 % гідрид натрію (370 мг) і метилйодид (672 мкл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 2 годин і при 50 °С протягом 2 годин. Реакційну суміш охолоджували до кімнатної температури, потім до реакційної суміші додавали дистильовану воду, етилацетат і толуол, і розділяли шари. Органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску з одержанням метильної сполуки.

(3) Вказану в заголовку сполуку (650 мг) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 1, стадія (2), шляхом використання сполуки, отриманої на описаній вище стадії (2), як вихідної речовини.

МС (ESI) $m/z = 118,2 [M+H]^+$

¹H-ЯМР (600 МГц, CDCl₃) δ (м. ч.): 1,12-1,19 (м, 6H), 2,46 (с, 3H), 2,71-2,77 (м, 2H), 3,54 (т, J=5,27 Гц, 2H), 3,58 (дт, J=12,26, 6,02 Гц, 1H)

Довідковий приклад 9: Синтез N,N-діетил-2-(метиламіно)етансульфонаміду

(1) Діетиламін (1,0 г) розчиняли в хлороформі (60 мл), до розчину додавали триетиламін (3,8 мл), до суміші при охолодженні на льоді по краплях додавали 2-фталімідоетансульфонілхлорид (3,74 г), і перемішували отриману суміш протягом 1 години. До реакційної суміші додавали дистильовану воду, і розділяли шари. Органічний шар промивали насиченим водним гідрокарбонатом натрію, а потім фільтрували з використанням фазового сепаратора для розділення шарів, отриманий органічний шар концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (гексан/етилацетат = 3/1→1/1) з одержанням сульфонамідної сполуки (3,34 г).

(2) Сполуку (3,3 г), отриману на описаній вище стадії (1), розчиняли в етанолі (110 мл), до розчину додавали гідазину моногідрат (1,65 мл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 1 години й при нагріванні зі зворотним холодильником протягом 2 годин. Реакційну суміш залишали охолоджуватися до кімнатної температури, а потім фільтрували, і концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску. Отриманий залишок очищали методом

колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 500/1/0,1→50/1/0,1) з одержанням аміносполуки (1,35 г).

(3) Вказану в заголовку сполуку (650 мг) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 8, стадії (1) і (2), і довідковому прикладі 1, стадія (2), шляхом використання сполуки (1,35 г), отриманої на описаній вище стадії (2), як вихідної речовини.

MC (ESI) $m/z = 195,2 [M+H]^+$

^1H -ЯМР (600 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 1,21 (т, $J=7,11$ Гц, 6H), 2,45 (с, 3H), 3,01-3,05 (м, 2H), 3,08-3,13 (м, 2H), 3,30 (кв, $J=6,88$ Гц, 4H)

Довідковий приклад 10: Синтез 1-[2-(метиламіно)етил]піролідін-2-ону

(1) Сульфонамідну сполуку (3,8 г) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 9, стадія (1), шляхом використання N-бензил-N-метилетаноламіну (5,0 г) і метансульфонілхлориду (258 мкл) як вихідних речовин.

(2) 2-Піролідон (349,8 мг) розчиняли в диметилформаміді (20 мл), до розчину додавали 70% гідрид натрію (141 мг), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 5 хвилин. До реакційної суміші додавали сполуку (500 мг), отриману на описаній вище стадії (1), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 2 годин. До реакційної суміші додавали етилацетат, толуол і дистильовану воду, і розділяли шари. Органічний шар двічі промивали дистильованою водою, потім сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол = 50/1→10/1) з одержанням заміщеної сполуки (287 мг).

(3) Вказану в заголовку сполуку (210 мг) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 7, стадія (2), шляхом використання отриманої вище сполуки (280 мг) як вихідної речовини.

MC (ESI) $m/z = 143,2 [M+H]^+$

^1H -ЯМР (600 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 1,98-2,07 (м, 2H), 2,39 (т, $J=8,25$ Гц, 2H), 2,44 (с, 3H), 2,74-2,77 (м, 2H), 3,37-3,46 (м, 4H)

Довідковий приклад 11: Синтез 1-метил-3-[2-(метиламіно)етил]імідазолідін-2,4-діону

Вказану в заголовку сполуку (205 мг) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 10, стадія (2), і довідковому прикладі 7, стадія (2), шляхом використання 1-метилгідантоїну (468,9 мг) як вихідної речовини.

MC (ESI) $m/z = 172,2 [M+H]^+$

^1H -ЯМР (200 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 2,44 (с, 3H), 2,83 (т, $J=6,15$ Гц, 2H), 3,00 (с, 3H), 3,65 (т, $J=6,15$ Гц, 2H), 3,88 (с, 2H)

Довідковий приклад 12: Синтез 3-[2-(метиламіно)етил]-1,3-оксазолідін-2-ону

Вказану в заголовку сполуку (41 мг) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 10, стадія (2), і довідковому прикладі 7, стадія (2), шляхом використання 2-оксазолідону (357,9 мг) як вихідної речовини.

MC (ESI) $m/z = 145,1 [M+H]^+$

^1H -ЯМР (600 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 2,45 (с, 3H), 2,80 (т, $J=6,19$ Гц, 2H), 3,39 (т, $J=6,19$ Гц, 2H), 3,59-3,67 (м, 2H), 4,29-4,37 (м, 2H)

Довідковий приклад 13: Синтез 3-[2-(метиламіно)етил]імідазолідін-2,4-діону

Вказану в заголовку сполуку (200 мг) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 10, стадія (2), і довідковому прикладі 7, стадія (2), шляхом використання гідантоїну (411,3 мг) як вихідної речовини.

MC (ESI) $m/z = 158,2 [M+H]^+$

^1H -ЯМР (600 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 2,44 (с, 3H), 2,84 (т, $J=6,19$ Гц, 2H), 3,66 (т, $J=6,19$ Гц, 2H), 3,98 (с, 2H), 5,44 (ушир. с, 1H)

Довідковий приклад 14: Синтез 2-(1,1-діоксидотіоморфолін-4-іл)-N-метилетанаміну

Вказану в заголовку сполуку (884 мг) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 1, шляхом використання тіоморфолін-1,1-діоксиду (780 мг) як вихідної речовини.

MC (ESI) $m/z = 193,1 [M+H]^+$

^1H -ЯМР (200 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 2,45 (с, 3H), 2,67 (с, 4H), 2,96-3,11 (м, 8H)

Довідковий приклад 15: Синтез N-метил-2-(морфолін-4-іл)етанаміну

Вказану в заголовку сполуку (905 мг) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 1, шляхом використання морфоліну (503 мг) як вихідної речовини.

MC (ESI) $m/z = 145,1 [M+H]^+$

^1H -ЯМР (200 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 2,39-2,53 (м, 6H), 2,45 (с, 3H), 2,62-2,72 (м, 2H), 3,65-3,76 (м, 4H)

Довідковий приклад 16: Синтез N-метил-2-(тіоморфолін-4-іл)етанаміну

Вказану в заголовку сполуку (451 мг) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 1, шляхом використання тіоморфоліну (328 мг) як вихідної речовини.

МС (ESI) $m/z = 161,1$ $[M+H]^+$

^1H -ЯМР (200 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 2,44 (с, 3H), 2,48-2,54 (м, 2H), 2,57-2,76 (м, 10H)

Довідковий приклад 17: Синтез N-метил-2-(3-окса-8-азабіцикло[3.2.1]окт-8-ил)етанаміну

Вказану в заголовку сполуку (24 мг) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 1, шляхом використання 3-окса-8-азабіцикло[3.2.1]октану (40 мг), отриманого способом, описаним у міжнародній патентній публікації WO 10/120854, як вихідної речовини.

МС (ESI) $m/z = 171,1$ $[M+H]^+$

^1H -ЯМР (200 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 1,80-1,90 (м, 4H), 2,34-2,46 (м, 2H), 2,46 (с, 3H), 2,58-2,67 (м, 2H), 3,01 (ушир. с, 2H), 3,44-3,55 (м, 2H), 3,63-3,72 (м, 2H)

Довідковий приклад 18: Синтез 1-[(2S)-1-етилпіролідін-2-іл]-N-метилметанаміну

(1) Захищену речовину одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 8, стадія (1), шляхом використання (S)-(-)-2-амінометил-1-етилпіролідіну (500 мг) як вихідної речовини.

(2) До суспензії алюмогідриду літію (590,5 мг) у тетрагідрофурані (20 мл) по краплях додавали розчин сполуки, отриманої на описаній вище стадії (1), у тетрагідрофурані (10 мл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 0,5 години й при нагріванні зі зворотним холодильником протягом 6 годин. Реакційну суміш охолоджували до кімнатної температури, потім при охолодженні на льоді до реакційної суміші додавали дистильовану воду, 25 % водний гідроксид натрію й дистильовану воду у вказаному порядку, і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 1 години. Реакційну суміш фільтрували через целіт, і концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску з одержанням вказаної в заголовку сполуки (510 мг).

МС (ESI) $m/z = 143,0$ $[M+H]^+$

^1H -ЯМР (200 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 1,10 (т, $J=7,25$ Гц, 3H), 1,55-1,97 (м, 4H), 2,05-2,32 (м, 2H), 2,39-2,58 (м, 5H), 2,60-2,94 (м, 2H), 3,08-3,21 (м, 1H)

Довідковий приклад 19: Синтез N,N'-диметил-N-пропілетан-1,2-діаміну

(1) Алкільну сполуку одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 1, стадія (1), шляхом використання пропіламіну (3,41 г) як вихідної речовини.

(2) Сполуку, отриману на описаній вище стадії (1), розчиняли в хлороформі (30 мл), до розчину додавали 37 % водний формальдегід (9,4 мл) і триацетоксиборгідрид натрію (3,67 г), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 2 годин. До реакційної суміші додавали насичений водний гідрокарбонат натрію, і розділяли шари. Органічний шар фільтрували з використанням фазового сепаратора для додаткового розділення шарів, і концентрували отриманий органічний шар в умовах зниженого тиску з одержанням алкільної сполуки.

(3) Сполуку, отриману на описаній вище стадії (2), розчиняли в хлороформі (1,5 мл), до розчину додавали трифтороцтову кислоту (1,5 мл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 4 годин. До реакційної суміші додавали трифтороцтову кислоту (5 мл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 2 годин. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску, до отриманого залишку додавали насичений водний карбонат калію й хлороформ, і розділяли шари. Органічний шар фільтрували з використанням фазового сепаратора для додаткового розділення шарів, отриманий органічний шар концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ \rightarrow хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 10/1/0,1) з одержанням вказаної в заголовку сполуки (880 мг).

МС (ESI) $m/z = 131,0$ $[M+H]^+$

^1H -ЯМР (200 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 0,89 (т, $J=8,35$ Гц, 4H), 1,37-1,63 (м, 2H), 2,20 (с, 3H), 2,24-2,35 (м, 2H), 2,40-2,52 (м, 5H), 2,59-2,70 (м, 2H)

Довідковий приклад 20: Синтез N,N'-диметил-N-(пропан-2-іл)етан-1,2-діаміну

Вказану в заголовку сполуку (58 мг) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 1, стадія (1), і довідковому прикладі 19, стадія (3), шляхом використання N-ізопропілметиламіну (844,7 мг) як вихідної речовини.

МС (ESI) $m/z = 131,0$ $[M+H]^+$

^1H -ЯМР (200 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 0,99 (д, $J=6,59$ Гц, 6H), 2,19 (с, 3H), 2,44 (с, 3H), 2,46-2,94 (м, 5H)

Довідковий приклад 21: Синтез N,N'-диметил-N-(проп-2-ен-1-іл)етан-1,2-діаміну

Вказану в заголовку сполуку (246 мг) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 1, стадія (1), і довідковому прикладі 19, стадія (3), шляхом використання N-алілметиламіну (821,5 мг) як вихідної речовини.

МС (ESI) $m/z = 129,0 [M+H]^+$

5 ^1H -ЯМР (200 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 2,21 (с, 3H), 2,44 (с, 3H), 2,45-2,52 (м, 2H), 2,61-2,70 (м, 2H), 3,00 (дт, $J=6,59$, 1,32 Гц, 2H), 5,07-5,23 (м, 2H), 5,74-5,97 (м, 1H)

Довідковий приклад 22: Синтез N-бутил-N,N'-диметилетан-1,2-діаміну

Вказану в заголовку сполуку (612 мг) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 1, стадія (1), і довідковому прикладі 19, стадія (3), шляхом використання N-бутилметиламіну (1,0 г) як вихідної речовини.

10 МС (ESI) $m/z = 145,0 [M+H]^+$

^1H -ЯМР (200 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 0,84-0,96 (м, 3H), 1,20-1,54 (м, 4H), 2,20 (с, 3H), 2,28-2,38 (м, 2H), 2,41-2,49 (м, 5H), 2,59-2,69 (м, 2H)

Довідковий приклад 23: Синтез N-трет-бутил-N,N'-диметилетан-1,2-діаміну

15 Вказану в заголовку сполуку (75 мг) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 1, стадія (1), і довідковому прикладі 19, стадія (3), шляхом використання N-метил-трет-бутиламіну (580,0 мг) як вихідної речовини.

МС (ESI) $m/z = 145,0 [M+H]^+$

20 ^1H -ЯМР (600 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 1,05 (с, 9H), 2,18 (с, 3H), 2,44 (с, 3H), 2,48-2,52 (м, 2H), 2,59-2,63 (м, 2H)

Довідковий приклад 24: Синтез N-(бутан-2-іл)-N,N'-диметилетан-1,2-діаміну

Вказану в заголовку сполуку (810 мг) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 1, стадія (1), і довідковому прикладі 19, стадії (2) і (3), шляхом використання втор-бутиламіну (844,7 мг) як вихідної речовини.

25 МС (ESI) $m/z = 145,0 [M+H]^+$

^1H -ЯМР (200 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 0,81-0,96 (м, 6H), 1,08-1,60 (м, 2H), 2,16 (с, 3H), 2,44 (с, 3H), 2,45-2,65 (м, 5H)

Довідковий приклад 25: Синтез N,N'-диметил-N-(2-метилпропіл)етан-1,2-діаміну

30 Вказану в заголовку сполуку (170 мг) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 1, стадія (1), і довідковому прикладі 19, стадія (3), шляхом використання N-метилізобутиламіну (1,01 г) як вихідної речовини.

МС (ESI) $m/z = 145,0 [M+H]^+$

^1H -ЯМР (200 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 0,85-0,90 (м, 6H), 1,61-1,85 (м, 1H), 2,06 (д, $J=7,47$ Гц, 2H), 2,17 (с, 3H), 2,39-2,48 (м, 5H), 2,58-2,66 (м, 2H)

35 Довідковий приклад 26: Синтез N-циклопропіл-N,N'-диметилетан-1,2-діаміну

Вказану в заголовку сполуку (575 мг) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 1, стадія (1), і довідковому прикладі 19, стадії (2) і (3), шляхом використання циклопропіламіну (3,30 г) як вихідної речовини.

МС (ESI) $m/z = 129,0 [M+H]^+$

40 Довідковий приклад 27: Синтез N-(циклопропілметил)-N,N'-диметилетан-1,2-діаміну

Вказану в заголовку сполуку (868 мг) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 1, стадія (1), і довідковому прикладі 19, стадії (2) і (3), шляхом використання циклопропілметиламіну (4,11 г) як вихідної речовини.

45 МС (ESI) $m/z = 143,0 [M+H]^+$

^1H -ЯМР (200 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 0,05-0,16 (м, 1H), 0,44-0,57 (м, 2H), 0,79-1,01 (м, 1H), 2,25 (д, $J=6,59$ Гц, 2H), 2,29 (с, 3H), 2,45 (с, 3H), 2,49-2,57 (м, 2H), 2,62-2,71 (м, 2H)

Довідковий приклад 28: Синтез N-циклобутил-N,N'-диметилетан-1,2-діаміну

Вказану в заголовку сполуку (1,16 г) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 1, стадія (1), і довідковому прикладі 19, стадії (2) і (3), шляхом використання циклобутиламіну (821,5 мг) як вихідної речовини.

50 МС (ESI) $m/z = 142,9 [M+H]^+$

^1H -ЯМР (600 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 1,57-2,05 (м, 6H), 2,05-2,07 (м, 3H), 2,32-2,35 (м, 2H), 2,42-2,45 (м, 3H), 2,61-2,65 (м, 2H), 2,72-2,79 (м, 1H)

Довідковий приклад 29: Синтез N-циклопентил-N,N'-диметилетан-1,2-діаміну

55 Вказану в заголовку сполуку (126 мг) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 1, стадія (1), і довідковому прикладі 19, стадії (2) і (3), шляхом використання циклопентиламіну (983,5 мг) як вихідної речовини.

МС (ESI) $m/z = 157,0 [M+H]^+$

60 ^1H -ЯМР (600 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 1,34-1,42 (м, 2H), 1,47-1,55 (м, 2H), 1,60-1,69 (м, 2H), 1,76-1,83 (м, 2H), 2,19-2,21 (м, 3H), 2,43-2,45 (м, 3H), 2,51 (т, $J=6,30$ Гц, 2H), 2,64-2,71 (м, 3H)

Довідковий приклад 30: Синтез N-метил-2-(піперидин-1-іл)етанаміну

Вказану в заголовку сполуку (120 мг) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 1, стадія (1), і довідковому прикладі 19, стадія (3), шляхом використання піперидину (983,5 мг) як вихідної речовини.

5 MC (ESI) $m/z = 143,0 [M+H]^+$

^1H -ЯМР (200 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 1,36-1,71 (м, 10H), 2,32-2,49 (м, 11H), 2,61-2,71 (м, 2H)

Довідковий приклад 31: Синтез 2-(3,6-дигідропіридин-1(2H)-іл)-N-метилетанаміну

Вказану в заголовку сполуку (855 мг) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 1, стадія (1), і довідковому прикладі 19, стадія (3), шляхом використання 1,2,3,6-тетрагідропіридина (960,2 мг) як вихідної речовини.

10 MC (ESI) $m/z = 141,0 [M+H]^+$

^1H -ЯМР (200 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 2,08-2,24 (м, 2H), 2,44 (с, 3H), 2,50-2,62 (м, 4H), 2,65-2,78 (м, 2H), 2,92-3,02 (м, 2H), 5,60-5,82 (м, 2H)

Довідковий приклад 32: Синтез 2-(метил[2-(метиламіно)етил]аміно)етанолу

15 Вказану в заголовку сполуку (740 мг) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 1, стадія (1), і довідковому прикладі 19, стадія (3), шляхом використання 2-(метиламіно)етанолу (867,5 мг) як вихідної речовини.

MC (ESI) $m/z = 133,0 [M+H]^+$

20 ^1H -ЯМР (600 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 2,30 (с, 3H), 2,44 (с, 3H), 2,53-2,58 (м, 4H), 2,66-2,70 (м, 2H), 3,58-3,62 (м, 2H)

Довідковий приклад 33: Синтез N-(2-метоксietил)-N,N'-диметилетан-1,2-діаміну

Вказану в заголовку сполуку (681 мг) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 1, стадія (1), і довідковому прикладі 19, стадія (3), шляхом використання N-(2-метоксietил)метиламіну (1029,5 мг) як вихідної речовини.

25 MC (ESI) $m/z = 147,0 [M+H]^+$

^1H -ЯМР (200 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 2,28 (с, 3H), 2,44 (с, 3H), 2,48-2,70 (м, 6H), 3,33-3,37 (м, 3H), 3,47 (т, $J=5,93$ Гц, 2H)

Довідковий приклад 34: Синтез (2R)-2-аміно-3-(диметиламіно)пропан-1-олу

30 (1) N-(трет-бутоксикарбоніл)-О-бензил-L-серин (2,5 г) розчиняли в хлороформі (100 мл), до розчину додавали 50 % водний диметиламін (3 мл), 4-диметиламінопіридин (2,07 г), N-етил-N'-(3-диметиламінопропіл)карбодііміду гідрохлорид (3,25 г) і 1-гідроксибензотриазол (2,29 г), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 16 годин. До реакційної суміші додавали насичений водний гідрокарбонат натрію, і екстрагували отриману суміш хлороформом. Отриманий органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ \rightarrow хлороформ/метанол = 100/1) з одержанням амідної сполуки (2,02 г).

40 (2) До сполуки, отриманої на описаній вище стадії (1), додавали 2 М розчин соляної кислоти в ізопропанолі (20 мл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 4 годин. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску, і для екстрагування додавали до отриманого залишку 10 % водний гідроксид натрію й хлороформ. Органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску з одержанням сполуки зі знятим захистом (1,36 г).

45 (3) Аміносполука (1,3 г) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 18, стадія (2), шляхом використання сполуки (1,36 г), отриманої на описаній вище стадії (2), як вихідної речовини.

(4) Вказану в заголовку сполуку (0,23 г) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 7, стадія (2), шляхом використання отриманої вище сполуки (1,3 г) як вихідної речовини.

50 MC (ESI) $m/z = 119,0 [M+H]^+$

^1H -ЯМР (200 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 2,27 (с, 6H), 2,30-2,49 (м, 3H), 3,56 (д, $J=5,71$ Гц, 2H)

Довідковий приклад 35: Синтез N-етил-N-[2-(метиламіно)етил]ацетаміду

(1) Алкільну сполуку (1,35 г) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 1, стадія (1), шляхом використання етиламіну (43,3 мл) як вихідної речовини.

55 (2) Сполуку (300 мг), отриману на описаній вище стадії (1), розчиняли в піридині (1 мл), при охолодженні на льоді до розчину додавали ацетилхлорид (159 мкл), і перемішували отриману суміш при тій же температурі протягом 1 години. До реакційної суміші додавали ацетилхлорид (159 мкл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 1 години. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску, потім до отриманого залишку додавали дистильовану воду й хлороформ, і розділяли шари. Органічний шар промивали

60

насиченим водним гідрокарбонатом натрію, сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ → хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 10/1/0,1) з одержанням амідної сполуки (338 мг).

5 (3) Вказану в заголовку сполуку (134 мг) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 19, стадія (3), шляхом використання сполуки (338 мг), отриманої на описаній вище стадії (2), як вихідної речовини.

МС (ESI) m/z = 145,1 $[M+H]^+$

10 ^1H -ЯМР (200 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 1,06-1,24 (м, 3H), 2,07-2,15 (м, 3H), 2,41-2,49 (м, 3H), 2,70-2,81 (м, 2H), 3,27-3,51 (м, 4H)

Довідковий приклад 36: Синтез метилетил[2-(метиламіно)етил]карбамату

Вказану в заголовку сполуку (171 мг) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 35, стадія (2), і довідковому прикладі 19, стадія (3), шляхом використання сполуки (300 мг), отриманої в довідковому прикладі 35, стадія (1), і метилхлороформіату (342 мкл) як вихідних речовин.

МС (ESI) m/z = 161,1 $[M+H]^+$

15 ^1H -ЯМР (200 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 1,12 (т, $J=7,25$ Гц, 3H), 2,45 (с, 3H), 2,73 (т, $J=6,59$ Гц, 2H), 3,26-3,43 (м, 4H), 3,70 (с, 3H)

Довідковий приклад 37: Синтез 1-[2-(метиламіно)етил]піперидин-4-олу

20 Суміш (8,0 г), що містить головним чином вказану в заголовку сполуку, одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 1, стадія (1), і довідковому прикладі 19, стадія (3), шляхом використання 4-гідроксіпіперидину (1,0 г) як вихідної речовини.

МС (ESI) m/z = 159,1 $[M+H]^+$

25 ^1H -ЯМР (200 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 1,47-1,69 (м, 2H), 2,07-2,26 (м, 2H), 2,46 (с, 3H), 2,46-2,84 (м, 8H), 3,64-3,81 (м, 1H)

Довідковий приклад 38: Синтез N-(циклопропілметил)-N-етил-N'-метилетан-1,2-діаміну

(1) Алкільну сполуку одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 1, стадія (1), шляхом використання циклопропілметиламіну (1,23 г) як вихідної речовини.

30 (2) Вказану в заголовку сполуку (156 мг) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 1, стадія (1), і довідковому прикладі 19, стадія (3), шляхом використання сполуки, отриманої на описаній вище стадії (1), і ацетальдегіду (1,4 мл) як вихідних речовин.

МС (ESI) m/z = 157,2 $[M+H]^+$

^1H -ЯМР (200 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 0,04-0,14 (м, 2H), 0,43-0,54 (м, 2H), 0,78-0,94 (м, 1H), 1,02 (т, $J=7,25$ Гц, 3H), 2,34 (д, $J=6,59$ Гц, 2H), 2,45 (с, 3H), 2,54-2,68 (м, 6H)

35 Довідковий приклад 39: Синтез N-етил-N-(піролідин-3-ілметил)етанаміну

(1) Алкільну сполуку одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 1, стадія (1), шляхом використання 1-трет-бутоксикарбоніл-3-формилпіролідину (500 мг) і діетиламіну (285 мкл) як вихідних речовин.

40 (2) До сполуки, отриманої на описаній вище стадії (1), додавали 2М розчин соляної кислоти в етанолі (20 мл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 4 годин. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску, і для екстрагування додавали до отриманого залишку 10 % водний гідроксид натрію й хлороформ. Отриманий органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на NH-силікагелі (гексан/хлороформ = 1/1 → хлороформ → хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 10/1/0,1) з одержанням вказаної в заголовку сполуки (95 мг).

МС (ESI) m/z = 157,1 $[M+H]^+$

45 ^1H -ЯМР (200 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 1,00 (т, $J=7,25$ Гц, 6H), 1,22-2,00 (м, 3H), 2,15-2,38 (м, 3H), 2,46-2,59 (м, 4H), 2,85-3,11 (м, 3H)

50 Довідковий приклад 40: Синтез 1-(1-етилпіролідин-3-іл)-N-метилметанаміну

(1) Алкільну сполуку (0,25 г) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 1, стадія (1), і довідковому прикладі 39, стадія (2), шляхом використання 1-трет-бутоксикарбоніл-3-формилпіролідину (250 мг) і N-метилбензиламіну (180 мкл) як вихідних речовин.

55 (2) Вказану в заголовку сполуку (66 мг) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 1, стадія (1), і довідковому прикладі 7, стадія (2), шляхом використання сполуки (0,25 г), отриманої на описаній вище стадії (1), і ацетальдегіду (0,4 мл) як вихідних речовин.

60 ^1H -ЯМР (200 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 1,11 (т, $J=7,25$ Гц, 3H), 1,31-1,54 (м, 2H), 1,89-2,24 (м, 2H), 2,26-2,86 (м, 10H)

Довідковий приклад 41: Синтез N-метил-2-(2-метилпіролідін-1-іл)етанаміну

Вказану в заголовку сполуку (0,55 г) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 1, стадія (1), і довідковому прикладі 39, стадія (2), шляхом використання 2-метилпіролідину (680 мкл) як вихідної речовини.

5 MC (ESI) $m/z = 143,0 [M+H]^+$

^1H -ЯМР (200 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 1,08 (д, $J=5,71$ Гц, 3H), 1,30-1,52 (м, 1H), 1,61-1,97 (м, 3H), 1,99-2,38 (м, 3H), 2,45 (с, 3H), 2,64-2,74 (м, 2H), 2,88-3,18 (м, 2H)

Довідковий приклад 42: Синтез N,N-диметил-1-[2-(метиламіно)етил]пролінамід

10 (1) Амідну сполуку (136 мг) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 34, стадія (1), і довідковому прикладі 7, стадія (2), шляхом використання 1-[(бензилокси)карбоніл]піролідін-2-карбонової кислоти (500 мг) і 50 % водного диметиламіну (2,5 мл) як вихідних речовин.

(2) Вказану в заголовку сполуку (0,15 г) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 1, стадія (1), і довідковому прикладі 39, стадія (2), шляхом використання сполуки (136 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

15 MC (ESI) $m/z = 200,1 [M+H]^+$

^1H -ЯМР (200 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 1,75-2,17 (м, 4H), 2,26-2,41 (м, 1H), 2,42 (с, 3H), 2,49-2,80 (м, 4H), 2,95 (с, 3H), 3,09 (с, 3H), 3,17-3,42 (м, 2H)

Довідковий приклад 43: Синтез {(2R)-1-[2-(метиламіно)етил]піролідін-2-іл}метанолу

20 Вказану в заголовку сполуку (0,17 г) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 1, стадія (1), і довідковому прикладі 39, стадія (2), шляхом використання D-пролінолу (500 мг) як вихідної речовини.

MC (ESI) $m/z = 159,0 [M+H]^+$

25 ^1H -ЯМР (200 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 1,59-1,93 (м, 4H), 2,27-2,42 (м, 1H), 2,44 (с, 3H), 2,46-2,58 (м, 1H), 2,61-2,97 (м, 4H), 3,10-3,23 (м, 1H), 3,32-3,43 (м, 1H), 3,53-3,64 (м, 1H)

Довідковий приклад 44: Синтез {(2S)-1-[2-(метиламіно)етил]піролідін-2-іл}метанолу

Вказану в заголовку сполуку (0,22 г) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 1, стадія (1), і довідковому прикладі 39, стадія (2), шляхом використання L-пролінолу (500 мг) як вихідної речовини.

30 MC (ESI) $m/z = 159,0 [M+H]^+$

^1H -ЯМР (200 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 1,57-2,04 (м, 4H), 2,27-2,42 (м, 1H), 2,42-2,46 (м, 3H), 2,45-2,58 (м, 1H), 2,60-2,75 (м, 3H), 2,76-2,97 (м, 1H), 3,10-3,23 (м, 1H), 3,31-3,43 (м, 1H), 3,54-3,64 (м, 1H)

Довідковий приклад 45: Синтез 2-[(2R)-2-(метоксиметил)піролідін-1-іл]-N-метилетанаміну

35 Вказану в заголовку сполуку (0,45 г) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 1, стадія (1), і довідковому прикладі 39, стадія (2), шляхом використання O-метил-D-пролінолу (500 мг) як вихідної речовини.

MC (ESI) $m/z = 173,1 [M+H]^+$

40 ^1H -ЯМР (200 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 1,58-1,96 (м, 4H), 2,12-2,26 (м, 1H), 2,33-2,47 (м, 4H), 2,54-2,72 (м, 3H), 2,94-3,17 (м, 2H), 3,20-3,43 (м, 2H), 3,35 (с, 3H)

Довідковий приклад 46: Синтез (3R)-1-[2-(метиламіно)етил]піролідін-3-олу

Вказану в заголовку сполуку (210 мг) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 1, стадія (1), і довідковому прикладі 19, стадія (3), шляхом використання (R)-3-гідроксипіролідину (2,0 г) як вихідної речовини.

45 MC (ESI) $m/z = 145,0 [M+H]^+$

Довідковий приклад 47: Синтез (3S)-1-[2-(метиламіно)етил]піролідін-3-олу

Вказану в заголовку сполуку (195 мг) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 1, стадія (1), і довідковому прикладі 19, стадія (3), шляхом використання (S)-3-гідроксипіролідину (1,0 г) як вихідної речовини.

50 MC (ESI) $m/z = 145,0 [M+H]^+$

Довідковий приклад 48: Синтез (3R)-N,N-диметил-1-[2-(метиламіно)етил]піролідін-3-аміну

Вказану в заголовку сполуку (123 мг) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 1, стадія (1), і довідковому прикладі 19, стадія (3), шляхом використання (3R)-(+)-3-(диметиламіно)піролідину (200 мг) як вихідної речовини.

55 MC (ESI) $m/z = 172,1 [M+H]^+$

^1H -ЯМР (200 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 1,59-1,80 (м, 1H), 1,86-2,07 (м, 1H), 2,21 (с, 6H), 2,26-2,89 (м, 9H), 2,44 (с, 3H)

Довідковий приклад 49: Синтез (3S)-N,N-диметил-1-[2-(метиламіно)етил]піролідін-3-аміну

Вказану в заголовку сполуку (80 мг) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 1, стадія (1), і довідковому прикладі 19, стадія (3), шляхом використання (3S)-(-)-3-(диметиламіно)піролідину (200 мг) як вихідної речовини.

MC (ESI) $m/z = 172,1 [M+H]^+$

¹H-ЯМР (200 МГц, CDCl₃) δ (м. ч.): 1,59-2,12 (м, 2H), 2,21 (с, 6H), 2,27-2,88 (м, 9H), 2,44 (с, 3H)

Довідковий приклад 50: Синтез 2-[(2R)-2-[(диметиламіно)метил]піролідин-1-іл]-N-метилетанаміну

(1) Амідну сполуку (1,23 г) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 34, стадія (1), і довідковому прикладі 7, стадія (2), шляхом використання N-карбобензилокси-D-проліну (3,0 г) і 50 % водного диметиламіну (2,5 мл) як вихідних речовин.

(2) Аміносполуку одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 18, стадія (2), шляхом використання сполуки (500 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

(3) Вказану в заголовку сполуку (0,17 г) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 1, стадія (1), і довідковому прикладі 39, стадія (2), шляхом використання сполуки, отриманої на описаній вище стадії (2), як вихідної речовини.

MC (ESI) $m/z = 186,1 [M+H]^+$

¹H-ЯМР (600 МГц, CDCl₃) δ (м. ч.): 1,54-1,62 (м, 1H), 1,70-1,77 (м, 2H), 1,93-2,01 (м, 1H), 2,11-2,22 (м, 2H), 2,23 (с, 6H), 2,31-2,37 (м, 2H), 2,43-2,51 (м, 4H), 2,62-2,73 (м, 2H), 2,99-3,05 (м, 1H), 3,09-3,13 (м, 1H)

Довідковий приклад 51: Синтез 2-[(3R)-3-метоксипіролідин-1-іл]-N-метилетанаміну

(1) (R)-3-гідроксипіролідин (0,65 г) розчиняли в хлороформі (16 мл), до розчину додавали насичений водний гідрокарбонат натрію (16 мл) і ди-трет-бутилдикарбонат (2,45 г), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 16 годин. Шари реакційної суміші розділяли, органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ → хлороформ/метанол/28% водний аміак = 10/1/0,1) з одержанням захищеної сполуки (1,51 г).

(2) Сполуку зі знятим захистом (0,13 г) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 8, стадія (2), і довідковому прикладі 39, стадія (2), шляхом використання сполуки, отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

(3) Вказану в заголовку сполуку (0,10 г) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 1, стадія (1), і довідковому прикладі 39, стадія (2), шляхом використання сполуки (0,13 г), отриманої на описаній вище стадії (2), як вихідної речовини.

MC (ESI) $m/z = 159,2 [M+H]^+$

Довідковий приклад 52: Синтез 2-[(2S)-2-(метоксиметил)піролідин-1-іл]-N-метилетанаміну

(1) Сполуку зі знятим захистом (0,31 г) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 51, стадія (1), довідковому прикладі 8, стадія (2), і довідковому прикладі 39, стадія (2), шляхом використання L-пролінолу (0,5 г) як вихідної речовини.

(2) Вказану в заголовку сполуку (0,32 г) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 1, стадія (1), і довідковому прикладі 39, стадія (2), шляхом використання сполуки (0,31 г), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

MC (ESI) $m/z = 173,2 [M+H]^+$

Довідковий приклад 53: Синтез N-метил-2-[(2S)-2-метилпіролідин-1-іл]етанаміну

Вказану в заголовку сполуку (0,34 г) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 1, стадія (1), і довідковому прикладі 39, стадія (2), шляхом використання (S)-2-метилпіролідину (250 мг) як вихідної речовини.

MC (ESI) $m/z = 143,2 [M+H]^+$

¹H-ЯМР (200 МГц, CDCl₃) δ (м. ч.): 1,08 (д, J=6,15 Гц, 3H), 1,32-1,46 (м, 1H), 1,62-2,36 (м, 6H), 2,45 (с, 3H), 2,65-2,75 (м, 2H), 2,86-3,20 (м, 2H)

Довідковий приклад 54: Синтез 2-[3-(метоксііміно)піролідин-1-іл]-N-метилетанаміну

(1) Алкільну сполуку (1,15 г) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 1, стадія (1), шляхом використання (S)-3-гідроксипіролідину (1,0 г) як вихідної речовини.

(2) Сполуку (1,0 г), отриману на описаній вище стадії (1), розчиняли в хлороформі (100 мл), до розчину додавали N-етил-N'-(3-диметиламінопропіл)карбодііміду гідрохлорид (2,35 г), трифторацетат піридину (2,37 г) і диметилсульфоксид (3,16 мл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 2 годин. До реакційної суміші додавали насичений водний гідрокарбонат натрію, і розділяли шари. Органічний шар сушили над безводним сульфатом

магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 20/1/0,1→12,5/1/0,1) з одержанням кетонної сполуки (0,50 г).

(3) Сполуку (0,50 г), отриману на описаній вище стадії (2), розчиняли в піридині (8,34 мл), до розчину додавали О-метилгідроксиламіну гідрохлорид (861,7 мг), і перемішували отриману суміш протягом ночі при кімнатній температурі. До реакційної суміші додавали дистильовану воду й етилацетат, і розділяли шари. Органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 100/1/0,1→20/1/0,1) з одержанням метоксимної сполуки.

(4) Вказану в заголовку сполуку (254 мг) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 19, стадія (3), шляхом використання сполуки, отриманої на описаній вище стадії (3), як вихідної речовини.

MC (ESI) $m/z = 272,3 [M+H]^+$

¹H-ЯМР (200 МГц, CDCl₃) δ (м. ч.): 2,48 (с, 3H), 2,51-2,79 (м, 8H), 3,20 (с, 1H), 3,31 (с, 1H), 3,85 (д, J=1,32 Гц, 3H)

Довідковий приклад 55: Синтез 2-(2-етилпіролідін-1-іл)-N-метилетанаміну

(1) Складний трет-бутиловий ефір метил-(2-оксоетил)-карбаминової кислоти (280 мг) розчиняли в хлороформі (15 мл), до розчину додавали 2-етилпіролідину гідрохлорид (200 мг), триетиламін (230 мкл) і триацетоксиборгидрид натрію (773 мг), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 2 годин. До реакційної суміші додавали насичений водний гідрокарбонат натрію, і розділяли шари. Органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ → хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 10/1/0,1) з одержанням алкільної сполуки (0,46 г).

(2) Вказану в заголовку сполуку (0,15 г) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 39, стадія (2), шляхом використання сполуки (0,46 г), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

MC (ESI) $m/z = 157,2 [M+H]^+$

¹H-ЯМР (200 МГц, CDCl₃) δ (м. ч.): 0,81-0,94 (м, 3H), 1,09-2,25 (м, 9H), 2,45 (с, 3H), 2,64-2,74 (м, 2H), 2,88-3,20 (м, 2H)

Довідковий приклад 56: Синтез 2-(2,5-диметилпіролідін-1-іл)-N-метилетанаміну

Вказану в заголовку сполуку (0,17 г) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 1, стадія (1), і довідковому прикладі 39, стадія (2), шляхом використання 2,5-диметилпіролідину (200 мг) як вихідної речовини.

MC (ESI) $m/z = 157,2 [M+H]^+$

¹H-ЯМР (200 МГц, CDCl₃) δ (м. ч.): 1,08 (с, 3H), 1,09-1,12 (м, 3H), 1,32-1,44 (м, 2H), 1,74-1,89 (м, 2H), 2,44 (с, 3H), 2,52-2,67 (м, 6H)

Довідковий приклад 57: Синтез 2-(2,2-диметилпіролідін-1-іл)-N-метилетанаміну

Вказану в заголовку сполуку (1,25 г) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 1, стадія (1), і довідковому прикладі 19, стадія (3), шляхом використання 2,2-диметилпіролідину (1,0 г) як вихідної речовини.

MC (ESI) $m/z = 157,2 [M+H]^+$

¹H-ЯМР (200 МГц, CDCl₃) δ (м. ч.): 0,97 (с, 6H), 1,53-1,84 (м, 4H), 2,44 (с, 3H), 2,47-2,78 (м, 6H)

Довідковий приклад 58: Синтез 2-метоксі-N-[2-(метиламіно)етил]бензолсульфонаміду

(1) N-трет-бутоксикарбоніл-N-метилетилендіамін (500 мг) і триетиламін (1,2 мл) розчиняли в хлороформі (30 мл), до розчину додавали 2-метоксибензолсульфонілхлорид (770,8 мг), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 2 годин. До реакційної суміші додавали насичений водний гідрокарбонат натрію, і розділяли шари. Органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 20/1/0,1) з одержанням сульфонамідної сполуки.

(2) Сполуку, отриману на описаній вище стадії (1), розчиняли в метанолі (10 мл), до розчину додавали 4 М розчин соляної кислоти в діоксані (10 мл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 4 годин. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на NH-силікагелі (хлороформ → хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 10/1/0,1) з одержанням вказаної в заголовку сполуки (212 мг).

MC (ESI) $m/z = 245,1 [M+H]^+$

¹H-ЯМР (200 МГц, CDCl₃) δ (м. ч.): 2,31 (с, 3H), 2,62-2,71 (м, 2H), 2,88-2,98 (м, 2H), 3,98 (с, 3H), 6,98-7,14 (м, 2H), 7,54 (ддд, J=8,35, 7,47, 1,76 Гц, 1H), 7,92 (дд, J=7,47, 1,76 Гц, 1H)

Довідковий приклад 59: Синтез N-[2-(метиламіно)етил]метансульфонаміду

Вказану в заголовку сполуку (260 мг) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 58, шляхом використання N-трет-бутоксикарбоніл-N-метилетилендіаміну (500 мг) і метансульфонілхлориду (289 мкл) як вихідних речовин.

¹H-ЯМР (200 МГц, CDCl₃) δ (м. ч.): 2,42 (с, 3H), 2,75-2,83 (м, 2H), 2,97 (с, 21H), 3,16-3,24 (м, 2H)

Довідковий приклад 60: Синтез N-метил-3-(морфолін-4-іл)пропан-1-аміну

Вказану в заголовку сполуку (57 мг) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 51, стадія (1), довідковому прикладі 8, стадія (2), і довідковому прикладі 19, стадія (3), шляхом використання N-(3-амінопропіл)морфоліну (1,0 г) як вихідної речовини.

МС (ESI) m/z = 159,1 [M+H]⁺

¹H-ЯМР (200 МГц, CDCl₃) δ (м. ч.): 1,58-1,77 (м, 2H), 2,32-2,50 (м, 9H), 2,62 (т, J=7,03 Гц, 2H), 3,65-3,76 (м, 4H)

Довідковий приклад 61: Синтез N,N,N'-триметилпропан-1,2-діаміну

Вказану в заголовку сполуку (493 мг) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 51, стадія (1), і довідковому прикладі 18, стадія (2), шляхом використання N,N-диметилпропан-1,2-діаміну (2,0 г) як вихідної речовини.

МС (ESI) m/z = 117,0 [M+H]⁺

¹H-ЯМР (200 МГц, CDCl₃) δ (м. ч.): 0,98 (д, J=6,15 Гц, 3H), 1,97-2,08 (м, 2H), 2,21 (с, 6H), 2,41 (д, J=0,88 Гц, 3H), 2,50-2,68 (м, 1H)

Довідковий приклад 62: Синтез N-етил-N,N'-диметилетан-1,2-діаміну

Вказану в заголовку сполуку (62 мг) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 1, стадія (1), і довідковому прикладі 19, стадія (3), шляхом використання N-етилметиламіну (682,7 мг) як вихідної речовини.

МС (ESI) m/z = 117,0 [M+H]⁺

¹H-ЯМР (200 МГц, CDCl₃) δ (м. ч.): 1,05 (т, J=7,25 Гц, 3H), 2,21 (с, 3H), 2,36-2,52 (м, 6H), 2,61-2,70 (м, 2H)

Довідковий приклад 63: Синтез 4-[4-(піридин-3-іл)-1H-імідазол-1-іл]бутан-1-аміну

(1) 70 % Гідрід натрію (827 мг) суспендували в диметилформаміді (20 мл), до суспензії при охолодженні на льоді додавали розчин 4-(3-піридинил)-1H-імідазола (3,0 г), отриманого способом, описаним у міжнародній патентній публікації WO 00/02875, у диметилформаміді (10 мл), і перемішували отриману суміш при тій же температурі протягом 5 хвилин. До реакційної суміші додавали розчин N-(4-бромбутил)фталіміду (5,84 г) у диметилформаміді (10 мл), і перемішували отриману суміш при 60 °C протягом 4 годин. До реакційної суміші додавали дистильовану воду, і екстрагували отриману суміш етилацетатом. Органічний шар промивали водним гідрокарбонатом натрію, сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, отриманий залишок розчиняли в етилацетаті, і додавали до розчину гексан для осадження твердої речовини. Тверду речовину, яка випала в осад, збирали шляхом фільтрування з одержанням фталімідної сполуки (3,16 г).

(2) Вказану в заголовку сполуку (1,94 г) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 9, стадія (2), шляхом використання сполуки (3,16 г), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

МС (ESI) m/z = 217,0 [M+H]⁺

¹H-ЯМР (200 МГц, CDCl₃) δ (м. ч.): 1,39-1,57 (м, 2H), 1,81-1,99 (м, 2H), 2,75 (т, J=6,81 Гц, 2H), 4,01 (т, J=7,03 Гц, 2H), 7,28-7,35 (м, 2H), 7,54 (д, J=1,32 Гц, 1H), 8,09 (дт, J=7,90, 2,00 Гц, 1H), 8,47 (дд, J=4,83, 1,76 Гц, 1H), 8,92-8,99 (м, 1H)

Довідковий приклад 64: Синтез 4-(4-метил-1H-імідазол-1-іл)бутан-1-аміну

(1) 4-Метилімідазол (5,0 г) і N-(4-бромбутил)фталімід (17,2 г) розчиняли в диметилформаміді (250 мл), до розчину додавали триетиламін (25,5 мл), і перемішували отриману суміш при 120 °C протягом 3 годин. Реакційну суміш залишали охолоджуватися до кімнатної температури, потім до реакційної суміші додавали етилацетат і дистильовану воду, і розділяли шари. Органічний шар промивали дистильованою водою, сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і розчиняли отриманий залишок в етилацетаті. Реакційну суміш перемішували, тверду речовину, що випала в осад, видаляли шляхом фільтрування, і концентрували отриманий фільтрат в умовах зниженого тиску. Отриманий залишок очищали методом колонкової хроматографії на силікагелі (етилацетат/метанол = 20/1). До отриманого грубо очищеного продукту додавали суміш етилацетату й гексану, отриману суміш перемішували при нагріванні для розчинення грубо

очищеного продукту, а потім поступово охолоджували до кімнатної температури для осадження твердої речовини. Тверду речовину, яка випала в осад, збирали шляхом фільтрування з одержанням фталімідної сполуки (324 мг).

5 (2) Вказану в заголовку сполуку (183 мг) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 9, стадія (2), шляхом використання сполуки (324 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

MC (ESI) $m/z = 154,2 [M+H]^+$

^1H -ЯМР (200 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 1,33-1,55 (м, 2H), 1,70-1,90 (м, 2H), 2,22 (с, 3H), 2,71 (т, $J=7,00$ Гц, 2H), 3,87 (т, $J=7,03$ Гц, 2H), 6,61 (с, 1H), 7,34 (с, 1H)

10 Довідковий приклад 65: Синтез 4-(1H-імідазол-1-іл)бутан-1-аміну

Вказану в заголовку сполуку (0,37 г) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 63, стадія (1), і довідковому прикладі 9, стадія (2), шляхом використання імідазолу (2,00 г) як вихідної речовини.

MC (ESI) $m/z = 140,2 [M+H]^+$

15 ^1H -ЯМР (200 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 1,36-1,54 (м, 2H), 1,75-1,93 (м, 2H), 2,73 (т, $J=7,03$ Гц, 2H), 3,96 (т, $J=7,03$ Гц, 2H), 6,91 (с, 1H), 7,06 (с, 1H), 7,47 (с, 1H)

Довідковий приклад 66: Синтез N-феніл- β -аланінамідну гідрохлориду

20 (1) β -аланін (3,0 г) розчиняли в хлороформі (50 мл), до розчину додавали 5 % водний гідроксид натрію (50 мл) і розчин ди-трет-бутилдикарбонату (7,3 г) у хлороформі, і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 3 годин. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску, до отриманого залишку додавали 1N соляну кислоту для підкислення залишку, і екстрагували водний шар етилацетатом. Органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували, і концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску. До отриманого залишку додавали гексан для осадження твердої речовини, і збирали
25 тверду речовину, яка випала в осад, шляхом фільтрування з одержанням захищеної сполуки (365 мг).

(2) Сполуку (150 мг), отриману на описаній вище стадії (1), розчиняли в хлороформі (2 мл), до розчину додавали 4-диметиламінопіридин (145 мг), анілін (110 мг) і N-етил-N'-(3-диметиламінопропіл)карбодііміду гідрохлорид (228 мг), і перемішували отриману суміш
30 протягом ночі при кімнатній температурі. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (гексан/етилацетат = 1/1) з одержанням амідної сполуки.

(3) Сполуку, отриману на описаній вище стадії (2), розчиняли в 4M розчині соляної кислоти в діоксані (6 мл), і перемішували розчин протягом ночі при кімнатній температурі. Реакційну суміш
35 концентрували в умовах зниженого тиску, до отриманого залишку додавали метанол, і концентрували отриману суміш в умовах зниженого тиску з одержанням вказаної в заголовку сполуки (130 мг).

MC (ESI) $m/z = 165,2 [M+H]^+$

^1H -ЯМР (200 МГц, CD_3OD) δ (м. ч.): 2,68-2,94 (м, 2H), 3,12-3,26 (м, 2H), 7,03-7,72 (м, 5H)

40 Довідковий приклад 67: Синтез N-фенілпропан-1,3-діаміну гідрохлориду

(1) 3-(трет-Бутоксикарбоніламіно)-1-пропанол (500 мг) розчиняли в хлороформі (20 мл), до розчину додавали реактив Десса-Мартіна (1,21 г), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 30 хвилин. До реакційної суміші додавали насичений водний гідрокарбонат натрію й водний тиосульфат натрію, і розділяли шари. Органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (гексан/етилацетат = 1/1) з одержанням альдегідної сполуки.

(2) Вказану в заголовку сполуку (424 мг) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 1, стадія (1), і довідковому прикладі 66, стадія (3), шляхом використання
50 сполуки, отриманої на описаній вище стадії (1), і аніліну (398 мг) як вихідних речовин.

MC (ESI) $m/z = 151,2 [M+H]^+$

^1H -ЯМР (200 МГц, DMSO_{d-6}) δ (м. ч.): 1,85-2,19 (м, 2H), 2,78-3,03 (м, 2H), 3,30 (т, $J=7,47$ Гц, 2H), 7,09-7,64 (м, 5H)

Довідковий приклад 68: Синтез 6-[(4-амінобутил)аміно]-піридин-3-карбонітрилу

55 6-Хлор-3-піридинкарбонітрил (5,0 г) розчиняли в 1,4-діамінобутані (50 мл), і перемішували розчин при нагріванні при 170 °C протягом 2 годин. До реакційної суміші додавали діетиловий ефір і дистильовану воду, розділяли шари, і екстрагували водний шар діетиловим ефіром. Водний шар насичували хлоридом натрію, і екстрагували отриману суміш хлороформом. Отриманий органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували, і

концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску з одержанням вказаної в заголовку сполуки (4,77 г).

МС (ESI) $m/z = 191,2 [M+H]^+$

¹H-ЯМР (600 МГц, CDCl₃) δ (м. ч.): 1,50-1,60 (м, 2H), 1,64-1,73 (м, 2H), 2,64-2,76 (м, 4H), 3,30-3,38 (м, 2H), 5,59 (ушир. с, 1H), 6,32-6,36 (м, 1H), 7,53 (д, J=8,71 Гц, 1H), 8,33 (д, J=1,83 Гц, 1H)

Довідковий приклад 69: Синтез 3-(4-амінобутил)-1-метилімідазолідин-2,4-діону

Вказану в заголовку сполуку (1,38 г) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 63, стадія (1), і довідковому прикладі 9, стадія (2), шляхом використання 1-метилгідантоїну (2,8 г) як вихідної речовини.

МС (ESI) $m/z = 186,2 [M+H]^+$

¹H-ЯМР (600 МГц, CDCl₃) δ (м. ч.): 1,43-1,49 (м, 2H), 1,63-1,69 (м, 2H), 2,72 (т, J=7,11 Гц, 2H), 3,00 (с, 3H), 3,52 (т, J=7,34 Гц, 2H), 3,84-3,86 (м, 2H)

Довідковий приклад 70: Синтез 2-(1,1-діоксидо-1,2-тіазолідин-2-іл)етанаміну

(1) N-трет-бутоксикарбонілетилендіамін (1,0 г) і N,N-діізопропілетиламін (1,30 мл) розчиняли в тетрагідрофурані (62 мл), до розчину при охолодженні на льоді по краплях додавали розчин 3-хлорпропансульфонілхлориду (0,84 мл) у тетрагідрофурані (5 мл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 16 годин. До реакційної суміші додавали етилацетат і дистильовану воду, і розділяли шари. Органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували, і концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску з одержанням сульфонамідної сполуки (2,17 г).

(2) Сполуку (2,17 г), отриману на описаній вище стадії (1), розчиняли в диметилформаміді (75 мл), до розчину при охолодженні на льоді повільно додавали 70 % гідрид натрію (0,5 г), і перемішували отриману суміш протягом 3 годин при нагріванні до кімнатної температури. До реакційної суміші додавали етилацетат, і розділяли шари. Органічний шар промивали дистильованою водою й насиченим водним хлоридом натрію, сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску з одержанням циклізованої сполуки.

(3) Вказану в заголовку сполуку (0,89 г) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 1, стадія (2), шляхом використання сполуки, отриманої на описаній вище стадії (2), як вихідної речовини.

МС (ESI) $m/z = 165,1 [M+H]^+$

¹H-ЯМР (600 МГц, CDCl₃) δ (м. ч.): 2,35-2,41 (м, 2H), 2,86-2,98 (м, 2H), 3,09-3,13 (м, 2H), 3,16-3,20 (м, 2H), 3,28-3,32 (м, 2H)

Довідковий приклад 71: Синтез 2-(1H-тетразол-5-іл)етанаміну

(1) 3-Амінопропіонітрил (2,00 г) розчиняли в тетрагідрофурані (40 мл), до розчину додавали водний розчин (40 мл) гідроксиду натрію (0,68 г) і бензилхлороформіат (5,0 мл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 1,75 години. До реакційної суміші додавали водний розчин (20 мл) гідроксиду натрію (0,8 г), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 4 годин. До реакційної суміші додавали етилацетат, і розділяли шари. Органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували, і концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску з одержанням захищеної сполуки (6,20 г).

(2) Сполуку (2,00 г), отриману на описаній вище стадії (1), розчиняли в толуолі (90 мл), до розчину додавали азид натрію (1,27 г) і гідрохлорид триетиламіну (2,70 г), і перемішували отриману суміш при нагріванні при 100 °C протягом 22 годин. До реакційної суміші додавали дистильовану воду, розділяли шари, і додавали до водного шару 1N соляну кислоту для підкислення водного шару й, у результаті, осадження твердої речовини. Тверду речовину, яка випала в осад, збирали шляхом фільтрування з одержанням циклізованої сполуки (1,28 г).

(3) Вказану в заголовку сполуку (877 мг) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 7, стадія (2), шляхом використання сполуки (1,28 г), отриманої на описаній вище стадії (2), як вихідної речовини.

МС (ESI) $m/z = 114,1 [M+H]^+$

¹H-ЯМР (200 МГц, CD₃OD) δ (м. ч.): 3,38-3,67 (м, 2H), 4,82-5,15 (м, 2H)

Довідковий приклад 72: Синтез N-[(2S)-1-аміно-3-(бензилокси)пропан-2-іл]метансульфонамід

(1) Амідну сполуку (1,96 г) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 34, стадія (1), шляхом використання O-бензил-N-(трет-бутоксикарбоніл)-D-серину (2,74 г) і 28 % водного аміаку (6,3 мл) як вихідних речовин.

(2) Сполуку (1,96 г), отриману на описаній вище стадії (1), розчиняли в етанолі (15 мл), до розчину додавали концентровану соляну кислоту (5 мл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 18 годин. До реакційної суміші додавали концентровану соляну

кислоту (2 мл), і перемішували отриману суміш при 55 °С протягом 4 годин. До реакційної суміші додавали 15 % водний гідроксид натрію й хлороформ, і розділяли шари. Органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ → хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 10/1/0,1) з одержанням сполуки зі знятим захистом (0,93 г).

(3) Сполуку (0,93 г), отриману на описаній вище стадії (2), розчиняли в тетрагідрофурані (50 мл), до розчину додавали триетиламін (1,2 мл) і метансульфонілхлорид (0,69 мл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 3 годин. До реакційної суміші додавали насичений водний гідрокарбонат натрію й хлороформ, і збирали осад шляхом фільтрування. Фільтрат екстрагували хлороформом, і промивали отриманий органічний шар насиченим водним хлоридом амонію й насиченим водним хлоридом натрію, сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, отриманий залишок і згаданий вище осад поєднували й промивали хлороформом з одержанням сульфонамідної сполуки (1,11 г).

(4) Вказану в заголовку сполуку (0,29 г) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 18, стадія (2), шляхом використання сполуки (1,11 г), отриманої на описаній вище стадії (3), як вихідної речовини.

MC (ESI) m/z = 259,2 $[M+H]^+$

¹H-ЯМР (200 МГц, CDCl₃) δ (м. ч.): 2,88 (д, J=4,83 Гц, 2H), 2,97 (с, 3H), 3,48-3,60 (м, 3H), 3,83-3,91 (м, 1H), 4,53 (с, 2H), 7,28-7,39 (м, 5H)

Довідковий приклад 73: Синтез (3R)-1-(метилсульфоніл)піролідін-3-аміну

Вказану в заголовку сполуку (0,98 г) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 58, стадія (1), і довідковому прикладі 39, стадія (2), шляхом використання (R)-(+)-3-(трет-бутоксикарбоніламіно)піролідину (2,0 г) і метансульфонілхлориду (1 мл) як вихідних речовин.

MC (ESI) m/z = 165,1 $[M+H]^+$

Довідковий приклад 74: Синтез (3S)-1-(метилсульфоніл)піролідін-3-аміну

Вказану в заголовку сполуку (1,03 г) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 58, стадія (1), і довідковому прикладі 39, стадія (2), шляхом використання (S)-(-)-3-(трет-бутоксикарбоніламіно)піролідину (2,0 г) і метансульфонілхлориду (1 мл) як вихідних речовин.

MC (ESI) m/z = 165,1 $[M+H]^+$

Довідковий приклад 75: Синтез 1-[1-(метилсульфоніл)піролідін-3-іл]метанаміну

Вказану в заголовку сполуку (0,78 г) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 58, стадія (1), і довідковому прикладі 39, стадія (2), шляхом використання 3-(трет-бутоксикарбоніламінометил)піролідину (1,0 г) і метансульфонілхлориду (0,48 мл) як вихідних речовин.

MC (ESI) m/z = 179,1 $[M+H]^+$

¹H-ЯМР (200 МГц, CDCl₃) δ (м. ч.): 1,59-1,80 (м, 1H), 2,02-2,20 (м, 1H), 2,24-2,42 (м, 1H), 2,72-2,79 (м, 2H), 2,83 (с, 3H), 3,02-3,13 (м, 1H), 3,23-3,57 (м, 3H)

Довідковий приклад 76: Синтез 3-(6-аміно-9H-пурин-9-ил)пропан-1-тіола

(1) Алкілну сполуку (2,61 г) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 63, стадія (1), шляхом використання аденіну (2,7 г) і 1-бром-3-хлорпропану(3,5 г) як вихідних речовин.

(2) Сполуку (1,50 г), отриману на описаній вище стадії (1), і тіоацетат калію (0,82 г) розчиняли в ацетоні (40 мл), і перемішували отриману суміш при нагріванні зі зворотним холодильником протягом 10 годин. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол = 30/1) з одержанням заміщеної сполуки (1,76 г).

(3) До сполуки (1,0 г), отриманої на описаній вище стадії (2), додавали 2М розчин аміаку в метанолі (40 мл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 2 діб. Осад збирали шляхом фільтрування, і промивали залишок фільтрування сумішшю хлороформу й метанолу (10/1) з одержанням вказаної в заголовку сполуки (0,46 г).

¹H-ЯМР (600 МГц, DMSO-d₆) δ (м. ч.): 2,13-2,21 (м, 1H), 2,47-2,53 (м, 4H), 2,66-2,72 (м, 1H), 4,18-4,25 (м, 1H), 7,17 (с, 1H), 8,13 (д, J=1,83 Гц, 1H)

Довідковий приклад 77: Синтез 2-аміно-N,N-диметилетансульфонамід

(1) 2-Фталимидоетансульфонілхлорид (3,04 г) розчиняли в тетрагідрофурані (40 мл), до розчину при кімнатній температурі по краплях додавали 50 % водний диметиламін (2,5 мл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 30 хвилин. Реакційну суміш

концентрували в умовах зниженого тиску, до отриманого залишку додавали етилацетат і насичений водний гідрокарбонат натрію, і розділяли шари. Органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол = 97/1) з одержанням фталімідної сполуки (1,60 г).

(2) Вказану в заголовку сполуку (840 мг) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 9, стадія (2), шляхом використання сполуки (1,58 г), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

MC (ESI) $m/z = 153 [M+H]^+$

^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 2,89 (с, 6H), 3,05 (т, $J=6,0$ Гц, 3H), 3,22 (т, $J=6,0$ Гц, 3H)

Довідковий приклад 78: Синтез N-(2-аміноетил)-N-метилметансульфонамід

(1) N-Метилетилендіамін (2,12 г) розчиняли в хлороформі (21,2 мл), при охолодженні на льоді до розчину додавали трифтороцтову кислоту (2,12 мл), а потім до суміші додавали диметилформамід (4 мл). До реакційної суміші додавали розчин ди-трет-бутилдикарбонату (3,26 г) у хлороформі (21,2 мл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 1,5 годин. До реакційної суміші додавали насичений водний гідрокарбонат натрію (20 мл) і карбонат калію (18 г), і розділяли шари. Органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ \rightarrow хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 5/1/0,1) з одержанням захищеної сполуки (560 мг).

(2) Сульфонамідну сполуку (731 мг) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 58, стадія (1), шляхом використання сполуки (560 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), і метансульфонілхлориду (249 мкл) як вихідних речовин.

(3) Сполуку (731 мг), отриману на описаній вище стадії (2), розчиняли в метанолі (7,3 мл), до розчину при охолодженні на льоді додавали 5н соляну кислоту (7,3 мл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 4 годин. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску, до отриманого залишку додавали 8н водний гідроксид калію (10 мл) і хлороформ (10 мл), і розділяли шари. Органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували, а потім концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску з одержанням вказаної в заголовку сполуки (409 мг).

MC (ESI) $m/z = 153 [M+H]^+$

^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 2,84 (с, 3H), 2,89 (с, 3H), 2,89 (т, $J=5,86$ 2H), 3,18 (т, $J=5,86$ 2H)

Довідковий приклад 79: Синтез 3-аміно-N,N-диметилпропанамід

(1) N-карбобензилокси- β -аланін (1,50 г) розчиняли в диметилформаміді (40 мл), до розчину додавали 50 % водний диметиламін (2,4 мл), гідроксибензотриазол (3,63 г) і N-етил-N'-(3-диметиламінопропіл)карбодііміду гідрохлорид (5,15 г), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 23 годин. До реакційної суміші додавали етилацетат і 1н соляну кислоту, розділяли шари, і екстрагували водний шар етилацетатом. Об'єднаний органічний шар двічі промивали насиченим водним гідрокарбонатом натрію й двічі насиченим водним хлоридом натрію, сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували, а потім концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску з одержанням амідної сполуки (1,57 г).

(2) Сполуку (1,57 г), отриману на описаній вище стадії (1), розчиняли в етанолі (12 мл) і етилацетаті (12 мл), до розчину в атмосфері аргону додавали 5 % паладоване вугілля (160 мг), і перемішували суміш при кімнатній температурі протягом 4 годин під тиском 1 атм водню. Реакційну суміш фільтрували, а потім концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску з одержанням вказаної в заголовку сполуки (825 мг).

MC (ESI) $m/z = 117 [M+H]^+$

^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 3,19-3,24 (м, 2H), 3,28-3,33 (м, 2H), 5,21 (ушир. с, 2H)

Довідковий приклад 80: Синтез метил-2-аміноетил(метил)карбамату

(1) трет-Бутил-(2-гідроксиетил)метилкарбамат (2 г), отриманий описаним у літературі способом (Synthetic Communications, 1993, р. 2443), фталімід (2,02 г) і трифенілфосфін (3,59 г) розчиняли в тетрагідрофурані (40 мл), потім до розчину додавали толуол (2 мл), і охолоджували отриману суміш на льоді. До реакційної суміші додавали 2,2 М розчин діетилазодикарбоксилату в толуолі (6,23 мл), і перемішували отриману суміш при тій же температурі протягом 1,5 годин. Реакційну суміш нагрівали до кімнатної температури й концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (гексан/етилацетат = 10/1 \rightarrow 1/1) з одержанням захищеної сполуки (2,67 г).

(2) До сполуки (2,67 г), отриманої на описаній вище стадії (1), додавали 5М розчин соляної кислоти в метанолі (27 мл) і тетрагідрофурані (4 мл), і перемішували реакційну суміш при 55 °C

протягом 2 годин. Реакційну суміш залишали охолоджуватися, а потім концентрували в умовах зниженого тиску з одержанням сполуки зі знятим захистом (2,3 г).

(3) Сполуку (700 мг), отриману на описаній вище стадії (2), розчиняли в хлороформі (7 мл), до розчину при охолодженні на льоді додавали триетиламін (2,03 мл) і метилхлороформіат (270 мкл), і перемішували отриману суміш при тій же температурі протягом 1 години. До реакційної суміші додавали насичений водний хлорид амонію, і розділяли шари. Органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (гексан/етилацетат = 10/1→1/1) з одержанням метоксикарбонільної сполуки (562 мг).

(4) Вказану в заголовку сполуку (99,5 мг) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 9, стадія (2), шляхом використання сполуки (562 мг), отриманої на описаній вище стадії (3), як вихідної речовини.

MC (ESI) $m/z = 133 [M+H]^+$

^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 2,81-2,89 (м, 2H), 2,89-2,99 (м, 3H), 3,26-3,39 (м, 2H), 3,70 (с, 3H)

Довідковий приклад 81: Синтез 2-аміноетансульфонаміду

(1) 2-Фталімідоетансульфонілхлорид (2,42 г) розчиняли в тетрагідрофурані (40 мл), до розчину при кімнатній температурі по краплях додавали концентрований хлорид амонію (1,08 мл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 30 хвилин. До реакційної суміші додавали етилацетат і насичений водний гідрокарбонат натрію, і розділяли шари. Органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, до отриманого залишку додавали етанол (27 мл) і гідразину моногідрат (593 мкл), і перемішували суміш при нагріванні зі зворотним холодильником протягом 3 годин. Реакційну суміш залишали охолоджуватися до кімнатної температури й фільтрували через целіт, а потім концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску. До отриманого залишку додавали діоксан (20 мл), дистильовану воду (10 мл), триетиламін (2,02 мл) і N-(бензилоксикарбоніл)сукцинімід (2,69 г), і перемішували суміш при кімнатній температурі протягом 1,5 годин. До реакційної суміші додавали етилацетат і насичений водний гідрокарбонат натрію, і розділяли шари. Органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і збирали отримані кристалічні речовини шляхом фільтрування з одержанням бензилоксикарбонільної сполуки (618 мг).

(2) Сполуку (618 мг), отриману на описаній вище стадії (1), розчиняли в метанолі (18 мл), до розчину в атмосфері аргону додавали 10 % паладоване вугілля (120 мг), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 1 години під тиском 1 атм водню. Реакційну суміш фільтрували, а потім концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску з одержанням вказаної в заголовку сполуки (287 мг).

MC (ESI) $m/z = 125 [M+H]^+$

^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 3,19-3,24 (м, 2H), 3,28-3,33 (м, 2H), 5,21 (ушир. с, 2H)

Довідковий приклад 82: Синтез 2-аміно-N-метилетансульфонаміду

Вказану в заголовку сполуку (298 мг) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 81, шляхом використання 2-фталімідоетансульфонілхлориду (2,42 г) і 40 % розчину метиламіну в метанолі (1,48 мл) як вихідних речовин.

MC (ESI) $m/z = 139 [M+H]^+$

^1H -ЯМР (400 МГц, $\text{DMSO}-d_6$) δ (м. ч.): 2,55 (с, 3H), 2,86 (т, J=6,8 Гц, 2H), 3,05 (т, J=6,8 Гц, 2H)

Довідковий приклад 83: Синтез 4-(метилсульфоніл)бутан-1-аміну

(1) Тіометоксид натрію (300 мг) розчиняли в метанолі (20 мл), до розчину додавали N-(4-бромбутил)фталімід (1,0 г), і перемішували отриману суміш при 65 °C протягом 18 годин. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску, до отриманого залишку додавали етилацетат і дистильовану воду, і розділяли шари. Органічний шар промивали насиченим водним хлоридом натрію, сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували, а потім концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску з одержанням фталімідної сполуки (778 мг).

(2) Сполуку (775 мг), отриману на описаній вище стадії (1), розчиняли в хлористому метилені (23 мл), до розчину при охолодженні на льоді додавали мета-хлорпербензойну кислоту (2,06 г), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 17 годин. До реакційної суміші додавали 10 % водний тіосульфат натрію, розділяли шари, органічний шар промивали 10 % водним тіосульфатом натрію, насиченим водним гідрокарбонатом натрію, дистильованою водою й насиченим водним хлоридом натрію. Органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували, а потім концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску з одержанням окисненої сполуки (854 мг).

(3) Вказану в заголовку сполуку (256 мг) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 9, стадія (2), шляхом використання сполуки (850 мг), отриманої на описаній вище стадії (2), як вихідної речовини.

MC (ESI) $m/z = 152 [M+H]^+$

5 ^1H -ЯМР (400 МГц, CD_3OD) δ (м. ч.): 1,64-1,98 (м, 4H), 2,84 (т, $J=7,56$ Гц, 2H), 2,93 (с, 3H), 3,15 (т, $J=7,56$ Гц, 2H)

Довідковий приклад 84: Синтез 2-(етилсульфоніл)етанаміну

10 (1) N-(2-брометил)фталімід (500 мг) розчиняли в метанолі (7 мл), до розчину додавали етилмеркаптаннатрій (199 мг), і перемішували отриману суміш протягом ночі при нагріванні зі зворотним холодильником. До реакційної суміші додавали етилацетат і насичений водний гідрокарбонат натрію, і розділяли шари. Органічний шар двічі промивали насиченим водним гідрокарбонатом натрію, сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували, а потім концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску з одержанням сульфідної сполуки (348 мг).

15 (2) Вказану в заголовку сполуку (200 мг) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 83, стадія (2), і довідковому прикладі 9, стадія (2), шляхом використання сполуки (346 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

MC (ESI) $m/z = 138 [M+H]^+$

^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 1,42 (т, $J=7,6$ Гц, 3H), 3,06-3,12 (м, 4H), 3,25-3,29 (м, 2H)

Довідковий приклад 85: Синтез 2-аміно-N-фенілетансульфонаміду

20 (1) 2-Фталімідоетансульфонілхлорид (500 мг) розчиняли в хлороформі (5 мл), до розчину при кімнатній температурі додавали анілін (448 мкл), і перемішували отриману суміш при нагріванні зі зворотним холодильником протягом 3 годин. До реакційної суміші додавали етилацетат, дистильовану воду й 1н соляну кислоту, і розділяли шари. Органічний шар промивали дистильованою водою, сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували, а потім концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску з одержанням сукцинімідної сполуки (464 мг).

(2) Вказану в заголовку сполуку (239 мг) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 9, стадія (2), шляхом використання сполуки (460 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

30 MC (ESI) $m/z = 201 [M+H]^+$

^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 2,86 (т, $J=6,8$ Гц, 2H), 3,11 (т, $J=6,8$ Гц, 2H), 7,06 (дт, $J=7,2$, 1,2 Гц, 1H), 7,16 (дд, $J=7,2$, 1,2 Гц, 2H), 7,31 (дд, $J=7,2$, 1,2 Гц, 1H)

Довідковий приклад 86: Синтез сульфамойлхлориду

35 Хлорсульфонілізоціанат (1,22 мл) розчиняли в хлористому метилені (3 мл), до розчину при охолодженні на льоді додавали розчин (3 мл) мурашиної кислоти (533 мкл) у хлористому метилені, отриману суміш повільно нагрівали до кімнатної температури, а потім перемішували при 40 °C протягом 3 годин. Реакційну суміш залишали охолоджуватися до кімнатної температури, а потім концентрували в умовах зниженого тиску з одержанням вказаної в заголовку сполуки (1,68 г).

40 Довідковий приклад 87: Синтез метилсульфамойлхлориду

Метилсульфамову кислоту (2 г) розчиняли в толуолі (20 мл), до розчину при охолодженні на льоді додавали пентоксид фосфору (3,75 г), і перемішували отриману суміш при 80 °C протягом 30 хвилин. Реакційну суміш фільтрували, потім фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і піддавали отриманий залишок дистиляції в умовах зниженого тиску (1,9 мм рт. ст., точка кипіння: 67 °C) з одержанням вказаної в заголовку сполуки (1,2 г).

45 Довідковий приклад 88: Синтез 2-аміно-N-бензилацетаміду

50 (1) N-(трет-бутоксикарбоніл)гліцин (1,0 г) і бензиламін (624 мкл) розчиняли в хлороформі (10 мл), і охолоджували розчин на льоді. До розчину додавали гідроксибензотриазол (874 мг) і N-етил-N'-(3-диметиламінопропіл)карбодііміду гідрохлорид (1,09 г), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 19 годин. До реакційної суміші додавали 1н водний гідросульфат калію, отриману суміш фільтрували, і розділяли органічний шар. До органічного шару додавали насичений водний гідрокарбонат натрію, і розділяли шари. Органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (гексан/етилацетат = 1/1→1/4) з одержанням амідної сполуки (1,6 г).

55 (2) Вказану в заголовку сполуку (802 мг) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 78, стадія (3), шляхом використання сполуки (1,6 г), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

MC (ESI) $m/z = 165 [M+H]^+$

¹H-ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ (м. ч.): 3,41 (с, 2H), 4,48 (д, J=6,10 Гц, 2H), 7,27-7,37 (м, 5H), 7,59 (с, 1H)

Довідковий приклад 89: Синтез 2-аміноацетаніліду

(1) N-(трет-бутоксикарбоніл)гліцин (384 мг) і анілін (204 мг) розчиняли в тетрагідрофурані (5 мл), до розчину додавали N,N'-дициклогексилкарбодіімід (471 мг), і перемішували отриману суміш протягом ночі при кімнатній температурі. До реакційної суміші додавали етилацетат, і фільтрували отриману суміш. Потім до фільтрату додавали 0,1н соляну кислоту, і розділяли шари. Органічний шар промивали насиченим водним гідрокарбонатом натрію, сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували, а потім концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску з одержанням амідної сполуки (520 мг).

(2) Сполуку (395 мг), отриману на описаній вище стадії (1), розчиняли в хлористому метилені (10 мл), до розчину при охолодженні на льоді додавали трифтороцтову кислоту (5 мл), перемішували отриману суміш при тій же температурі протягом 30 хвилин, а потім перемішували при кімнатній температурі протягом 40 хвилин. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску, до отриманого залишку додавали суміш хлороформу й ізопропанолу (5/1) і насичений водний гідрокарбонат натрію, і розділяли шари. Потім водний шар двічі екстрагували сумішшю хлороформу й ізопропанолу (5/1). Органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували, а потім концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску з одержанням вказаної в заголовку сполуки (171 мг).

MC (ESI) m/z = 151 [M+H]⁺

¹H-ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ (м. ч.): 3,48 (с, 2H), 7,08-7,13 (м, 1H), 7,31-7,36 (м, 2H), 7,58-7,62 (м, 2H), 9,40 (ушир. с, 1H)

Довідковий приклад 90: Синтез 2-аміно-N-(піридин-3-ілметил)ацетаміду

Вказану в заголовку сполуку (892 мг) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 88, стадія (1), і довідковому прикладі 78, стадія (3), шляхом використання N-(трет-бутоксикарбоніл)гліцину (1,0 г) і 3-піколіламіну (577 мкл) як вихідних речовин.

MC (ESI) m/z = 166 [M+H]⁺

¹H-ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ (м. ч.): 3,42 (с, 2H), 4,50 (д, J=6,35 Гц, 2H), 7,25-7,29 (м, 1H), 7,63-7,67 (м, 1H), 7,70-7,81 (м, 1H), 8,53 (дд, J=4,88, 1,71 Гц, 1H), 8,56 (д, J=1,71 Гц, 1H)

Довідковий приклад 91: Синтез 2-аміно-N-(метилсульфоніл)ацетаміду

(1) N-(бензилоксикарбоніл)гліцин (1,0 г) розчиняли в тетрагідрофурані (20 мл), до розчину при кімнатній температурі додавали карбонілдімідазол (780 мг), перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 30 хвилин, а потім перемішували при нагріванні зі зворотним холодильником протягом 1 години. Реакційну суміш залишали охолоджуватися до кімнатної температури, до реакційної суміші додавали метансульфонамід (460 мг), і перемішували отриману суміш протягом 10 хвилин. Потім до реакційної суміші додавали розчин 1,8-діазабіцикло[5.4.0]-7-ундецена (715 мкл) у тетрагідрофурані (5 мл), і додатково перемішували отриману суміш протягом 21 години. Реакційну суміш при охолодженні на льоді вливали в 0,8н соляну кислоту, отриманий осад збирали шляхом фільтрування й промивали дистильованою водою з одержанням метансульфоніламідної сполуки (753 мг).

(2) Сполуку (753 мг), отриману на описаній вище стадії (1), розчиняли в метанолі (10 мл), до розчину в атмосфері аргону додавали 5 % паладоване вугілля (100 мг), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 4 годин під тиском 1 атм водню. Реакційну суміш фільтрували, а потім концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску з одержанням вказаної в заголовку сполуки (420 мг).

MC (ESI) m/z = 153 [M+H]⁺

¹H-ЯМР (400 МГц, D₂O) δ (м. ч.): 2,92 (с, 3H), 3,49 (с, 2H)

Довідковий приклад 92: Синтез 2-аміно-N-(N,N-диметилсульфамоіл)ацетаміду

(1) N-(бензилоксикарбоніл)гліцин (500 мг) розчиняли в тетрагідрофурані (10 мл), до розчину при кімнатній температурі додавали карбонілдімідазол (390 мг), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 30 хвилин, а потім перемішували при нагріванні зі зворотним холодильником протягом 1 години. Реакційну суміш залишали охолоджуватися до кімнатної температури, до реакційної суміші додавали N,N-диметилсульфамід (297 мг), і перемішували отриману суміш протягом 10 хвилин. Потім до реакційної суміші додавали 1,8-діазабіцикло[5.4.0]-7-ундецен (360 мкл), і додатково перемішували отриману суміш протягом 16 годин. До реакційної суміші при охолодженні на льоді додавали 0,8н соляну кислоту, і екстрагували отриману суміш хлороформом. Органічний шар промивали дистильованою водою й насиченим водним хлоридом амонію, сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок

методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол = 25/1→20/1) з одержанням сульфамідної сполуки (640 мг).

(2) Вказану в заголовку сполуку (109 мг) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 91, стадія (2), шляхом використання сполуки (635 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

МС (ESI) $m/z = 182 [M+H]^+$

^1H -ЯМР (400 МГц, D_2O) δ (м. ч.): 2,51 (с, 6H), 3,50 (с, 2H)

Довідковий приклад 93: Синтез 2-аміно-N-бензил-N-метилацетаміду

Вказану в заголовку сполуку (740 мг) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 88, стадія (1), і довідковому прикладі 78, стадія (3), шляхом використання N-(трет-бутоксикарбоніл)гліцину (1,0 г) і N-метилбензиламіну (736 мкл) як вихідних речовин.

МС (ESI) $m/z = 179 [M+H]^+$

^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 2,86-3,00 (м, 3H), 3,50-3,52 (м, 2H), 4,46-4,62 (м, 2H), 7,13-7,39 (м, 5H)

Довідковий приклад 94: Синтез 2-аміно-N-етилацетаміду

Вказану в заголовку сполуку (116 мг) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 89, шляхом використання N-(трет-бутоксикарбоніл)гліцину (384 мг) і 70 % водного етиламіну (147 мкл) як вихідних речовин.

МС (ESI) $m/z = 103 [M+H]^+$

^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 1,17 (т, $J=7,2$ Гц, 3H), 1,38 (ушир. с, 2H), 3,29-3,37 (м, 4H), 7,20 (ушир. с, 1H)

Довідковий приклад 95: Синтез 2-аміно-N-(N-метилсульфамоїл)ацетаміду

(1) N-Метилбензиламін (335 мкл) розчиняли в хлороформі (6 мл), до розчину додавали триетиламін (1,09 мл), і охолоджували отриману суміш на льоді. До реакційної суміші додавали сполуку (600 мг), отриману в довідковому прикладі 86, і перемішували отриману суміш при тій же температурі протягом 1,5 годин. Реакційну суміш нагрівали до кімнатної температури, до суміші додавали 4-диметиламінопіридин (31,7 мг), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 19 годин. Потім до реакційної суміші додавали 1N соляну кислоту, і розділяли шари. Органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (гексан/етилацетат = 10/1→1/1) з одержанням сульфамідної сполуки (262 мг).

(2) Вказану в заголовку сполуку (125 мг) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 91, шляхом використання сполуки (262 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), і N-(бензилоксикарбоніл)гліцину (273 мг) як вихідних речовин.

МС (ESI) $m/z = 168 [M+H]^+$

^1H -ЯМР (400 МГц, D_2O) δ (м. ч.): 2,44 (с, 3H), 3,55 (с, 2H)

Довідковий приклад 96: Синтез гідрохлориду (2-метансульфонілетил)гідразину

(1) Метилвінілсульфон (200 мг) розчиняли в тетрагідрофурані (4 мл), до розчину додавали трет-бутилкарбазат (747 мг) і 1,8-діазабіцикло[5.4.0]-7-ундецен (844 мкл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 26 годин. До реакційної суміші додавали насичений водний гідрокарбонат натрію й хлороформ, розділяли шари, органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ → хлороформ/метанол/28% водний аміак = 10/1/0,1), а потім знову очищали методом колонкової хроматографії на силікагелі (етилацетат → етилацетат/тетрагідрофуран = 10/1) з одержанням N-алкільної сполуки (234 мг).

(2) До сполуки (234 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), додавали 4M розчин соляної кислоти в діоксані (4,68 мл), до отриманої суміші додатково додавали метанол (1 мл) і дистильовану воду (800 мкл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 3 годин. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску з одержанням вказаної в заголовку сполуки (180 мг).

МС (ESI) $m/z = 139 [M+H]^+$

^1H -ЯМР (400 МГц, CD_3OD) δ (м. ч.): 3,06 (с, 3H), 3,41 (с, 4H)

Довідковий приклад 97: гідрохлорид 4-нітробензил-(R)-3-(аміноокси)піперидин-1-карбоксилату

(1) (S)-3-гідроксипіперидину гідрохлорид розчиняли в дистильованій воді (2,5 мл), до розчину додавали гідрокарбонат натрію (889 мг), до суміші при кімнатній температурі повільно додавали розчин (2,5 мл) 4-нітробензилхлороформіату (836 мг) в ацетоні, і перемішували отриману суміш протягом 2 годин. До реакційної суміші додавали етилацетат і дистильовану

воду, і розділяли шари. Органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (гексан → гексан/етилацетат = 1/2) з одержанням захищеної сполуки (971 мг).

5 (2) Сполуку (971 мг), отриману на описаній вище стадії (1), розчиняли в тетрагідрофурані, до розчину додавали N-гідроксифталімід (848 мг) і трифенілфосфін (1,36 г). До реакційної суміші при охолодженні на льоді додавали діізопропілазодикарбоксилат (1,02 мл), а потім перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 1,5 годин. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (гексан → гексан/етилацетат = 1/2) з одержанням фталімідної сполуки (1,52 г).

(3) Сполуку (1,52 г), отриману на описаній вище стадії (2), розчиняли в етанолі (10 мл) і хлороформі (10 мл), до розчину при нагріванні зі зворотним холодильником додавали гідразину моногідрат (638 мкл), і перемішували отриману суміш протягом 1,5 годин. Реакційну суміш фільтрували, і концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску. Отриманий залишок очищали методом колонкової хроматографії на силікагелі (гексан → гексан/етилацетат = 1/2), потім до очищеного залишку додавали 4М розчин соляної кислоти в діоксані (866 мкл), і концентрували отриману суміш в умовах зниженого тиску з одержанням вказаної в заголовку сполуки (825 мг).

MC (ESI) m/z = 296 $[M+H]^+$

20 ^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 1,40-1,53 (м, 1H), 1,67-1,85 (м, 3H), 3,14-3,72 (м, 4H), 3,72-4,05 (м, 1H), 5,25 (с, 2H), 5,28-5,49 (м, 2H), 7,48-7,57 (м, 2H), 8,20-8,24 (м, 2H)

Довідковий приклад 98: Синтез N,N-діізопропіл-N-метилетан-1,2-діаміну

(1) N,N-діізопропілетан-1,2-діамін (3,0 г) розчиняли в хлороформі (30 мл), до розчину при охолодженні на льоді додавали ди-трет-бутилдикарбонат (4,3 мл), і перемішували отриману суміш протягом ночі при кімнатній температурі. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску, потім до отриманого залишку додавали етилацетат і дистильовану воду, і розділяли шари. Органічний шар тричі промивали дистильованою водою, сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували, а потім концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску з одержанням захищеної сполуки (4,6 г).

30 (2) Вказану в заголовку сполуку (2,3 г) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 18, стадія (2), шляхом використання сполуки (4,6 г), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

MC (ESI) m/z = 159 $[M+H]^+$

35 ^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 0,99 (д, J=1,71 Гц, 6H), 1,00 (д, J=1,71 Гц, 6H), 2,43 (с, 3H), 2,54-2,57 (м, 4H), 2,96-3,03 (м, 2H)

Довідковий приклад 99: Синтез N-метил-2-(піролідін-1-іл)етанаміну

(1) Алкільну сполуку (475 мг) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 1, стадія (1), шляхом використання піролідину (0,24 мл) як вихідної речовини.

40 (2) Вказану в заголовку сполуку (183 мг) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 78, стадія (3), шляхом використання сполуки (462 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

MC (ESI) m/z = 129 $[M+H]^+$

45 ^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 1,75-1,79 (м, 4H), 2,45 (с, 3H), 2,48-2,52 (м, 4H), 2,59 (т, J=6,35 Гц, 2H), 2,70 (т, J=6,35 Гц, 2H)

Довідковий приклад 100: Синтез 2-(2-метоксифеніл)пропан-2-аміну

2-Метоксibenзонітрил (6 г) розчиняли в діетиловому ефірі (140 мл), до розчину додавали 3М розчин метилмагнійброміду в діетиловому ефірі (45 мл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 1 години. До реакційної суміші додавали тетраізопропоксид титану (13,1 мл), і перемішували отриману суміш при нагріванні зі зворотним холодильником протягом 4 годин. До реакційної суміші додавали 10 % водний гідроксид натрію (160 мл) і етилацетат (160 мл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 1 години. Реакційну суміш фільтрували через целіт, а потім розділяли шари фільтрату. Водний шар екстрагували хлороформом, а органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 40/1/0,1→10/1/0,1) з одержанням вказаної в заголовку сполуки (2,76 г).

MC (ESI) m/z = 166 $[M+H]^+$

55 ^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 1,53 (с, 6H), 3,89 (с, 3H), 6,89-6,94 (м, 2H), 7,19-7,25 (м, 1H), 7,32-7,36 (м, 1H)

60 Довідковий приклад 101: Синтез 2-метокси-N-метил-N-[2-(метиламіно)етил]бензаміду

(1) Алкільну сполуку (440 мг) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 1, стадія (1), шляхом використання бензиламіну (375 мг) як вихідної речовини.

(2) Метильну сполуку (445 мг) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 19, стадія (2), шляхом використання сполуки (435 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

(3) Дебензиловану сполуку (207 мг) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 91, стадія (2), шляхом використання сполуки (324 мг), отриманої на описаній вище стадії (2), як вихідної речовини.

(4) Сполуку (201 мг), отриману на описаній вище стадії (3), розчиняли в хлороформі (2,5 мл), до розчину при охолодженні на льоді додавали триетиламін (225 мкл) і розчин 2-метоксибензоїлхлориду (237 мг) у хлороформі (1,5 мл), і перемішували отриману суміш протягом 1 години. До реакційної суміші додавали насичений водний гідрокарбонат натрію й етилацетат, і розділяли шари. Органічний шар промивали дистильованою водою й насиченим водним хлоридом амонію, сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували, потім концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (гексан/етилацетат = 1/1→1:4) з одержанням амідної сполуки (335 мг).

(5) Сполуку (420 мг), отриману на описаній вище стадії (4), розчиняли в хлористому метилені (8 мл), до розчину додавали анізол (690 мкл) і трифтороцтову кислоту (1,2 мл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 3 годин. До реакційної суміші додавали 5н соляну кислоту й етилацетат, і розділяли шари. Водний шар нейтралізували додаванням карбонату калію, а потім екстрагували хлороформом. Органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували, а потім концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску з одержанням вказаної в заголовку сполуки (270 мг).

MC (ESI) m/z = 223 $[M+H]^+$

1H -ЯМР (200 МГц, $CDCl_3$) δ (м. ч.): 2,27 і 2,50 (кожний с, 3H), 2,60-2,73 (м, 1H), 2,85 і 3,12 (кожний с, 3H), 2,89 і 3,27 (кожний т, J=6,59 Гц, 3H), 3,83 і 3,84 (кожний с, 3H), 6,91 (д, J=8,30 Гц, 1H), 6,95-7,03 (м, 1H), 7,18-7,40 (м, 2H)

Довідковий приклад 102: Синтез N-етил-N-[(1S)-1-(2-метоксифеніл)етил]етан-1,2-діаміну

(1) (1S)-1-(2-метоксифеніл)етиламін (8,86 г), отриманий способом, описаним у публікації заявки на видачу патенту Японії № 54/154724, яка не пройшла експертизу) розчиняли в хлороформі (100 мл), до розчину додавали оцтовий ангідрид (12,0 г) і 4-диметиламінопіридин (14,3 г), і перемішували отриману суміш при 70 °C протягом 30 хвилин. Реакційну суміш залишали охолоджуватися, а потім послідовно промивали 1н соляною кислотою й 10 % водним гідроксидом натрію. Органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували, а потім концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску з одержанням ацетильної сполуки (11,23 г).

(2) N-Етильну сполуку (10,86 г) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 18, стадія (2), шляхом використання сполуки (11,2 г), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

(3) Фталімідоацетальдегід (125 мг), отриманий описаним у літературі способом (Tetrahedron Letters, 2001, vol. 42, p. 315), розчиняли в хлороформі (20 мл), до розчину додавали сполуку (0,6 г), отриману на описаній вище стадії (2), і триацетоксиборгідрид натрію (1,06 г), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 2 годин. До реакційної суміші додавали насичений водний гідрокарбонат натрію й хлороформ, і розділяли шари. Органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (гексан/етилацетат = 2/1) з одержанням фталімідної сполуки (0,93 г).

(4) Вказану в заголовку сполуку (484 мг) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 9, стадія (2), шляхом використання сполуки (0,93 г), отриманої на описаній вище стадії (3), як вихідної речовини.

MC (ESI) m/z = 223,2 $[M+H]^+$

1H -ЯМР (200 МГц, $CDCl_3$) δ (м. ч.): 0,98 (т, J=7,03 Гц, 3H), 1,29 (д, J=7,03 Гц, 3H), 2,38-2,72 (м, 6H), 3,82 (с, 3H), 4,37 (кв, J=7,03 Гц, 1H), 6,83-6,97 (м, 2H), 7,15-7,25 (м, 1H), 7,36 (дд, J=7,47, 1,76 Гц, 1H)

Довідковий приклад 103: Синтез (2R)-2-аміно-3-{етил[(1S)-1-(2-метоксифеніл)етил]аміно}пропан-1-олу

(1) N-трет-бутоксикарбоніл-O-бензил-(L)-серин (2,14 г) і гідроксибензотриазол (980 мг) розчиняли в диметилформаміді (20 мл), до розчину додавали дициклогексилкарбодіімід (1,50 г), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 5 хвилин. Потім до

реакційної суміші додавали сполуку (1,0 г), отриману в довідковому прикладі 102, стадія (2), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 5 годин. До реакційної суміші додавали етилацетат, отриману суміш фільтрували, і концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску. До отриманого залишку додавали етилацетат і насичений водний гідрокарбонат натрію, і розділяли шари. Органічний шар промивали насиченим водним гідрокарбонатом натрію й насиченим водним хлоридом натрію, а потім сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (гексан → гексан/етилацетат = 4/1) з одержанням амідної сполуки (1,76 г).

(2) Дебензиловану сполуку (155 мг) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 81, стадія (2), шляхом використання сполуки (197 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

(3) Вказану в заголовку сполуку (68,6 мг) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 101, стадія (5), і довідковому прикладі 18, стадія (2), шляхом використання сполуки (155 мг), отриманої на описаній вище стадії (2), як вихідної речовини.

MC (FAB) $m/z = 253 [M+H]^+$

^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 1,06 (т, $J=7,1$ Гц, 3H), 1,36 (д, $J=6,8$ Гц, 1H), 2,37-2,57 (м, 3H), 2,63-2,75 (м, 1H), 3,02-3,11 (м, 1H), 3,47-3,58 (м, 2H), 3,83 (с, 3H), 4,45 (кв, $J=6,8$ Гц, 1H), 6,88 (д, $J=8,3$ Гц, 1H), 6,96 (дт, $J=7,6$, 1,0 Гц, 1H), 7,21-7,31 (м, 2H)

Довідковий приклад 104: Синтез N-[2-(2-метоксифеніл)пропан-2-іл]-N,N'-диметилетан-1,2-діаміну

(1) Алкілну сполуку (1,24 г) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 1, стадія (1), шляхом використання сполуки (1,50 г), отриманої в довідковому прикладі 100, як вихідної речовини.

(2) Алкілну сполуку (299 мг) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 19, стадія (2), шляхом використання сполуки (300 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

(3) Сполуку (295 мг), отриману на описаній вище стадії (2), розчиняли в метанолі (2 мл), до розчину додавали 5-10 % розчин соляної кислоти в метанолі (5 мл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 1 доби. До реакційної суміші додавали 10н водний гідроксид натрію, і екстрагували отриману суміш хлороформом. Органічний шар концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 10/1/0,1) з одержанням вказаної в заголовку сполуки (130,5 мг).

MC (ESI) $m/z = 237,2 [M+H]^+$

^1H -ЯМР (200 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 1,45 (с, 6H), 2,13 (с, 3H), 2,36 (с, 3H), 2,48-2,63 (м, 4H), 3,82 (с, 3H), 6,83-6,95 (м, 2H), 7,14-7,25 (м, 1H), 7,41 (дд, $J=7,91$, 1,76 Гц, 1H)

Довідковий приклад 105: Синтез N-[2-(2-метоксипіридин-3-іл)пропан-2-іл]-N,N'-диметилетан-1,2-діаміну

(1) 2-Хлор-3-ціанопіридин (10,0 г) розчиняли в метанолі (200 мл), до розчину додавали 28% розчин метоксиду натрію в метанолі (27,8 г), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 18 годин. Реакційну суміш фільтрували, а потім концентрували в умовах зниженого тиску, і збирали кристалічні речовини, що випали в осад, шляхом фільтрування з одержанням метоксисполуки (4,15 г).

(2) Диметильну сполуку (350 мг) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 100, шляхом використання сполуки (4,15 г), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

(3) Алкілну сполуку (53,8 мг) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 1, стадія (1), шляхом використання сполуки (50 мг), отриманої на описаній вище стадії (2), як вихідної речовини.

(4) Вказану в заголовку сполуку (46,3 мг) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 19, стадія (2), і довідковому прикладі 104, стадія (3), шляхом використання сполуки (290 мг), отриманої на описаній вище стадії (3), як вихідної речовини.

MC (ESI) $m/z = 238,2 [M+H]^+$

^1H -ЯМР (200 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 1,43 (с, 6H), 2,14 (с, 3H), 2,39 (с, 3H), 2,47-2,69 (м, 4H), 3,96 (с, 3H), 6,84 (дд, $J=7,47$, 4,83 Гц, 1H), 7,69 (дд, $J=7,47$, 2,20 Гц, 1H), 8,04 (дд, $J=4,83$, 2,20 Гц, 1H)

Довідковий приклад 106: Синтез N-[2-(2-метоксифеніл)пропан-2-іл]етан-1,2-діаміну

Вказану в заголовку сполуку (34,7 мг) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 102, стадія (3), і довідковому прикладі 9, стадія (2), шляхом використання сполуки (480 мг), отриманої в довідковому прикладі 100, як вихідної речовини.

MC (ESI) $m/z = 209,0 [M+H]^+$

5 ^1H -ЯМР (600 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 1,50 (с, 6H), 2,24 (т, $J=6,19$ Гц, 2H), 2,70 (т, $J=6,19$ Гц, 2H), 3,85 (с, 3H), 6,86-6,94 (м, 2H), 7,19-7,25 (м, 2H)

Довідковий приклад 107: Синтез (2S)-N-[2-(2-метоксифеніл)пропан-2-іл]-N-метилпропан-1,2-діаміну

10 (1) Амідну сполуку (1,00 г) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 88, стадія (1), шляхом використання сполуки (1,18 г), отриманої в довідковому прикладі 100, і N-трет-бутоксикарбоніл-(L)-аланіну (2,70 г) як вихідних речовин.

15 (2) Сполуку (1,00 г), отриману на описаній вище стадії (1), розчиняли в тетрагідрофурані (15 мл), до розчину при охолодженні на льоді додавали 1М розчин комплексу боран/тетрагідрофуран у тетрагідрофурані (15 мл), і перемішували отриману суміш протягом ночі при кімнатній температурі. До реакційної суміші при охолодженні на льоді додавали метанол, отриману суміш концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 40/1/0,1→20/1/0,1) з одержанням відновленої сполуки (241 мг).

20 (3) Вказану в заголовку сполуку (21,8 мг) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 19, стадія (2), і довідковому прикладі 104, стадія (3), шляхом використання сполуки (82,8 мг), отриманої на описаній вище стадії (2), як вихідної речовини.

MC (ESI) $m/z = 237,2 [M+H]^+$

25 ^1H -ЯМР (600 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 0,94 (д, $J=6,42$ Гц, 3H), 1,44 (с, 6H), 1,70 (ушир. с, 2H), 2,10 (с, 3H), 2,13 (дд, $J=12,38$, 3,67 Гц, 1H), 2,19-2,26 (м, 1H), 2,87-2,96 (м, 1H), 3,80 (с, 3H), 6,85-6,90 (м, 2H), 7,16-7,22 (м, 1H), 7,34-7,38 (м, 1H)

Довідковий приклад 108: Синтез (2S)-N-[2-(2-метоксипіридин-3-іл)пропан-2-іл]-N-метилпропан-1,2-діаміну

30 Вказану в заголовку сполуку (23,2 мг) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 103, стадія (1), довідковому прикладі 107, стадія (2), довідковому прикладі 19, стадія (2), і довідковому прикладі 89, стадія (2), шляхом використання сполуки (604 мг), отриманої в довідковому прикладі 105, стадія (2), і N-трет-бутоксикарбоніл-(L)-аланіну (1,37 г) як вихідних речовин.

MC (ESI) $m/z = 238,2 [M+H]^+$

35 ^1H -ЯМР (600 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 0,95 (д, $J=5,96$ Гц, 3H), 1,41 (с, 6H), 2,10 (с, 3H), 2,11-2,26 (м, 2H), 2,84-3,03 (м, 1H), 3,92 (с, 3H), 6,82 (дд, $J=7,57$, 4,81 Гц, 1H), 7,64 (дд, $J=7,57$, 1,83 Гц, 1H), 8,03 (дд, $J=4,81$, 1,83 Гц, 1H)

Довідковий приклад 109: Синтез N,N'-диметил-N'-(2-фенілпропан-2-іл)етан-1,2-діаміну

40 (1) Аміносполуку (505 мг) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 1, стадія (1), шляхом використання 2-фенілпропан-2-аміну (270 мг) як вихідної речовини.

(2) Вказану в заголовку сполуку (110 мг) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 19, стадія (2), і довідковому прикладі 101, стадія (5), шляхом використання сполуки (200 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

MC (ESI) $m/z = 207 [M+H]^+$

45 ^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 1,35 (с, 6H), 2,15 (с, 3H), 2,33 (с, 3H), 2,43 (т, $J=5,98$ Гц, 2H), 2,58 (т, $J=5,98$ Гц, 2H), 7,17-7,22 (м, 1H), 7,27-7,33 (м, 2H), 7,47-7,52 (м, 2H)

Довідковий приклад 110: Синтез (2R)-3-(диметиламіно)-2-(метиламіно)пропан-1-олу

50 Вказану в заголовку сполуку (0,58 г) одержували тими ж способами, що й описані в довідковому прикладі 34, стадія (1), довідковому прикладі 107, стадія (2), і довідковому прикладі 7, стадія (2), шляхом використання N-(трет-бутоксикарбоніл)-О-бензил-(L)-серину (2,50 г) і 50 % водного диметиламіну (3 мл) як вихідних речовин.

MC (ESI) $m/z = 132,9 [M+H]^+$

55 ^1H -ЯМР (600 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 2,33 (с, 6H), 2,35-2,39 (м, 1H), 2,70-2,76 (м, 4H), 2,97-3,04 (м, 1H), 3,73 (дд, $J=13,30$, 5,96 Гц, 1H), 3,90 (дд, $J=13,30$, 3,21 Гц, 1H)

Довідковий приклад 111: 3-(метилсульфініл)пропан-1-аміну гідрохлориду

(1) Захищену сполуку (54,0 г) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 8, стадія (1), шляхом використання 3-(метилтіо)пропіламіну (25 г) як вихідної речовини.

60 (2) Сполуку (3,0 г), отриману на описаній вище стадії (1), розчиняли в хлороформі (300 мл), до розчину при охолодженні на льоді порціями додавали мета-хлорпербензойну кислоту (3,88 г), і перемішували отриману суміш при тій же температурі протягом 2 годин. До реакційної

суміші додавали 25 % водний гідроксид натрію, і розділяли шари. Органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 200/1/0,1→50/1/0,1) з одержанням окисненої сполуки (2,59 г).

(3) Вказану в заголовку сполуку (1,57 г) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 66, стадія (3), шляхом використання сполуки (2,5 г), отриманої на описаній вище стадії (2), як вихідної речовини.

¹H-ЯМР (200 МГц, DMSO-d₆) δ (м. ч.): 1,86-2,07 (м, 2H), 2,47-3,27 (м, 7H), 8,15 (ушир. с, 3H)

Довідковий приклад 112: Синтез N-циклобутил-N'-етил-N'-метилетан-1,2-діаміну

(1) Алкільну сполуку (6,80 г) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 1, стадія (1), шляхом використання циклобутиламіну (10,3 г) як вихідної речовини.

(2) Вказану в заголовку сполуку (358 мг) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 1, стадія (2), шляхом використання сполуки (3,4 г), отриманої на описаній вище стадії (1), і ацетальдегіду (3,64 мл) як вихідних речовин.

MC (ESI) m/z = 157,2 [M+H]⁺

¹H-ЯМР (600 МГц, CDCl₃) δ (м. ч.): 0,96 (т, J=7,02 Гц, 3H), 1,56-1,71 (м, 2H), 1,81-1,88 (м, 2H), 1,97-2,04 (м, 2H), 2,43 (с, 3H), 2,47-2,54 (м, 4H), 2,57-2,63 (м, 2H), 3,04-3,11 (м, 1H)

Довідковий приклад 113: Синтез N-метил-2-(3-метилтіоморфоліно)етанаміну

(1) Алкільну сполуку (337 мг) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 1, стадія (1), шляхом використання 3-метилтіоморфоліну (163 мг) як вихідної речовини.

(2) Вказану в заголовку сполуку (100,6 мг) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 1, стадія (2), шляхом використання сполуки (200 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

MC (ESI) m/z = 175,1 [M+H]⁺

¹H-ЯМР (200 МГц, CDCl₃) δ (м. ч.): 1,17 (д, J=6,15 Гц, 3H), 2,36-3,06 (м, 11H), 2,44 (с, 3H)

Довідковий приклад 114: Синтез 2-(2-аміноетил)-1,2,5-тиадіазолідин-1,1-діоксиду гідрохлориду

(1) трет-Бутил-{2-[(2-аміноетил)аміно]етил}карбамат (3,00 г) розчиняли в піридині (30 мл), до розчину додавали сульфамід (1,42 г), і перемішували отриману суміш при 110 °C протягом 6 годин. До реакційної суміші додавали насичений водний гідрокарбонат натрію й етилацетат, і розділяли шари. Органічний шар промивали насиченим водним гідрокарбонатом натрію й насиченим водним хлоридом натрію, а потім сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 100/1/0,1→20/1/0,1) з одержанням циклізованої сполуки (1,84 г).

(2) Вказану в заголовку сполуку (1,35 г) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 66, стадія (3), шляхом використання сполуки (1,84 г), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

MC (ESI) m/z = 166,1 [M+H]⁺

¹H-ЯМР (600 МГц, DMSO-d₆) δ (м. ч.): 2,96-3,58 (м, 8H)

Довідковий приклад 115: Синтез 2-(7-азабіцикло[2.2.1]гептан-7-іл)-N-метилетанаміну

(1) Алкільну сполуку (150 мг) одержували тим же способом, що й описаний у довідковому прикладі 1, стадія (1), шляхом використання 7-азабіцикло[2.2.1]гептану (122 мг) як вихідної речовини.

(2) До сполуки (145 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), при охолодженні на льоді додавали 4M розчин соляної кислоти в діоксані (5 мл), і перемішували отриману суміш протягом 16 годин. До реакційної суміші додавали насичений водний гідрокарбонат натрію й хлороформ, отриману суміш фільтрували з використанням фазового сепаратора для розділення шарів, і концентрували органічний шар в умовах зниженого тиску. Отриманий залишок очищали методом колонкової хроматографії на NH-силікагелі (гексан/хлороформ = 4/1→0/1) з одержанням вказаної в заголовку сполуки (20,4 мг).

MC (ESI) m/z = 155,2 [M+H]⁺

¹H-ЯМР (600 МГц, CDCl₃) δ (м. ч.): 1,23-1,29 (м, 4H), 1,61-1,66 (м, 2H), 1,69-1,74 (м, 4H), 2,45 (с, 3H), 2,48 (т, J=6,40 Гц, 2H), 2,66 (т, J=6,61 Гц, 2H)

Довідковий приклад 116: Синтез 3-(етилсульфоніл)пропан-1-аміну гідрохлориду

(1) До етантіолу (2 г) додавали метоксид натрію (33 мг), до суміші при охолодженні на льоді додавали акрилонітрил (8 мл), потім реакційну суміш залишали нагріватися до кімнатної температури й перемішували протягом 3 годин. Реакційну суміш фільтрували через целіт, і концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску з одержанням нітрильної сполуки (3,7 г).

(2) Сполуку (1,4 г), отриману на описаній вище стадії (1), розчиняли в хлороформі (19 мл), до розчину при охолодженні на льоді додавали мета-хлорпербензойну кислоту (11 г), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 1 години. До реакційної суміші додавали насичений водний тіосульфат натрію, і розділяли шари. Потім органічний шар промивали насиченим водним гідрокарбонатом натрію й насиченим водним хлоридом натрію, сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували, а потім концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску з одержанням сульфонової сполуки (0,74 г).

(3) 1М розчин комплексу боран/тетрагідрофуран у тетрагідрофурані (15 мл) нагрівали до 40 °С, і повільно додавали до розчину сполуки (0,74 г), отриману на описаній вище стадії (2). Реакційну суміш залишали охолоджуватися до кімнатної температури й перемішували протягом ночі, потім до реакційної суміші при охолодженні на льоді додавали метанол (10 мл), і перемішували отриману суміш при нагріванні зі зворотним холодильником протягом 30 хвилин. Реакційну суміш охолоджували до кімнатної температури й концентрували в умовах зниженого тиску, а потім ще двічі повторювали додавання метанолу (10 мл) і концентрування в умовах зниженого тиску. До отриманого концентрованого залишку при охолодженні на льоді додавали 5М розчин соляної кислоти в метанолі (8 мл), і перемішували отриману суміш при нагріванні зі зворотним холодильником 1 година. Реакційну суміш залишали охолоджуватися до кімнатної температури й концентрували в умовах зниженого тиску тверда речовина, що випала в осад, суспендували в 5 М розчині соляної кислоти в метанолі (7,0 мл), і перемішували суспензію при нагріванні зі зворотним холодильником протягом 20 хвилин. Реакційну суміш залишали охолоджуватися до кімнатної температури, до суміші по краплях додавали дихлорметан (10 мл), а потім перемішували отриману суміш протягом ночі при кімнатній температурі. речовини, що випали в осад, збирали шляхом фільтрування аспірацією й промивали дихлорметаном з одержанням вказаної в заголовку сполуки (0,43 г).

MC (ESI) $m/z = 152 [M+H]^+$

^1H -ЯМР (400 МГц, D_2O) δ (м. ч.): 3,20 (т, $J=7,57$ Гц, 2H), 3,12 (кв, $J=7,45$ Гц, 2H), 3,03 (т, $J=7,81$ Гц, 2H), 2,09-2,02 (м, 2H), 1,21 (т, $J=7,45$ Гц, 3H)

Довідковий приклад 117: Синтез 3-метил-2-бутен-1-аміну гідрохлориду

2-(3-Метилбут-2-еніл)ізоіндолін-1,3-діон (5,3 г), отриманий способом, описаним у міжнародній патентній публікації WO 09/087395, розчиняли в етанолі (53 мл), до розчину при кімнатній температурі додавали 79 % гідразину моногідрат (1,2 мл), і перемішували отриману суміш при нагріванні зі зворотним холодильником протягом 1 години. Реакційну суміш залишали охолоджуватися до кімнатної температури, до реакційної суміші додавали 5н соляну кислоту (5,9 мл), і перемішували отриману суміш при нагріванні зі зворотним холодильником протягом 1 години. Реакційну суміш фільтрували, отриманий після фільтрування залишок додатково промивали дистильованою водою, а потім концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску з одержанням вказаної в заголовку сполуки (3,0 г).

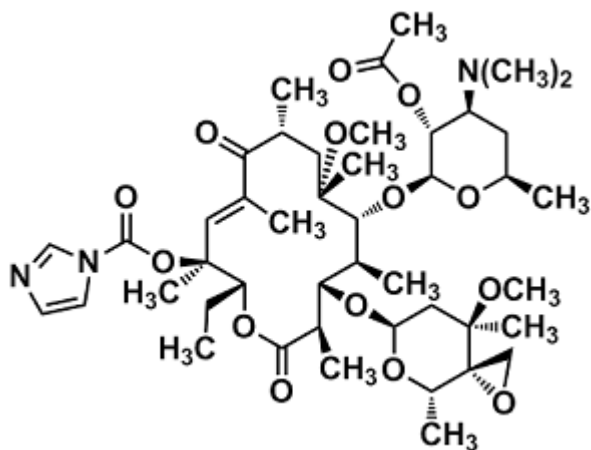
MC (ESI) $m/z = 122 [M+H]^+$

^1H -ЯМР (400 МГц, CD_3COCD_3) δ (м. ч.): 5,27-5,23 (м, 1H), 4,22 (д, $J=6,80$ Гц, 2H), 1,80 (с, 3H), 1,68 (с, 3H)

Приклади 1-147

Нижче представлені способи одержання сполук, представлених формулою (A), і сполук, представлених формулою (B), і характеризуються значеннями R^{29a} і R^2 , визначеними в таблиці 1.

Формула (А)
Формула 29



5

Формула (В)
Формула 30

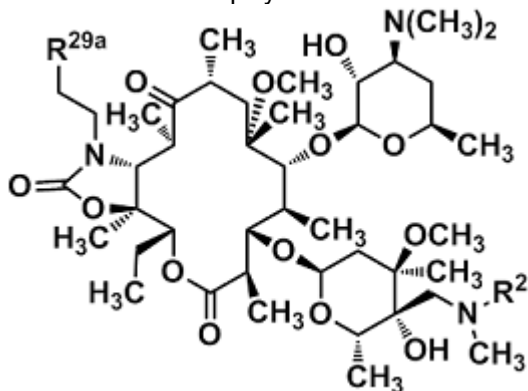
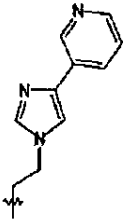

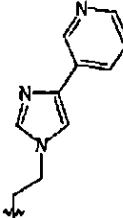
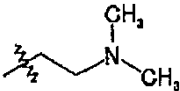
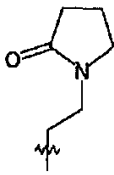
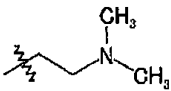


Таблица 1-1

При- клад	R ^{29a}	R ²	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
1	HO		959,7	(500 МГц): 0,85 (т, J=7,27 Гц, 3H) 0,99-1,07 (м, 9H) 1,08-1,27 (м, 19H) 1,40 (с, 6H) 1,50-2,12 (м, 9H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,39-2,63 (м, 10H) 2,83 (д, J=14,53 Гц, 1H) 2,89-2,97 (м, 1H) 3,04-3,14 (м, 4H) 3,19 (дд, J=10,28, 7,27 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,44-3,51 Гц, 1H) 3,65-3,87 (м, 7H) 4,09 (кв, J=6,31 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,13 Гц, 1H) 4,97-5,06 (м, 2H)


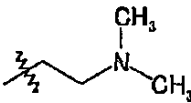



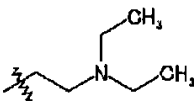

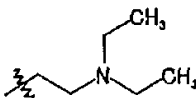
10

2			1029,7	(600 МГц): 0,79 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,00 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,08-1,11 (м, 3H) 1,11-1,14 (м, 6H) 1,15-1,18 (м, 3H) 1,19-1,25 (м, 7H) 1,35-1,41 (м, 6H) 1,47-1,61 (м, 2H) 1,68-1,75 (м, 3H) 1,83-2,00 (м, 7H) 2,04-2,09 (м, 1H) 2,29 (ушир. с, 6H) 2,36 (с, 6H) 2,39-2,47 (м, 1H) 2,56-2,61 (м, 1H) 2,73 (д, J=15,13 Гц, 1H) 2,87-2,94 (м, 1H) 3,03 (с, 3H) 3,07-3,12 (м, 1H) 3,15-3,21 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,39-3,46 (м, 1H) 3,62 (с, 1H) 3,63-3,68 (м, 2H) 3,73 (д, J=9,17 Гц, 1H) 3,75-3,81 (м, 1H) 3,99-4,05 (м, 2H) 4,08-4,13 (м, 1H) 4,38-4,41 (м, 1H) 4,90-4,95 (м, 1H) 4,98 (д, J=5,04 Гц, 1H) 7,26-7,30 (м, 1H) 7,33-7,35 (м, 1H) 7,54-7,58 (м, 1H) 8,05-8,09 (м, 1H) 8,43 (дд, J=4,58, 1,83 Гц, 1H) 8,92-8,97 (м, 1H)
3			1086,7	(600 МГц): 0,79 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,00 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,09 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,12 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,16-1,23 (м, 12H) 1,22-1,25 (м, 1H) 1,38 (с, 6H) 1,48-1,55 (м, 1H) 1,63-1,75 (м, 4H) 1,85-1,96 (м, 5H) 1,95-2,04 (м, 2H) 2,13 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,24 (с, 6H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,36-2,66 (м, 4H) 2,41-2,46 (м, 1H) 2,56-2,61 (м, 1H) 2,81 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,86-2,93 (м, 1H) 3,02 (с, 3H) 3,07-3,12 (м, 1H) 3,15-3,20 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,44-3,50 (м, 1H) 3,63 (с, 1H) 3,64-3,74 (м, 3H) 3,74-3,80 (м, 1H) 3,98-4,05 (м, 2H) 4,09-4,14 (м, 1H) 4,41 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,91-4,95 (м, 1H) 4,96-4,99 (м, 1H) 7,26-7,29 (м, 1H) 7,34 (с, 1H) 7,55 (д, J=1,38 Гц, 1H) 8,04-8,09 (м, 1H) 8,40-8,45 (м, 1H) 8,93-8,96 (м, 1H)
4			1027,0	(600 МГц): 0,82 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,99 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,08 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,11 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,17 (с, 3H) 1,17-1,20 (м, 6H) 1,20-1,24 (м, 1H) 1,22 (д, J=6,42 Гц, 3H) 1,37-1,38 (м, 3H) 1,37-1,40 (м, 1H) 1,38 (с, 3H) 1,48-1,54 (м, 1H) 1,52-1,68 (м, 4H) 1,63-1,68 (м, 1H) 1,72 (д, J=6,88 Гц, 1H) 1,87-2,03 (м, 7H) 2,14 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,24 (ушир. с, 6H) 2,29 (ушир.с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,35-2,37 (м, 1H) 2,36-2,65 (м, 4H) 2,40-2,47 (м, 1H) 2,56-2,61 (м, 1H) 2,81 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,87 (дд, J=9,40, 7,11 Гц, 1H) 3,00 (с, 3H) 3,03-3,09 (м, 1H) 3,16-3,21 (м, 1H) 3,23-3,41 (м, 4H) 3,27 (с, 3H) 3,45-3,51 (м, 1H) 3,55-3,67 (м, 2H) 3,64 (с, 1H) 3,67-3,72 (м, 2H) 4,07-4,12 (м, 1H) 4,41 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,90-5,00 (м, 2H)

5			969,9	(500 МГц): 0,83 (т, J=7,40 Гц, 3H) 1,00 (д, J=6,86 Гц, 3H) 1,08-1,12 (м, 6H) 1,13 (с, 3H) 1,17 (д, J=6,31 Гц, 3H) 1,20 (д, J=7,13 Гц, 3H) 1,23 (д, J=6,03 Гц, 3H) 1,23-1,27 (м, 1H) 1,38 (с, 3H) 1,39-1,40 (м, 1H) 1,39 (с, 3H) 1,48-1,69 (м, 4H) 1,49-1,56 (м, 1H) 1,64-1,89 (м, 1H) 1,73 (д, J=6,86 Гц, 1H) 1,87-2,09 (м, 7H) 2,30 (с, 6H) 2,34-2,40 (м, 2H) 2,37 (с, 6H) 2,40-2,48 (м, 1H) 2,55-2,63 (м, 1H) 2,74 (д, J=14,53 Гц, 1H) 2,85-2,94 (м, 1H) 3,03 (с, 3H) 3,05-3,10 (м, 1H) 3,19 (дд, J=10,28, 7,27 Гц, 1H) 3,24-3,36 (м, 2H) 3,28 (с, 3H) 3,36-3,47 (м, 3H) 3,56-3,70 (м, 2H) 3,63 (с, 1H) 3,67 (д, J=7,40 Гц, 1H) 3,73 (д, J=9,32 Гц, 1H) 4,07-4,14 (м, 1H) 4,41 (д, J=7,13 Гц, 1H) 4,93-5,00 (м, 2H)
6			979,8	(600 МГц): 0,83 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,01 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,08-1,18 (м, 12H) 1,18-1,28 (м, 7H) 1,38-1,40 (м, 6H) 1,48-2,09 (м, 13H) 2,30 (с, 6H) 2,37 (с, 6H) 2,41-2,47 (м, 1H) 2,58-2,64 (м, 1H) 2,74 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,86-2,94 (м, 1H) 3,01 (с, 3H) 3,06-3,12 (м, 1H) 3,16-3,21 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,40-3,49 (м, 3H) 3,60-3,75 (м, 5H) 4,07-4,13 (м, 1H) 4,40 (д, J=6,88 Гц, 1H) 4,96-5,03 (м, 2H) 5,43-5,48 (м, 1H) 6,46 (т, J=4,81 Гц, 1H) 8,25 (д, J=4,59 Гц, 2H)

Таблица 1-2

При-клад	R ^{29a}	R ²	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
7			1036,8	(600 МГц): 0,83 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,01 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,10 (д, J=7,79 Гц, 3H) 1,13 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,16-1,26 (м, 13H) 1,39 (с, 6H) 1,48-1,78 (м, 8H) 1,88-2,05 (м, 4H) 2,14 (д, J=15,13 Гц, 1H) 2,24 (с, 6H) 2,29 (с, 6H) 2,31-2,48 (м, 6H) 2,51-2,65 (м, 3H) 2,82 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,86-2,92 (м, 1H) 3,00-3,02 (м, 3H) 3,06-3,12 (м, 1H) 3,19 (дд, J=10,09, 7,34 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,44-3,49 (м, 3H) 3,61-3,74 (м, 5H) 4,07-4,14 (м, 1H) 4,42 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,95-5,02 (м, 2H) 5,43-5,48 (м, 1H) 6,46 (т, J=4,81 Гц, 1H) 8,25 (д, J=4,59 Гц, 2H)
8			1171,0	(600 МГц): 0,83 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,01 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,07-1,26 (м, 19H) 1,39 (с, 3H) 1,39 (с, 3H) 1,43 (ушир. с, 3H) 1,44 (ушир.с, 3H) 1,48-1,85 (м, 7H) 1,87-2,07 (м, 6H) 2,19 (с, 3H) 2,26 (с, 3H) 2,28-2,30 (м, 6H) 2,38-2,65 (м, 6H) 2,82 (д, J=15,13 Гц, 1H) 2,86-2,93 (м, 1H) 3,01 (с, 3H) 3,07-3,12 (м, 1H) 3,18 (дд, J=10,09, 7,34 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,40-3,50 (м, 3H) 3,60-3,75 (м, 5H) 3,80 (с, 3H) 4,06-4,12 (м, 1H) 4,41 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,95-5,04 (м, 2H) 5,43-5,48 (м, 1H) 6,45 (т, J=4,81 Гц, 1H) 6,85-6,90 (м, 2H) 7,15-7,20 (м 1H) 7,58-7,63 (м, 1H) 8,24 (д, J=5,04 Гц, 2H)

9			1023,9	(600 МГц): 0,82 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,00 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,10 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,13 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,16-1,26 (м, 13H) 1,39 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,49-1,93 (м, 10H) 1,96-2,05 (м, 2H) 2,14 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,20-2,21 (м, 3H) 2,24 (с, 6H) 2,29 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,21-2,66 (м, 6H) 2,82 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,87-2,93 (м, 1H) 3,01-3,04 (м, 3H) 3,09 (с, 1H) 3,16-3,21 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,42-3,51 (м, 2H) 3,58-3,66 (м, 2H) 3,68-3,77 (м, 3H) 3,89 (т, J=7,57 Гц, 2H) 4,10-4,15 (м, 1H) 4,42 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,92-4,96 (м, 1H) 5,00 (д, J=5,04 Гц, 1H) 6,64 (с, 1H) 7,35 (д, J=1,38 Гц, 1H)
10			966,8	(600 МГц): 0,82 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,00 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,10 (д, J=7,79 Гц, 3H) 1,12-1,14 (м, 6H) 1,16-1,26 (м, 10H) 1,39 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,49-2,00 (м, 12H) 2,05-2,09 (м, 1H) 2,19-2,22 (м, 3H) 2,29 (с, 6H) 2,37 (с, 6H) 2,40-2,46 (м, 1H) 2,56-2,62 (м, 1H) 2,74 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,88-2,94 (м, 1H) 3,03 (с, 3H) 3,07-3,12 (м, 1H) 3,16-3,21 (м, 1H) 3,29 (с, 3H) 3,40-3,46 (м, 2H) 3,59-3,69 (м, 3H) 3,71-3,77 (м, 2H) 3,90 (т, J=7,57 Гц, 2H) 4,09-4,15 (м, 1H) 4,40 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,93 (дд, J=11,00, 2,29 Гц, 1H) 5,01 (д, J=5,04 Гц, 1H) 6,64 (с, 1H) 7,36 (с, 1H)
11			1051,7	(600 МГц): 0,82 (т, J=7,43 Гц, 3H) 0,98-1,05 (м, 9H) 1,10 (д, J=7,43 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,02 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,17-1,26 (м, 10H) 1,39 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,48-1,94 (м, 10H) 1,97-2,06 (м, 2H) 2,09 (д, J=14,86 Гц, 1H) 2,20-2,21 (м, 3H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,38-2,63 (м, 10H) 2,84 (д, J=14,86 Гц, 1H) 2,87-2,93 (м, 1H) 3,02 (с, 3H) 3,07-3,12 (м, 1H) 3,18 (дд, J=10,11, 7,22 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,44-3,50 (м, 1H) 3,59-3,77 (м, 5H) 3,89 (т, J=7,43 Гц, 2H) 4,08-4,13 (м, 1H) 4,42 (д, J=7,02 Гц, 1H) 4,93 (дд, J=10,73, 2,06 Гц, 1H) 5,01 (д, J=4,54 Гц, 1H) 6,64 (с, 1H) 7,36 (д, J=1,24 Гц, 1H)
12			973,7	(500 МГц): 0,84 (т, J=7,40 Гц, 3H) 0,99-1,27 (м, 28H) 1,39 (с, 6H) 1,44-1,54 (м, 1H) 1,63-1,80 (м, 3H) 1,88-2,12 (м, 5H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,39-2,64 (м, 10H) 2,81-2,91 (м, 2H) 3,04 (с, 3H) 3,06-3,11 (м, 1H) 3,19 (дд, J=10,28, 7,27 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,38 (с, 3H) 3,45-3,51 (м, 1H) 3,61-3,71 (м, 4H) 3,74 (д, J=9,05 Гц, 1H) 3,83-3,95 (м, 2H) 4,10 (кв, J=6,31 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,40 Гц, 1H) 5,00 (д, J=4,39 Гц, 1H) 5,10 (дд, J=10,42, 2,74 Гц, 1H)

Таблиця 1-3

При- клад	R ^{29a}	R ²	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
13			968,8	(600 МГц): 0,85 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,98-1,05 (м, 9H) 1,10 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,18-1,22 (м, 6H) 1,23 (д, J=9,17 Гц, 3H) 1,22-1,26 (м, 1H) 1,39 (с, 3H) 1,41 (с, 3H) 1,51-1,57 (м, 1H) 1,63-1,67 (м, 1H) 1,70-1,77 (м, 2H) 1,82-1,93 (м, 2H) 1,96-2,04 (м, 2H) 2,10 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,39-2,61 (м, 8H) 2,41-2,46 (м, 1H) 2,57-2,61 (м, 1H) 2,75-2,86 (м, 3H) 2,87-2,92 (м, 1H) 3,05 (с, 3H) 3,06-3,09 (м, 1H) 3,18 (дд, J=10,09, 7,34 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,44 (ушир. с, 1H) 3,46-3,50 (м, 1H) 3,62 (с, 1H) 3,70-3,72 (м, 2H) 3,87-3,94 (м, 1H) 3,95-4,01 (м, 1H) 4,07-4,11 (м, 1H) 4,42 (д, J=6,88 Гц, 1H) 4,93 (дд, J=11,00, 2,29 Гц, 1H) 4,99 (д, J=4,13 Гц, 1H)
14			1026,7	(500 МГц): 0,85 (т, J=7,45 Гц, 3H) 0,98-1,27 (м, 28H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,47-2,13 (м, 11H) 2,29 (с, 6H) 2,32-2,38 (м, 4H) 2,41-2,64 (м, 10H) 2,80-2,92 (м, 2H) 3,03-3,13 (м, 4H) 3,19 (дд, J=10,32, 7,26 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,40-3,57 (м, 5H) 3,61-3,75 (м, 5H) 3,79-3,87 (м, 1H) 4,09 (кв, J=6,12 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,98 (д, J=3,82 Гц, 1H) 5,07 (дд, J=10,89, 2,10 Гц, 1H)
15			1035,7	(500 МГц): 0,84 (т, J=7,27 Гц, 3H) 0,98-1,05 (м, 9H) 1,10 (д, J=7,68 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,13 Гц, 3H) 1,15-1,27 (м, 13H) 1,39 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,49-1,78 (м, 4H) 1,84-2,20 (м, 6H) 2,21-2,31 (м, 7H) 2,35 (с, 3H) 2,38-2,64 (м, 10H) 2,83 (д, J=14,81 Гц, 1H) 2,88-2,96 (м, 4H) 3,03 (с, 3H) 3,06-3,21 (м, 4H) 3,28 (с, 3H) 3,43-3,51 (м, 1H) 3,63 (с, 1H) 3,66-3,77 (м, 3H) 3,87-3,94 (м, 1H) 4,10 (кв, J=6,31 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,13 Гц, 1H) 4,88 (дд, J=11,11, 2,06 Гц, 1H) 4,98 (д, J=4,39 Гц, 1H)
16			1021,7	(600 МГц): 0,84 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,98-1,28 (м, 28H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,49-1,53 (м, 1H) 1,65 (д, J=12,38 Гц, 1H) 1,73-1,76 (м, 2H) 1,82-1,92 (м, 2H) 1,98-2,02 (м, 2H) 2,09 (д, J=15,13 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,39-2,64 (м, 10H) 2,83 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,86-2,93 (м, 1H) 3,02 (с, 3H) 3,05-3,11 (м, 1H) 3,07 (с, 3H) 3,18 (дд, J=10,32, 7,11 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,40-3,58 (м, 3H) 3,63 (с, 1H) 3,69-3,73 (м, 2H) 4,01-4,17 (м, 3H) 4,42 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,96 (дд, J=11,00, 1,83 Гц, 1H) 4,99 (д, J=3,67 Гц, 1H)

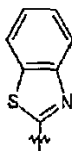
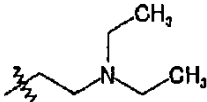
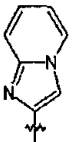
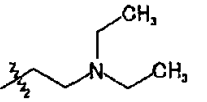

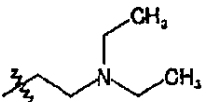
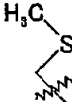
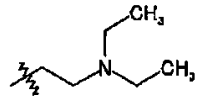
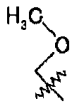
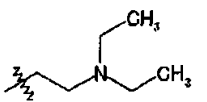

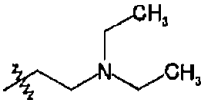
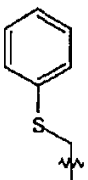
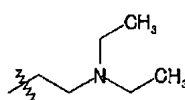
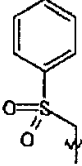
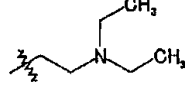

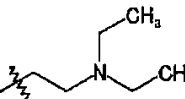
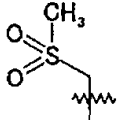
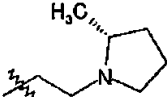
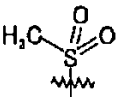
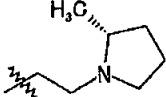
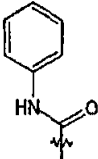
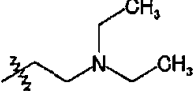
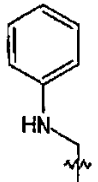
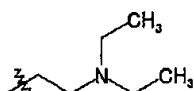
17			1076,7	(600 МГц): 0,75-0,85 (м, 3H) 0,92-1,27 (м, 28H) 1,39 (ушир. с, 6H) 1,43-2,04 (м, 8H) 2,06-2,13 (м, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,37 (ушир. с, 3H) 2,38-2,64 (м, 10H) 2,79-3,23 (м, 7H) 3,27 (с, 3H) 3,36-4,03 (м, 8H) 4,05-4,12 (м, 1H) 4,37-4,45 (м, 1H) 4,95-5,00 (м, 1H) 5,07-5,14 (м, 1H) 7,32-7,50 (м, 4H)
18			1059,7	(600 МГц): 0,79 (т, J=7,22 Гц, 3H) 0,99-1,07 (м, 9H) 1,10 (д, J=7,43 Гц, 3H) 1,14 (д, J=7,02 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,17-1,25 (м, 10H) 1,40 (с, 3H) 1,41 (с, 3H) 1,47-1,79 (м, 4H) 1,85-2,04 (м, 4H) 2,07-2,13 (м, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,38-2,66 (м, 10H) 2,81-2,91 (м, 2H) 3,12 (с, 3H) 3,09-3,14 (м, 1H) 3,16-3,24 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,39-3,51 (м, 4H) 3,69-3,77 (м, 3H) 4,03-4,17 (м, 3H) 4,40-4,44 (м, 1H) 4,96-5,01 (м, 2H) 7,33 (с, 1H) 7,38 (д, J=8,26 Гц, 2H) 7,86-7,92 (м, 2H)
19			971,7	(500 МГц): 0,83 (т, J=7,45 Гц, 3H) 0,95 (т, J=7,45 Гц, 3H) 0,99-1,05 (м, 9H) 1,07-1,27 (м, 19H) 1,30-1,42 (м, 8H) 1,45-1,69 (м, 5H) 1,70-1,76 (м, 2H) 1,88-2,12 (м, 5H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,38-2,65 (м, 10H) 2,80-2,92 (м, 2H) 3,03-3,10 (м, 4H) 3,18 (дд, J=10,32, 7,26 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,44-3,51 (м, 1H) 3,56-3,61 (м, 2H) 3,65 (с, 1H) 3,69 (д, J=7,26 Гц, 1H) 3,74 (д, J=9,17 Гц, 1H) 4,10 (кв, J=6,12 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,95-5,02 (м, 2H)

Таблица 1-4

При- клад	R ^{29a}	R ²	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
20			1003,7	(600 МГц): 0,83 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,99-1,04 (м, 9H) 1,10 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,14-1,26 (м, 13H) 1,38 (с, 3H) 1,39-1,41 (м, 3H) 1,48-1,56 (м, 1H) 1,62-1,67 (м, 1H) 1,72-1,76 (м, 2H) 1,87-2,05 (м, 6H) 2,07-2,13 (м, 4H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,40-2,63 (м, 12H) 2,81-2,85 (м, 1H) 2,85-2,91 (м, 1H) 3,05 (с, 3H) 3,06-3,11 (м, 1H) 3,16-3,21 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,44-3,50 (м, 1H) 3,65 (с, 1H) 3,67-3,75 (м, 4H) 4,10 (кв, J=6,42 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,94-5,01 (м, 2H)
21			987,7	(500 МГц): 0,84 (т, J=7,45 Гц, 3H) 0,99-1,05 (м, 9H) 1,07-1,14 (м, 6H) 1,14-1,27 (м, 13H) 1,38 (с, 3H) 1,39 (с, 3H) 1,46-1,68 (м, 2H) 1,72-1,76 (м, 2H) 1,87-2,12 (м, 7H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,39-2,64 (м, 10H) 2,80-2,92 (м, 2H) 3,02-3,10 (м, 4H) 3,18 (дд, J=9,94, 7,26 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,32 (с, 3H) 3,39-3,51 (м, 3H) 3,61-3,76 (м, 5H) 4,10 (кв, J=6,24 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,95-5,02 (м, 2H)

22			1037,7	(600 МГц): 0,82 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,00 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,01-1,04 (м, 6H) 1,10 (д, J=7,79 Гц, 3H) 1,13 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,17 (с, 3H) 1,20 (д, J=6,42 Гц, 3H) 1,22 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,23-1,26 (м, 1H) 1,24 (д, J=6,42 Гц, 3H) 1,39 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,49-1,56 (м, 1H) 1,58-1,71 (м, 2H) 1,64-1,69 (м, 1H) 1,72-1,76 (м, 2H) 1,79-1,93 (м, 4H) 1,96-2,06 (м, 2H) 2,09 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,39-2,60 (м, 8H) 2,41-2,46 (м, 1H) 2,57-2,61 (м, 1H) 2,82-2,85 (м, 1H) 2,87-2,93 (м, 1H) 3,03 (с, 3H) 3,07-3,12 (м, 1H) 3,16-3,21 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,41-3,45 (м, 1H) 3,45-3,50 (м, 1H) 3,60-3,67 (м, 1H) 3,63 (с, 1H) 3,69 (д, J=7,34 Гц, 1H) 3,73 (д, J=8,71 Гц, 1H) 3,73-3,78 (м, 1H) 3,96-4,00 (м, 2H) 4,09-4,13 (м, 1H) 4,42 (д, J=6,88 Гц, 1H) 4,92-4,94 (м, 1H) 5,01 (д, J=4,13 Гц, 1H) 6,93-6,94 (м, 1H) 7,03 (с, 1H) 7,48 (с, 1H)
23			1065,7	(500 МГц): 0,81 (т, J=7,40 Гц, 3H) 0,98-1,05 (м, 9H) 1,07-1,27 (м, 21H) 1,38 (с, 6H) 1,47-1,68 (м, 2H) 1,73 (д, J=6,86 Гц, 2H) 1,85-2,12 (м, 7H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,40-2,64 (м, 9H) 2,80-2,90 (м, 2H) 2,94-3,01 (м, 4H) 3,08 (кв, J=6,76 Гц, 1H) 3,15-3,21 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,44-3,50 (м, 1H) 3,64 (с, 1H) 3,67-3,80 (м, 4H) 4,09 (кв, J=6,31 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,13 Гц, 1H) 4,93 (дд, J=10,97, 2,19 Гц, 1H) 4,99 (д, J=4,11 Гц, 1H) 7,12-7,17 (м, 1H) 7,23-7,28 (м, 2H) 7,35-7,39 (м, 2H)
24			1097,7	(500 МГц): 0,80 (т, J=7,40 Гц, 3H) 0,94 (д, J=6,86 Гц, 3H) 1,00-1,12 (м, 12H) 1,15-1,29 (м, 13H) 1,35 (с, 6H) 1,46-2,14 (м, 11H) 2,28 (с, 6H) 2,33-2,37 (м, 3H) 2,40-2,64 (м, 10H) 2,77 (с, 3H) 2,81-2,91 (м, 2H) 3,03-3,08 (м, 1H) 3,14-3,34 (м, 6H) 3,43-3,51 (м, 1H) 3,54 (с, 1H) 3,60-3,69 (м, 3H) 3,73-3,81 (м, 1H) 4,09 (кв, J=6,40 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,40 Гц, 1H) 4,77-4,82 (м, 1H) 5,00 (д, J=3,56 Гц, 1H) 7,49-7,55 (м, 2H) 7,61-7,66 (м, 1H) 7,93-7,98 (м, 2H)
25			1049,7	(600 МГц): 0,65 (т, J=7,57 Гц, 3H) 1,00-1,05 (м, 9H) 1,09 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,18-1,26 (м, 10H) 1,38 (с, 3H) 1,39 (с, 3H) 1,41-1,51 (м, 1H) 1,62-1,68 (м, 1H) 1,70-1,79 (м, 2H) 1,81-1,88 (м, 1H) 1,89-1,95 (м, 1H) 1,95-2,05 (м, 2H) 2,10 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,40-2,63 (м, 10H) 2,81-2,90 (м, 2H) 3,04 (с, 3H) 3,10 (кв, J=6,88 Гц, 1H) 3,17-3,21 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,45-3,51 (м, 1H) 3,58-3,63 (м, 1H) 3,67-3,77 (м, 4H) 3,88-3,93 (м, 1H) 3,96-4,02 (м, 1H) 4,10 (м, 1H) 4,42 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,58-4,63 (м, 2H) 5,01 (д, J=5,04 Гц, 1H) 5,10 (дд, J=10,55, 2,29 Гц, 1H) 7,20-7,24 (м, 1H) 7,28-7,31 (м, 2H) 7,33-7,36 (м, 2H)

Таблиця 1-5

При- клад	R ^{29a}	R ²	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
26			1047,6	(600 МГц): 0,84 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,00 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,06-1,11 (м, 6H) 1,13 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,15 (с, 3H) 1,18-1,20 (м, 6H) 1,21-1,26 (м, 1H) 1,23 (д, J=5,96 Гц, 3H) 1,37-1,42 (м, 7H) 1,51-1,58 (м, 2H) 1,63-1,71 Гц, 2H) 1,72-1,81 (м, 3H) 1,86-1,93 (м, 3H) 1,95-2,05 (м, 2H) 2,08-2,19 (м, 4H) 2,22-2,29 (м, 1H) 2,28-2,30 (м, 6H) 2,30-2,35 (м, 1H) 2,36 (с, 3H) 2,39-2,46 (м, 1H) 2,55-2,66 (м, 3H) 2,84-2,93 (м, 3H) 2,93 (с, 3H) 3,03 (с, 3H) 3,08-3,20 (м, 4H) 3,28 (с, 3H) 3,42-3,49 (м, 2H) 3,63 (с, 1H) 3,66-3,75 (м, 3H) 3,86-3,93 (м, 1H) 4,10 (кв, J=6,42 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,85-4,92 (м, 1H) 4,98 (д, J=4,58 Гц, 1H)
27			1033,7	(500 МГц); 0,84 (т, J=7,26 Гц, 3H) 1,02 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,07-1,29 (м, 22H) 1,39 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,48-2,19 (м, 14H) 2,29 (с, 6H) 2,31-2,38 (м, 4H) 2,40-2,47 (м, 1H) 2,56-2,68 (м, 3H) 2,83-2,95 (м, 3H) 3,02 (с, 3H) 3,04-3,22 (м, 6H) 3,28 (с, 3H) 3,40-3,59 (м, 4H) 3,63 (с, 1H) 3,68-3,74 (м, 2H) 3,99-4,19 (м, 3H) 4,42 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,93-5,02 (м, 2H)
28			1062,8	(600 МГц): 0,54 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,99-1,05 (м, 9H) 1,11 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,14-1,16 (м, 3H) 1,17 (с, 3H) 1,18-1,26 (м, 10H) 1,38 (с, 3H) 1,42 (с, 3H) 1,43-1,51 (м, 2H) 1,63-1,69 (м, 1H) 1,71-1,83 (м, 3H) 1,87-1,93 (м, 1H) 1,97-2,06 (м, 2H) 2,07-2,12 (м, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,38-2,70 (м, 12H) 2,81-2,87 (м, 1H) 2,90-2,97 (м, 1H) 3,11 (с, 3H) 3,14-3,22 (м, 2H) 3,28 (с, 3H) 3,42-3,51 (м, 2H) 3,69-3,73 (м, 2H) 3,74-3,79 (м, 1H) 4,00-4,07 (м, 1H) 4,08-4,14 (м, 1H) 4,20-4,28 (м, 1H) 4,42 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,84-4,90 (м, 1H) 5,01-5,04 (м, 1H) 7,02-7,06 (м, 1H) 7,23-7,28 (м, 1H) 7,54 (д, J=7,34 Гц, 2H) 8,41-8,45 (м, 1H)
29			1048,7	(600 МГц): 0,79 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,99-1,03 (м, 9H) 1,09 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,15 (с, 3H) 1,17 (д, J=6,42 Гц, 3H) 1,18-1,24 (м, 7H) 1,38 (с, 3H) 1,39 (с, 3H) 1,47-1,54 (м, 1H) 1,61-1,66 (м, 1H) 1,70-1,76 (м, 2H) 1,85-2,06 (м, 6H) 2,07-2,11 (м, 1H) 2,28 (с, 6H) 2,33 (с, 3H) 2,38-2,64 (м, 10H) 2,81-2,85 (м, 1H) 2,86-2,92 (м, 1H) 3,01 (с, 3H) 3,06-3,25 (м, 4H) 3,27 (с, 3H) 3,41 (с, 1H) 3,43-3,49 (м, 1H) 3,65-3,79 (м, 5H) 4,06-4,11 (м, 1H) 4,19-4,23 (м, 1H) 4,41 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,94-4,97 On, 1H) 4,98-5,00 (м, 1H) 6,60-6,66 (м, 3H) 7,11-7,17 (м, 2H)

30			1051,6	(600 МГц): 0,83 (т, J=7,57 Гц, 3H) 1,01 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,10 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,13 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,14 (с, 3H) 1,18-1,21 (м, 6H) 1,22-1,25 (м, 1H) 1,24 (д, J=5,96 Гц, 3H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,49-1,56 (м, 1H) 1,66-1,70 (м, 1H) 1,72-1,76 (м, 2H) 1,87-2,00 (м, 5H) 2,03-2,11 (м, 2H) 2,12 (с, 3H) 2,29 (с, 6H) 2,34-2,39 (м, 2H) 2,39-2,42 (м, 1H) 2,41 (с, 3H) 2,42-2,45 (м, 1H) 2,50-2,62 (м, 3H) 2,67-2,73 (м, 1H) 2,86-2,93 (м, 2H) 3,05 (с, 3H) 3,06-3,10 (м, 1H) 3,11-3,21 (м, 5H) 3,24-3,32 (м, 2H) 3,28 (с, 3H) 3,40-3,46 (м, 1H) 3,64 (с, 1H) 3,65-3,75 (м, 4H) 4,12 (кв, J=6,11 Гц, 1H) 4,40 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,95 (дд, J=10,55, 2,29 Гц, 1H) 4,99 (д, J=5,04 Гц, 1H)
31			1049,7	(600 МГц): 0,84 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,90 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,99-1,32 (м, 28H) 1,36-1,46 (м, 1H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,50-1,53 (м, 1H) 1,63-1,67 (м, 1H) 1,74 (д, J=5,96 Гц, 2H) 1,84-1,90 (м, 2H) 1,96-2,03 (м, 2H) 2,08 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,36-2,64 (м, 10H) 2,83 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,90 (дд, J=9,86, 7,11 Гц, 1H) 3,02 (с, 3H) 3,05-3,11 (м, 1H) 3,07 (с, 3H) 3,18 (дд, J=10,55, 7,34 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,40-3,50 (м, 3H) 3,52-3,58 (м, 1H) 3,63 (с, 1H) 3,69-3,73 (м, 2H) 4,01-4,16 (м, 3H) 4,41 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,94-4,98 (м, 1H) 4,98-5,01 (м, 1H)

Таблица 1-6

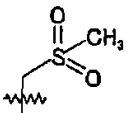
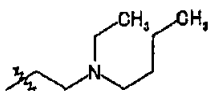
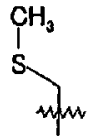
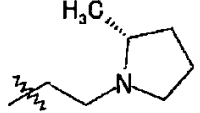

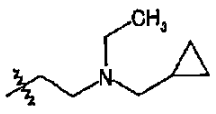
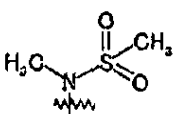
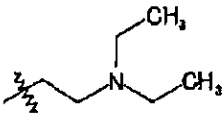
При-клад	R ^{29a}	R ²	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
32			1035,7	(600 МГц): 0,84 (т, J=7,43 Гц, 3H) 0,95-1,07 (м, 12H) 1,09 (д, J=7,43 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,02 Гц, 3H) 1,15 (с, 3H) 1,17-1,27 (м, 10H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,48-1,57 (м, 1H) 1,63-1,70 (м, 1H) 1,72-1,77 (м, 2H) 1,82-1,91 (м, 2H) 1,95-2,09 (м, 3H) 2,30 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,40-2,64 (м, 9H) 2,82-2,94 (м, 2H) 3,01 (с, 3H) 3,07 (с, 3H) 3,04-3,11 (м, 1H) 3,16-3,21 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,41-3,59 (м, 3H) 3,63 (с, 1H) 3,68-3,74 (м, 2H) 4,01-4,17 (м, 3H) 4,41 (д, J=7,43 Гц, 1H) 4,96 (дд, J=10,94, 1,86 Гц, 1H) 4,99 (д, J=4,54 Гц, 1H)

33			1047,7	(600 МГц): 0,46-0,51 (м, 4H) 0,84 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,86-0,90 (м, 1H) 1,01-1,05 (м, 6H) 1,09 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,13 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,20 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,20 (д, J=10,55 Гц, 3H) 1,20 (д, J=10,09 Гц, 3H) 1,20 (д, J=8,71 Гц, 3H) 1,14-1,26 (м, 1H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,49-1,68 (м, 2H) 1,72-1,76 (м, 2H) 1,83-1,91 (м, 2H) 1,95-2,04 (м, 2H) 2,09 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,49 (с, 3H) 2,30-2,68 (м, 10H) 2,82-2,93 (м, 2H) 3,01 (с, 3H) 3,07 (с, 3H) 3,07-3,10 (м, 1H) 3,16-3,20 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,41-3,50 (м, 2H) 3,52-3,59 (м, 1H) 3,63 (с, 1H) 3,69-3,73 (м, 2H) 4,01-4,17 (м, 3H) 4,42 (д, J=6,88 Гц, 1H) 4,96 (дд, J=10,77, 2,06 Гц, 1H) 4,99 (д, J=4,13 Гц, 1H)
34			1019,6	(500 МГц): 0,79-0,86 (м, 3H) 0,98-1,27 (м, 28H) 1,37-1,42 (м, 6H) 1,48-2,19 (м, 10H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,39-2,63 (м, 13H) 2,77-2,94 (м, 4H) 3,00-3,06 (м, 3H) 3,10 (т, J=6,99 Гц, 1H) 3,18 (дд, J=10,15, 7,13 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,40-3,52 (м, 2H) 3,63 (д, J=10,15 Гц, 1H) 3,66-3,77 (м, 3H) 3,79-3,91 (м, 1H) 4,06-4,14 (м, 1H) 4,42 (д, J=7,40 Гц, 1H) 4,85-4,93 (м, 1H) 4,96-5,02 (м, 1H)
35			1083,7	(600 МГц): 0,84 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,00 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,10 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,12-1,15 (м, 6H) 1,17-1,21 (м, 6H) 1,22-1,26 (м, 1H) 1,24 (д, J=6,42 Гц, 3H) 1,39 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,53-1,58 (м, 1H) 1,66-1,70 (м, 1H) 1,71-1,77 (м, 2H) 1,86-1,99 (м, 3H) 2,03-2,11 (м, 2H) 2,12-2,20 (м, 1H) 2,23-2,28 (м, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,33-2,45 (м, 5H) 2,41 (с, 3H) 2,56-2,63 (м, 1H) 2,67-2,75 (м, 1H) 2,88-2,93 (м, 2H) 2,93 (с, 3H) 3,03 (с, 3H) 3,08-3,21 (м, 7H) 3,28 (с, 3H) 3,29-3,35 (м, 2H) 3,40-3,44 (м, 1H) 3,63 (с, 1H) 3,66 (д, J=7,34 Гц, 1H) 3,70 (м, 2H) 3,87-3,93 (м, 1H) 4,10-4,14 (м, 1H) 4,39 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,86-4,91 (м, 1H) 4,98 (д, J=5,04 Гц, 1H)
36			989,7	(600 МГц): 0,84 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,99-1,05 (м, 9H) 1,09 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,17-1,21 (м, 6H) 1,22-1,25 (м, 1H) 1,23 (д, J=6,42 Гц, 3H) 1,38 (с, 3H) 1,39 (с, 3H) 1,48-1,54 (м, 1H) 1,63-1,67 (м, 1H) 1,72-1,75 (м, 2H) 1,85-2,04 (м, 4H) 2,09 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,16 (с, 3H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,41-2,46 (м, 1H) 2,43-2,59 (м, 8H) 2,57-2,61 (м, 1H) 2,75-2,80 (м, 2H) 2,83 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,86-2,90 (м, 1H) 3,04 (с, 3H) 3,06-3,11 (м, 1H) 3,18 (дд, J=10,09, 7,34 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,42 (ушир. с, 1H) 3,44-3,50 (м, 1H) 3,63 (с, 1H) 3,69 (д, J=7,34 Гц, 1H) 3,72 (д, J=9,63 Гц, 1H) 3,77-3,83 (м, 1H) 3,88-3,94 (м, 1H) 4,06-4,11 (м, 1H) 4,42 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,99 (д, J=4,13 Гц, 1H) 5,13 (дд, J=10,55, 2,29 Гц, 1H)

37			1037,6	(600 МГц): 0,84 (т, J=7,57 Гц, 3H) 1,02 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,09 (д, J=7,79 Гц, 3H) 1,12-1,15 (м, 6H) 1,18 (д, J=6,42 Гц, 3H) 1,20 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,21-1,25 (м, 1H) 1,24 (д, J=6,42 Гц, 3H) 1,38 (с, 3H) 1,39 (с, 3H) 1,49-1,53 (м, 1H) 1,65-1,70 (м, 1H) 1,73-1,76 (м, 2H) 1,87-1,99 (м, 3H) 2,03-2,11 (м, 2H) 2,16 (с, 3H) 2,29 (с, 6H) 2,34-2,39 (м, 2H) 2,40 (с, 3H) 2,42-2,45 (м, 1H) 2,57-2,62 (м, 1H) 2,67-2,81 (м, 4H) 2,86-2,91 (м, 2H) 3,03 (с, 3H) 3,06-3,21 (м, 6H) 3,28 (с, 3H) 3,29-3,33 (м, 2H) 3,40-3,46 (м, 1H) 3,62 (с, 1H) 3,66 (д, J=7,34 Гц, 1H) 3,71-3,74 (м, 1H) 3,77-3,84 (м, 1H) 3,89-3,95 (м, 1H) 4,10-4,14 (м, 1H) 4,40 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,98 (д, J=5,04 Гц, 1H) 5,11-5,16 (м, 1H)
----	--	--	--------	--

Таблица 1-7

При- клад	R ^{29a}	R ²	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
38			1049,7	(600 МГц): 0,84 (т J=7,34 Гц, 3H) 0,96 (д, J=6,42 Гц, 3H) 0,99 (с, 3H) 1,01 (с, 3H) 1,04 (т, J=7,11 Гц, 3H) 1,10 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,13 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,15 (с, 3H) 1,18-1,20 (м, 6H) 1,20-1,27 (м, 1H) 1,24 (д, J=6,42 Гц, 3H) 1,39 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,51-1,58 (м, 1H) 1,63-1,67 (м, 1H) 1,72-1,75 (м, 2H) 1,85-1,94 (м, 2H) 1,96-2,05 (м, 2H) 2,06 (д, J=15,13 Гц, 1H) 2,11-2,19 (м, 1H) 2,22-2,29 (м, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,36-2,62 (м, 8H) 2,83 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,88-2,97 (м, 2H) 2,93 (с, 3H) 3,04 (с, 3H) 3,08-3,20 (м, 4H) 3,28 (с, 3H) 3,43-3,49 (м, 2H) 3,63 (с, 1H) 3,66-3,76 (м, 3H) 3,87-3,93 (м, 1H) 4,06-4,11 (м, 1H) 4,41 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,89 (дд, J=10,77, 2,06 Гц, 1H) 4,98 (д, J=4,58 Гц, 1H)
39			1061,8	(500 МГц): 0,07-0,11 (м, 2H) 0,47-0,51 (м, 2H) 0,84 (т, J=7,27 Гц, 3H) 0,87-0,91 (м, 1H) 0,99-1,06 (м, 6H) 1,10 (д, J=7,68 Гц, 3H) 1,13 (д, J=6,86 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,18-1,21 (м, 6H) 1,22-1,27 (м, 1H) 1,24 (д, J=6,03 Гц, 3H) 1,39 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,49-1,56 (м, 1H) 1,62-1,68 (м, 1H) 1,72-1,76 (м, 2H) 1,85-1,94 (м, 2H) 1,95-2,05 (м, 2H) 2,06-2,12 (м, 1H) 2,13-2,26 (м, 2H) 2,29 (с, 6H) 2,31-2,69 (м, 10H) 2,35 (с, 3H) 2,81-2,87 (м, 1H) 2,88-2,92 (м, 1H) 2,92-2,96 (м, 3H) 3,03 (с, 3H) 3,06-3,21 (м, 4H) 3,28 (с, 3H) 3,44-3,49 (м, 1H) 3,63 (с, 1H) 3,66-3,77 (м, 3H) 3,86-3,94 (м, 1H) 4,10 (кв, J=6,03 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,13 Гц, 1H) 4,85-4,91 (м, 1H) 4,94-5,00 (м, 1H)

40			1063,8	(500 МГц): 0,84 (т, J=7,27 Гц, 3H) 0,90 (т, J=7,27 Гц, 3H) 0,98-1,04 (м, 6H) 1,10 (д, J=7,40 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,13 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,17-1,20 (м, 6H) 1,19-1,25 (м, 1H) 1,24 (д, J=6,03 Гц, 3H) 1,25-1,34 (м, 2H) 1,39 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,41-1,46 (м, 2H) 1,47-1,55 (м, 1H) 1,63-1,68 (м, 1H) 1,71-1,78 (м, 2H) 1,85-2,06 (м, 4H) 2,08 (д, J=14,81 Гц, 1H) 2,12-2,20 (м, 1H) 2,21-2,27 (м, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,36-2,64 (м, 10H) 2,83 (д, J=14,81 Гц, 1H) 2,88-2,93 (м, 1H) 2,92-2,95 (м, 3H) 3,03 (с, 3H) 3,07-3,21 (м, 4H) 3,28 (с, 3H) 3,42-3,50 (м, 1H) 3,63 (с, 1H) 3,66-3,76 (м, 3H) 3,86-3,94 (м, 1H) 4,09 (кв, J=6,22 Гц, 1H) 4,39-4,42 (м, 1H) 4,86-4,91 (м, 1H) 4,98 (д, J=4,39 Гц, 1H)
41			1015,6	(600 МГц): 0,83 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,01 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,07-1,10 (м, 6H) 1,12 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,15 (с, 3H) 1,17-1,22 (м, 6H) 1,22-1,24 (м, 3H) 1,23-1,28 (м, 1H) 1,38 (с, 3H) 1,39 (с, 3H) 1,40-1,44 (м, 1H) 1,48-1,57 (м, 1H) 1,62-1,70 (м, 2H) 1,72-1,80 (м, 3H) 1,87-2,00 (м, 6H) 2,01-2,05 (м, 1H) 2,07-2,18 (м, 3H) 2,12 (с, 3H) 2,29 (с, 6H) 2,31-2,35 (м, 1H) 2,36 (с, 3H) 2,41-2,46 (м, 1H) 2,50-2,65 (м, 5H) 2,84-2,93 (м, 3H) 3,05 (с, 3H) 3,06-3,11 (м, 1H) 3,12-3,17 (м, 1H) 3,19 (д, J=7,34 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,39-3,43 (м, 1H) 3,44-3,49 (м, 1H) 3,64-3,73 (м, 5H) 4,10 (кв, J=6,42 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,96 (дд, J=11,00, 2,29 Гц, 1H) 4,99 (д, J=4,58 Гц, 1H)
42			985,7	(600 МГц): 0,07-0,11 (м, 2H) 0,45-0,52 (м, 2H) 0,82-0,91 (м, 4H) 1,00-1,27 (м, 28H) 1,40 (с, 6H) 1,52-1,58 (м, 1H) 1,63-1,67 (м, 1H) 1,70-1,79 (м, 2H) 1,87-2,04 (м, 4H) 2,10 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,31-2,68 (м, 12H) 2,84 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,89-2,97 (м, 1H) 3,08 (с, 3H) 3,08-3,13 (м, 1H) 3,16-3,22 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,44-3,50 (м, 1H) 3,67-3,86 (м, 5H) 4,09 (кв, J=6,11 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,98 (д, J=4,13 Гц, 1H) 5,04 (дд, J=11,00, 2,29 Гц, 1H)
43			1050	(400 МГц): 0,86 (т, J=7,32 Гц, 3H) 1,01 (д, J=7,32 Гц, 3H) 1,02 (т, J=7,32 Гц, 6H) 1,09 (д, J=7,57 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,08 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,17-1,26 (м, 1H) 1,19 (д, J=6,10 Гц, 3H) 1,21 (д, J=5,62 Гц, 3H) 1,24 (д, J=5,86 Гц, 3H) 1,38 (с, 3H) 1,41 (с, 3H) 1,48-1,94 (м, 7H) 1,95-2,14 (м, 3H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,38-2,64 (м, 10H) 2,80-2,92 (м, 2H) 2,87 (с, 3H) 2,98 (с, 3H) 3,06 (с, 3H) 3,06-3,11 (м, 1H) 3,19 (дд, J=10,25, 7,32 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,34-3,56 (м, 4H) 3,63 (с, 1H) 3,66-3,78 (м, 3H) 3,86-3,96 (м, 1H) 4,10 (кв, J=6,35 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,08 Гц, 1H) 4,93 (д, J=9,52 Гц, 1H) 4,99 (д, J=3,91 Гц, 1H)

Таблиця 1-8

Приклад	R ^{29a}	R ²	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
44			1014	(400 МГц): 0,88 (т, J=7,1 Гц, 3H) 1,00 (д, J=6,6 Гц, 3H) 1,02 (д, J=6,8 Гц, 3H) 1,08-1,14 (м, 7H) 1,15-1,22 (м, 6H) 1,22-1,27 (м, 3H) 1,29-1,37 (м, 4H) 1,39 (с, 3H) 1,50-1,85 (м, 2H) 1,97-2,20 (м, 2H) 2,29 (с, 6H) 2,35 (д, J=14,1 Гц, 1H) 2,40-2,70 (м, 5H) 2,83-2,95 (м, 3H) 2,99-3,05 (м, 1H) 3,13-3,24 (м, 3H) 3,27-3,43 (м, 8H) 3,47-3,62 (м, 1H) 3,67-3,73 (м, 1H) 3,83 (с, 3H) 3,89-3,93 (м, 1H) 4,15 (кв, J=6,9 Гц, 1H) 4,19-4,31 (м, 1H) 4,45-4,11 (м, 1H) 4,60-4,65 (м, 1H) 4,90-4,991 (м, 1H) 4,99-5,05 (м, 1H) 6,83-6,89 (м, 1H) 6,90-6,96 (м, 1H) 7,18-7,26 (м, 2H)
45			986	(400 МГц): 0,87 (т, J=7,0 Гц, 3H) 0,93-1,00 (м, 9H) 1,01 (д, J=6,8 Гц, 3H) 1,06 (д, J=6,4 Гц, 3H) 1,10 (д, J=7,5 Гц, 3H) 1,15 (д, J=5,9 Гц, 3H) 1,24 (д, J=7,1 Гц, 3H) 1,30 (д, J=6,9 Гц, 3H) 1,37 (с, 3H) 1,51-1,70 (м, 2H) 1,92-2,05 (м, 2H) 2,08-2,23 (м, 2H) 2,29 (с, 6H) 2,40-2,62 (м, 1H) 2,77-2,93 (м, 2H) 2,99-3,23 (м, 3H) 3,27 (с, 3H) 3,34 (с, 3H) 3,37-3,474 (м, 1H) 3,56-3,62 (м, 1H) 3,65-3,70 (м, 1H) 3,81 (с, 3H) 3,90 (д, J=6,1 Гц, 1H) 4,14 (кв, J=6,2 Гц, 1H) 4,39-4,51 (м, 2H) 4,63 (т, J=4,4 Гц, 1H) 4,92-5,03 (м, 2H) 6,79-6,86 (м, 1H) 6,87-6,94 (м, 1H) 7,16-7,22 (м, 1H) 7,33-7,36 (м, 1H)
46			1030	(400 МГц): 0,84 (т, J=7,32 Гц, 3H) 1,01 (д, J=7,32 Гц, 3H) 1,02 (т, J=7,08 Гц, 6H) 1,10 (д, J=7,57 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,08 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,17-1,26 (м, 1H) 1,19 (д, J=6,10 Гц, 3H) 1,21 (д, J=6,59 Гц, 3H) 1,24 (д, J=5,89 Гц, 3H) 1,38 (с, 3H) 1,41 (с, 3H) 1,46-1,78 (м, 5H) 1,82-1,96 (м, 2H) 1,96-2,13 (м, 3H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,39-2,63 (м, 10H) 2,84 (д, J=14,89 Гц, 1H) 2,84-3,11 (м, 6H) 3,06 (с, 3H) 3,19 (дд, J=10,01, 7,32 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,40-3,82 (м, 9H) 3,68 (с, 3H) 4,10 (кв, J=5,86 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,08 Гц, 1H) 4,92 (д, J=10,50 Гц, 1H) 5,00 (д, J=3,91 Гц, 1H)

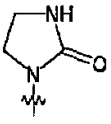
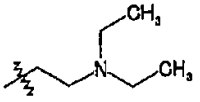
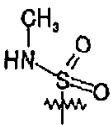
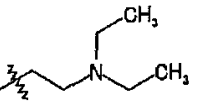
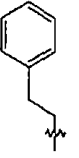
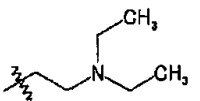
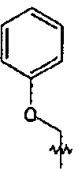
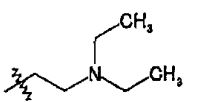
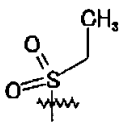
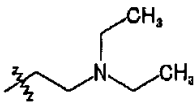
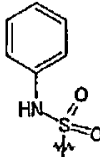
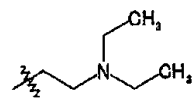
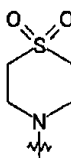
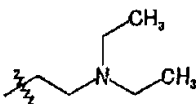
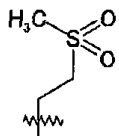
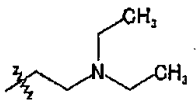
47			1027	(400 МГц): 0,84 (т, J=7,32 Гц, 3H) 1,01 (д, J=7,08 Гц, 3H) 1,02 (т, J=7,32 Гц, 6H) 1,08 (д, J=7,32 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,08 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,18 (д, J=6,59 Гц, 3H) 1,20 (д, J=7,57 Гц, 3H) 1,23 (д, J=6,10 Гц, 3H) 1,38 (с, 3H) 1,39 (с, 3H) 1,44-1,68 (м, 2H) 1,74 (д, J=6,84 Гц, 2H) 1,84-1,96 (м, 2H) 1,96-2,06 (м, 2H) 2,09 (д, J=14,9 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,39-2,65 (м, 10H) 2,83 (д, J=14,9 Гц, 1H) 2,84-2,92 (м, 1H) 3,06 (с, 3H) 3,10 (кв, J=6,84 Гц, 1H) 3,18 (дд, J=10,3, 7,32 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,37-3,65 (м, 8H) 3,68 (с, 3H) 3,69-3,77 (м, 3H) 3,78-3,87 (м, 1H) 4,08 (кв, J=6,35 Гц, 1H) 4,15 (ушир. с, 1H) 4,42 (д, J=7,32 Гц, 1H) 4,98 (д, J=4,15 Гц, 1H) 5,07 (дд, J=10,6, 1,57 Гц, 1H)
48			1036,7	(400 МГц): 0,85 (т, J=7,3 Гц, 3H) 0,99-1,05 (м, 9H) 1,07-1,27 (м, 19H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,46-1,79 (м, 4H) 1,81-1,93 (м, 2H) 1,94-2,05 (м, 2H) 2,06-2,13 (м, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,39-2,64 (м, 9H) 2,80-2,86 (м, 4H) 2,86-2,94 (м, 1H) 3,04 (с, 3H) 3,09 (кв, J=6,8 Гц, 1H) 3,18 (дд, J=10,3, 7,3 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,37-3,55 (м, 4H) 3,65-3,75 (м, 3H) 3,96-4,05 (м, 1H) 4,09 (кв, J=6,3 Гц, 1H) 4,20 (дт, J=14,9, 5,8 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,3 Гц, 1H) 4,96-5,02 (м, 2H) 5,21 (дд, J=11,0, 2,0, 1H)
49			1047,7	(400 МГц): 0,82 (т, J=7,3 Гц, 3H) 0,99-1,05 (м, 9H) 1,07-1,26 (м, 19H) 1,39 (с, 3H) 1,39 (с, 3H) 1,46-1,57 (м, 1H) 1,58-1,78 (м, 7H) 1,86-2,14 (м, 5H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,41-2,68 (м, 12H) 2,82-2,91 (м, 2H) 3,01 (с, 3H) 3,08 (кв, J=6,9 Гц, 1H) 3,19 (дд, J=10,3, 7,3 Гц, 1H) 3,29 (с, 3H) 3,40-3,53 (м, 2H) 3,60-3,71 (м, 4H) 3,74 (д, J=9,5 Гц, 1H) 4,10 (кв, J=6,2 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,1 Гц, 1H) 4,96-5,04 (м, 2H) 7,13-7,28 (м, 5H)

Таблица 1-9

При-клад	R ^{29a}	R ²	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
50			1049,7	(400 МГц): 0,92 (т, J=7,4 Гц, 3H) 1,03 (д, J=6,6 Гц, 3H) 1,06 (д, J=6,8 Гц, 3H) 1,08(д, J=7,1 Гц, 3H) 1,13 (с, 3H) 1,15-1,28 (м, 11H) 1,39 (с, 3H) 1,42 (с, 3H) 1,50-1,88 (м, 10H) 1,85 (дд, J=15,0, 5,0 Гц, 1H) 2,03 (д, J=13,2 Гц, 1H) 2,06 (д, J=14,6 Гц, 1H) 2,18 (с, 3H) 2,20-2,34 (м, 10H) 2,38-2,55 (м, 4H) 2,58-2,73 (м, 3H) 2,80 (д, J=14,4 Гц, 1H) 3,19 (дд, J=10,0, 7,4 Гц, 1H) 3,30 (с, 3H) 3,40-3,52 (м, 1H) 3,61 (д, J=10,3 Гц, 1H) 3,81 (с, 3H) 3,91 (д, J=9,8 Гц, 1H) 4,08 (с, 1H) 4,11 (кв, J=6,3 Гц, 1H) 4,33 (д, J=7,3 Гц, 1H) 4,91 (дд, J=9,9, 3,1 Гц, 1H) 5,21 (с, 1H) 5,35 (д, J=4,9 Гц, 1H) 6,84-6,93 (м, 2H) 7,14-7,23 (м, 1H) 7,60 (д, J=7,3 Гц, 1H)

51			1035	(400 МГц): 0,83 (т, J=7,3 Гц, 3H) 1,01 (т, J=7,1 Гц, 6H) 1,02 (д, J=7,3 Гц, 3H) 1,03 (д, J=7,3 Гц, 3H) 1,09 (д, J=7,6 Гц, 3H) 1,12 (д, J=7,1 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,1 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,17 (д, J=6,6 Гц, 3H) 1,20 (д, J=7,3 Гц, 3H) 1,23 (д, J=6,1 Гц, 3H) 1,48-1,56 (м, 1H), 1,61-1,68 (м, 2H) 1,71-1,76 (м, 3H) 1,81-1,90 (м, 3H) 1,97-2,04 (м, 3H) 2,08 (д, J=14,9 Гц, 1H) 2,28 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,38-2,63 (м, 9H) 2,82 (д, J=14,9 Гц, 1H) 2,86-2,94 (м, 1H) 3,06 (с, 3H) 3,07-3,13 (м, 2H) 3,18 (дд, J=10,3, 7,3 Гц, 1H) 3,27 (с, 3H) 3,36-3,54 (м, 4H) 3,62 (с, 1H) 3,67-3,74 (м, 2H) 3,98-4,15 (м, 3H) 4,41 (д, J=7,3 Гц, 1H) 4,94 (дд, J=10,7, 2,0 Гц, 1H) 4,97-5,00 (м, 1H)
52			1098,7	(400 МГц): 0,82 (т, J=7,3 Гц, 3H) 0,98-1,07 (м, 9H) 1,09-1,27 (м, 19H) 1,40 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,45-1,80 (м, 2H) 1,85-2,23 (м, 7H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,38-2,66 (м, 10H) 2,83 (д, J=14,6 Гц, 1H) 2,85-2,95 (м, 1H) 3,03-3,13 (м, 4H) 3,19 (дд, J=10,1, 7,2 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,41-3,53 (м, 2H) 3,68-3,88 (м, 5H) 4,03 (т, J=6,1 Гц, 2H) 4,09 (кв, J=6,3 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,3 Гц, 1H) 4,95-5,01 (м, 2H) 6,87-6,94 (м, 3H) 7,21-7,30 (м, 2H)
53			1076	(400 МГц): 0,85 (т, J=7,32 Гц, 3H) 1,01 (д, J=7,32 Гц, 3H) 1,02 (т, J=7,08 Гц, 6H) 1,08 (д, J=7,57 Гц, 3H) 1,14 (д, J=7,08 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,19 (д, J=6,35 Гц, 3H) 1,21 (д, J=6,35 Гц, 3H) 1,24 (д, J=6,10 Гц, 3H) 1,39 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,45-1,70 (м, 3H) 1,72-1,77 (м, 1H) 1,84-1,98 (м, 2H) 1,98-2,03 (м, 1H) 2,08 (д, J=14,6 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,37-2,63 (м, 10H) 2,80-2,90 (м, 4H) 2,90-3,14 (м, 10H) 3,18 (дд, J=10,3, 7,08 Гц, 1H) 3,20-3,28 (м, 2H) 3,28 (с, 3H) 3,40-3,51 (м, 2H) 3,56 (с, 3H) 3,66 (д, J=7,57 Гц, 1H) 3,72 (д, J=9,28 Гц, 3H) 3,84-3,91 (м, 2H) 4,10 (кв, J=6,35 Гц, 1H) 4,98 (д, J=3,91 Гц, 1H) 5,16 (дд, J=10,6, 1,57 Гц, 1H)
54			1049	(400 МГц): 0,83 (т, J=7,32 Гц, 3H) 1,01 (т, J=6,84 Гц, 6H) 1,03 (д, J=6,84 Гц, 3H) 1,09 (д, J=7,57 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,08 Гц, 3H) 1,17 (с, 3H) 1,20 (д, J=6,35 Гц, 6H) 1,24 (д, J=6,10 Гц, 3H) 1,39 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,46-1,60 (м, 2H) 1,62-1,70 (м, 1H) 1,71-1,82 (м, 4H) 1,83-1,97 (м, 4H) 1,97-2,03 (м, 1H) 2,10 (д, J=14,9 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,48-2,64 (м, 9H) 2,83 (д, J=14,9 Гц, 1H) 2,90 (с, 3H) 3,03 (с, 3H) 3,06-3,13 (м, 3H) 3,18 (дд, J=10,5, 7,32 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,40-3,51 (м, 2H) 3,58-3,80 (м, 5H) 4,10 (кв, J=6,35 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,08 Гц, 1H) 4,92 (дд, J=5,68, 2,26 Гц, 1H) 4,99 (д, J=3,42 Гц, 1H)

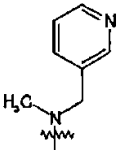
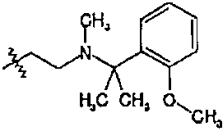
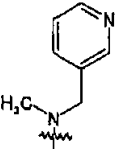
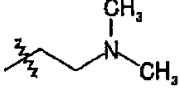
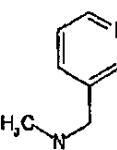

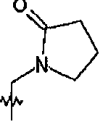
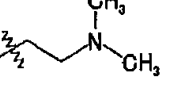
55			1169,8	(600 МГц): 0,75 (т, J=7,43 Гц, 3H) 1,04 (д, J=6,61 Гц, 3H) 1,09 (д, J=7,43 Гц, 3H) 1,11-1,27 (м, 16H) 1,37-1,40 (м, 6H) 1,44 (ушир. с, 6H) 1,48-1,79 (м, 4H) 1,86-2,07 (м, 5H) 2,18 (с, 6H) 2,22-2,63 (м, 16H) 2,77-2,93 (м, 3H) 3,03 (с, 3H) 3,08-3,14 (м, 1H) 3,15-3,23 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,40-3,49 (м, 2H) 3,62-3,69 (м, 2H) 3,71-3,84 (м, 5H) 3,84-3,98 (м, 2H) 4,05-4,13 (м, 1H) 4,41 (д, J=7,43 Гц, 1H) 4,99 (д, J=4,95 Гц, 1H) 5,06-5,13 (м, 1H) 6,84-6,94 (м, 2H) 7,14-7,24 (м, 2H) 7,58-7,63 (м, 1H) 7,72 (д, J=7,84 Гц, 1H) 8,44-8,52 (м, 2H)
----	---	---	--------	--

Таблица 1-10

При- клад	R ^{29a}	R ²	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
56			1035,7	(600 МГц): 0,75 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,03 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,09 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,14 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,17 (с, 3H) 1,18-1,26 (м, 10H) 1,39 (с, 6H) 1,48-1,56 (м, 1H) 1,62-1,79 (м, 3H) 1,87-1,98 (м, 3H) 2,00-2,04 (м, 1H) 2,14 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,18 (с, 3H) 2,24 (с, 6H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,35-2,66 (м, 7H) 2,79-2,92 (м, 3H) 3,03 (с, 3H) 3,08-3,13 (м, 1H) 3,16-3,21 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,43-3,50 (м, 2H) 3,64 (с, 1H) 3,68 (д, J=7,34 Гц, 1H) 3,72-3,74 (м, 1H) 3,75-3,79 (м, 1H) 3,84-3,98 (м, 2H) 4,09-4,14 (м, 1H) 4,41 (д, J=6,88 Гц, 1H) 4,96-5,00 (м, 1H) 5,08-5,12 (м, 1H) 7,20-7,23 (м, 1H) 7,69-7,74 (м, 1H) 8,44-8,47 (м, 1H) 8,49 (с, 1H)
57			978,6	(600 МГц): 0,75 (т, J=7,43 Гц, 3H) 1,03 (д, J=6,61 Гц, 3H) 1,09 (д, J=7,43 Гц, 3H) 1,12 (с, 3H) 1,14 (д, J=7,02 Гц, 3H) 1,16-1,26 (м, 10H) 1,40 (с, 6H) 1,46-1,80 (м, 4H) 1,87-2,00 (м, 4H) 2,03-2,08 (м, 1H) 2,18 (с, 3H) 2,29 (с, 6H) 2,37 (с, 6H) 2,40-2,48 (м, 1H) 2,49-2,64 (м, 2H) 2,73 (д, J=14,45 Гц, 1H) 2,83-2,92 (м, 2H) 3,03 (с, 3H) 3,08-3,14 (м, 1H) 3,19 (дд, J=10,11, 7,22 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,39-3,49 (м, 3H) 3,63-3,68 (м, 2H) 3,72-3,80 (м, 2H) 3,85-3,97 (м, 2H) 4,09-4,14 (м, 1H) 4,40 (д, J=7,43 Гц, 1H) 4,99 (д, J=5,37 Гц, 1H) 5,10 (дд, J=10,94, 2,27 Гц, 1H) 7,21 (дд, J=7,84, 4,54 Гц, 1H) 7,70-7,73 (м, 1H) 8,46 (дд, J=4,54, 1,65 Гц, 1H) 8,49 (д, J=1,65 Гц, 1H)
58			1012,9	(600 МГц): 0,84 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,99 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,09 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,12 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,18 (с, 3H) 1,19-1,26 (м, 10H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,47-1,75 (м, 4H) 1,82-2,07 (м, 8H) 2,15 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,25 (с, 6H) 2,29 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,31-2,66 (м, 8H) 2,82 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,85-2,92 (м, 1H) 3,03 (с, 3H) 3,08 (д, J=7,34 Гц, 1H) 3,19 (дд, J=10,09, 7,34 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,30-3,51 (м, 5H) 3,57-3,64 (м, 2H) 3,66-3,73 (м, 3H) 4,09-4,15 (м, 1H) 4,42 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,94-5,00 (м, 2H)

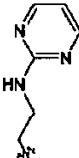
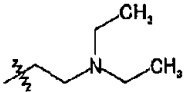
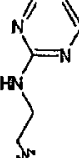
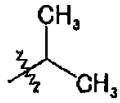
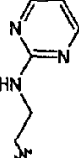
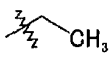
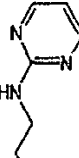
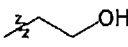
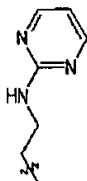
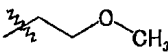
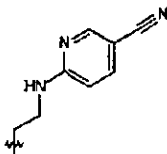
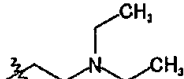
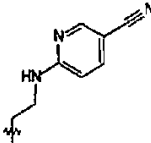
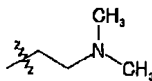
59			1064,8	(500 МГц): 0,83 (т, J=7,40 Гц, 3H) 0,98-1,06 (м, 9H) 1,10 (д, J=7,40 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,13 Гц, 3H) 1,15-1,27 (м, 13H) 1,39 (с, 3H) 1,39 (с, 3H) 1,47-1,80 (м, 8H) 1,86-2,12 (м, 5H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,40-2,65 (м, 10H) 2,81-2,93 (м, 2H) 3,01 (с, 3H) 3,06-3,12 (м, 1H) 3,15-3,22 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,40-3,52 (м, 3H) 3,60-3,74 (м, 5H) 4,09 (кв, J=6,12 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,40 Гц, 1H) 4,94-5,04 (м, 2H) 5,39-5,46 (м, 1H) 6,46 (т, J=4,80 Гц, 1H) 8,25 (д, J=4,66 Гц, 2H)
60			1007,7	(500 МГц): 0,83 (т, J=7,28 Гц, 3H) 0,98-1,17 (м, 21H) 1,20-1,29 (м, 7H) 1,39 (с, 6H) 1,48-1,79 (м, 9H) 1,88-2,00 (м, 3H) 2,04-2,10 (м, 1H) 2,21 (с, 3H) 2,32 (с, 6H) 2,44-2,52 (тн, 1H) 2,56-2,65 (м, 1H) 2,85-2,95 (м, 2H) 3,02 (с, 3H) 3,06-3,13 (м, 1H) 3,20 (дд, J=9,94, 7,26 Гц, 1H) 3,29 (с, 3H) 3,42-3,51 (м, 3H) 3,60-3,75 (м, 6H) 4,08-4,14 (м, 1H) 4,43 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,96-5,03 (м, 2H) 5,44-5,50 (м, 1H) 6,46 (т, J=4,78 Гц, 1H) 8,25 (д, J=4,59 Гц, 2H)
61			993,7	(500 МГц): 0,83 (т, J=7,27 Гц, 3H) 1,01 (д, J=6,86 Гц, 3H) 1,03-1,17 (м, 15H) 1,18-1,30 (м, 7H) 1,39 (с, 6H) 1,47-1,79 (м, 8H) 1,88-2,09 (м, 5H) 2,31 (ушир. с, 6H) 2,33 (с, 3H) 2,41-2,66 (м, 4H) 2,76-2,94 (м, 2H) 3,02 (с, 3H) 3,09 (кв, J=7,04 Гц, 1H) 3,17-3,23 (м, 1H) 3,29 (с, 3H) 3,41-3,51 (м, 3H) 3,60-3,75 (м, 5H) 4,10 (кв, J=6,31 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,13 Гц, 1H) 4,94-5,05 (м, 2H) 5,42-5,49 (м, 1H) 6,46 (т, J=4,80 Гц, 1H) 8,25 (д, J=4,66 Гц, 2H)
62			1009,7	(600 МГц): 0,83 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,01 (д, J=6,86 Гц, 3H) 1,10 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,18-1,20 (м, 6H) 1,21-1,25 (м, 7H) 1,39 (с, 3H) 1,39 (с, 3H) 1,48-1,78 (м, 8H) 1,87-1,97 (м, 3H) 2,04-2,09 (м, 1H) 2,14-2,19 (м, 1H) 2,30 (ушир. с, 6H) 2,38 (с, 3H) 2,41-2,49 (м, 1H) 2,57-2,79 (м, 3H) 2,86-2,93 (м, 2H) 3,01 (с, 3H) 3,06-3,12 (м, 1H) 3,16-3,23 (м, 1H) 3,29 (с, 3H) 3,39-3,50 (м, 4H) 3,65 (с, 7H) 4,12-4,18 (м, 1H) 4,38-4,43 (м, 1H) 4,96-5,01 (м, 2H) 5,41-5,45 (м, 1H) 6,46 (с, 1H) 8,24 (д, J=4,59 Гц, 2H)

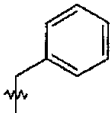
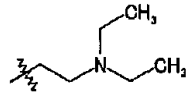
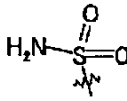
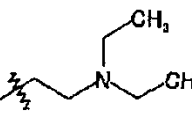
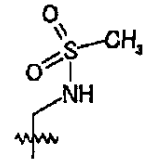
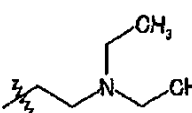
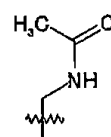
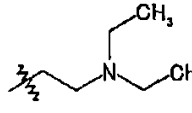
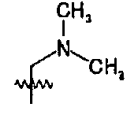
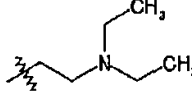
Таблица 1-11

При- клад	R ^{29a}	R ²	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
63			1023,7	(600 МГц): 0,83 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,01 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,10 (д, J=7,79 Гц, 3H) 1,13 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,15 (с, 3H) 1,16-1,26 (м, 10H) 1,39 (с, 3H) 1,39 (с, 3H) 1,47-1,78 (м, 8H) 1,87-1,94 (м, 2H) 1,95-2,00 (м, 1H) 2,04 (с, 1H) 2,09-2,14 (м, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,38 (с, 3H) 2,40-2,47 (м, 1H) 2,57-2,70 (м, 2H) 2,76-2,82 (м, 1H) 2,85-2,92 (м, 2H) 3,01 (с, 3H) 3,07-3,12 (м, 1H) 3,16-3,22 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,35 (с, 3H) 3,40-3,51 (м, 6H) 3,61-3,71 (м, 4H) 3,71-3,74 (м, 1H) 4,08-4,14 (м, 1H) 4,41 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,96-4,99 (м, 1H) 5,00-5,02 (м, 1H) 5,40-5,45 (м, 1H) 6,46 (т, J=4,81 Гц 1H) 8,25 (д, J=4,59 Гц, 2H)
64			1088,8	(600 МГц): 0,81 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,97-1,05 (м, 9H) 1,11 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,14(д, J=6,88 Гц, 3H) 1,16-1,19 (м, 6H) 1,20-1,26 (м, 7H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,51-1,59 (м, 1H) 1,61-1,80 (м, 7H) 1,88-1,95 (м, 2H) 1,98-2,06 (м, 2H) 2,10 (с, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,40-2,46 (м, 1H) 2,42-2,63 (м, 8H) 2,57-2,61 (м, 1H) 2,84 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,90-2,95 (м, 1H) 2,97 (с, 3H) 3,07-3,13 (м, 1H) 3,16-3,20 (м, 1H) 3,29 (с, 3H) 3,42-3,50 (м, 3H) 3,63 (с, 1H) 3,65-3,70 (м, 1H) 3,69 (д, J=6,88 Гц, 1H) 3,73 (д, J=9,63 Гц, 1H) 3,76-3,82 (м, 1H) 4,06-4,12 (м, 1H) 4,42 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,94-4,97 (м, 1H) 5,00 (д, J=4,58 Гц, 1H) 5,66-5,72 (м, 1H) 6,44 (д, J=8,71 Гц, 1H) 7,52-7,57 (м, 1H) 8,34 (д, J=2,29 Гц, 1H)
65			1060,8	(600 МГц): 0,82 (т, J=7,57 Гц, 3H) 1,01 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,11 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,14 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,17-1,20 (м, 6H) 1,21-1,26 (м, 7H) 1,37 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,51-1,58 (м, 1H) 1,63-1,79 (м, 7H) 1,87-1,96 (м, 2H) 1,97-2,07 (м, 2H) 2,14 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,25 (с, 6H) 2,29 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,36-2,65 (м, 4H) 2,42-2,47 (м, 1H) 2,57-2,62 (м, 1H) 2,82 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,90-2,96 (м, 1H) 2,96 (с, 3H) 3,08-3,13 (м, 1H) 3,18 (дд, J=10,09, 7,34 Гц, 1H) 3,29 (с, 3H) 3,38-3,51 (м, 3H) 3,63 (с, 1H) 3,65-3,69 (м, 1H) 3,69 (д, J=7,34 Гц, 1H) 3,73 (д, J=9,63 Гц, 1H) 3,76-3,82 (м, 1H) 4,09-4,14 (м, 1H) 4,42 (д, J=6,88 Гц, 1H) 4,96 (дд, J=11,00, 2,29 Гц, 1H) 5,00 (д, J=4,58 Гц, 1H) 5,67-5,72 (м, 1H) 6,44 (д, J=9,17 Гц, 1H) 7,56 (дд, J=8,71, 1,83 Гц, 1H) 8,34 (д, J=2,29 Гц, 1H)

66			1003,6	(600 МГц): 0,82 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,01 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,09-1,17 (м, 12H) 1,19-1,27 (м, 7H) 1,37 (с, 3H) 1,39-1,42 (м, 1H) 1,40 (с, 3H) 1,50-1,80 (м, 7H) 1,88-2,02 (м, 4H) 2,07-2,11 (м, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,37 (с, 6H) 2,40-2,45 (м, 1H) 2,56-2,62 (м, 1H) 2,74 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,91-2,95 (м, 1H) 2,96 (с, 3H) 3,08-3,13 (м, 1H) 3,15-3,20 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,40-3,48 (м, 3H) 3,63 (с, 1H) 3,64-3,70 (м, 1H) 3,67 (д, J=7,34 Гц, 1H) 3,74 (с, 1H) 3,76-3,82 (м, 1H) 4,07-4,13 (м, 1H) 4,41 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,96 (дд, J=11,00, 2,29 Гц, 1H) 5,01 (д, J=5,04 Гц, 1H) 5,68-5,73 (м, 1H) 6,44 (д, J=8,71 Гц, 1H) 7,56 (дд, J=8,71, 2,29 Гц, 1H) 8,34 (д, J=1,83 Гц, 1H)
67			1083,8	(600 МГц): 0,85 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,99 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,02 (т, J=6,88 Гц, 6H) 1,08 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,11 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,18 (д, J=6,42 Гц, 3H) 1,20 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,22-1,25 (м, 1H) 1,23 (д, J=5,96 Гц, 3H) 1,38 (с, 3H) 1,38 (с, 3H) 1,47-1,54 (м, 1H) 1,55-1,74 (м, 5H) 1,70-1,74 (м, 2H) 1,87-1,93 (м, 2H) 1,93-1,99 (м, 1H) 2,01-2,05 (м, 1H) 2,09 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,39-2,62 (м, 8H) 2,41-2,46 (м, 1H) 2,57-2,60 (м, 1H) 2,83 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,88 (дд, J=9,63, 7,34 Гц, 1H) 2,96 (с, 3H) 3,00 (с, 3H) 3,06 (кв, J=6,72 Гц, 1H) 3,18 (дд, J=10,32, 7,11 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,43-3,50 (м, 1H) 3,52-3,72 (м, 4H) 3,61 (с, 1H) 3,67 (д, J=7,34 Гц, 1H) 3,71 (д, J=9,17 Гц, 1H) 3,79-3,92 (м, 2H) 4,07-4,11 (м, 1H) 4,42 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,91-4,95 (м, 1H) 4,96 (д, J=4,58 Гц, 1H)

Таблица 1-12

При-клад	R ^{29a}	R ²	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
68			1050,7	(400 МГц): 0,84 (т, J=7,3 Гц, 3H) 1,01-1,04 (м, 9H) 1,07-1,25 (м, 19H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,49-1,77 (м, 5H) 1,84-1,94 (м, 2H) 2,09 (д, J=14,9 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,40-2,61 (м, 9H) 2,83 (д, J=14,9 Гц, 1H) 2,87-2,92 (м, 1H) 2,93 (с, 6H) 3,04-3,09 (м, 4H) 3,18 (дд, J=10,1, 7,2 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,34-3,49 (м, 4H) 3,62 (с, 1H) 3,69 (д, J=7,2 Гц, 1H) 3,72 (д, J=10,0 Гц, 1H) 4,13-3,98 (м, 3H) 4,42 (д, J=7,3 Гц, 1H) 4,91-4,95 (м, 1H) 4,99 (д, J=3,7 Гц, 1H)

69			1033	(400 МГц): 0,82 (т, J=7,32 Гц, 3H) 1,02 (т, J=6,84 Гц, 6H) 1,04 (д, J=7,08 Гц, 3H) 1,09 (д, J=7,57 Гц, 3H) 1,12 (д, J=7,08 Гц, 3H) 1,17 (с, 3H) 1,19 (д, J=6,10 Гц, 3H) 1,20 (д, J=8,79 Гц, 3H) 1,24 (д, J=5,86 Гц, 3H) 1,38 (с, 3H) 1,38 (с, 3H) 1,45-1,60 (м, 1H) 1,62-1,69 (м, 1H) 1,73 (д, J=6,84 Гц, 2H) 1,85-2,07 (м, 5H) 2,10 (д, J=14,9 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,39-2,74 (м, 11H) 2,84 (д, J=14,9 Гц, 1H) 2,85-2,91 (м, 1H) 2,92 (с, 3H) 3,07 (кв, J=6,84 Гц, 1H) 3,19 (дд, J=10,0, 7,32 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,37-3,51 (м, 2H) 3,60-3,75 (м, 4H) 4,10 (кв, J=6,35 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,08 Гц, 1H) 4,96-5,03 (м, 2H) 7,14-7,34 (м, 5H)
70			1022,7	(400 МГц): 0,85 (т, J=7,3 Гц, 3H) 0,99-1,27 (м, 28H) 1,39 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,46-1,79 (м, 4H) 1,81-2,06 (м, 4H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,39-2,65 (м, 9H) 2,83 (д, J=14,9 Гц, 1H) 2,87-2,94 (м, 1H) 3,04 (с, 3H) 3,07-3,14 (м, 1H) 3,18 (дд, J=10,1, 7,4 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,38-3,52 (м, 3H) 3,53-3,63 (м, 1H) 3,66-3,75 (м, 3H) 4,05-4,34 (м, 2H) 4,42 (д, J=7,3 Гц, 1H) 4,99 (д, J=3,7 Гц, 1H) 5,08-5,15 (м, 2H) 5,29 (д, J=10,7 Гц, 1H)
71			1050,7	(500 МГц): 0,84 (т, J=7,26 Гц, 3H) 0,99-1,06 (м, 9H) 1,10 (д, J=7,64 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,26 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,17-1,27 (м, 10H) 1,39 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,50-1,77 (м, 4H) 1,85-2,05 (м, 6H) 2,09 (д, J=14,91 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,40-2,67 (м, 10H) 2,80-3,05 (м, 8H) 3,07-3,21 (м, 3H) 3,24-3,33 (м, 5H) 3,42-3,51 (м, 1H) 3,61-3,73 (м, 3H) 3,83-3,91 (м, 1H) 4,07-4,12 (м, 1H) 4,41 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,90 (дд, J=10,89, 2,10 Гц, 1H) 4,98 (д, J=4,20 Гц, 1H) 5,15-5,21 (м, 1H)
72			1014,7	(600 МГц): 0,81-0,86 (м, 3H) 0,99-1,05 (м, 9H) 1,08-1,11 (м, 3H) 1,12-1,15 (м, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,19 (д, J=6,42 Гц, 10H) 1,39 (с, 6H) 1,49-1,58 (м, 5H) 1,63-2,04 (м, 10H) 2,07-2,12 (м, 1H) 2,29 (з 6H) 2,34 (с, 3H) 2,38-2,64 (м, 10H) 2,81-2,93 (м, 2H) 3,02 (с, 3H) 3,08-3,21 (м, 2H) 3,28 (с, 3H) 3,44-3,51 (м, 1H) 3,59-3,66 (м, 2H) 3,68-3,72 (м, 2H) 3,74-3,79 (м, 1H) 4,06-4,12 (м, 1H) 4,42 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,91-4,95 (м, 1H) 4,97-5,00 (м, 1H) 6,44-6,49 (м, 1H)
73			1000,7	(600 МГц): 0,83 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,98-1,06 (м, 9H) 1,09 (д, J=7,79 Гц, 3H) 1,12 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,18-1,26 (м, 10H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,49-2,05 (м, 12H) 2,08-2,12 (м, 1H) 2,23 (ушир. с, 6H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,39-2,63 (м, 10H) 2,80-2,91 (м, 2H) 3,04 (с, 3H) 3,05-3,11 (м, 1H) 3,15-3,21 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,43-3,50 (м, 1H) 3,60-3,66 (м, 3H) 3,68 (д, J=7,34 Гц, 1H) 3,72 (д, J=9,17 Гц, 1H) 4,07-4,13 (м, 1H) 4,42 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,95-5,02 (м, 2H)

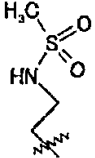
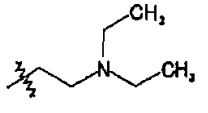
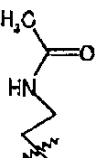
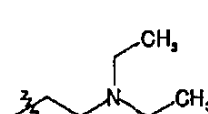
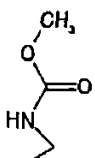
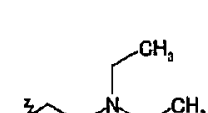
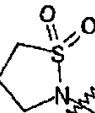
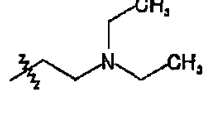
74			1064,7	(600 МГц): 0,84 (т, J=7,43 Гц, 3H) 0,99-1,05 (м, 9H) 1,10 (д, J=7,43 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,02 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,17-1,26 (м, 10H) 1,39 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,50-1,58 (м, 1H) 1,62-1,76 (м, 7H) 1,86-2,05 (м, 4H) 2,09 (д, J=14,86 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,40-2,66 (м, 11H) 2,83 (д, J=14,86 Гц, 1H) 2,87-2,94 (м, 1H) 2,95 (с, 3H) 3,07 (с, 3H) 3,08-3,25 (м, 4H) 3,28 (с, 3H) 3,43-3,50 (м, 1H) 3,55-3,63 (м, 1H) 3,63 (с, 1H) 3,67-3,74 (м, 3H) 4,09 (кв, J=6,47 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,43 Гц, 1H) 4,70 (с, 1H) 4,94 (дд, J=10,94, 1,86 Гц, 1H) 4,98 (д, J=4,54 Гц, 1H)
----	---	---	--------	---

Таблица 1-13

При- клад	R ^{29a}	R ²	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
75			1028,6	(600 МГц): 0,81-0,87 (м, 3H) 0,99-1,06 (м, 6H) 1,09-1,26 (м, 22H) 1,39 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,48-2,04 (м, 15H) 2,07-2,12 (м, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,40-2,63 (м, 9H) 2,83 (д, J=15,59 Гц, 1H) 2,90-2,96 (м, 1H) 3,03 (с, 3H) 3,08-3,12 (м, 1H) 3,15-3,21 (м, 1H) 3,24-3,37 (м, 5H) 3,41-3,51 (м, 2H) 3,58-3,65 (м, 2H) 3,67-3,77 (м, 3H) 4,06-4,11 (м, 1H) 4,41-4,44 (м, 1H) 4,93-4,99 (м, 2H) 6,27-6,31 (м, 1H)
76			1044,7	(600 МГц): 0,80-0,87 (м, 3H) 0,98-1,28 (м, 28H) 1,39 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,48-2,12 (м, 9H) 2,25-2,64 (м, 20H) 2,81-2,95 (м, 2H) 3,03 (с, 3H) 3,07-3,12 (м, 1H) 3,16-3,35 (м, 7H) 3,44-3,76 (м, 11H) 4,07-4,12 (м, 1H) 4,40-4,44 (м, 1H) 4,93-5,00 (м, 2H) 5,35-5,41 (м, 1H)
77			1062,8	(500 МГц): 0,85 (т, J=7,45 Гц, 3H) 0,99-1,07 (м, 9H) 1,09 (д, J=7,26 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,26 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,17-1,27 (м, 10H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,47-1,56 (м, 1H) 1,63-1,68 (м, 1H) 1,74 (д, J=6,50 Гц, 2H) 1,85-2,05 (м, 4H) 2,09 (д, J=14,91 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,31-2,38 (м, 5H) 2,40-2,64 (м, 10H) 2,81-2,92 (м, 2H) 3,05 (с, 3H) 3,07-3,55 (м, 9H) 3,28 (с, 3H) 3,65 (с, 1H) 3,66-3,77 (м, 3H) 3,82-3,91 (м, 1H) 4,09 (кв, J=6,50 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,99 (д, J=4,20 Гц, 1H) 5,12 (дд, J=11,08, 2,29 Гц, 1H)

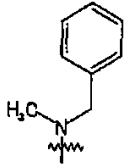
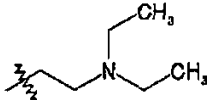
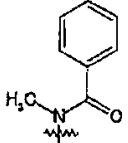
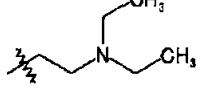
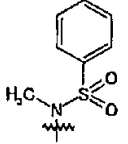
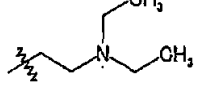
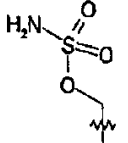
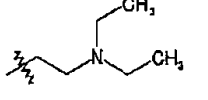
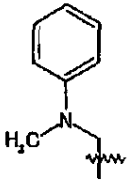
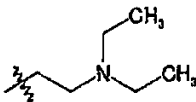
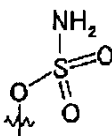
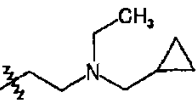
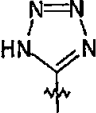
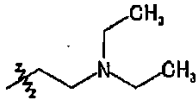
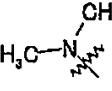
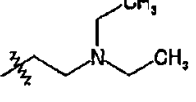
78			1062,7	(600 МГц): 0,76 (т, J=7,43 Гц, 3H) 0,99-1,05 (м, 9H) 1,09 (д, J=7,43 Гц, 3H) 1,14 (д, J=7,02 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,16-1,26 (м, 10H) 1,39 (с, 6H) 1,48-1,56 (м, 1H) 1,63-1,68 (м, 1H) 1,70-1,79 (м, 2H) 1,86-2,04 (м, 4H) 2,09 (д, J=14,86 Гц, 1H) 2,19 (с, 3H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,38-2,64 (м, 11H) 2,80-2,89 (м, 3H) 3,02 (с, 3H) 3,07-3,13 (м, 1H) 3,16-3,22 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,37-3,53 (м, 3H) 3,64-3,76 (м, 4H) 3,82-3,95 (м, 2H) 4,07-4,13 (м, 1H) 4,41 (д, J=7,43 Гц, 1H) 4,98 (д, J=4,95 Гц, 1H) 5,08-5,14 (м, 1H) 7,17-7,23 (м, 1H) 7,24-7,29 (м, 2H) 7,30-7,34 (м, 2H)
79			1076,7	(600 МГц): 0,74-0,83 (м, 3H) 0,89-1,26 (м, 28H) 1,28-1,40 (м, 6H) 1,42-2,03 (м, 8H) 2,08 (д, J=14,86 Гц, 1H) 2,27 (с, 6H) 2,33 (ушир.с, 3H) 2,36-2,65 (м, 10H) 2,77-2,92 (м, 5H) 2,99-3,21 (м, 5H) 3,26 (с, 3H) 3,37-4,00 (м, 8H) 4,05-4,11 (м, 1H) 4,36-4,44 (м, 1H) 4,69-4,75 (м, 1H) 4,94-4,99 (м, 1H) 5,06-5,13 (м, 1H) 7,31-7,49 (м, 5H)
80			1112,7	(600 МГц): 0,80 (т, J=7,22 Гц, 3H) 0,95 (д, J=7,02 Гц, 3H) 0,96-1,01 (м, 6H) 1,05 (д, J=7,84 Гц, 3H) 1,08 (д, J=7,02 Гц, 3H) 1,13 (с, 3H) 1,14-1,21 (м, 10H) 1,33 (с, 3H) 1,34 (с, 3H) 1,44-1,51 (м, 1H) 1,59-1,63 (м, 1H) 1,66-1,71 (м, 2H) 1,79-1,87 (м, 2H) 1,92-2,02 (м, 2H) 2,06 (д, J=14,86 Гц, 1H) 2,25 (с, 6H) 2,31 (с, 3H) 2,36-2,60 (м, 10H) 2,80 (д, J=14,86 Гц, 1H) 2,83 (с, 3H) 2,83-2,87 (м, 1H) 2,90 (с, 3H) 3,00-3,05 (м, 1H) 3,12-3,20 (м, 2H) 3,24 (с, 3H) 3,33-3,46 (м, 3H) 3,56 (с, 1H) 3,62-3,70 (м, 3H) 3,78-3,86 (м, 1H) 4,03-4,08 (м, 1H) 4,38 (д, J=7,43 Гц, 1H) 4,87-4,93 (м, 1H) 4,95-5,00 (м, 1H) 7,42-7,49 (м, 2H) 7,51-7,57 (м, 1H) 7,81-7,87 (м, 2H)
81			1052,7	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,96-1,29 (м, 28H) 1,40 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,45-1,51 (м, 1H) 1,63-1,76 (м, 3H) 1,85-2,15 (м, 7H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,38-2,64 (м, 10H) 2,83 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,87-2,95 (м, 1H) 3,03 (с, 3H) 3,11 (кв, J=7,18 Гц, 1H) 3,18 (дд, J=10,32, 7,11 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,43 (ушир. с, 1H) 3,44-3,50 (м, 1H) 3,66 (с, 1H) 3,67-3,72 (м, 2H) 3,76 (ддд, J=14,67, 8,71, 5,96 Гц, 1H) 3,91 (дт, J=14,67, 5,50 Гц, 1H) 4,09 (кв, J=6,57 Гц, 1H) 4,27-4,34 (м, 1H) 4,34-4,44 (м, 2H) 4,93-5,02 (м, 2H) 5,26 (ушир. с, 2H)

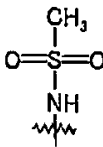
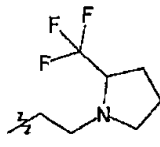
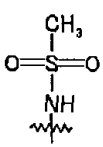
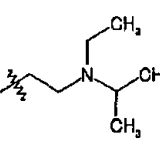
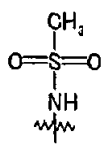
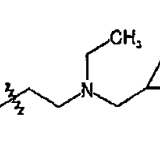
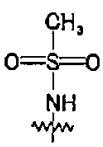
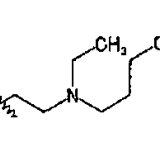
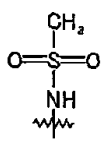
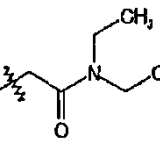
Таблица 1-14

При- клад	R ^{29a}	R ²	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
82			1062,8	(600 МГц): 0,82 (т, J=7,57 Гц, 3H) 0,98-1,05 (м, 9H) 1,08 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,12 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,15 (с, 3H) 1,16-1,25 (м, 10H) 1,35 (с, 3H) 1,38 (с, 3H) 1,45-1,75 (м, 4H) 1,86-2,04 (м, 6H) 2,07-2,12 (м, 1H) 2,29 (ушир. с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,37-2,63 (м, 10H) 2,80-2,89 (м, 2H) 2,91 (с, 3H) 2,93 (с, 3H) 3,05-3,11 (м, 1H) 3,16-3,21 (м, 1H) 3,27 (с, 3H) 3,36-3,48 (м, 3H) 3,63-3,73 (м, 5H) 4,06-4,12 (м, 1H) 4,38-4,42 (м, 1H) 4,95-4,99 (м, 2H) 6,62-6,67 (м, 1H) 6,71-6,75 (м, 2H) 7,18-7,22 (м, 2H)
83			1064,8	(600 МГц): 0,06-0,12 (м, 2H) 0,44-0,53 (м, 2H) 0,82-0,91 (м, 4H) 1,00-1,04 (м, 6H) 1,09 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,14 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,17-1,25 (м, 10H) 1,39 (с, 3H) 1,42 (с, 3H) 1,48-1,68 (м, 2H) 1,73-1,78 (м, 2H) 1,87-2,11 (м, 5H) 2,29 (с, 6H) 2,35 (с, 6H) 2,47-2,69 (м, 7H) 2,82-2,93 (м, 2H) 3,03 (с, 3H) 3,09-3,13 (м, 1H) 3,16-3,20 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,44-3,50 (м, 1H) 3,64-3,72 (м, 3H) 3,90-3,95 (м, 1H) 4,04-4,14 (м, 2H) 4,21-4,25 (м, 1H) 4,41 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,59-4,66 (м, 1H) 4,94 (д, J=4,58 Гц, 1H) 5,20 (дд, J=10,55, 2,75 Гц, 1H) 5,46 (ушир. с, 2H)
84			1011,8	(600 МГц, DMSO-d ₆): 0,80-0,85 (м, 3H) 0,89-0,93 (м, 3H) 0,95-1,01 (м, 6H) 1,03 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,07-1,13 (м, 9H) 1,13-1,18 (м, 7H) 1,28 (с, 3H) 1,41 (с, 3H) 1,52-1,88 (м, 7H) 1,95-2,00 (м, 1H) 2,05-2,10 (м, 1H) 2,25 (с, 6H) 2,27 (с, 3H) 2,38-2,42 (м, 1H) 2,44-2,57 (м, 9H) 2,74 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,81-2,91 (м, 2H) 2,96 (с, 3H) 3,02-3,12 (м, 2H) 3,13-3,18 (м, 2H) 3,20-3,24 (м, 3H) 3,38-3,45 (м, 1H) 3,55-3,71 (м, 4H) 4,03-4,12 (м, 2H) 4,29 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,81 (д, J=5,04 Гц, 1H) 4,93-4,98 (м, 1H)
85			986,7	(600 МГц): 0,83 (т, J=7,57 Гц, 3H) 0,99-1,05 (м, 9H) 1,09 (д, J=7,79 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,17-1,26 (м, 10H) 1,38 (с, 3H) 1,39 (с, 3H) 1,45-1,52 (м, 1H) 1,62-1,67 (м, 1H) 1,72-1,76 (м, 2H) 1,87-2,05 (м, 4H) 2,07-2,11 (м, 1H) 2,29 (с, 12H) 2,34 (с, 3H) 2,32-2,70 (м, 12H) 2,80-2,91 (м, 2H) 3,05 (с, 3H) 3,06-3,11 (м, 1H) 3,16-3,21 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,39-3,50 (м, 2H) 3,61 (с, 1H) 3,68 (д, J=7,34 Гц, 1H) 3,73-3,80 (м, 3H) 4,08-4,13 (м, 1H) 4,41 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,98-5,01 (м, 1H) 5,07-5,12 (м, 1H)

86			1008,8	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,02 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,11 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,18 (с, 3H) 1,19-1,26 (м, 10H) 1,40 (с, 6H) 1,51-1,76 (м, 4H) 1,82-2,04 (м, 4H) 2,15 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,24 (с, 6H) 2,29 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,31-2,47 (м, 3H) 2,49-2,66 (м, 3H) 2,82 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,90-2,96 (м, 1H) 2,98 (с, 3H) 3,05 (с, 3H) 3,12 (д, J=6,88 Гц, 1H) 3,18 (дд, J=10,55, 7,34 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,29-3,35 (м, 1H) 3,42-3,57 (м, 3H) 3,59 (с, 1H) 3,68 (д, J=9,63 Гц, 1H) 3,72 (д, J=7,34 Гц, 1H) 3,77-3,83 (м, 1H) 3,87 (дд, J=10,09, 4,13 Гц, 1H) 4,11 (д, J=6,42 Гц, 1H) 4,42 (д, J=6,88 Гц, 1H) 4,93-4,99 (м, 2H) 5,54 (т, J=5,73 Гц, 1H)
87			1037,7	(500 МГц): 0,85 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,00-1,04 (м, 9H) 1,09-1,14 (м, 6H) 1,14-1,17 (м, 3H) 1,17-1,26 (м, 10H) 1,38-1,41 (м, 6H) 1,52-1,68 (м, 2H) 1,74 (д, J=6,42 Гц, 2H) 1,83-2,04 (м, 4H) 2,09 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,40-2,62 (м, 10H) 2,83 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,91-2,96 (м, 1H) 2,98 (с, 3H) 3,05 (с, 3H) 3,12 (м, 1H) 3,12-3,13 (м, 1H) 3,18 (дд, J=10,09, 7,34 Гц, 1H) 3,27 (с, 3H) 3,29-3,35 (м, 1H) 3,46-3,50 (м, 1H) 3,51-3,57 (м, 1H) 3,59 (с, 1H) 3,67-3,73 (м, 2H) 3,78-3,83 (м, 1H) 3,85-3,92 (м, 1H) 4,09 (кв, J=6,11 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,93-5,00 (м, 2H) 5,54 (т, J=5,73 Гц, 1H)

Таблица 1-15

При-клад	R ^{29a}	R ²	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
88			1048,6	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,02 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,05-1,16 (м, 12H) 1,17-1,27 (м, 10H) 1,40 (с, 6H) 1,53-2,19 (м, 16H) 2,29 (с, 6H) 2,31-2,38 (м, 4H) 2,40-2,46 (м, 1H) 2,56-2,67 (м, 3H) 2,84-2,96 (м, 3H) 2,99 (с, 3H) 3,05 (с, 3H) 3,09-3,20 (м, 3H) 3,27 (с, 3H) 3,30-3,35 (м, 1H) 3,43-3,50 (м, 1H) 3,51-3,57 (м, 1H) 3,59 (с, 1H) 3,68 (д, J=9,63 Гц, 1H) 3,72 (д, J=7,34 Гц, 1H) 3,77-3,82 (м, 1H) 3,84-3,91 (м, 1H) 4,09 (кв, J=6,40 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,93-5,01 (м, 2H) 5,52-5,56 (м, 1H)
89			1084,7	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,43 Гц, 3H) 0,99-1,26 (м, 22H) 1,40 (с, 6H) 1,52-1,62 (м, 1H) 1,66-1,71 (м, 1H) 1,74 (д, J=6,61 Гц, 2H) 1,82-2,12 (м, 5H) 2,29 (с, 6H) 2,34-2,46 (м, 6H) 2,55-2,63 (м, 1H) 2,70 (ушир. с, 2H) 2,87-2,96 (м, 2H) 2,98 (с, 3H) 3,05 (с, 3H) 3,09-3,21 (м, 6H) 3,26-3,35 (м, 6H) 3,40-3,46 (м, 1H) 3,49-3,54 (м, 1H) 3,58 (с, 1H) 3,66-3,72 (м, 2H) 3,78-3,91 (м, 2H) 4,11 (кв, J=6,19 Гц, 1H) 4,40 (д, J=7,02 Гц, 1H) 4,71 (ушир. с, 1H) 4,94-5,00 (м, 2H)

90			1102,7	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,27 Гц, 3H) 1,02 (д, J=7,13 Гц, 3H) 1,08-1,15 (м, 9H) 1,16-1,28 (м, 10H) 1,36-1,43 (м, 6H) 1,52-2,10 (м, 13H) 2,25-2,39 (м, 10H) 2,41-2,77 (м, 5H) 2,81-2,96 (м, 2H) 2,98 (с, 3H) 3,00-3,15 (м, 6H) 3,16-3,22 (м, 1H) 3,24-3,37 (м, 5H) 3,41-3,49 (м, 1H) 3,50-3,57 (м, 1H) 3,58 (с, 1H) 3,67-3,73 (м, 2H) 3,77-3,83 (м, 1H) 3,84-3,92 (м, 1H) 4,07-4,13 (м, 1H) 4,39-4,43 (м, 1H) 4,93-5,01 (м, 2H) 5,52-5,57 (м, 1H)
91			1050,7	(600 МГц): 0,85 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,96 (д, J=6,42 Гц, 3H) 0,98-1,06 (м, 9H) 1,09-1,14 (м, 6H) 1,16 (с, 3H) 1,17-1,26 (м, 10H) 1,39-1,41 (м, 6H) 1,52-1,67 (м, 2H) 1,74 (д, J=6,42 Гц, 2H) 1,82-2,08 (м, 5H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,35-2,62 (м, 8H) 2,84 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,90-2,97 (м, 1H) 2,98 (с, 3H) 3,06 (с, 3H) 3,09-3,14 (м, 1H) 3,18 (дд, J=10,09, 7,34 Гц, 1H) 3,27 (с, 3H) 3,29-3,35 (м, 1H) 3,45-3,49 (м, 1H) 3,51-3,56 (м, 1H) 3,59 (с, 1H) 3,68-3,72 (м, 2H) 3,77-3,82 (м, 1H) 3,84-3,91 (м, 1H) 4,08 (кв, J=6,42 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,93-5,02 (м, 2H) 5,53 (т, J=5,73 Гц, 1H)
92			1062,8	(500 МГц): 0,10 (д, J=4,20 Гц, 2H) 0,45-0,53 (м, 2H) 0,86 (т, J=7,26 Гц, 4H) 0,98-1,27 (м, 25H) 1,40 (с, 6H) 1,51-2,12 (м, 9H) 2,29 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,38-2,70 (м, 9H) 2,84 (д, J=14,91 Гц, 1H) 2,93 (ушир. с, 1H) 2,98 (с, 3H) 3,05 (с, 3H) 3,09-3,22 (м, 2H) 3,28 (с, 3H) 3,29-3,36 (м, 1H) 3,47 (д, J=3,06 Гц, 3H) 3,59 (с, 1H) 3,66-3,74 (м, 2H) 3,77-3,92 (м, 2H) 4,10 (д, J=6,50 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,92-5,01 (м, 2H) 5,54 (ушир. с, 1H)
93			1064,8	(600 МГц): 0,85 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,90 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,98-1,04 (м, 6H) 1,08-1,33 (м, 21H) 1,37-1,46 (м, 8H) 1,52-1,76 (м, 4H) 1,83-2,10 (м, 5H) 2,29 (с, 6H) 2,32-2,36 (м, 3H) 2,37-2,63 (м, 10H) 2,83 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,90-2,97 (м, 1H) 2,98 (с, 3H) 3,06 (с, 3H) 3,09-3,21 (м, 2H) 3,25-3,36 (м, 4H) 3,43-3,57 (м, 3H) 3,59 (с, 1H) 3,67-3,73 (м, 2H) 3,77-3,91 (м, 2H) 4,06-4,11 (м, 1H) 4,41 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,94-5,01 (м, 2H) 5,52-5,55 (м, 1H)
94			1050,6	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,27 Гц, 3H) 1,02 (д, J=6,86 Гц, 3H) 1,09-1,24 (м, 25H) 1,39 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,51-2,09 (м, 9H) 2,26-2,31 (м, 6H) 2,35 (д, J=15,63 Гц, 1H) 2,40-2,48 (м, 1H) 2,51-2,62 (м, 4H) 2,91-2,96 (м, 1H) 2,98 (с, 3H) 3,06 (с, 3H) 3,09-3,40 (м, 11H) 3,42-3,48 (м, 2H) 3,49-3,57 (м, 1H) 3,59 (с, 1H) 3,67-3,73 (м, 2H) 3,77-3,92 (м, 2H) 4,12 (кв, J=6,31 Гц, 1H) 4,40 (д, J=7,13 Гц, 1H) 4,93-5,02 (м, 2H) 5,54 (т, J=5,90 Гц, 1H)

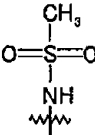
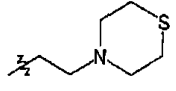
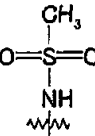
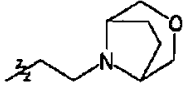
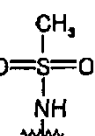
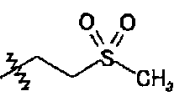
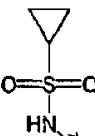
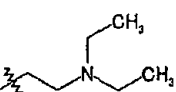
Таблиця 1-16

При- клад	R ^{29a}	R ²	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
95			1023,6	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,02 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,08-1,27 (м, 25H) 1,39-1,42 (м, 6H) 1,49-2,06 (м, 8H) 2,08-2,12 (м, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,38 (с, 3H) 2,40-2,45 (м, 1H) 2,50-2,78 (м, 3H) 2,87-2,96 (м, 2H) 2,98 (с, 3H) 3,06 (с, 3H) 3,10-3,14 (м, 1H) 3,15-3,20 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,30-3,36 (м, 1H) 3,42-3,60 (м, 6H) 3,68-3,72 (м, 2H) 3,78-3,91 (м, 2H) 4,07-4,13 (м, 1H) 4,38-4,43 (м, 1H) 4,93-5,01 (м, 2H) 5,50-5,55 (м, 1H)
96			1100,6	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,22 Гц, 3H) 1,02 (д, J=7,02 Гц, 3H) 1,09-1,27 (м, 25H) 1,40 (с, 6H) 1,52-1,62 (м, 2H) 1,66-1,77 (м, 3H) 1,83-1,99 (м, 3H) 2,03-2,13 (м, 2H) 2,29 (с, 6H) 2,36 (с, 3H) 2,40-2,46 (м, 1H) 2,56-2,63 (м, 1H) 2,87-3,20 (м, 14H) 3,24-3,35 (м, 8H) 3,39-3,46 (м, 1H) 3,50-3,56 (м, 1H) 3,59 (с, 1H) 3,66-3,72 (м, 2H) 3,78-3,91 (м, 2H) 4,12 (кв, J=6,20 Гц, 1H) 4,39 (д, J=7,02 Гц, 1H) 4,93-4,99 (м, 2H)
97			1048,6	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,02 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,09-1,17 (м, 12H) 1,18-1,27 (м, 7H) 1,40 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,49-1,62 (м, 2H) 1,71-1,75 (м, 2H) 1,85-1,98 (м, 3H) 2,01-2,09 (м, 4H) 2,29-2,46 (м, 11H) 2,56-2,77 (м, 3H) 2,85-2,89 (м, 1H) 2,92-2,95 (м, 1H) 2,98 (с, 3H) 3,05 (с, 3H) 3,11 (кв, J=6,42 Гц, 1H) 3,18-3,22 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,31-3,56 (м, 8H) 3,58 (с, 1H) 3,66-3,72 (м, 2H) 3,76-3,91 (м, 2H) 4,08-4,13 (м, 1H) 4,38-4,42 (м, 1H) 4,93-5,00 (м, 2H) 5,49-5,54 (м, 1H)
98			1077,6	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,02 Гц, 3H) 1,00-1,26 (м, 22H) 1,40 (с, 6H) 1,51-1,77 (м, 4H) 1,82-1,96 (м, 3H) 2,01-2,09 (м, 2H) 2,29 (с, 6H) 2,38-2,45 (м, 4H) 2,55-2,63 (м, 1H) 2,72-3,01 (м, 10H) 3,04 (з 3H) 3,09-3,20 (м, 2H) 3,26 (с, 3H) 3,28-3,34 (м, 1H) 3,37-3,44 (м, 1H) 3,50-3,56 (м, 1H) 3,56-3,73 (м, 6H) 3,78-3,93 (м, 4H) 4,04-4,10 (м, 1H) 4,37 (д, J=7,43 Гц, 1H) 4,93-4,99 (м, 2H)
99			1050,6	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,34 Гц, 1H) 1,01-1,04 (м, 3H) 1,09-1,15 (м, 9H) 1,16-1,18 (м, 3H) 1,19-1,26 (м, 7H) 1,40 (с, 6H) 1,47-1,60 (м, 1H) 1,66-2,13 (м, 8H) 2,29 (с, 6H) 2,38-2,45 (м, 4H) 2,56-2,62 (м, 1H) 2,70-2,76 (м, 1H) 2,88-2,96 (м, 2H) 2,98 (с, 3H) 3,05 (с, 3H) 3,09-3,14 (м, 1H) 3,16-3,20 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,29-3,48 (м, 5H) 3,51-3,72 (м, 6H) 3,77-3,91 (м, 2H) 4,10-4,16 (м, 1H) 4,31-4,41 (м, 3H) 4,93-5,00 (м, 2H) 5,49-5,54 (м, 1H)

100			1063,6	(600 МГц): 0,85 (т, J=7,34 Гц, 1H) 1,02 (д, J=6,88 Гц, 1H) 1,07-1,15 (м, 12H) 1,17-1,26 (м, 7H) 1,40 (с, 6H) 1,49-1,60 (м, 1H) 1,64-1,78 (м, 3H) 1,81-1,96 (м, 3H) 2,01-2,09 (м, 2H) 2,29 (с, fih) 2,44 (с, 4H) 2,56-2,63 (м, 1H) 2,78-2,96 (м, 4H) 2,98 (с, 3H) 3,04 (с, 3H) 3,08-3,14 (м, 1H) 3,16-3,21 (м, 1H) 3,26 (с, 3H) 3,28-3,45 (м, 2H) 3,51-3,73 (м, 6H) 3,77-3,91 (м, 2H) 3,93-4,02 (м, 2H) 4,04-4,11 (м, 1H) 4,34-4,38 (м, 1H) 4,41-4,46 (м, 1H) 4,93-4,97 (м, 2H) 5,49-5,54 (м, 1H)
101			1098,6	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,02 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,10 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,12-1,15 (м, 6H) 1,17 (д, J=5,96 Гц, 3H) 1,19-1,26 (м, 7H) 1,38-1,42 (м, 6H) 1,57 (д, J=3,67 Гц, 1H) 1,64-1,67 (м, 1H) 1,72-1,76 (м, 2H) 1,84-2,06 (м, 4H) 2,10 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,36 (с, 3H) 2,40-2,63 (м, 5H) 2,86 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,90-2,96 (м, 1H) 2,99 (с, 3H) 3,00-3,14 (м, 9H) 3,06 (с, 3H) 3,16-3,21 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,30-3,36 (м, 1H) 3,41-3,48 (м, 1H) 3,51-3,56 (м, 1H) 3,59 (с, 1H) 3,67-3,71 (м, 2H) 3,78-3,83 (м, 1H) 3,85-3,90 (м, 1H) 4,07-4,12 (м, 1H) 4,40 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,94-4,98 (м, 2H) 5,53 (т, J=5,73 Гц, 1H)

Таблица 1-17

При-клад	R ^{29a}	R ²	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
102			1050,6	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,02 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,11 (д, J=7,79 Гц, 3H) 1,13 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,17 (с, 3H) 1,19 (д, J=6,42 Гц, 3H) 1,20-1,25 (м, 7H) 1,39-1,41 (м, 6H) 1,53-1,59 (м, 1H) 1,63-1,67 (м, 1H) 1,72-1,75 (м, 2H) 1,84-1,95 (м, 2H) 1,97-2,05 (м, 2H) 2,13 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,37-2,49 (м, 7H) 2,52-2,64 (м, 3H) 2,82 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,90-2,96 (м, 1H) 2,98 (с, 3H) 3,05 (с, 3H) 3,09-3,14 (м, 1H) 3,18 (дд, J=10,09, 7,34 Гц 1H) 3,28 (с, 3H) 3,29-3,36 (м, 1H) 3,44-3,50 (м, 1H) 3,51-3,56 (м, 1H) 3,59 (с, 1H) 3,66-3,74 (м, 6H) 3,77-3,83 (м, 1H) 3,85-3,90 (м, 1H) 4,10 (кв, J=6,27 Гц, 1H) 4,42 (д, J=6,88 Гц, 1H) 4,93-4,99 (м, 2H) 5,54 (т, J=5,73 Гц, 1H)

103			1066,6	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,22 Гц, 3H) 1,02 (д, J=6,61 Гц, 3H) 1,11 (д, J=7,84 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,02 Гц, 3H) 1,17 (с, 3H) 1,18 (д, J=6,19 Гц, 3H) 1,20-1,26 (м, 7H) 1,39-1,42 (м, 6H) 1,53-1,60 (м, 1H) 1,66 (д, J=11,56 Гц, 1H) 1,72-1,76 (м, 2H) 1,83-1,95 (м, 2H) 1,97-2,04 (м, 2H) 2,10 (д, J=14,86 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,38-2,47 (м, 3H) 2,48-2,53 (м, 1H) 2,56-2,62 (м, 2H) 2,65-2,76 (м, 8H) 2,82 (д, J=14,86 Гц, 1H) 2,91-2,96 (м, 1H) 2,98 (с, 3H) 3,06 (с, 3H) 3,09-3,14 (м, 1H) 3,16-3,21 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,29-3,35 (м, 1H) 3,44-3,49 (м, 1H) 3,51-3,56 (м, 1H) 3,59 (с, 1H) 3,69 (д, J=9,50 Гц, 1H) 3,72 (д, J=7,43 Гц, 1H) 3,77-3,83 (м, 1H) 3,84-3,92 (м, 1H) 4,09 (кв, J=6,19 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,43 Гц, 1H) 4,93-5,01 (м, 2H) 5,54 (т, J=5,57 Гц, 1H)
104			1076,6	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,22 Гц, 3H) 1,02 (д, J=7,02 Гц, 3H) 1,11 (д, J=7,43 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,43 Гц, 3H) 1,18 (с, 3H) 1,19-1,27 (м, 7H) 1,24 (д, J=6,19 Гц, 3H) 1,38-1,43 (м, 6H) 1,54-1,60 (м, 1H) 1,63-1,68 (м, 1H) 1,72-1,75 (м, 2H) 1,85-1,94 (м, 6H) 1,99-2,02 (м, 2H) 2,11 (д, J=14,45 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,32-2,36 (м, 2H) 2,34-2,35 (м, 3H) 2,41-2,62 (м, 4H) 2,86 (д, J=14,45 Гц, 1H) 2,92-2,95 (м, 1H) 2,97-3,01 (м, 2H) 2,98 (с, 3H) 3,06 (с, 3H) 3,09-3,14 (м, 1H) 3,16-3,20 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,31-3,35 (м, 1H) 3,44-3,50 (м, 3H) 3,51-3,56 (м, 1H) 3,59 (с, 1H) 3,68-3,77 (м, 4H) 3,78-3,83 (м, 1H) 3,85-3,91 (м, 1H) 4,07-4,12 (м, 1H) 4,42 (д, J=7,43 Гц, 1H) 4,94-5,00 (м, 2H) 5,50-5,56 (м, 1H)
105			1043,5	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,00-1,27 (м, 22H) 1,40 (с, 6H) 1,52-1,76 (м, 4H) 1,85-1,99 (м, 3H) 2,03-2,12 (м, 2H) 2,29 (с, 6H) 2,36 (с, 3H) 2,40-2,45 (м, 1H) 2,50-2,62 (м, 2H) 2,87-2,96 (м, 2H) 2,98 (с, 3H) 3,04-3,14 (м, 5H) 3,15-3,20 (м, 1H) 3,26-3,35 (м, 7H) 3,39-3,48 (м, 2H) 3,51-3,57 (м, 1H) 3,59 (с, 1H) 3,66-3,72 (м, 2H) 3,77-3,91 (м, 2H) 4,10-4,15 (м, 2H) 4,39 (д, J=6,88 Гц, 1H) 4,93-4,99 (м, 2H) 5,50-5,53 (м, 1H)
106			1062,8	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,90-0,96 (м, 1H) 0,97-1,05 (м, 10H) 1,09-1,26 (м, 21H) 1,40 (с, 6H) 1,52-2,04 (м, 9H) 2,09 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,39-2,63 (м, 10H) 2,80-2,85 (м, 1H) 2,90-2,97 (м, 1H) 3,06 (с, 3H) 3,10-3,21 (м, 2H) 3,25-3,35 (м, 4H) 3,44-3,50 (м, 1H) 3,52-3,61 (м, 2H) 3,68 (д, J=10,09 Гц, 1H) 3,72 (д, J=7,34 Гц, 1H) 3,75-3,80 (м, 1H) 3,90-3,97 (м, 1H) 4,09 (кв, J=6,11 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,96-5,01 (м, 2H) 5,60 (т, J=6,19 Гц, 1H)

107			1050,7 (600 МГц): 0,85 (т, J=7,34 Гц, 2H) 1,00-1,05 (м, 9H) 1,11 (д, J=7,79 Гц, 3H) 1,13 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,18-1,27 (м, 10H) 1,35 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,50-1,68 (м, 2H) 1,72-1,76 (м, 2H) 1,83-2,04 (м, 4H) 2,07-2,12 (м, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,39-2,63 (м, 10H) 2,81-2,86 (м, 1H) 2,91-2,96 (м, 1H) 3,03-3,20 (м, 7H) 3,27 (с, 3H) 3,43-3,56 (м, 3H) 3,59 (с, 1H) 3,67-3,89 (м, 4H) 4,06-4,12 (м, 1H) 4,42 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,96-5,01 (м, 2H) 5,49 (т, J=5,73 Гц, 1H)
-----	--	--	---

Таблица 1-18

При- клад	R ^{29a}	R ²	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
108			1176,7	(600 МГц): 0,84 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,92 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,00-1,10 (м, 12H) 1,17 (с, 3H) 1,18-1,26 (м, 10H) 1,33 (с, 3H) 1,37 (с, 3H) 1,46-1,72 (м, 4H) 1,80-1,90 (м, 2H) 1,95-2,05 (м, 2H) 2,08-2,12 (м, 1H) 2,28 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,39-2,65 (м, 10H) 2,84 (д, J=15,13 Гц, 2H) 2,89 (с, 3H) 3,01-3,05 (м, 1H) 3,15-3,25 (м, 2H) 3,27 (с, 3H) 3,32-3,38 (м, 1H) 3,38-3,41 (м, 4H) 3,43-3,50 (м, 1H) 3,57 (с, 1H) 3,58-3,67 (м, 3H) 3,74-3,81 (м, 1H) 4,06-4,11 (м, 1H) 4,40 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,91-4,97 (м, 2H) 7,76-7,80 (м, 2H) 8,25-8,33 (м, 2H)
109			1123,7	(500 МГц): 0,84 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,93 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,00-1,28 (м, 25H) 1,37 (с, 6H) 1,50-2,12 (м, 9H) 2,28 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,39-2,64 (м, 10H) 2,80-2,97 (м, 5H) 3,03-3,08 (м, 1H) 3,15-3,29 (м, 5H) 3,37-3,52 (м, 3H) 3,62-3,77 (м, 4H) 4,06-4,11 (м, 1H) 4,40 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,82-4,85 (м, 1H) 4,97-5,00 (м, 1H) 6,24 (т, J=5,04 Гц, 1H) 7,62-7,66 (м, 1H) 7,80-7,83 (м, 1H) 8,10-8,13 (м, 1H) 8,17-8,19 (м, 1H)
110			1123,7	(500 МГц): 0,75-1,31 (м, 31H) 1,34-1,45 (м, 6H) 1,46-2,14 (м, 9H) 2,26-2,36 (м, 9H) 2,39-2,71 (м, 10H) 2,81-3,30 (м, 11H) 3,40-4,43 (м, 10H) 4,79-5,26 (м, 2H) 7,61-8,85 (м, 4H)
111			1123,7	(500 МГц): 0,82 (т, J=7,40 Гц, 3H) 0,93 (д, J=6,86 Гц, 3H) 1,00-1,27 (м, 25H) 1,36 (с, 3H) 1,37 (с, 3H) 1,50-2,14 (м, 9H) 2,28 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,39-2,64 (м, 10H) 2,78-2,97 (м, 5H) 3,02-3,09 (м, 1H) 3,13-3,24 (м, 2H) 3,28 (с, 3H) 3,34-3,52 (м, 3H) 3,64-3,80 (м, 4H) 4,09 (кв, J=6,22 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,13 Гц, 1H) 4,85 (дд, J=10,97, 1,92 Гц, 1H) 5,01 (д, J=3,29 Гц, 1H) 6,31-6,45 (м, 1H) 7,78-7,81 (м, 2H) 7,99-8,03 (м, 2H)

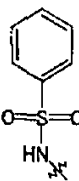
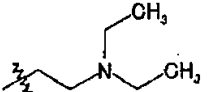
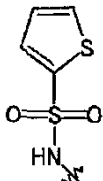
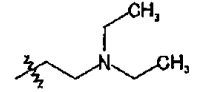
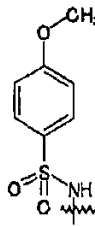
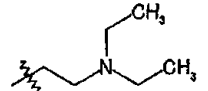
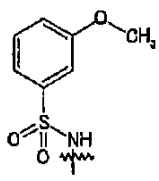
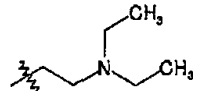
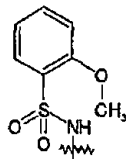
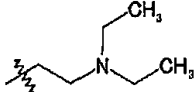
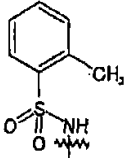
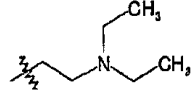
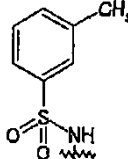
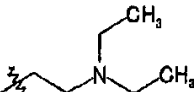
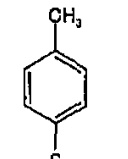
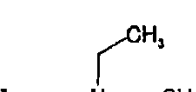
112			1098,7	(500 МГц): 0,83 (т, J=7,40 Гц, 3H) 0,93 (д, J=7,13 Гц, 3H) 1,00-1,11 (м, 12H) 1,14-1,26 (м, 13H) 1,34 (с, 3H) 1,36 (с, 3H) 1,47-2,12 (м, 9H) 2,28 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,38-2,64 (м, 10H) 2,77-2,81 (м, 3H) 2,84 (д, J=14,81 Гц, 1H) 2,88-2,96 (м, 1H) 3,02-3,09 (м, 1H) 3,12-3,20 (м, 2H) 3,28 (с, 3H) 3,30-3,37 (м, 1H) 3,42-3,52 (м, 2H) 3,59-3,71 (м, 3H) 3,72-3,81 (м, 1H) 4,08 (д, J=6,31 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,13 Гц, 1H) 4,89 (дд, J=10,83, 2,06 Гц, 1H) 5,00 (д, J=3,57 Гц, 1H) 6,03 (т, J=6,03 Гц, 1H) 7,43-7,55 (м, 3H) 7,85-7,95 (м, 2H)
113			1104,6	(500 МГц): 0,85 (т, J=7,27 Гц, 3H) 0,96 (д, J=6,86 Гц, 3H) 1,01-1,05 (м, 6H) 1,10 (т, J=7,13 Гц, 6H) 1,14-1,27 (м, 13H) 1,36 (с, 3H) 1,37-1,38 (м, 3H) 1,48-2,12 (м, 9H) 2,29 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,39-2,64 (м, 10H) 2,80-2,95 (м, 5H) 3,04-3,11 (м, 1H) 3,15-3,30 (м, 5H) 3,38-3,50 (м, 2H) 3,53 (с, 1H) 3,62-3,73 (м, 3H) 3,76-3,84 (м, 1H) 4,08 (кв, J=6,22 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,40 Гц, 1H) 4,90 (дд, J=10,97, 1,92 Гц, 1H) 4,99 (д, J=3,84 Гц, 1H) 6,22 (ушир. с, 1H) 7,05 (дд, J=4,94, 3,84 Гц, 1H) 7,53 (дд, J=4,94, 1,37 Гц, 1H) 7,62 (дд, J=3,84, 1,37 Гц, 1H)
114			1128,7	(600 МГц): 0,83 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,91-1,26 (м, 28H) 1,35 (с, 3H) 1,36 (с, 3H) 1,48-1,57 (м, 1H) 1,62-1,75 (м, 3H) 1,79-1,92 (м, 2H) 1,97-2,05 (м, 2H) 2,09 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,28 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,38-2,64 (м, 10H) 2,83 (д, J=10,09 Гц, 1H) 2,85 (с, 3H) 2,88-2,95 (м, 1H) 3,06 (кв, J=6,88 Гц, 1H) 3,10-3,20 (м, 2H) 3,25-3,34 (м, 1H) 3,27 (с, 3H) 3,40-3,46 (м, 1H) 3,58-3,73 (м, 4H) 3,76 (с, 1H) 3,86 (с, 3H) 4,08 (кв, J=6,42 Гц, 1H) 4,40 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,89 (дд, J=11,00, 2,29 Гц, 1H) 4,99 (д, J=3,67 Гц, 1H) 5,92 (т, J=5,96 Гц, 1H) 6,94 (д, J=8,71 Гц, 2H) 7,82 (д, J=8,71 Гц, 2H)

Таблица 1-19

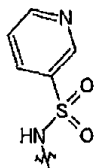
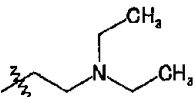
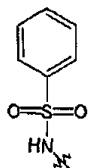
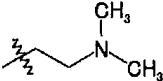
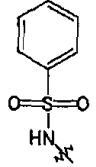
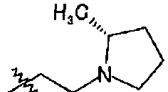
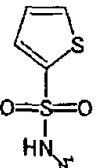
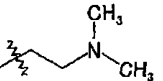
При-клад	R ^{29a}	R ²	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
115			1128,7	(600 МГц): 0,82 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,91 (д, J=6,88 Гц, 3H) 0,96-1,25 (м, 25H) 1,34 (с, 3H) 1,35 (с, 3H) 1,48-1,56 (м, 1H) 1,60-1,72 (м, 3H) 1,77-1,90 (м, 2H) 1,95-2,04 (м, 2H) 2,08 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,27 (с, 6H) 2,33 (с, 3H) 2,37-2,64 (м, 10H) 2,81 (с, 3H) 2,83-2,93 (м, 2H) 3,04 (кв, J=6,88 Гц, 1H) 3,12-3,19 (м, 2H) 3,26 (с, 3H) 3,30-3,36 (м, 1H) 3,40-3,51 (м, 3H) 3,59-3,70 (м, 3H) 3,71-3,78 (м, 1H) 3,84 (с, 3H) 4,06 (кв, J=6,27 Гц, 1H) 4,39 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,87 (дд, J=11,00, 2,29 Гц, 1H) 4,97 (д, J=4,13 Гц, 1H) 6,01 (т, J=5,96 Гц, 1H) 7,00-7,04 (м, 1H) 7,34-7,38 (м, 1H) 7,39-7,41 (м, 1H) 7,45 (д, J=7,79 Гц, 1H)

116			1128,7	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,91-1,28 (м, 28H) 1,36 (с, 3H) 1,37 (с, 3H) 1,50-1,57 (м, 1H) 1,65 (д, J=11,92 Гц, 1H) 1,71 (д, J=6,88 Гц, 2H) 1,82-2,05 (м, 4H) 2,10 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,39-2,66 (м, 10H) 2,84 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,87-2,97 (м, 1H) 2,94 (с, 3H) 3,06 (кв, J=6,88 Гц, 1H) 3,13-3,21 (м, 3H) 3,28 (с, 3H) 3,38-3,50 (м, 2H) 3,55 (с, 1H) 3,62-3,77 (м, 4H) 3,96 (с, 3H) 4,09 (кв, J=6,27 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,97 (д, J=5,04 Гц, 1H) 5,01 (дд, J=11,00, 1,83 Гц, 1H) 6,04 (т, J=5,96 Гц, 1H) 6,98 (д, J=8,25 Гц, 1H) 7,04 (т, J=7,57 Гц, 1H) 7,46-7,53 (м, 1H) 7,94 (дд, J=7,57, 1,60 Гц, 1H)
117			1112,7	(500 МГц): 0,85 (т, J=7,45 Гц, 3H) 0,94 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,03 (т, J=7,07 Гц, 6H) 1,09 (д, J=7,26 Гц, 6H) 1,15-1,28 (м, 13H) 1,36 (с, 3H) 1,36-1,38 (м, 3H) 1,50-1,73 (м, 4H) 1,80-2,12 (м, 5H) 2,28 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,39-2,63 (м, 10H) 2,65 (с, 3H) 2,84 (д, J=14,14 Гц, 1H) 2,92 (с, 4H) 3,03-3,20 (м, 3H) 3,24-3,32 (м, 4H) 3,42-3,51 (м, 2H) 3,54 (с, 1H) 3,59-3,74 (м, 4H) 4,05-4,11 (м, 1H) 4,41 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,93-5,02 (м, 2H) 6,15-6,20 (м, 1H) 7,27-7,31 (м, 2H) 7,39-7,43 (м, 1H) 7,97-8,01 (м, 1H)
118			1112,7	(500 МГц): 0,83 (т, J=7,26 Гц, 3H) 0,93 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,00-1,11 (м, 12H) 1,15-1,27 (м, 13H) 1,35 (с, 3H) 1,36 (с, 3H) 1,47-1,74 (м, 4H) 1,79-1,92 (м, 2H) 1,95-2,05 (м, 2H) 2,09 (д, J=14,91 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,39-2,64 (м, 13H) 2,81-2,87 (м, 4H) 2,92 (дд, J=9,56, 7,26 Гц, 1H) 3,03-3,09 (м, 1H) 3,11-3,20 (м, 2H) 3,27 (с, 3H) 3,30-3,37 (м, 1H) 3,42-3,49 (м, 1H) 3,51 (с, 1H) 3,60-3,79 (м, 4H) 4,08 (кв, J=6,12 Гц, 1H) 4,41 (д, J=6,88 Гц, 1H) 4,89 (дд, J=11,08, 1,91 Гц, 1H) 4,99 (д, J=4,20 Гц, 1H) 5,97 (т, J=6,12 Гц, 1H) 7,30-7,39 (м, 2H) 7,67-7,72 (м, 2H)
119			1112,7	(500 МГц): 0,83 (т, J=7,45 Гц, 3H) 0,93 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,00-1,12 (м, 12H) 1,15-1,27 (м, 13H) 1,35 (с, 3H) 1,36 (с, 3H) 1,47-1,74 (м, 4H) 1,78-1,93 (м, 2H) 1,97-2,12 (м, 3H) 2,29 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,37-2,64 (м, 13H) 2,79-2,86 (м, 4H) 2,88-2,96 (м, 1H) 3,02-3,20 (м, 3H) 3,25-3,35 (м, 4H) 3,42-3,49 (м, 1H) 3,50 (с, 1H) 3,60-3,70 (м, 3H) 3,73-3,81 (м, 1H) 4,08 (кв, J=6,12 Гц, 1H) 4,40 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,89 (дд, J=10,89, 1,72 Гц, 1H) 4,99 (д, J=3,06 Гц, 1H) 5,94-6,00 (м, 1H) 7,27 (д, J=8,03 Гц, 2H) 7,77 (д, J=8,03 Гц, 2H)

120			1102,6	(600 МГц): 0,89 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,94-1,27 (м, 28H) 1,37 (с, 3H) 1,38 (с, 3H) 1,56 (ддд, J=14,44, 11,00, 7,11 Гц, 1H) 1,62-1,67 (м, 1H) 1,69-1,76 (м, 2H) 1,81-1,94 (м, 2H) 1,95-2,04 (м, 2H) 2,09 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,28 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,39-2,64 (м, 10H) 2,84 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,93 (дд, J=9,86, 7,11 Гц, 1H) 2,99 (с, 3H) 3,10 (кв, J=6,88 Гц, 1H) 3,17 (дд, J=10,09, 7,34 Гц, 1H) 3,22-3,29 (м, 1H) 3,27 (с, 3H) 3,44 (ушир. с, 1H) 3,45-3,50 (м, 1H) 3,51-3,62 (м, 2H) 3,55 (с, 1H) 3,67 (д, J=9,63 Гц, 1H) 3,71 (д, J=6,88 Гц, 1H) 3,77 (ддд, J=13,87, 9,97, 4,13 Гц, 1H) 3,94 (с, 3H) 4,08 (кв, J=5,96 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,98 (д, J=4,58 Гц, 1H) 5,02 (дд, J=10,77, 2,06 Гц, 1H) 6,20 (т, J=5,96 Гц, 1H) 6,67 (д, J=2,29 Гц, 1H) 7,37 (д, J=2,29 Гц, 1H)
-----	--	--	--------	---

Таблица 1-20

При- клад	R ^{29a}	R ²	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
121			1014,6	(500 МГц): 0,83 (т, J=7,40 Гц, 3H) 0,95 (д, J=7,13 Гц, 3H) 1,02 (д, J=7,13 Гц, 3H) 1,07-1,15 (м, 9H) 1,16-1,27 (м, 7H) 1,35 (с, 3H) 1,37 (с, 3H) 1,45-2,17 (м, 9H) 2,30 (с, 6H) 2,37 (с, 6H) 2,43-2,51 (м, 1H) 2,75 (д, J=14,81 Гц, 1H) 2,82 (с, 3H) 2,84-2,90 (м, 2H) 2,96-3,02 (м, 1H) 3,16 (дд, J=10,15, 7,40 Гц, 1H) 3,23 (с, 3H) 3,29-3,46 (м, 4H) 3,51 (с, 1H) 3,57-3,68 (м, 3H) 3,74 (д, J=10,15 Гц, 1H) 4,10 (кв, J=6,49 Гц, 1H) 4,24 (д, J=7,13 Гц, 1H) 4,78-4,87 (м, 2H) 7,41-7,45 (м, 1H) 8,16-8,20 (м, 1H) 8,76-8,79 (м, 1H) 9,08-9,12 (м, 1H)
122			1071,7	(500 МГц): 0,84 (т, J=7,45 Гц, 3H) 0,93 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,06-1,12 (м, 6H) 1,16-1,27 (м, 13H) 1,35 (с, 3H) 1,36 (с, 3H) 1,47-2,06 (м, 8H) 2,14 (д, J=14,91 Гц, 1H) 2,25 (с, 6H) 2,29 (с, 6H) 2,32-2,67 (м, 9H) 2,79-2,85 (м, 4H) 2,88-2,96 (м, 1H) 3,06 (кв, J=6,88 Гц, 1H) 3,15-3,30 (м, 5H) 3,37-3,51 (м, 3H) 3,61 (д, J=9,94 Гц, 1H) 3,65-3,81 (м, 3H) 4,10 (кв, J=6,12 Гц, 1H) 4,40 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,85 (дд, J=10,70, 1,91 Гц, 1H) 4,99 (д, J=3,82 Гц, 1H) 6,24-6,32 (м, 1H) 7,41-7,47 (м, 1H) 8,13-8,21 (м, 1H) 8,74-8,79 (м, 1H) 9,08-9,12 (м, 1H)

123			1099,7	(500 МГц): 0,84 (т, J=7,26 Гц, 3H) 0,93 (д, J=6,88 Гц, 3H) 0,99-1,27 (м, 25H) 1,35 (с, 3H) 1,36 (с, 3H) 1,49-1,73 (м, 4H) 1,76-1,92 (м, 2H) 1,97-2,12 (м, 3H) 2,28 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,39-2,64 (м, 10H) 2,80-2,87 (м, 4H) 2,89-2,96 (м, 1H) 3,06 (кв, J=6,63 Гц, 1H) 3,14-3,30 (м, 5H) 3,36-3,53 (м, 3H) 3,58-3,81 (м, 4H) 4,04-4,11 (м, 1H) 4,40 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,85 (дд, J=11,08, 1,91 Гц, 1H) 5,00 (д, J=2,68 Гц, 2H) 6,22-6,36 (м, 1H) 7,41-7,47 (м, 1H) 8,14-8,20 (м, 1H) 8,74-8,80 (м, 1H) 9,08-9,12 (м, 1H)
124			1070,6	(500 МГц): 0,83 (т, J=7,26 Гц, 3H) 0,93 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,06-1,11 (м, 6H) 1,16-1,26 (м, 13H) 1,34 (с, 3H) 1,36 (с, 3H) 1,48-2,07 (м, 8H) 2,15 (д, J=14,91 Гц, 1H) 2,23-2,27 (м, 6H) 2,27-2,31 (м, 6H) 2,33-2,66 (м, 9H) 2,77-2,96 (м, 5H) 3,02-3,08 (м, 1H) 3,11-3,20 (м, 2H) 3,28 (с, 3H) 3,29-3,36 (м, 1H) 3,43-3,52 (м, 2H) 3,58-3,80 (м, 4H) 4,10 (кв, J=6,37 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,89 (дд, J=11,09, 1,91 Гц, 1H) 5,00 (д, J=3,82 Гц, 1H) 6,00-6,06 (м, 1H) 7,44-7,55 (м, 3H) 7,87-7,92 (м, 2H)
125			1110,7	(500 МГц): 0,83 (т, J=7,45 Гц, 3H) 0,93 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,06-1,27 (м, 22H) 1,34 (с, 3H) 1,35-1,38 (м, 3H) 1,46-1,72 (м, 3H) 1,75-2,20 (м, 9H) 2,28 (с, 6H) 2,31-2,55 (м, 7H) 2,62-2,68 (м, 2H) 2,80 (с, 3H) 2,84-2,96 (м, 3H) 3,03-3,20 (м, 4H) 3,27 (с, 3H) 3,30-3,52 (м, 5H) 3,60-3,70 (м, 3H) 3,73-3,80 (м, 1H) 4,06-4,11 (м, 1H) 4,39-4,43 (м, 1H) 4,86-4,91 (м, 1H) 5,00 (д, J=3,82 Гц, 1H) 6,02 (т, J=5,35 Гц, 1H) 7,44-7,55 (м, 3H) 7,90 (д, J=7,26 Гц, 2H)
126			1076,6	(600 МГц): 0,85 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,96 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,10 (т, J=7,34 Гц, 6H) 1,16-1,28 (м, 13H) 1,36 (с, 3H) 1,37 (с, 3H) 1,62-1,68 (м, 1H) 1,68-1,73 (м, 2H) 1,80-1,93 (м, 2H) 1,95-2,05 (м, 2H) 2,15 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,21-2,47 (м, 18H) 2,50-2,66 (м, 3H) 2,82 (д, J=15,13 Гц, 1H) 2,86 (с, 3H) 2,89-2,96 (м, 1H) 3,04-3,09 (м, 1H) 3,15-3,26 (м, 2H) 3,27 (с, 3H) 3,39-3,50 (м, 3H) 3,53 (с, 1H) 3,62-3,72 (м, 3H) 3,76-3,83 (м, 1H) 4,10 (кв, J=6,27 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,88-4,93 (м, 1H) 4,99 (д, J=5,04 Гц, 1H) 6,18-6,23 (м, 1H) 7,03-7,07 (м, 1H) 7,52-7,55 (м, 1H) 7,59-7,63 (м, 1H)

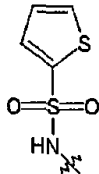
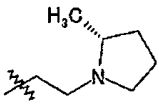
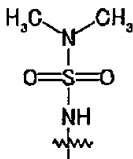
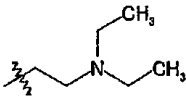
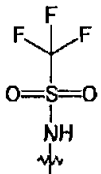
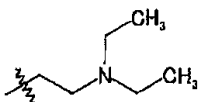
127			1116,6	(600 МГц): 0,85 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,96 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,05-1,27 (м, 22H) 1,36 (с, 3H) 1,37 (с, 3H) 1,50-1,59 (м, 1H) 1,62-1,93 (м, 7H) 1,95-2,06 (м, 2H) 2,07-2,19 (м, 3H) 2,28 (с, 6H) 2,31-2,38 (м, 4H) 2,39-2,46 (м, 1H) 2,51-2,58 (м, 1H) 2,60-2,69 (м, 2H) 2,83-2,95 (м, 6H) 3,04-3,10 (м, 1H) 3,12-3,27 (м, 3H) 3,26-3,29 (м, 3H) 3,39-3,48 (м, 3H) 3,53 (с, 1H) 3,62-3,72 (м, 3H) 3,76-3,83 (м, 1H) 4,06-4,12 (м, 1H) 4,39-4,43 (м, 1H) 4,88-4,92 (м, 1H) 4,98-5,01 (м, 1H) 6,18-6,22 (м, 1H) 7,03-7,06 (м, 1H) 7,51-7,54 (м, 1H) 7,60-7,63 (м, 1H)
-----	---	---	--------	---

Таблица 1-21

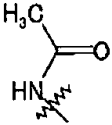
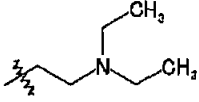
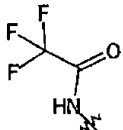
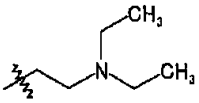
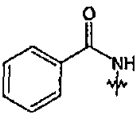
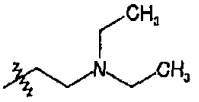
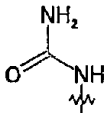
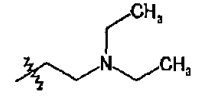
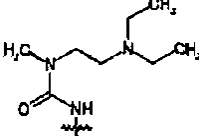
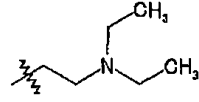
При- клад	R ^{29a}	R ²	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
128			1065	(400 МГц): 0,85 (т, J=7,32 Гц, 3H) 1,02 (д, J=6,59 Гц, 3H) 1,03 (т, J=7,08 Гц, 6H) 1,10 (д, J=7,57 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,32 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,17-1,26 (м, 1H) 1,19 (д, J=6,35 Гц, 3H) 1,21 (д, J=6,59 Гц, 3H) 1,24 (д, J=6,10 Гц, 3H) 1,39 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,50-2,04 (м, 9H) 2,10 (д, J=14,65 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,39-2,63 (м, 10H) 2,80 (с, 6H) 2,83 (д, J=14,89 Гц, 1H) 2,88-2,98 (м, 1H) 3,06 (с, 3H) 3,12 (кв, J=6,84 Гц, 1H) 3,18 (дд, J=10,25, 7,08 Гц, 1H) 3,24-3,31 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,40-3,52 (м, 3H) 3,58 (с, 1H) 3,67-3,75 (м, 3H) 3,80-3,90 (м, 1H) 4,09 (кв, J=6,35 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,08 Гц, 1H) 4,96-5,02 (м, 2H) 5,54 (т, J=5,86 Гц, 1H)
129			1091	(400 МГц): 0,85 (т, J=7,32 Гц, 3H) 1,02 (т, J=7,08 Гц, 6H) 1,03 (д, J=6,84 Гц, 3H) 1,11 (д, J=7,57 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,32 Гц, 3H) 1,17 (с, 3H) 1,20 (д, J=6,35 Гц, 3H) 1,22 (д, J=8,06 Гц, 3H) 1,24 (д, J=6,10 Гц, 3H) 1,40 (с, 6H) 1,46-1,71 (м, 3H) 1,72-1,78 (м, 1H) 1,79-1,98 (м, 2H) 1,98-2,03 (м, 1H) 2,09 (д, J=14,6 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,38-2,64 (м, 10H) 2,83 (д, J=14,6 Гц, 1H) 2,88-3,00 (м, 1H) 3,06 (с, 3H) 3,08-3,15 (м, 1H) 3,18 (дд, J=10,3, 7,32 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,41-3,53 (м, 3H) 3,56 (с, 1H) 3,64-3,78 (м, 4H) 3,82-3,90 (м, 1H) 4,09 (кв, J=6,34 Гц, 1H) 4,89 (дд, J=10,6, 1,57 Гц, 1H) 4,97-5,02 (м, 1H)

130			1037	(400 МГц): 0,86 (т, J=7,57 Гц, 3H) 1,02 (д, J=7,08 Гц, 3H) 1,03 (т, J=7,08 Гц, 6H) 1,11 (д, J=7,57 Гц, 3H) 1,14 (д, J=7,08 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,17-1,26 (м, 1H) 1,19 (д, J=6,10 Гц, 3H) 1,20 (д, J=5,89 Гц, 3H) 1,24 (д, J=6,10 Гц, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,41 (с, 3H) 1,50-1,77 (м, 4H) 1,82-2,05 (м, 4H) 2,09 (д, J=14,65 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,39-2,66 (м, 10H) 2,84 (д, J=6,84 Гц, 1H) 2,89-2,98 (м, 1H) 3,04 (с, 3H) 3,09-3,23 (м, 2H) 3,28 (с, 3H) 3,28-3,33 (м, 1H) 3,40-3,54 (м, 3H) 3,59 (с, 1H) 3,67 (д, J=9,77 Гц, 1H) 3,70 (д, J=7,32 Гц, 1H) 3,87-3,94 (м, 1H) 3,98-4,08 (м, 1H) 4,09 (кв, J=6,59 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,08 Гц, 1H) 4,91 (с, 2H) 4,97 (д, J=3,42 Гц, 1H) 5,03 (дд, J=10,99, 1,95 Гц, 1H) 5,18-5,25 (м, 1H)
131			1051	(400 МГц): 0,85 (т, J=7,32 Гц, 3H) 1,02 (д, J=6,84 Гц, 3H) 1,03 (т, J=6,59 Гц, 3H) 1,11 (д, J=7,32 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,08 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,17-1,26 (м, 1H) 1,19 (д, J=6,35 Гц, 3H) 1,21 (д, J=7,57 Гц, 3H) 1,24 (д, J=6,10 Гц, 3H) 1,40 (с, 6H) 1,49-1,77 (м, 4H) 1,82-2,05 (м, 4H) 2,09 (д, J=14,65 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,39-2,63 (м, 10H) 2,72 (д, J=5,37 Гц, 3H) 2,84 (д, J=14,65 Гц, 1H) 2,88-2,97 (м, 1H) 3,05 (с, 3H) 3,12 (кв, J=7,08 Гц, 1H) 3,18 (дд, J=10,25, 7,32 Гц, 1H) 3,22-3,28 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,40-3,52 (м, 3H) 3,59 (с, 1H) 3,68 (д, J=9,77 Гц, 1H) 3,71 (д, J=7,32 Гц, 1H) 3,76-3,83 (м, 1H) 3,86-3,94 (м, 1H) 3,99 (кв, J=6,35 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,32 Гц, 1H) 4,42-4,47 (м, 1H) 4,97-5,23 (м, 1H) 5,34 (т, J=5,62 Гц, 1H)
132			1142,7	(600 МГц, CD3OD): 0,73 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,01 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,09 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,14-1,35 (м, 22H) 1,41 (с, 3H) 1,45 (с, 3H) 1,50-1,59 (м, 1H) 1,70-1,96 (м, 6H) 2,11-2,18 (м, 1H) 2,22-2,30 (м, 2H) 2,38 (с, 3H) 2,42 (ушир. с, 6H) 2,45-3,12 (м, 15H) 3,17-3,36 (м, 5H) 3,49-3,55 (м, 1H) 3,57-3,64 (м, 1H) 3,66-3,70 (м, 1H) 3,70-3,76 (м, 2H) 3,77-3,81 (м, 1H) 3,84-3,90 (м, 1H) 3,93-4,00 (м, 1H) 4,24 (кв, J=6,27 Гц, 1H) 4,37-4,42 (м, 1H) 4,91-4,96 (м, 1H) 4,97-5,01 (м, 1H) 7,39-7,50 (м, 2H) 7,56-7,61 (м, 1H) 7,93-7,97 (м, 1H)

133			1022,7	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,22 Гц, 3H) 1,02 (д, J=7,02 Гц, 3H) 1,10-1,18 (м, 12H) 1,19-1,26 (м, 13H) 1,40-1,42 (м, 6H) 1,53-1,60 (м, 1H) 1,64-1,78 (м, 3H) 1,85-1,95 (м, 3H) 1,98-2,02 (м, 1H) 2,28 (с, 6H) 2,40-2,45 (м, 1H) 2,57-2,62 (м, 1H) 2,89 (с, 3H) 2,89-2,93 (м, 1H) 2,99 (с, 3H) 3,03 (с, 3H) 3,09-3,14 (м, 1H) 3,16-3,22 (м, 2H) 3,31 (с, 3H) 3,32-3,37 (м, 1H) 3,41 (ушир. с, 1H) 3,47-3,57 (м, 3H) 3,59 (с, 1H) 3,66 (д, J=9,50 Гц, 1H) 3,72 (д, J=7,43 Гц, 1H) 3,76-3,82 (м, 1H) 3,84-3,90 (м, 1H) 3,91-3,98 (м, 1H) 4,21-4,26 (м, 1H) 4,40 (д, J=7,02 Гц, 1H) 4,61-4,66 (м, 1H) 4,90-4,92 (м, 1H) 4,94-4,97 (м, 1H) 5,51 (т, J=5,78 Гц, 1H)
-----	--	--	--------	---

Таблица 1-22

При- клад	R ^{29a}	R ²	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
134			1036,6	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,43 Гц, 3H) 0,91 (д, J=6,61 Гц, 6H) 1,02 (д, J=7,02 Гц, 3H) 1,12 (д, J=7,43 Гц, 3H) 1,14 (д, J=7,02 Гц, 3H) 1,16-1,28 (м, 13H) 1,39-1,44 (м, 6H) 1,53-1,59 (м, 1H) 1,62-1,69 (м, 1H) 1,69-1,80 (м, 3H) 1,83-2,03 (м, 4H) 2,28 (с, 6H) 2,38-2,46 (м, 1H) 2,55-2,63 (м, 1H) 2,88-2,94 (м, 4H) 2,98 (с, 3H) 3,03 (с, 3H) 3,04-3,14 (м, 3H) 3,15-3,23 (м, 2H) 3,31 (с, 3H) 3,28-3,36 (м, 1H) 3,37-3,61 (м, 5H) 3,67 (д, J=9,91 Гц, 1H) 3,72 (д, J=7,43 Гц, 1H) 3,75-3,82 (м, 1H) 3,83-3,90 (м, 1H) 4,21-4,27 (м, 1H) 4,39 (д, J=7,02 Гц, 1H) 4,89-4,99 (м, 3H) 5,27-5,41 (м, 1H) 5,51 (т, J=5,57 Гц, 1H)
135			1016,7	(600 МГц): 0,84 (т, J=7,22 Гц, 3H) 0,98-1,06 (м, 9H) 1,10 (д, J=7,43 Гц, 3H) 1,12 (д, J=7,02 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,17-1,26 (м, 10H) 1,39 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,48-1,79 (м, 4H) 1,84-1,95 (м, 2H) 1,95-2,04 (м, 2H) 2,09 (д, J=14,45 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,39-2,64 (м, 10H) 2,84 (д, J=14,45 Гц, 1H) 2,90-2,97 (м, 1H) 3,05 (с, 3H) 3,09-3,14 (м, 1H) 3,16-3,24 (м, 2H) 3,28 (с, 3H) 3,37-3,51 (м, 2H) 3,54-3,58 (м, 1H) 3,59 (с, 1H) 3,62-3,74 (м, 3H) 3,64 (с, 3H) 3,89-3,96 (м, 1H) 4,07-4,11 (м, 1H) 4,42 (д, J=7,02 Гц, 1H) 4,95 (дд, J=11,15, 2,06 Гц, 1H) 4,99 (д, J=4,54 Гц, 1H) 5,87-5,91 (м, 1H)

136			1000,7	(600 МГц): 0,84 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,99-1,04 (м, 9H) 1,10-1,15 (м, 6H) 1,17 (с, 3H) 1,19 (д, J=6,42 Гц, 3H) 1,20-1,26 (м, 7H) 1,40 (с, 3H) 1,41 (с, 3H) 1,49-1,69 (м, 2H) 1,71-1,77 (м, 2H) 1,95 (с, 3H) 1,84-2,06 (м, 4H) 2,07-2,12 (м, 1H) 2,29 (с, 3H) 2,34 (с, 6H) 2,38-2,64 (м, 10H) 2,80-2,88 (м, 1H) 2,93-3,00 (м, 1H) 3,04 (с, 3H) 3,09-3,14 (м, 1H) 3,16-3,20 (м, 1H) 3,21-3,30 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,42-3,52 (м, 2H) 3,58-3,66 (м, 2H) 3,69-3,77 (м, 3H) 3,84-3,91 (м, 1H) 4,06-4,13 (м, 1H) 4,43 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,92-4,97 (м, 1H) 4,98-5,01 (м, 1H) 6,90-6,95 (м, 1H)
137			1054,7	(600 МГц): 0,83 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,98-1,05 (м, 9H) 1,09-1,27 (м, 19H) 1,40 (с, 3H) 1,41 (с, 3H) 1,51-2,11 (м, 9H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,39-2,63 (м, 10H) 2,81-2,86 (м, 1H) 2,94-2,98 (м, 1H) 3,06 (с, 3H) 3,11-3,21 (м, 2H) 3,28 (с, 3H) 3,34-3,40 (м, 1H) 3,41-3,50 (м, 1H) 3,62 (с, 1H) 3,67-3,78 (м, 3H) 3,79-3,86 (м, 1H) 3,91-3,97 (м, 1H) 4,07-4,12 (м, 1H) 4,42 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,82-4,86 (м, 1H) 4,97-5,01 (м, 1H)
138			1062,8	(600 МГц): 0,63 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,98-1,06 (м, 9H) 1,09-1,26 (м, 19H) 1,39 (с, 3H) 1,42 (с, 3H) 1,46-2,12 (м, 9H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,39-2,65 (м, 10H) 2,81-2,86 (м, 1H) 2,91-2,98 (м, 1H) 3,09 (с, 3H) 3,11-3,21 (м, 2H) 3,28 (с, 3H) 3,39-3,51 (м, 3H) 3,69 (с, 1H) 3,71-3,81 (м, 3H) 3,95-4,12 (м, 3H) 4,43 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,87-4,92 (м, 1H) 4,98-5,02 (м, 1H) 7,32-7,37 (м, 2H) 7,41 (д, J=7,34 Гц, 1H) 7,76-7,81 (м, 1H) 7,82-7,86 (м, 2H)
139			1001,7	(600 МГц): 0,79-0,93 (м, 3H) 0,98-1,27 (м, 28H) 1,38-1,42 (м, 6H) 1,62 (с, 9H) 2,29 (с, 6H) 2,32-2,35 (м, 3H) 2,39-2,74 (м, 10H) 2,81-3,07 (м, 5H) 3,07-3,13 (м, 1H) 3,15-3,36 (м, 6H) 3,40-3,86 (м, 8H) 4,06-4,13 (м, 1H) 4,32-4,45 (м, 1H) 4,53-4,75 (м, 1H) 4,84-5,00 (м, 2H)
140			1114,8	(500 МГц): 0,79-0,88 (м, 3H) 0,98-1,27 (м, 33H) 1,39 (с, 6H) 1,51-1,78 (м, 5H) 1,85-2,06 (м, 4H) 2,09 (д, J=14,53 Гц, 1H) 2,25-2,31 (м, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,39-2,64 (м, 16H) 2,81-2,87 (м, 3H) 2,89-2,95 (м, 1H) 3,05 (с, 3H) 3,07-3,13 (м, 1H) 3,14-3,50 (м, 10H) 3,64-3,74 (м, 4H) 3,80-3,88 (м, 1H) 4,05-4,16 (м, 1H) 4,42 (м, 1H) 4,88-5,03 (м, 2H) 6,04-6,15 (м, 1H)

Таблиця 1-23

При- клад	R ^{29a}	R ²	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
141			1029,7	(600 МГц): 0,82 (т, J=7,34 Гц, 2H) 0,98-1,04 (м, 9H) 1,09-1,27 (м, 19H) 1,39 (с, 6H) 1,48-1,78 (м, 4H) 1,86-2,04 (м, 4H) 2,09 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,39-2,63 (м, 10H) 2,80-2,87 (м, 7H) 2,89-2,95 (м, 1H) 3,05 (с, 3H) 3,09-3,21 (м, 3H) 3,28 (с, 3H) 3,44-3,51 (м, 2H) 3,64-3,76 (м, 5H) 3,84-3,90 (м, 1H) 4,07-4,12 (м, 1H) 4,40-4,44 (м, 1H) 4,96-5,02 (м, 2H) 5,76 (т, J=5,27 Гц, 1H)
142			1038,7	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,96-1,27 (м, 28H) 1,39 (с, 3H) 1,42 (с, 3H) 1,48-1,52 (м, 1H) 1,62-1,69 (м, 1H) 1,70-1,79 (м, 2H) 1,85-2,05 (м, 4H) 2,09 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,37-2,64 (м, 10H) 2,83 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,86-2,93 (м, 1H) 3,02 (с, 3H) 3,11 (кв, J=6,88 Гц, 1H) 3,18 (дд, J=10,09, 7,34 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,43 (ушир. с, 1H) 3,44-3,50 (м, 1H) 3,63-3,68 (м, 1H) 3,66 (с, 1H) 3,70 (д, J=8,71 Гц, 1H) 3,93 (ддд, J=15,36, 5,73, 2,75 Гц, 1H) 4,03-4,13 (м, 2H) 4,23 (ддд, J=10,55, 5,73, 2,98 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,63 (ддд, J=10,55, 7,79, 2,75 Гц, 1H) 4,94 (д, J=5,04 Гц, 1H) 5,21 (дд, J=10,55, 2,29 Гц, 1H) 5,45 (ушир. с, 2H)
143			1001,7	(600 МГц): 0,84 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,97-1,29 (м, 28H) 1,39 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,50-1,52 (м, 1H) 1,63-1,67 (м, 1H) 1,72-1,78 (м, 2H) 1,87-2,04 (м, 4H) 2,05 (с, 3H) 2,09 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,38-2,64 (м, 10H) 2,83 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,87 (дд, J=9,17, 7,34 Гц, 1H) 3,03 (с, 3H) 3,11 (кв, J=6,88 Гц, 1H) 3,18 (дд, J=10,09, 7,34 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,41 (ушир. с, 1H) 3,44-3,50 (м, 1H) 3,64-3,73 (м, 3H) 3,88-3,93 (м, 1H) 3,94-4,00 (м, 1H) 4,06-4,15 (м, 2H) 4,40-4,47 (м, 2H) 4,97 (д, J=4,58 Гц, 1H) 5,09 (дд, J=10,77, 2,52 Гц, 1H)
144			1063,7	(600 МГц): 0,50 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,96-1,30 (м, 28H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,43-1,49 (м, 1H) 1,64 (д, J=11,92 Гц, 1H) 1,72-1,91 (м, 4H) 1,93-2,01 (м, 2H) 2,09 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,39-2,64 (м, 10H) 2,79-2,85 (м, 2H) 3,08 (с, 3H) 3,13 (кв, J=7,18 Гц, 1H) 3,18 (дд, J=10,32, 7,11 Гц, 1H) 3,26 (с, 3H) 3,41 (ушир. с, 1H) 3,44-3,51 (м, 1H) 3,67-3,74 (м, 3H) 4,05-4,14 (м, 2H) 4,16-4,23 (м, 1H) 4,39-4,45 (м, 2H) 4,58 (ддд, J=11,58, 4,47, 2,75 Гц, 1H) 4,94-5,01 (м, 2H) 7,35-7,40 (м, 2H) 7,46-7,51 (м, 1H) 8,02-8,07 (м, 2H)

145			1002,6	(600 МГц): 0,84 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,99-1,26 (м, 28H) 1,38 (с, 3H) 1,42 (с, 3H) 1,47-1,51 (м, 1H) 1,65 (д, J=10,55 Гц, 1H) 1,69-1,79 (м, 2H) 1,90-2,05 (м, 4H) 2,09 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,39-2,63 (м, 10H) 2,81-2,90 (м, 2H) 3,01 (с, 3H) 3,07 (кв, J=6,88 Гц, 1H) 3,18 (дд, J=10,32, 7,11 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,41 (ушир. с, 1H) 3,47 (дд, J=9,86, 7,11 Гц, 1H) 3,66 (д, J=6,88 Гц, 1H) 3,70-3,76 (м, 3H) 3,85 (ддд, J=15,02, 11,12, 3,67 Гц, 1H) 4,10 (кв, J=6,42 Гц, 1H) 4,21 (дт, J=11,46, 3,44 Гц, 1H) 4,39-4,45 (м, 2H) 4,96 (д, J=4,58 Гц, 1H) 5,23 (дд, J=10,55, 2,75 Гц, 1H)
146			1052,7	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,94-1,26 (м, 31H) 1,39 (с, 3H) 1,42 (с, 3H) 1,48-1,52 (м, 1H) 1,63-1,67 (м, 1H) 1,71-1,79 (м, 2H) 1,86-2,07 (м, 5H) 2,29 (с, 6H) 2,32-2,62 (м, 8H) 2,34 (с, 3H) 2,83 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,86-2,97 (м, 2H) 3,03 (с, 3H) 3,11 (кв, J=7,03 Гц, 1H) 3,18 (дд, J=10,55, 7,34 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,41-3,50 (м, 2H) 3,64-3,72 (м, 3H) 3,90-3,95 (м, 1H) 4,04-4,11 (м, 2H) 4,20-4,25 (м, 1H) 4,41 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,63 (ддд, J=10,66, 7,68, 3,21 Гц, 1H) 4,95 (д, J=4,58 Гц, 1H) 5,21 (дд, J=10,55, 2,29 Гц, 1H) 5,45 (ушир. с, 2H)
147			1050,7	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,99-1,45 (м, 33H) 1,47-1,52 (м, 1H) 1,63-1,81 (м, 3H) 1,86-2,19 (м, 5H) 2,23-2,31 (м, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,31-2,38 (м, 1H) 2,37 (с, 3H) 2,39-2,46 (м, 1H) 2,55-2,68 (м, 2H) 2,83-2,96 (м, 5H) 3,03 (с, 3H) 3,08-3,21 (м, 4H) 3,28 (с, 3H) 3,38-3,50 (м, 3H) 3,64-3,73 (м, 3H) 3,93 (ддд, J=15,47, 5,62, 2,75 Гц, 1H) 4,03-4,14 (м, 2H) 4,23 (ддд, J=10,55, 5,73, 2,98 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,62 (ддд, J=10,66, 7,68, 2,75 Гц, 1H) 4,95 (д, J=4,58 Гц, 1H) 5,20 (дд, J=10,55, 2,29 Гц, 1H) 5,45 (ушир. с, 2H)

Приклад 1

(1) Кларитроміцин (200 г) розчиняли в ацетоні (1,5 л), до розчину по краплях додавали оцтовий ангідрид (30,3 мл), і перемішували отриману суміш протягом ночі при кімнатній температурі. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску, до отриманого залишку додавали етилацетат, гексан і водний гідроксид натрію, а потім до суміші додавали насичений водний гідрокарбонат натрію для коректування значення рН суміші до 9. Тверду речовину, яка випала в осад, збирали шляхом фільтрування на скляному фільтрі, промивали дистильованою водою, а потім сушили в умовах зниженого тиску з одержанням ацетильної сполуки (202 г).

МС (ESI) m/z = 790,6 [M+H]⁺

(2) Сполуку (202 г), отриману на описаній вище стадії (1), розчиняли в хлороформі (1,8 л), до розчину додавали піридин (210 мл), потім отриману суміш охолоджували на льоді, і протягом 40 хвилин до суміші по краплях додавали розчин трифосгену (77,4 г) у хлороформі (0,8 л). Реакційну суміш нагрівали до кімнатної температури, а потім перемішували протягом 3 годин.

До реакційної суміші додавали піридин (158 мл), до отриманої суміші при охолодженні на льоді по краплях додавали розчин трифосгену (57,9 г) у хлороформі, і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 15 хвилин. До реакційної суміші додавали дистильовану воду й насичений водний гідрокарбонат натрію, отриману суміш екстрагували хлороформом, органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і додавали до отриманого залишку суміш етилацетату й гексану (1/1). Отриману суміш перемішували, до суміші додатково додавали гексан, і

перемішували отриману суміш протягом ночі при кімнатній температурі. Тверду речовину, яка випала в осад, збирали шляхом фільтрування, і промивали сумішшю етилацетату й гексану (1/2) з одержанням карбонатної сполуки (220 г).

МС (ESI) $m/z = 816,5 [M+H]^+$

(3) N-хлорсукцинімід (99,7 г) розчиняли в хлороформі (1 л), і охолоджували розчин до $-25\text{ }^{\circ}\text{C}$. До реакційної суміші протягом 20 хвилин по краплях додавали розчин диметилсульфіду (210 мл) у хлороформі (0,2 л), і перемішували отриману суміш протягом 15 хвилин. Потім до реакційної суміші протягом 30 хвилин по краплях додавали розчин сполуки, отриманої на описаній вище стадії (2), у хлороформі (1 л), і перемішували отриману суміш протягом 15 хвилин. До реакційної суміші додавали розчин триетиламіну (136 мл) у хлороформі (0,2 л), і перемішували отриману суміш протягом 30 хвилин. До реакційної суміші додавали насичений водний гідрокарбонат натрію, отриману суміш нагрівали до кімнатної температури, до суміші додавали хлороформ, і розділяли шари. Органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували, а потім концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску. До отриманого залишку додавали етилацетат, суміш етилацетату й гексану (1/1) і гексан, і перемішували отриману суміш протягом ночі при кімнатній температурі. Тверду речовину, яка випала в осад, збирали шляхом фільтрування й промивали сумішшю етилацетату й гексану (1/2) з одержанням кетонної сполуки (109 г). Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (етилацетат/гексан = 1/1 \rightarrow ацетон/гексан/триетиламін = 10/10/0,2), а потім кристалізували тим же способом, що й описаний вище, з одержанням кетонної сполуки (59,5 г).

МС (ESI) $m/z = 814,5 [M+H]^+$

(4) Йодид триметилсульфоксонію (210 г) розчиняли в суміші диметилсульфоксиду й тетрагідрофурану (5/1, 1,2 л), до розчину порціями додавали 70 % гідрид натрію (32,6 г), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 1,5 годин. До реакційної суміші при охолодженні на льоді по краплях додавали розчин сполуки (155 г), отриманої на описаній вище стадії (3), у тетрагідрофурані (0,8 л), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 30 хвилин. Реакційну суміш охолоджували на льоді, до реакційної суміші додавали дистильовану воду й етилацетат, і розділяли шари. Отриманий органічний шар промивали дистильованою водою. Водний шар екстрагували етилацетатом, і промивали органічний шар дистильованою водою. Органічні шари об'єднували, сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску з одержанням епоксисполуки (146 г).

МС (ESI) $m/z = 784,5 [M+H]^+$

^1H -ЯМР (600 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 0,90 (т, $J=7,57$ Гц, 3H), 0,97 (д, $J=7,34$ Гц, 3H), 1,04 (д, $J=6,88$ Гц, 3H), 1,07 (с, 3H), 1,14 (д, $J=6,88$ Гц, 3H), 1,18 (д, $J=5,96$ Гц, 3H), 1,21-1,36 (м, 7H), 1,42 (с, 3H), 1,47-1,55 (м, 1H), 1,67-1,73 (м, 1H), 1,83-1,98 (м, 5H), 2,02 (д, $J=1,83$ Гц, 6H), 2,18-2,29 (м, 1H), 2,25 (с, 6H), 2,58-2,69 (м, 1H), 2,63 (д, $J=4,13$ Гц, 1H), 2,80-2,89 (м, 1H), 2,94 (д, $J=4,13$ Гц, 1H), 3,12-3,26 (м, 1H), 3,17 (с, 3H), 3,34 (с, 3H), 3,43-3,51 (м, 1H), 3,66 (д, $J=6,42$ Гц, 1H), 3,94 (ушир. с, 1H), 4,57 (д, $J=7,34$ Гц, 1H), 4,73 (дд, $J=10,55, 7,34$ Гц, 1H), 4,80 (кв, $J=6,42$ Гц, 1H), 4,98-5,06 (м, 2H), 6,50 (с, 1H)

(5) Сполуку (138 г), отриману на описаній вище стадії (4), розчиняли в суміші тетрагідрофурану й диметилформаміду (1/1, 1,4 л), і додавали до розчину 1,1'-карбонілдіімідазол (85,6 г). До суміші при охолодженні на льоді протягом 40 хвилин додавали 70 % гідрид натрію (18,1 г), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 0,5 години. Реакційну суміш охолоджували на льоді, і додавали до реакційної суміші дистильовану воду. Отриману суміш екстрагували етилацетатом, і двічі промивали органічний шар дистильованою водою. Водний шар екстрагували етилацетатом, і двічі промивали органічний шар дистильованою водою. Органічні шари об'єднували, сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (гексан \rightarrow гексан/етилацетат = 1/1 \rightarrow ацетон/гексан/триетиламін = 10/10/0,2). До отриманого очищеного продукту додавали етилацетат і гексан, і перемішували отриману суміш протягом ночі при кімнатній температурі. Тверду речовину, яка випала в осад, збирали шляхом фільтрування, і промивали сумішшю етилацетату й гексану (1/4) з одержанням сполуки, представленої формулою (A) (87,1 г).

МС (ESI) $m/z = 878,6 [M+H]^+$

^1H -ЯМР (600 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 0,85-1,41 (м, 25H), 1,64-1,78 (м, 3H), 1,79 (с, 3H), 1,90 (дд, $J=14,67, 5,04$ Гц, 4H), 1,86 (с, 3H), 2,04 (с, 3H), 2,19-2,28 (м, 1H), 2,25 (с, 6H), 2,60-2,68 (м, 1H), 2,65 (д, $J=4,13$ Гц, 1H), 2,86-2,97 (м, 1H), 2,95 (д, $J=4,13$ Гц, 1H), 3,15 (с, 3H), 3,22-3,29 (м, 1H), 3,35 (с, 3H), 3,38-3,47 (м, 1H), 3,66 (д, $J=6,42$ Гц, 1H), 3,79-3,88 (м, 1H), 4,56 (д, $J=6,88$ Гц, 1H),

4,72 (дд, J=10,32, 7,57 Гц, 1H), 4,79 (кв, J=6,27 Гц, 1H), 5,01-5,09 (м, 1H), 5,83 (дд, J=10,55, 2,75 Гц, 1H), 6,66 (с, 1H), 7,07 (с, 1H), 7,34-7,38 (м, 1H), 8,08 (с, 1H)

(6) Сполуку (500 мг), отриману на описаній вище стадії (5), розчиняли в ацетонітрилі (10 мл), до розчину додавали 2-аміноетанол (173,9 мг), і перемішували отриману суміш протягом ночі при кімнатній температурі. До реакційної суміші додавали 1,1,3,3-тетраметилгуанідин (72 мкл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 1 години. До реакційної суміші додавали етилацетат і насичений водний розчин хлориду амонію, розділяли шари, і отриманий органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Отриманий фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску з одержанням карбаматної сполуки.

Згідно з іншим способом, відмінним від описаного вище, вищезгадану сполуку також одержували з використанням наступного способу. Більш конкретно, сполуку (300 мг), отриману на описаній вище стадії (5), розчиняли в ацетонітрилі (30 мл), до розчину додавали 2-аміноетанол (104,4 мг) і 1,8-діазабіцикло[5.4.0]-7-ундецен (52,1 мг), і перемішували отриману суміш протягом ночі при кімнатній температурі. До реакційної суміші додавали етилацетат і насичений водний розчин хлориду амонію, розділяли шари, отриманий органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Отриманий фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 30/1/0,1→10/1/0,1) з одержанням карбаматної сполуки (329 мг).

(7) Сполуку, отриману на описаній вище стадії (6), розчиняли в метанолі (20 мл), і перемішували розчин при нагріванні зі зворотним холодильником протягом 4 годин. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 100/1/0,1→10/1/0,1) з одержанням сполуки зі знятим захистом (406 мг).

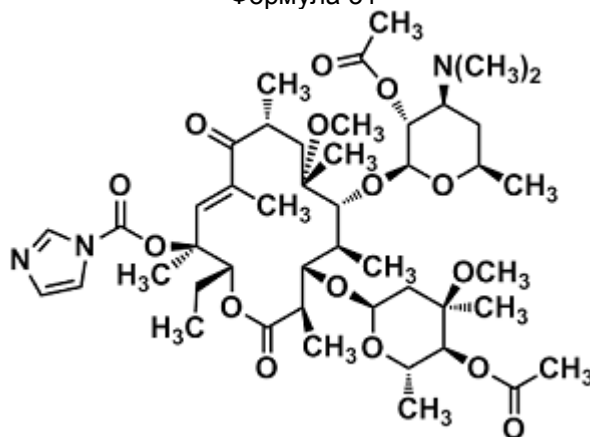
Згідно з іншим способом, відмінним від описаного вище, вищезгадану сполуку також одержували з використанням наступного способу. Більш конкретно, сполуку (329 мг), отриману на описаній вище стадії (6), розчиняли в метанолі (30 мл), до розчину додавали 1,8-діазабіцикло[5.4.0]-7-ундецен (0,5 мл), і перемішували отриману суміш при нагріванні зі зворотним холодильником протягом 3 годин. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 50/1/0,1→10/1/0,1) з одержанням сполуки зі знятим захистом (144 мг).

(8) Сполуку (100 мг), отриману на описаній вище стадії (7), розчиняли в етанолі (1 мл), до розчину додавали N,N-диметил-N'-метилетан-1,2-діамін (77,2 мг), і перемішували отриману суміш при 140 °C протягом 1 години на умовах мікрохвильової обробки. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом препаративної тонкошарової хроматографії (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 10/1/0,1) з одержанням сполуки (87 мг), представленої в таблиці 1.

Згідно з іншим способом, відмінним від описаного вище, вищезгадану сполуку також одержували з використанням наступного способу. Більш конкретно, сполуку (50 мг), отриману на описаній вище стадії (7), розчиняли в етанолі (1 мл), до розчину додавали N,N-діетил-N'-метилетан-1,2-діамін (45,0 мг), і перемішували отриману суміш при 110 °C протягом 4 годин у герметизованій пробірці. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 20/1/0,1→5/1/0,1) з одержанням сполуки (44 мг), представленої в таблиці 1.

Формула (SM1)

Формула 31



Приклад 2

5 (1) Представлену формулою (SM1) сполуку (1,63 г), отриману способом, описаним у міжнародній патентній публікації WO 93/21199, розчиняли в ацетонітрилі (30 мл), до розчину додавали 1,1,3,3-тетраметилгуанідин (225 мкл) і сполуку (1,94 г), отриману в довідковому прикладі 63, і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 20 годин. До реакційної суміші додавали дистильовану воду (3 мл), і перемішували отриману суміш при
10 кімнатній температурі протягом 1 години. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску, отриманий залишок розбавляли етилацетатом і промивали насиченим водним гідрокарбонатом натрію. Органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували, фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28% водний аміак =
15 100/1/0,1→20/1/0,1) з одержанням карбаматної сполуки (1,57 г).

(2) Сполуку (1,57 г), отриману на описаній вище стадії (1), розчиняли в метанолі (20 мл), до розчину додавали 1,8-діазабіцикло[5.4.0]-7-ундецен (666 мкл), і перемішували отриману суміш при нагріванні зі зворотним холодильником протягом 2 годин. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску, до отриманого залишку додавали хлороформ і насичений водний гідрокарбонат натрію, і розділяли шари. Органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували, потім фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28% водний аміак = 100/1/0,1→20/1/0,1) з одержанням сполуки зі знятим захистом (0,94 г).

(3) Кетоніву сполуки (0,88 г) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 1, стадії (1) і (3), шляхом використання сполуки (0,94 г), отриманої на описаній вище стадії (2), як вихідної речовини.

(4) Сполуку (0,58 г), отриману на описаній вище стадії (3), розчиняли в метанолі (10 мл), і перемішували розчин при кімнатній температурі протягом 2 діб. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску, і одержували епоксисполуку (367 мг) тим же способом, що й описаний у прикладі 1, стадія (4), шляхом використання отриманого залишку як вихідної речовини.

(5) Сполуку (90 мг), отриману на описаній вище стадії (4), розчиняли в етанолі (1 мл), до розчину додавали 50 % водний диметиламін (41 мкл), і перемішували отриману суміш при 100 °C протягом 20 годин у герметизованій пробірці. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом препаративної тонкошарової хроматографії (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 10/1/0,1) з одержанням сполуки (79,5 мг), представленої в таблиці 1.

Приклад 3

Сполуку (57,2 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (90 мг), отриманої в прикладі 2, стадія (4), і N,N,N'-триметилетен-1,2-діаміну (47 мкл) як вихідних речовин.

Приклад 4

(1) Представлену формулою (SM1) сполуку (10 г), отриману способом, описаним у міжнародній патентній публікації WO 93/21199, розчиняли в ацетонітрилі (100 мл), до розчину додавали 1,4-діамінобутан (5,5 мл), і перемішували отриману суміш протягом ночі при кімнатній температурі. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску, до отриманого залишку додавали етилацетат і дистильовану воду, розділяли шари, і екстрагували водний шар

етилацетатом. Органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували, а потім концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску. Отриманий залишок розчиняли в метанолі (20 мл), і до розчину по краплях додавали дистильовану воду для осадження твердої речовини. Тверду речовину, яка випала в осад, збирали шляхом фільтрування, промивали

5 дистильованою водою, а потім розчиняли в хлороформі. Розчин фільтрували з використанням фазового сепаратора для розділення шарів, і концентрували отриманий органічний шар в умовах зниженого тиску з одержанням карбаматної сполуки (8,17 г).

(2) Сполуку зі знятим захистом (9,36 г) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (2), шляхом використання сполуки (4,18 г), отриманої на описаній вище стадії

10 (1), як вихідної речовини.

(3) Сполуку (4,68 г), отриману на описаній вище стадії (2), розчиняли в хлороформі (23 мл), до розчину додавали триетиламін (0,47 мл), при охолодженні на льоді до суміші додавали 4-хлорбутирилхлорид (0,26 мл), і перемішували отриману суміш протягом 2 годин. До реакційної суміші додавали насичений водний хлорид амонію й хлороформ, і фільтрували отриману суміш

15 із використанням фазового сепаратора для розділення шарів. Отриманий органічний шар концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 50/1/0,1→20/1/0,1) з одержанням ацильної сполуки (1,15 г).

(4) Сполуку (892 мг), отриману на описаній вище стадії (3), розчиняли в тетрагідрофурані (19 мл), до розчину додавали 60 % гідрид натрію (376 мг), і перемішували отриману суміш при нагріванні зі зворотним холодильником протягом 0,5 години. До реакційної суміші додавали насичений водний хлорид амонію й хлороформ, і фільтрували отриману суміш із використанням фазового сепаратора для розділення шарів. Отриманий органічний шар концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на

25 силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 50/1/0,1→20/1/0,1) з одержанням циклізованої сполуки (425 мг).

(5) Кетонову сполуку (232 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 1, стадії (1) і (3), шляхом використання сполуки (422 мг), отриманої на описаній вище стадії (4), як вихідної речовини.

30 (6) Сполуку (232 мг), отриману на описаній вище стадії (5), розчиняли в метанолі (4 мл), і перемішували отриману суміш при нагріванні зі зворотним холодильником протягом 4 годин і при кімнатній температурі протягом 12 годин. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску з одержанням сполуки зі знятим захистом (230 мг).

35 (7) Епоксисполуку (103 мг) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 1, стадія (4), шляхом використання сполуки (227 мг), отриманої на описаній вище стадії (6), як вихідної речовини.

(8) Сполуку (50 мг), отриману на описаній вище стадії (7), розчиняли в етанолі (1 мл), до розчину додавали N,N,N'-триметилетилен-1,2-діамін (35 мкл), і перемішували отриману суміш при 140 °C протягом 45 хвилин в умовах мікрохвильової обробки. Реакційну суміш

40 концентрували в умовах зниженого тиску, до отриманого залишку додавали хлороформ і насичений водний хлорид амонію, розділяли шари, і екстрагували водний шар хлороформом. Органічні шари об'єднували й фільтрували з використанням фазового сепаратора для додаткового розділення шарів. Отриманий органічний шар концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом препаративної тонкошарової хроматографії

45 (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 10/1/0,1) з одержанням сполуки (25,6 мг), представленої в таблиці 1.

Приклад 5

Сполуку (21,5 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (50,0 мг), отриманої в прикладі 4, стадія

50 (7), і 50 % водного диметиламіну (24,4 мкл) як вихідних речовин.

Приклад 6

(1) Сполуку (1,0 г), отриману в прикладі 4, стадія (2), розчиняли в диметилформаміді (10 мл), до розчину додавали 2-хлорпіримідин (204 мг), і перемішували отриману суміш при 120 °C. До реакційної суміші додавали етилацетат і дистильовану воду, і розділяли шари. Органічний шар

55 тричі промивали дистильованою водою, потім сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували, і концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску. Отриманий залишок очищали методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак) з одержанням сполуки-аддукту (239 мг).

(2) Ацетильну сполуку (319 мг) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 1, стадія (1), шляхом використання сполуки (300 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

(3) Сполуку (300 мг), отриману на описаній вище стадії (2), розчиняли в хлороформі (10 мл), до розчину додавали N-етил-N'-(3-диметиламінопропіл)карбодііміду гідрохлорид (1,19 г), піридину трифторацетат (1,20 г) і диметилсульфоксид (722 мкл), і перемішували отриману суміш протягом ночі при кімнатній температурі. До реакційної суміші додавали дистильовану воду, і розділяли шари. Органічний шар промивали насиченим водним гідрокарбонатом натрію, потім сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску з одержанням кетонної сполуки.

(4) Епоксисполуку (93 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 4, стадія (6), і в прикладі 1, стадія (4), шляхом використання сполуки, отриманої на описаній вище стадії (3), як вихідної речовини.

(5) Сполуку (6 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (65 мг), отриманої на описаній вище стадії (4), і 50 % водного диметиламіну (63 мкл) як вихідних речовин.

Приклад 7

Сполуку (7 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (65 мг), отриманої в прикладі 6, стадія (4), як вихідної речовини.

Приклад 8

Сполуку (18 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (45 мг), отриманої в прикладі 6, стадія (4), і сполуки (34,2 мг), отриманої в довідковому прикладі 104, як вихідних речовин.

Приклад 9

(1) Деацетиловану сполуку (220 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 2, стадії (1) і (2), шляхом використання сполуки (393 мг), представлені формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і сполуки (180 мг), отриманої в довідковому прикладі 64, як вихідних речовин.

(2) Сполуку (59 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (70 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 10

Сполуку (59 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (70 мг), отриманої в прикладі 9, стадія (1), і 50 % водного диметиламіну (0,6 мл) як вихідних речовин.

Приклад 11

Сполуку (70 мг), отриману в прикладі 9, стадія (1), розчиняли в етанолі (0,6 мл), до розчину додавали N,N-діетил-N'-метилетан-1,2-діамін (50 мг), і перемішували отриману суміш при 140 °C протягом 60 хвилин в умовах мікрохвильової обробки. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом препаративної тонкошарової хроматографії (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 10/1/0,1) з одержанням сполуки (57 мг), представлені в таблиці 1.

Приклад 12

(1) Деацетиловану сполуку (283 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 2, стадії (1) і (2), шляхом використання сполуки (500 мг), представлені формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і 2-метоксиетанаміну (214 мг) як вихідних речовин.

(2) Сполуку (77 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання сполуки (100 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 13

(1) Деацетиловану сполуку (400 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 2, стадії (1) і (2), шляхом використання сполуки (700 мг), представлені формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і 3-амінопропіонітрилу (588 мкл) як вихідних речовин.

(2) Сполуку (144 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання сполуки (200 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 14

(1) Деацетиловану сполуку (480 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 2, стадії (1) і (2), шляхом використання сполуки (685 мг), представленої формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і 1-(2-аміноетил)піролідін-2-ону (500 мг) як вихідних речовин.

5 (2) Сполуку (86 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання сполуки (100 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 15

10 (1) Сполуку (360 мг), представлену формулою (A) і отриману в прикладі 1, стадія (5), розчиняли в ацетонітрилі (1,5 мл), до розчину додавали 1,8-діазабіцикло[5,4,0]-7-ундецен (280 мкл) і 3-метансульфонілпропіламіну гідрохлорид (273 мг), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 1 доби. До реакційної суміші додавали етилацетат і насичений водний розчин хлориду амонію, і розділяли шари. Органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували, фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ →

15 хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 25/1/0,1 → 15/1/0,1) з одержанням карбаматної сполуки (117 мг).
 (2) Сполуку (115 мг), отриману на описаній вище стадії (1), розчиняли в етанолі (1 мл), до розчину додавали N,N'-діетил-N'-метилетан-1,2-діамін (195 мкл), і перемішували отриману суміш при 100 °C протягом 1 доби в герметизованій пробірці. До реакційної суміші додавали етилацетат і насичений водний розчин хлориду амонію, і розділяли шари. Органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували, фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ → хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 12/1/0,1) і препаративної тонкошарової хроматографії (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 20/1/0,1) з одержанням сполуки (62,7

25 мг), представленої в таблиці 1.
 До сполуки (100 мг), отриманої в прикладі 15, стадія (2), додавали 1-пропанол (100 мкл), і розчиняли сполуку при нагріванні реакційної суміші на водяній бані при 80 °C. Цей розчин перемішували при охолодженні на льоді з випаданням в осад кристалічних речовин. Отримані кристалічні речовини сушили в умовах зниженого тиску з одержанням сольвату 1-пропанолу.

30 Елементний аналіз:

Виявлене: C 59,04 %, H 9,31 %, N 5,15 %, S 2,92

Точка плавлення: 105-120 °C

TG/DTA (пік): 96,0 °C, 118,8 °C

35 XRD пік 2θ (°): 4,6, 6,5, 11,0, 18,0, 21,2

До сполуки (100 мг), отриманої в прикладі 15, стадія (2), додавали 1,4-діоксан (100 мкл), і розчиняли сполуку при нагріванні реакційної суміші на водяній бані при 80 °C. Цей розчин перемішували при охолодженні на льоді з випаданням в осад кристалічних речовин. Отримані кристалічні речовини сушили в умовах зниженого тиску з одержанням сольвату 1,4-діоксану.

40 Елементний аналіз:

Виявлене: C 57,83 %, H 9,08 %, N 4,84 %, S 2,73

Точка плавлення: 100-125 °C

TG/DTA (пік): 71,0 °C, 122,5 °C

XRD пік 2θ (°): 5,3, 7,3, 9,9, 10,3, 12,3

45 Сполуку (2,53 г), отриману в прикладі 15, стадія (2), перекристалізовували з діетилового ефіру/гексану, і отримані кристалічні речовини збирали шляхом фільтрування з одержанням сполуки (1,92 г) з наступними ідентифікованими фізико-хімічними даними.

Точка плавлення: 105-127 °C

TG/DTA (пік): 127,9 °C

XRD пік 2θ (°): 6,1, 10,3, 15,3, 18,5

50 Сполуку (1,00 г), отриману в прикладі 15, стадія (2), перекристалізовували з метанолу (20 мл)/води (15 мл), а потім розчиняли при нагріванні зі зворотним холодильником протягом 15 хвилин. Розчин перемішували протягом ночі при кімнатній температурі, отримані кристалічні речовини збирали шляхом фільтрування й промивали метанолом/водою = 1/2 з одержанням сполуки (682 мг) з наступними ідентифікованими фізико-хімічними даними.

55 Точка плавлення: 155-164 °C

TG/DTA (пік): 158,1 °C

XRD пік 2θ (°): 10,0, 12,5, 12,9, 15,8, 17,4, 18,7, 19,9

60 До сполуки (100 мг), отриманої в прикладі 15, стадія (2), додавали етанол (100 мкл), і повністю розчиняли сполуку при нагріванні реакційної суміші на водяній бані при 80 °C. Цей розчин перемішували при охолодженні на льоді з випаданням в осад кристалічних речовин.

Отримані кристалічні речовини сушили в умовах зниженого тиску з одержанням сполуки з наступними ідентифікованими фізико-хімічними даними.

Ця сполука також може бути отримана наступним шляхом. А саме, до сполуки (100 мг), отриманої в прикладі 15, стадія (2), при нагріванні на водяній бані при 80 °C додавали очищену воду (2 мл), а потім до суміші додавали етанол (2 мл) для повного розчинення сполуки. Цей розчин перемішували при охолодженні на льоді з випаданням в осад кристалічних речовин. Отримані кристалічні речовини сушили в умовах зниженого тиску з одержанням сполуки з наступними ідентифікованими фізико-хімічними даними.

Точка плавлення: 106-115 °C

TG/DTA (пік): 102,3 °C, 124,2 °C

XRD пік 2θ (°): 4,4, 5,1, 6,8, 10,9, 12,5

Сольват 1-пропанолу сполуки (50 мг), отриманої в прикладі 15, стадія (2), нагрівали при 100 °C протягом 15 хвилин з одержанням сполуки з наступними ідентифікованими фізико-хімічними даними.

Точка плавлення: 110-126 °C

TG/DTA (пік): 119,7 °C

XRD пік 2θ (°): 5,1, 10,3, 11,2, 13,4, 16,0, 16,9, 18,6

Приклад 16

(1) Карбаматну сполуку (117 мг) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 15, стадія (1), шляхом використання сполуки (300 мг), представленої формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і гідрохлориду 2-аміноетилметилсульфону (273 мг) як вихідних речовин.

(2) Сполуку (57,7 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 15, стадія (2), шляхом використання сполуки (115 мг), отриманої на описаний вище стадії (1), як вихідної речовини.

Сполуку (88,65 г), отриману способом, описаним у прикладі 16, стадія (2), розчиняли в метанолі при 55 °C, до розчину додавали воду для насичення розчину, а потім перемішували отриману суміш протягом ночі при кімнатній температурі з випаданням в осад кристалічних речовин. Отримані кристалічні речовини збирали шляхом фільтрування й сушили в умовах зниженого тиску з одержанням сполуки з наступними ідентифікованими фізико-хімічними даними (68,26 г).

Точка плавлення: 128-136 °C

DSC (пік): 135,8 °C

XRD пік 2θ (°): 10,3, 11,5, 13,5, 15,3, 16,1, 18,7

Приклад 17

Сполуку (21 мг), представлену в таблиці 1, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 15, стадія (1), у прикладі 2, стадія (2), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (200 мг), представленої формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і гідрохлориду 2-(1,3-бензотіазол-2-іл)етанаміну (200 мг) як вихідних речовин.

Приклад 18

Сполуку (37 мг), представлену в таблиці 1, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 15, стадія (1), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (200 мг), представленої формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і 2-імідазо[1,2-A]піридин-2-ілетанаміну гідрохлориду (184 мг) як вихідних речовин.

Приклад 19

Сполуку (38,0 мг), представлену в таблиці 1, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 2, стадії (1) і (2), і в прикладі 15, стадія (2), шляхом використання сполуки (300 мг), представленої формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і бутиламіну (170 мкл) як вихідних речовин.

Приклад 20

(1) Деацетиловану сполуку (110 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 2, стадії (1) і (2), шляхом використання сполуки (300 мг), представленої формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і 3-(метилтіо)пропіламіну (187 мкл) як вихідних речовин.

(2) Сполуку (65,8 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 15, стадія (2), шляхом використання сполуки (110 мг), отриманої на описаний вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 21

Сполуку (50,1 мг), представлену в таблиці 1, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 2, стадії (1) і (2), і в прикладі 15, стадія (2), шляхом використання сполуки (450 мг), представленої формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і 3-метоксипропіламіну (175 мкл) як вихідних речовин.

Приклад 22

(1) Деацетиловану сполуку (346 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 2, стадія (1), і в прикладі 4, стадія (6), шляхом використання сполуки (450 мг), представленої формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і сполуки (356 мг), отриманої в довідковому прикладі 65, як вихідних речовин.

(2) Сполуку (69,7 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання сполуки (100 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 23

Сполуку (69,6 мг), представлену в таблиці 1, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 2, стадії (1) і (2), і в прикладі 15, стадія (2), шляхом використання сполуки (178 мг), представленої формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і 3-(фенілтіо)-1-пропанаміну (170 мг) як вихідних речовин.

Приклад 24

Сполуку (51,3 мг), представлену в таблиці 1, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 2, стадії (1) і (2), і в прикладі 15, стадія (2), шляхом використання сполуки (203 мг), представленої формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і 3-(бензолсульфоніл)пропан-1-аміну (230 мг) як вихідних речовин.

Приклад 25

(1) Деацетиловану сполуку (281 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 2, стадія (1), і в прикладі 4, стадія (6), шляхом використання сполуки (350 мг), представленої формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і 2-(бензилокси)-1-етанаміну (301 мг) як вихідних речовин.

(2) Сполуку (78 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання сполуки (100 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 26

Сполуку (15,6 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (150 мг), отриманої в прикладі 15, стадія (1), і сполуки (255 мг), отриманої в довідковому прикладі 1, як вихідних речовин.

Приклад 27

Сполуку (34,5 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (150 мг), отриманої в прикладі 16, стадія (1), і сполуки (229 мг), отриманої в довідковому прикладі 1, як вихідних речовин.

Приклад 28

Сполуку (94 мг), представлену в таблиці 1, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 15, стадія (1), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (190 мг), представленої формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і сполуки (130 мг), отриманої в довідковому прикладі 66, як вихідних речовин.

Приклад 29

Сполуку (85 мг), представлену в таблиці 1, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 15, стадія (1), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (190 мг), представленої формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і сполуки (121 мг), отриманої в довідковому прикладі 67, як вихідних речовин.

Приклад 30

Сполуку (64,8 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (100 мг), отриманої в прикладі 20, стадія (1), і сполуки (102 мг), отриманої в довідковому прикладі 2, як вихідних речовин.

Приклад 31

(1) Деацетиловану сполуку (2,46 г) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 15, стадія (1), і в прикладі 2, стадія (2), шляхом використання сполуки (5,0 г), представленої формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і 2-аміноетилметилсульфону гідрохлориду (2,73 г) як вихідних речовин.

(2) Сполуку (87,2 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (200 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), і сполуки (178 мг), отриманої в довідковому прикладі 3, як вихідних речовин.

Приклад 32

Сполуку, представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (200 мг), отриманої в прикладі 31, стадія (1), і сполуки (162 мг), отриманої в довідковому прикладі 4, як вихідних речовин.

Приклад 33

Сполуку, представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (200 мг), отриманої в прикладі 31, стадія (1), і сполуки (175 мг), отриманої в довідковому прикладі 5, як вихідних речовин.

5 Приклад 34

(1) Деацетиловану сполуку (641 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 15, стадія (1), і в прикладі 4, стадія (6), шляхом використання сполуки (1,68 г), представлені формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і сполуки (1,5 г), отриманої в довідковому прикладі 111, як вихідних речовин.

10 (2) Сполуку (43 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання сполуки (200 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 35

15 (1) Деацетиловану сполуку (574 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 15, стадія (1), і в прикладі 2, стадія (2), шляхом використання сполуки (1,00 г), представлені формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і 3-метансульфонілпропіламіну гідрохлориду (0,99 г) як вихідних речовин.

20 (2) Сполуку (36,3 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (120 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), і сполуки (118 мг), отриманої в довідковому прикладі 2, як вихідних речовин.

Приклад 36

(1) Деацетиловану сполуку (522 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 2, стадії (1) і (2), шляхом використання сполуки (600 мг), представлені формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і 2-(метилтіо)етиламіну (639 мг) як вихідних речовин.

25 (2) Сполуку (43 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання сполуки (100 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 37

30 Сполуку (35,7 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (100 мг), отриманої в прикладі 36, стадія (1), і сполуки (103 мг), отриманої в довідковому прикладі 2, як вихідних речовин.

Приклад 38

35 Сполуку (34,2 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (105 мг), отриманої в прикладі 35, стадія (1), і сполуки (83,6 мг), отриманої в довідковому прикладі 4, як вихідних речовин.

Сполуку (88,46 г), отриману способом, описаним у прикладі 38, розчиняли в метанолі при 55 °C, до розчину додавали воду для насичення розчину, а потім перемішували отриману суміш протягом ночі при кімнатній температурі з випаданням в осад кристалічних речовин. Отримані кристалічні речовини збирали шляхом фільтрування й сушили в умовах зниженого тиску з одержанням сполуки з наступними ідентифікованими фізико-хімічними даними (68,07 г).

Точка плавлення: 121-124 °C

DSC (пік): 125,5 °C

XRD пік 2θ (°): 10,3, 11,6, 13,3, 15,1, 16,0, 18,6

Приклад 39

45 Сполуку (34,9 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (105 мг), отриманої в прикладі 35, стадія (1), і сполуки (90,6 мг), отриманої в довідковому прикладі 5, як вихідних речовин.

Приклад 40

50 Сполуку (28,7 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (105 мг), отриманої в прикладі 35, стадія (1), і сполуки (91,8 мг), отриманої в довідковому прикладі 3, як вихідних речовин.

Приклад 41

55 Сполуку (65,5 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (100 мг), отриманої в прикладі 20, стадія (1), і сполуки (48,9 мг), отриманої в довідковому прикладі 1, як вихідних речовин.

Приклад 42

Сполуку (920 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (1000 мг), отриманої в прикладі 1, стадія (7), і сполуки (337 мг), отриманої в довідковому прикладі 5, як вихідних речовин.

60 Приклад 43

Сполуку (72 мг), представлену в таблиці 1, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 2, стадія (1), у прикладі 4, стадія (6), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (300 мг), представлені формулою (A) і отримані в прикладі 1, стадія (5), і сполуки (260 мг), отримані в довідковому прикладі 78, як вихідних речовин.

5 Приклад 44

(1) Карбаматну сполуку (224 мг) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (1), шляхом використання сполуки (250 мг), представлені формулою (A) і отримані в прикладі 1, стадія (5), і сполуки (165 мг), отримані в довідковому прикладі 79, як вихідних речовин.

10 (2) Деацетиловану сполуку (184 мг) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (6), шляхом використання сполуки (206 мг), отримані на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

(3) Сполуку (39 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання сполуки (50 мг), отримані на описаній вище стадії (2), як вихідної речовини.

15 Приклад 45

(1) Деацетиловану сполуку (202 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 2, стадія (1), і в прикладі 4, стадія (6), шляхом використання сполуки (250 мг), представлені формулою (A) і отримані в прикладі 1, стадія (5), і β-аланінамід (177 мг) як вихідних речовин.

20 (2) Сполуку (38 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання сполуки (60 мг), отримані на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 46

25 (1) Карбаматну сполуку (103 мг) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (1), шляхом використання сполуки (125 мг), представлені формулою (A) і отримані в прикладі 1, стадія (5), і сполуки (94 мг), отримані в довідковому прикладі 80, як вихідних речовин.

30 (2) Сполуку (103 мг), отриману на описаній вище стадії (1), розчиняли в метанолі, і перемішували розчин при 75 °C протягом 20 хвилин і при 80 °C протягом 75 хвилин в умовах мікрохвильової обробки. Реакційну суміш концентрували як є з одержанням деацетилованої сполуки (99 мг).

(3) Сполуку (48 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання сполуки (50 мг), отримані на описаній вище стадії (2), як вихідної речовини.

35 Приклад 47

Сполуку (41 мг), представлену в таблиці 1, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 2, стадії (1) і (2), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (100 мг), представлені формулою (A) і отримані в прикладі 1, стадія (5), і 1-(2-аміноетил)імідазолін-2-ону (74 мг) як вихідних речовин.

40 Приклад 48

(1) Деацетиловану сполуку (98,5 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 2, стадії (1) і (2), шляхом використання сполуки (200 мг), представлені формулою (A) і отримані в прикладі 1, стадія (5), і сполуки (157 мг), отримані в довідковому прикладі 82, як вихідних речовин.

45 (2) Сполуку (43,2 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання сполуки (50 мг), отримані на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 49

50 (1) Деацетиловану сполуку (148 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 2, стадія (1), і в прикладі 4, стадія (6), шляхом використання сполуки (200 мг), представлені формулою (A) і отримані в прикладі 1, стадія (5), і 4-фенілбутан-1-аміну (170 мг) як вихідних речовин.

55 (2) Сполуку (43,7 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання сполуки (50 мг), отримані на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 50

60 (1) Деацетиловану сполуку (122 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 2, стадія (1), і в прикладі 4, стадія (6), шляхом використання сполуки (200 мг), представлені формулою (A) і отримані в прикладі 1, стадія (5), і 3-феноксипропан-1-аміну (172 мг) як вихідних речовин.

(2) Сполуку (39,8 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання сполуки (50 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 51

5 Сполуку (39 мг), представлену в таблиці 1, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 2, стадія (1), у прикладі 4, стадія (6), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (100 мг), представлені формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і сполуки (78 мг), отриманої в довідковому прикладі 84, як вихідних речовин.

Приклад 52

10 (1) Деацетиловану сполуку (125 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 2, стадії (1) і (2), шляхом використання сполуки (200 мг), представлені формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і сполуки (228 мг), отриманої в довідковому прикладі 85, як вихідних речовин.

15 (2) Сполуку (37,9 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання сполуки (50 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 53

20 (1) Деацетиловану сполуку (72 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 4, стадія (1), і в прикладі 2, стадія (2), шляхом використання сполуки (100 мг), представлені формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і 4-(2-аміноетил)тіоморфолін-1,1-діоксиду (102 мг) як вихідних речовин.

25 (2) Сполуку (69 мг), отриману на описаній вище стадії (1), розчиняли в суміші етанолу й диметилформаміду (1/2, 450 мкл), до розчину додавали N,N-діетил-N'-метилетан-1,2-діамін (25 мкл), і перемішували отриману суміш при 75 °C протягом 19 годин. До реакційної суміші додавали етилацетат і дистильовану воду, і розділяли шари. Органічний шар послідовно промивали двічі дистильованою водою й насиченим водним хлоридом натрію, а потім сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом препаративної тонкошарової хроматографії (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 10/1/0,1) з одержанням сполуки (58 мг),
30 представлені в таблиці 1.

Приклад 54

35 Сполуку (43 мг), представлену в таблиці 1, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 4, стадія (1), у прикладі 2, стадія (2), і в прикладі 53, стадія (2), шляхом використання сполуки (100 мг), представлені формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і сполуки (86 мг), отриманої в довідковому прикладі 83, як вихідних речовин.

Приклад 55

40 (1) Карбаматну сполуку (14,4 г) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (1), шляхом використання представлені формулою (SM1) сполуки (30 г), отриманої способом, описаним у міжнародній патентній публікації WO 93/21199, і етилендіаміну (22,1 мл) як вихідних речовин.

45 (2) Сполуку (11,0 г), отриману на описаній вище стадії (1), розчиняли в хлористому метилені (150 мл), до розчину додавали 3-формілпіридин (1,26 мл) і триацетоксиборгідрид натрію (5,18 г), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 4 годин. До реакційної суміші додавали 37 % водний формальдегід (2,97 мл) і триацетоксиборгідрид натрію (3,89 г), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 5 годин. До реакційної суміші додавали хлороформ і насичений водний гідрокарбонат натрію, і розділяли шари. Органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували, і концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску. Отриманий залишок очищали методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 10/1/0,1), отриманий продукт розчиняли в ацетонітрилі, і збирали тверду речовину, яка випала в осад, шляхом фільтрування з одержанням N-алкільної сполуки (6,36 г).

(3) Кетоніву сполуку (3,51 г) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 2, стадія (2), у прикладі 1, стадія (1), у прикладі 6, стадія (3), і в прикладі 4, стадія (6), шляхом використання сполуки (8,0 г), отриманої на описаній вище стадії (2), як вихідної речовини.

55 (4) Епоксисполуку (463 мг) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 1, стадія (4), шляхом використання сполуки (500 мг), отриманої на описаній вище стадії (3), як вихідної речовини.

60 (5) Сполуку (16,7 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (50 мг), отриманої на описаній вище стадії (4), і сполуки (38 мг), отриманої в довідковому прикладі 104, як вихідних речовин.

Приклад 56

Сполуку (12 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (50 мг), отриманої в прикладі 55, стадія (4), і N,N,N'-триметилетилен-1,2-діаміну (22 мг) як вихідних речовин.

5 Приклад 57

Сполуку (31,4 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (52 мг), отриманої в прикладі 55, стадія (4), і 50 % водного диметиламіну (2 мл) як вихідних речовин.

Приклад 58

10 (1) Деацетиловану сполуку (220 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 4, стадія (1), і в прикладі 4, стадія (6), шляхом використання сполуки (500 мг), представленої формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і 1-(3-амінопропіл)піролідін-2-ону (405 мг) як вихідних речовин.

15 (2) Сполуку (56,8 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (100 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), і N,N,N'-триметилетилен-1,2-діаміну (56 мг) як вихідних речовин.

Приклад 59

20 (1) Деацетиловану сполуку (0,75 г) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 4, стадії (1) і (6), шляхом використання сполуки (1,83 г), представленої формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і N-(4-амінобутил)піримідин-2-аміну (1,74 г) як вихідних речовин.

(2) Сполуку (119 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 15, стадія (2), шляхом використання сполуки (107 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

25 Приклад 60

Сполуку (61 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (50 мг), отриманої в прикладі 59, стадія (1), і N-ізопропілметиламіну (56 мг) як вихідних речовин.

Приклад 61

30 Сполуку (58 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (50 мг), отриманої в прикладі 59, стадія (1), і N-етилметиламіну (46 мкл) як вихідних речовин.

Приклад 62

35 Сполуку (50 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (50 мг), отриманої в прикладі 59, стадія (1), і 2-(метиламіно)етанолу (40 мг) як вихідних речовин.

Приклад 63

40 Сполуку (55 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (50 мг), отриманої в прикладі 59, стадія (1), і N-(2-метоксіетил)метиламіну (48 мг) як вихідних речовин.

Приклад 64

45 (1) Деацетиловану сполуку (112 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 4, стадія (1), і в прикладі 4, стадія (6), шляхом використання сполуки (500 мг), представленої формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і сполуки (595 мг), отриманої в довідковому прикладі 68, як вихідних речовин.

(2) Сполуку (29,3 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання сполуки (36 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 65

50 Сполуку (27,2 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (36 мг), отриманої в прикладі 64, стадія (1), як вихідної речовини.

Приклад 66

55 Сполуку (32,8 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (36 мг), отриманої в прикладі 64, стадія (1), і 50 % водного диметиламіну (16,9 мкл) як вихідних речовин.

Приклад 67

Сполуку (55,6 мг), представлену в таблиці 1, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 4, стадія (1), у прикладі 4, стадія (6), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки

(500 мг), представленої формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і сполуки (632 мг), отриманої в довідковому прикладі 69, як вихідних речовин.

Приклад 68

(1) Деацетиловану сполуку (178 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 4, стадія (1), і в прикладі 4, стадія (6), шляхом використання сполуки (250 мг), представленої формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і сполуки (217 мг), отриманої в довідковому прикладі 77, як вихідних речовин.

(2) Сполуку (44,8 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання сполуки (50 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 69

Сполуку (24 мг), представлену в таблиці 1, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 4, стадії (1) і (6), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (100 мг), представленої формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і 3-фенілпропіламіну (80 мкл) як вихідних речовин.

Приклад 70

(1) Деацетиловану сполуку (162 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 4, стадія (1), і в прикладі 4, стадія (6), шляхом використання сполуки (250 мг), представленої формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і сполуки (150,7 мг), отриманої в довідковому прикладі 81, як вихідних речовин.

(2) Сполуку (34,6 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання сполуки (50 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 71

(1) Карбаматну сполуку (1,71 г) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (1), шляхом використання сполуки (2 г), представленої формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і 1,3-пропандіаміну (844 мг) як вихідних речовин.

(2) Сполуку (500 мг), отриману на описаній вище стадії (1), і триетиламін (233 мкл) розчиняли в хлороформі (5 мл), до розчину при охолодженні на льоді додавали метансульфонілхлорид (65 мкл), і перемішували отриману суміш протягом 30 хвилин. До реакційної суміші додавали насичений водний гідрокарбонат натрію, і розділяли шари. Органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 50/1/0,1→9/1/0,1) з одержанням метансульфонільної сполуки (412 мг).

(3) Сполуку зі знятим захистом одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (6), шляхом використання сполуки (412 мг), отриманої на описаній вище стадії (2), як вихідної речовини.

(4) Сполуку (33 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання сполуки (100 мг), отриманої на описаній вище стадії (3), як вихідної речовини.

Приклад 72

(1) Сполуку (200 мг), отриману в прикладі 71, стадія (1), розчиняли в хлороформі (5 мл), до розчину при охолодженні на льоді додавали піридин (37 мкл) і оцтовий ангідрид (32 мкл), і перемішували отриману суміш протягом 2 годин при нагріванні до кімнатної температури. До реакційної суміші додавали оцтовий ангідрид (32 мкл), і перемішували отриману суміш протягом 1 години. Потім до реакційної суміші додавали насичений водний гідрокарбонат натрію, розділяли шари, отриманий органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 10/1/0,1) з одержанням ацетильної сполуки (169 мг).

(2) Сполуку (3 мг), представлену в таблиці 1, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 2, стадія (2), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (169 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 73

(1) Сполуку (200 мг), отриману в прикладі 71, стадія (1), розчиняли в хлороформі (5 мл), до розчину додавали 37% водний формальдегід (184 мкл) і триацетоксиборгідрид натрію (120 мг), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 2 годин. До реакційної суміші додавали насичений водний гідрокарбонат натрію, і розділяли шари. Органічний шар концентрували в умовах зниженого тиску з одержанням залишку. Отриманий залишок очищали

методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ → хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 12/1/0,1) з одержанням диметильної сполуки (172 мг).

(2) Сполуку (14 мг), представлену в таблиці 1, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 2, стадія (2), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (172 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 74

(1) Карбаматну сполуку (1,63 г) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (1), шляхом використання сполуки (2 г), представленної формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і 1,4-бутандіаміну (1 г) як вихідної речовини.

(2) Сполуку (81 мг), представлену в таблиці 1, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 71, стадія (2), у прикладі 4, стадія (6), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (500 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 75

Сполуку (16 мг), представлену в таблиці 1, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 71, стадія (2), у прикладі 4, стадія (6), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (200 мг), отриманої в прикладі 74, стадія (1), і оцтового ангідриду (32 мкл) як вихідних речовин.

Приклад 76

Сполуку (25 мг), представлену в таблиці 1, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 71, стадія (2), у прикладі 4, стадія (6), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (200 мг), отриманої в прикладі 74, стадія (1), і метилхлороформіату (26 мкл) як вихідних речовин.

Приклад 77

Сполуку (60 мг), представлену в таблиці 1, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 4, стадія (1), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (500 мг), представленної формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і сполуки (0,89 г), отриманої в довідковому прикладі 70, як вихідних речовин.

Приклад 78

(1) Карбаматну сполуку (833 мг) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (1), шляхом використання сполуки (1,0 г), представленної формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і N-бензил-N-метилетан-1,2-діаміну (935 мг) як вихідних речовин.

(2) Сполуку (65 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання сполуки (150 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 79

(1) Сполуку (480 мг), отриману в прикладі 78, стадія (1), розчиняли в тетрагідрофурані (10 мл), до розчину додавали 20 % гідроксид паладію на вугіллі (200 мг), і перемішували отриману суміш протягом ночі при кімнатній температурі під тиском 1 атм водню. Реакційну суміш фільтрували, а потім концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску. Отриманий залишок розчиняли в етанолі (10 мл), до розчину додавали 20 % гідроксид паладію на вугіллі (200 мг), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 3 годин під тиском 1 атм водню. Реакційну суміш фільтрували, а потім концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску з одержанням дебензилованої сполуки (396 мг).

(2) Сполуку (53 мг), представлену в таблиці 1, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 71, стадії (2) і (4), шляхом використання сполуки (100 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), і бензоїлхлориду (20 мкл) як вихідних речовин.

Приклад 80

Сполуку (87 мг), представлену в таблиці 1, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 71, стадії (2) і (4), шляхом використання сполуки (290 мг), отриманої в прикладі 79, стадія (1), і бензолсульфонілхлориду (87 мг) як вихідних речовин.

Приклад 81

(1) Карбаматну сполуку (914 мг) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (1), шляхом використання сполуки (1,0 г), представленної формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і 3-амінопропанолу (0,87 мл) як вихідних речовин.

(2) Ацетильну сполуку (176 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 11 і прикладі 1, стадія (1), шляхом використання сполуки (192 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

(3) Хлорсульфонілізоціанат (48 мкл) і мурашину кислоту (21 мкл) розчиняли в ацетонітрилі (1,0 мл) при охолодженні на льоді, і перемішували отриману суміш протягом 5 годин при нагріванні до кімнатної температури. До реакційної суміші при охолодженні на льоді по краплях додавали розчин сполуки (176 мг), отриманої на описаній вище стадії (2), у диметилацетаміді (2

мл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 1 години. До реакційної суміші додавали дистильовану воду й хлороформ, і розділяли шари. Органічний шар концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ → хлороформ/метанол/28% водний аміак = 10/1/0,1) з одержанням сульфаматної сполуки (217 мг).

(4) Сполуку (27,5 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (6), шляхом використання сполуки (120,4 мг), отриманої на описаній вище стадії (3), як вихідної речовини.

Приклад 82

Сполуку (13 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 73, стадія (1), шляхом використання сполуки (30 мг), отриманої в прикладі 29, як вихідної речовини.

Приклад 83

Сполуку (182 мг), представлену в таблиці 1, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 1, стадія (1), у прикладі 81, стадія (3), і в прикладі 4, стадія (6), шляхом використання сполуки (910 мг), отриманої в прикладі 42, як вихідної речовини.

Приклад 84

(1) Сполуку (455 мг), представлену формулою (A) і отриману в прикладі 1, стадія (5), розчиняли в диметилформаміді (10 мл), до розчину додавали 1,1,3,3-тетраметилгуанідин (324 мкл) і сполуку (586 мг), отриману в довідковому прикладі 71, і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 6 діб. Реакційну суміш розбавляли етилацетатом, і промивали розведену реакційну суміш насиченим водним хлоридом амонію й насиченим водним хлоридом натрію. Органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували, потім фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали частину отриманого залишку методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 100/1/0,1 → 3/1/0,1) з одержанням карбаматної сполуки (77,1 мг).

(2) Сполуку (34,4 мг), представлену в таблиці 1, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 2, стадія (2), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (75,0 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 85

(1) Карбаматну сполуку (756 мг) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (1), шляхом використання сполуки (1,5 г), представлені формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і 1,2-етилендіаміну (513 мг) як вихідних речовин.

(2) Сполуку (58 мг), представлену в таблиці 1, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 73, стадія (1), у прикладі 2, стадія (2), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (100 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 86

(1) Метансульфонільну сполуку (264 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 71, стадія (2), і в прикладі 2, стадія (2), шляхом використання сполуки (369 мг), отриманої в прикладі 85, стадія (1), як вихідної речовини.

(2) Сполуку (54 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (54 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), і N,N,N'-триметилетен-1,2-діаміну (60 мг) як вихідних речовин.

Приклад 87

Сполуку (54 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 15, стадія (2), шляхом використання сполуки (100 мг), отриманої в прикладі 86, стадія (1), як вихідної речовини.

Приклад 88

Сполуку (80 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (100 мг), отриманої в прикладі 86, стадія (1), і сполуки (79,4 мг), отриманої в довідковому прикладі 1, як вихідних речовин.

Приклад 89

Сполуку (105 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (100 мг), отриманої в прикладі 86, стадія (1), і сполуки (78,7 мг), отриманої в довідковому прикладі 2, як вихідних речовин.

Приклад 90

Сполуку (116 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (107 мг), отриманої в прикладі 86, стадія (1), і сполуки (0,51 г), отриманої в довідковому прикладі 6, як вихідних речовин.

Приклад 91

(1) Деацетиловану сполуку (140 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 71, стадія (2), і в прикладі 2, стадія (2), шляхом використання сполуки (200 мг), отриманої в прикладі 85, стадія (1), і 4-метоксибензолсульфонілхлориду (71 мг) як вихідних речовин.

5 (2) Сполуку (78,2 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання сполуки (103 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 115

10 (1) Деацетиловану сполуку (176 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 71, стадія (2), і в прикладі 2, стадія (2), шляхом використання сполуки (200 мг), отриманої в прикладі 85, стадія (1), і 3-метоксибензолсульфонілхлориду (49 мкл) як вихідних речовин.

(2) Сполуку (78,3 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання сполуки (99,3 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 116

15 (1) Деацетиловану сполуку (185 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 71, стадія (2), і в прикладі 2, стадія (2), шляхом використання сполуки (250 мг), отриманої в прикладі 85, стадія (1), і 2-метоксибензолсульфонілхлориду (89 мг) як вихідних речовин.

20 (2) Сполуку (108 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання сполуки (106 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 117

25 Сполуку (38,2 мг), представлену в таблиці 1, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 71, стадія (2), у прикладі 2, стадія (2), і в прикладі 15, стадія (2), шляхом використання сполуки (200 мг), отриманої в прикладі 85, стадія (1), і 2-метилбензолсульфонілхлориду (49 мкл) як вихідних речовин.

Приклад 118

30 Сполуку (52,1 мг), представлену в таблиці 1, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 71, стадія (2), у прикладі 2, стадія (2), і в прикладі 15, стадія (2), шляхом використання сполуки (200 мг), отриманої в прикладі 85, стадія (1), і 3-метилбензолсульфонілхлориду (50 мкл) як вихідних речовин.

Приклад 119

35 Сполуку (78,9 мг), представлену в таблиці 1, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 71, стадія (2), у прикладі 2, стадія (2), і в прикладі 15, стадія (2), шляхом використання сполуки (200 мг), отриманої в прикладі 85, стадія (1), і 4-метилбензолсульфонілхлориду (66 мг) як вихідних речовин.

Приклад 120

40 (1) Деацетиловану сполуку (192 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 71, стадія (2), і в прикладі 2, стадія (2), шляхом використання сполуки (200 мг), отриманої в прикладі 85, стадія (1), і 1-метил-1Н-піразол-3-сульфонілхлориду (62 мг) як вихідних речовин.

(2) Сполуку (46,1 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання сполуки (101 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 121

45 (1) Деацетиловану сполуку (462 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 71, стадія (2), і в прикладі 4, стадія (6), шляхом використання сполуки (720 мг), отриманої в прикладі 85, стадія (1), і піридин-3-сульфонілхлориду гідрохлориду (265 мг) як вихідних речовин.

(2) Сполуку (78 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (160 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), і 50% водного диметиламіну (1,0 мл) як вихідних речовин.

50 Приклад 122

Сполуку (73 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (160 мг), отриманої в прикладі 121, стадія (1), як вихідної речовини.

Приклад 123

55 Сполуку (69 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання сполуки (160 мг), отриманої в прикладі 121, стадія (1), як вихідної речовини.

Приклад 124

Сполуку (214 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (500 мг), отриманої в прикладі 112, стадія (1), як вихідної речовини.

Приклад 125

5 Сполуку (254 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (500 мг), отриманої в прикладі 112, стадія (1), і сполуки (367 мг), отриманої в довідковому прикладі 1, як вихідних речовин.

Приклад 126

10 (1) Деацетиловану сполуку (230 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 71, стадія (2), і в прикладі 2, стадія (2), шляхом використання сполуки (650 мг), отриманої в прикладі 85, стадія (1), і 2-тіофенсульфонілу (272 мг) як вихідних речовин.

(2) Сполуку (29 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (50 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

15 Приклад 127

Сполуку (36 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (50 мг), отриманої в прикладі 126, стадія (1), і сполуки (36,5 мг), отриманої в довідковому прикладі 1, як вихідних речовин.

Приклад 128

20 (1) Сполуку (80 мг), отриману в прикладі 85, стадія (1), розчиняли в хлороформі (800 мкл), до розчину додавали триетиламін (38,4 мкл), і охолоджували отриману суміш на льоді. До реакційної суміші додавали диметилсульфамойлхлорид (24,2 мкл), отриману суміш нагрівали до кімнатної температури, потім до суміші додавали 4-диметиламінопіридин (2,2 мг), і перемішували отриману суміш протягом 24 годин. До реакційної суміші додавали насичений водний гідрокарбонат натрію, і розділяли шари. Органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом препаративної тонкошарової хроматографії (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 15/1/0,1) з одержанням диметилсульфамойльної сполуки (70 мг).

30 (2) Сполуку (37 мг), представлену в таблиці 1, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 2, стадія (2), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (70 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 129

35 (1) Сполуку (80 мг), отриману в прикладі 85, стадія (1), розчиняли в хлористому метилені (2 мл), до розчину при охолодженні на льоді додавали триетиламін (20 мкл) і трифторметансульфоновий ангідрид (20 мкл), і перемішували отриману суміш при тій же температурі протягом 30 хвилин. До реакційної суміші додавали насичений водний гідрокарбонат натрію й етилацетат, і розділяли шари. Органічний шар промивали дистильованою водою й насиченим водним хлоридом натрію, а потім сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом препаративної тонкошарової хроматографії (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 15/1/0,1) з одержанням трифторацетильної сполуки (67 мг).

40 (2) Сполуку (64 мг), отриману на описаній вище стадії (1), розчиняли в метанолі (2,5 мл), до розчину додавали 1,8-діазабіцикло[5.4.0]-7-ундецен (2,7 мкл), і перемішували отриману суміш при 60°C протягом 18 годин. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом препаративної тонкошарової хроматографії (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 15/1/0,1) з одержанням сполуки зі знятим захистом (47 мг).

50 (3) Сполуку (45 мг), отриману на описаній вище стадії (2), розчиняли в етанолі (200 мкл), до розчину додавали N,N-діетил-N'-метилетан-1,2-діамін (25 мкл), і перемішували отриману суміш при 75°C протягом 17 годин. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом препаративної тонкошарової хроматографії (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 10/1/0,1) з одержанням сполуки (38 мг), представлені в таблиці 1.

Приклад 130

60 Сполуку (6,1 мг), представлену в таблиці 1, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 128, стадія (1), у прикладі 2, стадія (2), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (80 мг), отриманої в прикладі 85, стадія (1), і сполуки (31,8 мг), отриманої в довідковому прикладі 86, як вихідних речовин.

Приклад 131

Сполуку (50 мг), представлену в таблиці 1, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 128, стадія (1), у прикладі 2, стадія (2), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (80 мг), отриманої в прикладі 85, стадія (1), і сполуки (17,9 мг), отриманої в довідковому прикладі 87, як вихідних речовин.

Приклад 132

Сполуку (38 мг), представлену в таблиці 1, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 71, стадія (2), у прикладі 2, стадія (2), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (3 г), отриманої в прикладі 85, стадія (1), і метил-2-(хлорсульфоніл)бензоату (108 мг) як вихідних речовин.

Приклад 133

(1) Сполуку (1,0 г), отриману в прикладі 86, стадія (1), розчиняли в етанолі (4 мл), до розчину додавали 40 % водний метиламін (1,0 мл), і перемішували отриману суміш протягом ночі при нагріванні зі зворотним холодильником. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 100/1/0,1→10/1/0,1) з одержанням сполуки-аддукту (837 мг).

(2) Сполуку (50 мг), отриману на описаній вище стадії (1), розчиняли в хлороформі (1,0 мл), до розчину додавали ізопропілізоціанат (5,2 мкл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 1 години. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом препаративної тонкошарової хроматографії (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 10/1/0,1) з одержанням сполуки (43,3 мг), представленої в таблиці 1.

Приклад 134

Сполуку (59,8 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 133, стадія (2), шляхом використання сполуки (50 мг), отриманої в прикладі 133, стадія (1), і 1-ізоціанато-2-метилпропану (5,3 мг) як вихідних речовин.

Приклад 135

(1) Карбаматну сполуку (89 мг) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 71, стадія (2), шляхом використання сполуки (100 мг), отриманої в прикладі 85, стадія (1), і метилхлороформіату (16 мг) як вихідних речовин.

(2) Сполуку (56 мг), представлену в таблиці 1, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 2, стадія (2), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (89 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 136

Сполуку (62 мг), представлену в таблиці 1, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 1, стадія (1), у прикладі 2, стадія (2), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (100 мг), отриманої в прикладі 85, стадія (1), як вихідної речовини.

Приклад 137

(1) Сполуку (200 мг), отриману в прикладі 85, стадія (1), розчиняли в хлороформі (5 мл), до розчину при охолодженні на льоді додавали триетиламін (96 мкл) і трифтороцтовий ангідрид (49 мкл), і перемішували отриману суміш протягом 1 години. До реакційної суміші додавали насичений водний гідрокарбонат натрію, і розділяли шари. Органічний шар концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 100/1/0,1→10/1/0,1) з одержанням трифторацетильної сполуки (230 мг).

(2) Сполуку (19 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання сполуки (100 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 138

Сполуку (81 мг), представлену в таблиці 1, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 71, стадія (2), у прикладі 2, стадія (2), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (150 мг), отриманої в прикладі 85, стадія (1), і бензоїлхлориду (29,7 мкл) як вихідних речовин.

Приклад 139

(1) Сполуку (100 мг), отриману в прикладі 85, стадія (1), розчиняли в хлороформі (1 мл), до розчину додавали піридин (93 мкл), і охолоджували отриману суміш на льоді. До реакційної суміші порціями додавали трифосген (68,3 мг), і перемішували отриману суміш протягом 10 хвилин. Потім до суміші додавали 37 % водний аміак (1 мл), і перемішували отриману суміш протягом 1 години. До реакційної суміші додавали насичений водний гідрокарбонат натрію й

хлороформ, і розділяли шари. Органічний шар концентрували в умовах зниженого тиску з одержанням сечовинної сполуки.

(2) Сполуку (41 мг), представлену в таблиці 1, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 2, стадія (2), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки, отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 140

(1) Сполуку зі знятим захистом (50 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 139, стадія (1), і в прикладі 2, стадія (2), шляхом використання сполуки (150 мг), отриманої в прикладі 85, стадія (1), і диметиламіну (1 мл) як вихідних речовин.

(2) Сполуку (33 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання сполуки (50 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 141

Сполуку (19 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (50 мг), отриманої в прикладі 140, стадія (1), і N,N-діетил-N'-метилетан-1,2-діаміну (89,7 мг) як вихідних речовин.

Приклад 142

Сполуку (491 мг), представлену в таблиці 1, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 1, стадія (1), у прикладі 81, стадія (3), і в прикладі 4, стадія (6), шляхом використання сполуки (1,61 г), отриманої в прикладі 1, як вихідної речовини.

Приклад 143

(1) Сполуку (103 мг), отриману в прикладі 1, розчиняли в хлороформі (1,1 мл), до розчину додавали оцтовий ангідрид (22 мкл), триетиламін (77 мкл) і каталітичну кількість 4-диметиламінопіридину, і перемішували отриману суміш протягом ночі при кімнатній температурі. До реакційної суміші додавали дистильовану воду, і екстрагували отриману суміш етилацетатом. Органічний шар промивали насиченим водним гідрокарбонатом натрію, сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом препаративної тонкошарової хроматографії (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 10/1/0,1) з одержанням ацетильної сполуки (47,9 мг).

(2) Сполуку (32,7 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (6), шляхом використання сполуки (47,9 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 144

(1) Ацетильну сполуку (127,2 мг) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 1, стадія (1), шляхом використання сполуки (121 мг), отриманої в прикладі 1, як вихідної речовини.

(2) Сполуку (22,4 мг), отриману на описаній вище стадії (1), розчиняли в хлороформі (1,0 мл), до розчину додавали бензоїлхлорид (4 мкл), триетиламін (9 мкл) і каталітичну кількість 4-диметиламінопіридину, і перемішували отриману суміш протягом ночі при кімнатній температурі. До реакційної суміші додавали дистильовану воду, і екстрагували отриману суміш етилацетатом. Органічний шар промивали насиченим водним гідрокарбонатом натрію, сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом препаративної тонкошарової хроматографії (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 10/1/0,1) з одержанням бензоїльної сполуки (11,4 мг).

(3) Сполуку (8,7 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (6), шляхом використання сполуки (10,7 мг), отриманої на описаній вище стадії (2), як вихідної речовини.

Приклад 145

(1) Сполуку (100 мг), отриману в прикладі 1, розчиняли в хлороформі (1,0 мл), до розчину по краплях додавали трихлорацетилізоціанат (14 мкл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 1 години. До реакційної суміші додавали метанол (1,0 мл) і карбонат калію (7 мг), і перемішували отриману суміш протягом ночі при кімнатній температурі. До реакційної суміші додавали дистильовану воду, і екстрагували отриману суміш етилацетатом. Органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом препаративної тонкошарової хроматографії (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 10/1/0,1) з одержанням карбоїльної сполуки (60,1 мг).

(2) Сполуку (51,2 мг), представлену в таблиці 1, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (6), шляхом використання сполуки (60 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 146

(1) Сполуку (57,2 мг), представлену в таблиці 1, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 4, стадія (8), у прикладі 1, стадія (1), у прикладі 81, стадія (3), і в прикладі 4, стадія (6), шляхом використання сполуки (300 мг), отриманої в прикладі 1, стадія (6), і сполуки (147 мг), отриманої в довідковому прикладі 4, як вихідних речовин.

5 Приклад 147

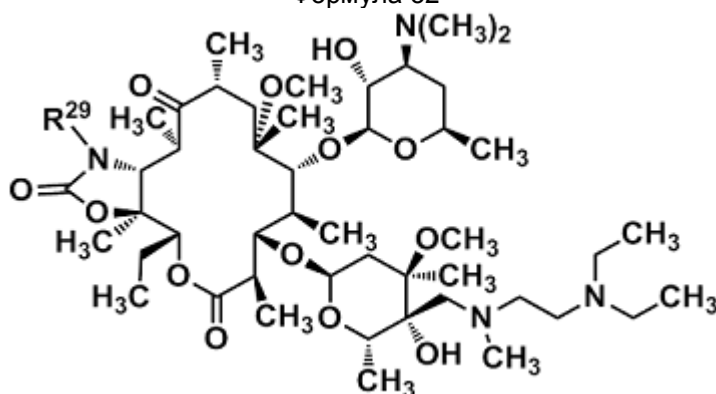
(1) Сполуку (49,6 мг), представлену в таблиці 1, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 4, стадія (8), у прикладі 1, стадія (1), у прикладі 81, стадія (3), і в прикладі 4, стадія (6), шляхом використання сполуки (300 мг), отриманої в прикладі 1, стадія (6), і сполуки (145 мг), отриманої в довідковому прикладі 1, як вихідних речовин.

10 Приклади 148-171

Нижче представлені способи одержання сполук, представлених формулою (C), і характеризуються значенням R^{29} , визначеним у таблиці 2.

Формула (C)

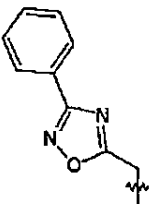
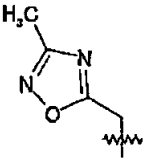
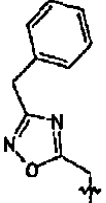
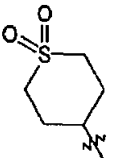
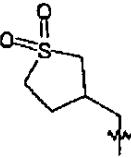
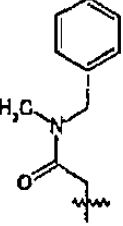
Формула 32



15

Таблиця 2-1

Приклад	R^{29}	ESI MS (M+H)	^1H -ЯМР, CDCl_3 , δ (м. ч.)
148		971,7	(500 МГц): 0,86 (т, $J=7,45$ Гц, 3H) 1,00-1,07 (м, 9H) 1,10 (д, $J=7,26$ Гц, 6H) 1,16 (с, 3H) 1,18-1,27 (м, 10H) 1,37 (с, 3H) 1,39 (с, 3H) 1,49-1,78 (м, 4H) 1,81-2,05 (м, 4H) 2,10 (д, $J=14,52$ Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,40-2,67 (м, 10H) 2,81-2,95 (м, 2H) 3,03 (кв, $J=6,88$ Гц, 1H) 3,06-3,10 (м, 3H) 3,18 (дд, $J=10,32$, 7,26 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,43-3,51 (м, 1H) 3,59 (с, 1H) 3,68-3,75 (м, 2H) 4,09 (кв, $J=6,24$ Гц, 1H) 4,42 (д, $J=7,26$ Гц, 1H) 4,62-4,74 (м, 2H) 4,95-5,05 (м, 4H) 5,18 (т, $J=6,69$ Гц, 1H)
149		1156,7	(600 МГц): 0,82 (т, $J=7,34$ Гц, 2H) 1,00-1,26 (м, 28H) 1,35 (с, 3H) 1,39 (с, 3H) 1,49-1,89 (м, 6H) 1,95-2,04 (м, 2H) 2,07-2,12 (м, 1H) 2,28 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,39-2,63 (м, 10H) 2,81-2,90 (м, 2H) 2,93 (с, 3H) 3,03 (с, 3H) 3,05-3,10 (м, 1H) 3,15-3,23 (м, 2H) 3,27 (с, 3H) 3,44-3,50 (м, 1H) 3,58-3,80 (м, 6H) 4,05-4,10 (м, 1H) 4,19-4,26 (м, 1H) 4,39-4,43 (м, 1H) 4,50-4,59 (м, 2H) 4,96-5,00 (м, 1H) 5,03-5,07 (м, 1H) 5,51-5,56 (м, 1H) 7,22-7,37 (м, 5H)

150		1073,7	(600 МГц): 0,90 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,95-1,27 (м, 28H) 1,33 (с, 3H) 1,46 (с, 3H) 1,49-1,53 (м, 1H) 1,60-1,66 (м, 1H) 1,69-1,79 (м, 2H) 1,81-2,03 (м, 4H) 2,06 (д, J=15,13 Гц, 1H) 2,28 (с, 6H) 2,32 (с, 3H) 2,37-2,63 (м, 10H) 2,75 (с, 3H) 2,76 -2,83 (м, 2H) 3,10-3,20 (м, 2H) 3,25 (с, 3H) 3,38 (ушир. с, 1H) 3,44 (ушир. с, 1H) 3,58-3,64 (м, 2H) 3,79 (с, 1H) 4,03 (кв, J=6,57 Гц, 1H) 4,39 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,87 (д, J=5,04 Гц, 1H) 5,06 (д, J=17,88 Гц, 1H) 5,45 (д, J=17,42 Гц, 1H) 5,52 (дд, J=10,32, 2,52 Гц, 1H) 7,40-7,48 (м, 3H) 8,11-8,15 (м, 2H)
151		1011,6	(600 МГц): 0,89 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,96-1,26 (м, 28H) 1,33 (с, 3H) 1,44 (с, 3H) 1,46-1,53 (м, 1H) 1,61-1,79 (м, 3H) 1,84 (т, J=7,34 Гц, 1H) 1,92-2,03 (м, 3H) 2,08 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,28 (с, 6H) 2,33 (с, 3H) 2,39 (с, 3H) 2,41-2,62 (м, 10H) 2,65 (с, 3H) 2,75-2,80 (м, 1H) 2,82 (д, J=14,67 Гц, 1H) 3,09 (кв, J=6,88 Гц, 1H) 3,17 (дд, J=10,09, 7,34 Гц, 1H) 3,27 (с, 3H) 3,38 (ушир.с, 1H) 3,41-3,47 (м, 1H) 3,58-3,64 (м, 3H) 4,03-4,09 (м, 1H) 4,39 (д, J=6,88 Гц, 1H) 4,93 (д, J=4,58 Гц, 1H) 4,99 (д, J=17,88 Гц, 1H) 5,39 (д, J=17,42 Гц, 1H) 5,53 (дд, J=10,09, 2,75 Гц, 1H)
152		1087,7	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,98-1,27 (м, 28H) 1,32 (с, 3H) 1,43 (с, 3H) 1,46-1,49 (м, 1H) 1,62-1,78 (м, 3H) 1,82-2,05 (м, 4H) 2,08 (д, J=15,59 Гц, 1H) 2,28 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,39-2,64 (м, 10H) 2,62 (с, 3H) 2,77-2,86 (м, 2H) 3,06-3,11 (м, 1H) 3,17 (дд, J=9,86, 7,11 Гц, 1H) 3,27 (с, 3H) 3,39 (ушир. с, 1H) 3,46 (ушир. с, 1H) 3,58-3,66 (м, 3H) 4,04-4,13 (м, 3H) 4,40 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,94-5,01 (м, 2H) 5,40 (д, J=17,42 Гц, 1H) 5,49 (дд, J=10,09, 2,75 Гц, 1H) 7,19-7,35 (м, 5H)
153		1047,7	(600 МГц): 0,84 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,00-1,28 (м, 32H) 1,36 (с, 3H) 1,41 (с, 3H) 1,49-1,54 (м, 1H) 1,64-1,78 (м, 3H) 1,81-1,93 (м, 2H) 1,98-2,02 (м, 2H) 2,10 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,38-2,64 (м, 11H) 2,80-2,91 (м, 3H) 2,99 (кв, J=6,72 Гц, 1H) 3,05 (с, 3H) 3,11-3,31 (м, 3H) 3,28 (с, 3H) 3,38-3,51 (м, 3H) 3,57 (с, 1H) 3,68-3,75 (м, 2H) 4,07-4,11 (м, 1H) 4,42 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,85 (дд, J=11,00, 1,83 Гц, 1H) 4,99 (д, J=4,58 Гц, 1H)
154		1047,7	(600 МГц): 0,81-0,87 (м, 3H) 0,95-1,27 (м, 28H) 1,40 (с, 6H) 1,50-1,53 (м, 1H) 1,74 (д, J=3,21 Гц, 3H) 1,83-2,05 (м, 5H) 2,09 (д, J=15,13 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,36-2,64 (м, 12H) 2,77-2,95 (м, 4H) 2,97-3,21 (м, 5H) 3,28 (с, 3H) 3,29-3,36 (м, 1H) 3,42-3,51 (м, 3H) 3,62-3,74 (м, 4H) 3,88-3,98 (м, 1H) 4,06-4,11 (м, 1H) 4,41 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,81-4,91 (м, 1H) 4,96-5,01 (м, 1H)
155		1076	(400 МГц): 0,93 (т, J=7,32 Гц, 3H) 1,00-1,29 (м, 28H) 1,32-1,39 (м, 3H) 1,42-1,46 (м, 3H) 1,47-1,81 (м, 4H) 1,89-2,06 (м, 4H) 2,10 (д, J=14,89 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,40-2,64 (м, 10H) 2,76-2,89 (м, 6H) 2,92 (с, 3H) 3,04-3,14 (м, 1H) 3,18 (дд, J=10,01, 7,57 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,39 (с, 1H) 3,42-3,52 (м, 1H) 3,66 (д, J=7,32 Гц, 1H) 3,69-3,76 (м, 2H) 4,08 (кв, J=6,10 Гц, 1H) 4,39-4,51 (м, 3H) 4,62-4,92 (м, 2H) 4,96-5,02 (м, 1H) 5,76-5,85 (м, 1H) 7,21-7,40 (м, 5H)

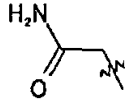
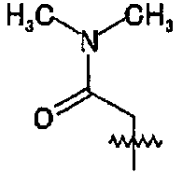
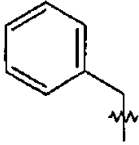
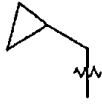
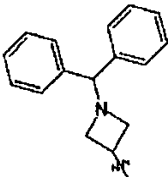

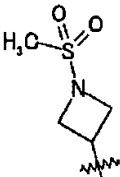
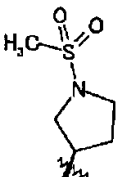
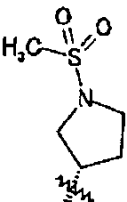


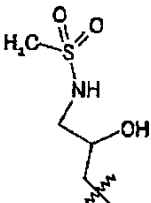
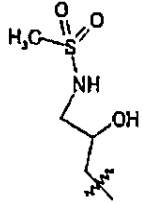
156		972,7	(500 МГц): 0,87 (т, J=7,26 Гц, 3H) 0,98-1,06 (м, 9H) 1,09 (д, J=7,64 Гц, 3H) 1,11-1,27 (м, 16H) 1,38 (с, 3H) 1,43 (с, 3H) 1,53-1,79 (м, 4H) 1,84-2,04 (м, 4H) 2,09 (д, J=14,52 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,40-2,64 (м, 10H) 2,80-2,92 (м, 2H) 2,99 (с, 3H) 3,06-3,12 (м, 1H) 3,15-3,21 (м, 1H) 3,27 (с, 3H) 3,41-3,51 (м, 1H) 3,65-3,74 (м, 2H) 3,78 (с, 1H) 4,03-4,11 (м, 1H) 4,22 (д, J=17,00 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,58 (д, J=17,00 Гц, 1H) 4,97 (д, J=4,20 Гц, 1H) 5,17 (дд, J=10,70, 1,91 Гц, 1H) 5,29-5,40 (м, 1H) 6,36-6,48 (м, 1H)
-----	---	-------	--

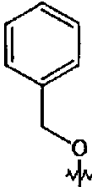

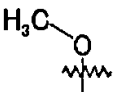
Таблица 2-2

Приклад	R ²⁹	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
157		1000,7	(600 МГц): 0,91 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,02 (т, J=7,11 Гц, 6H) 1,06 (т, J=7,11 Гц, 6H) 1,14 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,15 (с, 3H) 1,17 (д, J=6,42 Гц, 3H) 1,19 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,20-1,24 (м, 1H) 1,22 (д, J=6,42 Гц, 3H) 1,36 (с, 3H) 1,43 (с, 3H) 1,47-1,54 (м, 1H) 1,62-1,67 (м, 1H) 1,70-1,79 (м, 2H) 1,90-1,99 (м, 3H) 2,00-2,05 (м, 1H) 2,09 (д, J=15,13 Гц, 1H) 2,25-2,31 (м, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,39-2,60 (м, 8H) 2,43 (д, J=8,25 Гц, 1H) 2,54-2,58 (м, 1H) 2,77-2,80 (м, 1H) 2,83 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,89 (с, 3H) 2,93 (с, 3H) 3,04 (с, 3H) 3,05-3,10 (м, 1H) 3,18 (дд, J=10,09, 7,34 Гц, 1H) 3,27 (с, 3H) 3,38 (ушир. с, 1H) 3,44-3,49 (м, 1H) 3,66 (д, J=7,34 Гц, 1H) 3,68-3,72 (м, 1H) 3,70 (с, 1H) 4,05-4,10 (м, 1H) 4,34 (д, J=16,96 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,76 (д, J=16,96 Гц, 1H) 4,97 (д, J=4,13 Гц, 1H) 5,73 (дд, J=9,86, 3,44 Гц, 1H)
158		1005,8	(600 МГц): 0,83 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,99-1,05 (м, 9H) 1,07 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,11-1,16 (м, 12H) 1,17-1,21 (м, 1H) 1,21 (д, J=6,42 Гц, 3H) 1,31 (с, 3H) 1,42 (с, 3H) 1,45-1,52 (м, 1H) 1,58-1,74 (м, 3H) 1,82-1,87 (м, 1H) 1,91-2,02 (м, 3H) 2,07 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,28 (с, 6H) 2,33 (с, 3H) 2,37-2,62 (м, 9H) 2,39-2,42 (м, 1H) 2,44 (с, 3H) 2,78 (д, J=7,34 Гц, 1H) 2,81 (д, J=14,67 Гц, 1H) 3,10-3,19 (м, 2H) 3,26 (с, 3H) 3,37-3,41 (м, 1H) 3,41-3,47 (м, 1H) 3,54 (д, J=8,71 Гц, 1H) 3,56 (д, J=7,79 Гц, 1H) 3,58 (с, 1H) 4,02-4,07 (м, 1H) 4,37 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,82-4,96 (м, 2H) 4,90 (д, J=4,58 Гц, 1H) 4,97-5,02 (м, 1H) 7,21-7,25 (м, 1H) 7,30 (т, J=7,34 Гц, 2H) 7,42 (д, J=7,34 Гц, 2H)
159		969,8	(600 МГц): 0,29-0,33 (м, 1H) 0,34-0,39 (м, 1H) 0,51-0,54 (м, 2H) 0,85 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,99-1,04 (м, 9H) 1,10 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,18 (д, J=5,96 Гц, 3H) 1,20 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,21-1,25 (м, 2H) 1,23 (д, J=5,96 Гц, 3H) 1,39 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,49-1,55 (м, 1H) 1,65 (д, J=13,30 Гц, 1H) 1,70-1,81 (м, 2H) 1,90-1,99 (м, 3H) 2,00-2,05 (м, 1H) 2,09 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,40-2,63 (м, 10H) 2,83 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,85-2,91 (м, 1H) 3,03 (с, 3H) 3,07-3,12 (м, 1H) 3,13-3,22 (м, 2H) 3,28 (с, 3H) 3,42 (ушир. с, 1H) 3,44-3,51 (м, 1H) 3,69-3,74 (м, 3H) 3,77-3,83 (м, 1H) 4,07-4,12 (м, 1H) 4,42 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,98 (д, J=4,58 Гц, 1H) 5,15 (дд, J=10,77, 2,52 Гц, 1H)

160		1136,9	(500 МГц): 0,83 (т, J=7,40 Гц, 3H) 0,97 (д, J=6,86 Гц, 3H) 1,00-1,10 (м, 12H) 1,14-1,17 (м, 3H) 1,17-1,27 (м, 10H) 1,34 (с, 3H) 1,35 (с, 3H) 1,46-1,56 (м, 1H) 1,62-1,74 (м, 3H) 1,82-1,91 (м, 2H) 1,94-2,05 (м, 2H) 2,10 (д, J=14,81 Гц, 1H) 2,28 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,53 (м, 10H) 2,81-2,90 (м, 2H) 2,91 (с, 3H) 2,95-3,01 (м, 1H) 3,17 (дд, J=10,28, 7,27 Гц, 1H) 3,27 (с, 3H) 3,38-3,49 (м, 2H) 3,55 (с, 1H) 3,62 (т, J=7,68 Гц, 1H) 3,60-3,63 (м, 1H) 3,65-3,75 (м, 3H) 3,85 (т, J=6,99 Гц, 1H) 4,06-4,17 (м, 2H) 4,42 (д, J=7,13 Гц, 1H) 4,63 (с, 1H) 4,92-4,96 (м, 1H) 4,99 (д, J=4,11 Гц, 1H) 7,11-7,17 (м, 2H) 7,22-7,26 (м, 4H) 7,41-7,49 (м, 4H)
161		970,7	(500 МГц): 0,85 (т, J=7,27 Гц, 3H) 1,00-1,05 (м, 9H) 1,07-1,12 (м, 6H) 1,16 (с, 3H) 1,18-1,26 (м, 10H) 1,36 (с, 3H) 1,39 (с, 3H) 1,50-1,58 (м, 1H) 1,62-1,68 (м, 1H) 1,70-1,75 (м, 2H) 1,82-2,05 (м, 4H) 2,10 (д, J=14,81 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,39-2,63 (м, 10H) 2,83 (д, J=14,81 Гц, 1H) 2,86-2,92 (м, 1H) 2,96-3,03 (м, 1H) 3,08 (с, 3H) 3,15-3,21 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,45-3,51 (м, 1H) 3,58 (с, 1H) 3,61-3,66 (м, 1H) 3,69-3,74 (м, 2H) 3,92-3,98 (м, 1H) 4,09 (кв, J=6,31 Гц, 1H) 4,17 (т, J=7,68 Гц, 1H) 4,28-4,39 (м, 2H) 4,43 (д, J=7,40 Гц, 1H) 4,94-5,01 (м, 2H)
162		1048,7	(500 МГц): 0,85 (т, J=7,27 Гц, 3H) 0,99-1,06 (м, 9H) 1,07-1,12 (м, 6H) 1,16 (с, 3H) 1,20 (д, J=6,31 Гц, 6H) 1,22-1,27 (м, 4H) 1,37 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,51-1,60 (м, 1H) 1,63-1,69 (м, 1H) 1,70-1,76 (м, 2H) 1,77-1,90 (м, 2H) 1,94-2,04 (м, 2H) 2,10 (д, J=14,81 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,39-2,64 (м, 10H) 2,81-2,92 (м, 2H) 2,95-3,00 (м, 1H) 3,04 (с, 3H) 3,09 (с, 3H) 3,15-3,20 (м, 1H) 3,27 (с, 3H) 3,44-3,52 (м, 1H) 3,61 (с, 1H) 3,72 (т, J=7,54 Гц, 2H) 4,04-4,12 (м, 2H) 4,15-4,22 (м, 1H) 4,39-4,47 (м, 3H) 4,64 (т, J=7,54 Гц, 1H) 4,84 (дд, J=10,97, 1,92 Гц, 1H) 4,99 (д, J=3,29 Гц, 1H)
163		1062,7	(500 МГц): 0,85 (т, J=7,45 Гц, 3H) 1,00-1,13 (м, 15H) 1,16 (с, 3H) 1,18-1,27 (м, 10H) 1,36 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,49-1,59 (м, 1H) 1,63-1,78 (м, 3H) 1,82-1,92 (м, 2H) 1,94-2,05 (м, 2H) 2,10 (д, J=14,91 Гц, 1H) 2,25-2,33 (м, 7H) 2,34 (с, 3H) 2,36-2,65 (м, 11H) 2,81-2,92 (м, 2H) 2,94 (с, 3H) 2,95-3,00 (м, 1H) 3,02 (с, 3H) 3,18 (дд, J=10,32, 7,26 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,31-3,37 (м, 1H) 3,44-3,51 (м, 1H) 3,55-3,62 (м, 1H) 3,64 (с, 1H) 3,68-3,75 (м, 2H) 3,91-4,05 (м, 2H) 4,09 (кв, J=6,50 Гц, 1H) 4,12-4,18 (м, 1H) 4,42 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,88 (дд, J=10,89, 2,10 Гц, 1H) 4,99 (д, J=4,59 Гц, 1H)

Таблиця 2-3

Приклад	R ²⁹	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
164		1062,7	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,26 Гц, 3H) 1,01-1,06 (м, 6H) 1,09 (д, J=6,88 Гц, 6H) 1,12 (д, J=7,26 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,17-1,27 (м, 10H) 1,36 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,49-1,59 (м, 1H) 1,62-1,68 (м, 1H) 1,71-1,78 (м, 2H) 1,80-1,89 (м, 2H) 1,94-2,05 (м, 2H) 2,10 (д, J=14,52 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,40-2,77 (м, 12H) 2,81-2,91 (м, 5H) 2,97-3,03 (м, 1H) 3,03-3,06 (м, 3H) 3,18 (дд, J=10,32, 7,26 Гц, 1H) 3,27 (с, 3H) 3,39-3,52 (м, 3H) 3,56-3,62 (м, 1H) 3,63-3,66 (м, 1H) 3,69-3,74 (м, 2H) 3,78 (т, J=8,98 Гц, 1H) 3,98-4,12 (м, 2H) 4,43 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,81 (дд, J=10,89, 2,10 Гц, 1H) 4,99 (д, J=3,44 Гц, 1H)
165		1076,8	(500 МГц): 0,81-0,88 (м, 3H) 0,96-1,06 (м, 9H) 1,08-1,27 (м, 19H) 1,37-1,42 (м, 6H) 1,50-1,60 (м, 1H) 1,64 (ушир. с, 1H) 1,69-2,25 (м, 9H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,39-2,72 (м, 11H) 2,81-2,86 (м, 2H) 2,86-2,94 (м, 2H) 3,02 (с, 3H) 3,04-3,21 (м, 3H) 3,28 (с, 3H) 3,29-3,39 (м, 1H) 3,43-3,72 (м, 8H) 3,83-3,94 (м, 1H) 4,07-4,13 (м, 1H) 4,41 (дд, J=7,26, 1,15 Гц, 1H) 4,84-4,94 (м, 1H) 4,95-5,00 (м, 1H)
166		1062,7	(500 МГц): 0,82 (т, J=7,40 Гц, 3H) 0,97-1,28 (м, 28H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,47-2,13 (м, 9H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,40-2,64 (м, 10H) 2,84 (д, J=14,81 Гц, 1H) 2,86-3,14 (м, 10H) 3,18 (дд, J=10,15, 7,40 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,43-3,51 (м, 1H) 3,58 (с, 1H) 3,68-3,73 (м, 3H) 3,77 (дд, J=7,95, 5,76 Гц, 1H) 3,92 (д, J=7,68 Гц, 2H) 4,02 (т, J=8,23 Гц, 1H) 4,06-4,18 (м, 2H) 4,42 (д, J=7,40 Гц, 1H) 4,74 (дд, J=10,97, 1,92 Гц, 1H) 5,00 (д, J=3,84 Гц, 1H)
167		1066,7	(600 МГц): 0,85 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,99-1,06 (м, 9H) 1,08-1,27 (м, 19H) 1,40 (с, 6H) 1,54-1,78 (м, 4H) 1,82-2,04 (м, 4H) 2,09 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,40-2,65 (м, 10H) 2,83 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,95 (дд, J=10,09, 7,34 Гц, 1H) 3,00 (с, 3H) 3,08 (с, 3H) 3,12-3,21 (м, 3H) 3,28 (з., 3H) 3,31-3,37 (м, 1H) 3,43-3,51 (м, 2H) 3,63 (с, 1H) 3,65-3,79 (м, 4H) 3,96-4,02 (м, 1H) 4,06-4,11 (м, 1H) 4,42 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,90 (ушир. с, 1H) 4,96-5,01 (м, 2H)
168		1066,7	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,00-1,26 (м, 28H) 1,40 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,51-2,12 (м, 9H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,40-2,64 (м, 10H) 2,80-2,95 (м, 2H) 2,98-3,02 (м, 3H) 3,06 (с, 4H) 3,15-3,22 (м, 2H) 3,27 (с, 3H) 3,34-3,53 (м, 4H) 3,68-3,73 (м, 3H) 4,06-4,11 (м, 1H) 4,19-4,26 (м, 1H) 4,41 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,89-4,93 (м, 1H) 4,96-4,99 (м, 1H) 5,01-5,06 (м, 1H)

169		1021,6	(600 МГц): 0,83 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,99 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,01-1,05 (м, 6H) 1,12 (д, J=6,42 Гц, 6H) 1,17 (с, 3H) 1,18-1,22 (м, 3H) 1,21-1,27 (м, 7H) 1,42 (с, 3H) 1,45 (с, 3H) 1,45-1,54 (м, 2H) 1,62-1,67 (м, 1H) 1,72-1,78 (м, 1H) 1,79-1,86 (м, 1H) 1,89-1,94 (м, 1H) 1,98-2,08 (м, 2H) 2,10 (д, J=15,13 Гц, 1H) 2,28 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,39-2,63 (м, 8H) 2,40-2,45 (м, 1H) 2,84 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,88-2,96 (м, 3H) 3,15 (дд, J=10,32, 7,11 Гц, 1H) 3,25 (с, 3H) 3,28 (с, 3H) 3,40-3,48 (м, 1H) 3,71 (д, J=7,79 Гц, 1H) 3,81 (д, J=9,63 Гц, 1H) 4,11-4,15 (м, 1H) 4,29 (с, 1H) 4,38 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,91-4,97 (м, 2H) 5,03 (д, J=4,58 Гц, 1H) 5,15 (дд, J=10,77, 2,52 Гц, 1H) 7,28-7,38 (м, 3H) 7,47-7,53 (м, 2H)
170		931,7	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,02 (т, J=6,88 Гц, 6H) 1,08 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,15 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,16-1,16 (м, 3H) 1,17-1,19 (м, 6H) 1,21 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,23 (д, J=5,96 Гц, 3H) 1,23-1,25 (м, 1H) 1,39 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,47-1,54 (м, 1H) 1,63-1,69 (м, 1H) 1,75-1,85 (м, 3H) 1,85-1,92 (м, 1H) 1,93-2,04 (м, 2H) 2,09 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,39-2,61 (м, 8H) 2,41-2,46 (м, 1H) 2,66-2,73 (м, 1H) 2,78-2,86 (м, 2H) 3,00 (с, 3H) 3,09-3,14 (м, 1H) 3,17 (дд, J=10,09, 7,34 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,44-3,50 (м, 1H) 3,69 (д, J=7,34 Гц, 1H) 3,76 (д, J=8,71 Гц, 1H) 3,79 (с, 1H) 4,04-4,11 (м, 1H) 4,42 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,99 (д, J=3,67 Гц, 1H) 5,16 (дд, J=10,77, 2,52 Гц, 1H) 8,86 (ушир. с, 1H)
171		945,7	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,02 (т, J=7,11 Гц, 6H) 1,09-1,15 (м, 9H) 1,17 (с, 3H) 1,18-1,22 (м, 4H) 1,22-1,28 (м, 6H) 1,43 (с, 3H) 1,46 (с, 3H) 1,48 (д, J=7,79 Гц, 1H) 1,51-1,59 (м, 1H) 1,65 (д, J=12,40 Гц, 1H) 1,75 (дд, J=14,67, 5,96 Гц, 1H) 1,84-1,93 (м, 2H) 1,97-2,06 (м, 2H) 2,10 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,28 (с, 6H) 2,34 (ушир. с, 3H) 2,39-2,45 (м, 1H) 2,41-2,63 (м, 8H) 2,84 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,84-2,89 (м, 1H) 2,90-2,99 (м, 2H) 3,15 (дд, J=10,09, 7,34 Гц, 1H) 3,24 (с, 3H) 3,28 (с, 3H) 3,43-3,47 (м, 1H) 3,71 (д, J=7,79 Гц, 1H) 3,78 (с, 3H) 3,81 (д, J=10,09 Гц, 1H) 4,10-4,15 (м, 1H) 4,29 (с, 1H) 4,37 (д, J=7,34 Гц, 1H) 5,02 (д, J=4,58 Гц, 1H) 5,18 (дд, J=11,00, 2,29 Гц, 1H)

Приклад 148

5 (1) Деацетиловану сполуку (0,33 г) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 15, стадія (1), і в прикладі 4, стадія (6), шляхом використання сполуки (500 мг), представленої формулою (А) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і Зноксетанаміну гідрохлориду (0,32 г) як вихідних речовин.

10 (2) Сполуку (114 мг), представлену в таблиці 2, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 15, стадія (2), шляхом використання сполуки (130 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 149

15 (1) Деацетиловану сполуку (114 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 2, стадії (1) і (2), шляхом використання сполуки (329 мг), представленої формулою (А) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і сполуки (290 мг), отриманої в довідковому прикладі 72, як вихідних речовин.

(2) Сполуку (38 мг), представлену в таблиці 2, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання сполуки (64 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 150

Сполуку (46,0 мг), представлену в таблиці 2, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 2, стадії (1) і (2), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (200 мг), представленої формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і (3-феніл-1,2,4-оксадіазол-5-іл)метиламіну (200 мг) як вихідних речовин.

Приклад 151

Сполуку (41,4 мг), представлену в таблиці 2, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 15, стадії (1) і (2), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (200 мг), представленої формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і [(3-метил-1,2,4-оксадіазол-5-іл)метил]аміну гідрохлориду (172 мг) як вихідних речовин.

Приклад 152

Сполуку (53,3 мг), представлену в таблиці 2, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 15, стадія (1), у прикладі 4, стадія (6), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (153 мг), представленої формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і (3-бензил-[1,2,4]оксадіазол-5-іл)метиламіну гідрохлориду (118 мг) як вихідних речовин.

Приклад 153

(1) Деацетиловану сполуку (226 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 15, стадія (1), і в прикладі 2, стадія (2), шляхом використання сполуки (329 мг), представленої формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і 4-амінотетрагідро-2H-тіопіран-1,1-діоксиду гідрохлориду (159 мг) як вихідних речовин.

(2) Сполуку (27,3 мг), представлену в таблиці 2, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання сполуки (108 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 154

Сполуку (56,5 мг), представлену в таблиці 2, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 15, стадія (1), у прикладі 4, стадія (6), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (150 мг), представленої формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і [(1,1-діоксидотетрагідро-3-тієніл)метил]аміну гідрохлориду (95 мг) як вихідних речовин.

Приклад 155

Сполуку (55 мг), представлену в таблиці 2, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 2, стадії (1) і (2), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (100 мг), представленої формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і сполуки (94 мг), отриманої в довідковому прикладі 93, як вихідних речовин.

Приклад 156

(1) Деацетиловану сполуку (0,32 г) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 15, стадія (1), і в прикладі 4, стадія (6), шляхом використання сполуки (500 мг), представленої формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і гліцинамиду гідрохлориду (0,32 г) як вихідних речовин.

(2) Сполуку (75 мг), представлену в таблиці 2, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 15, стадія (2), шляхом використання сполуки (100 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 157

Сполуку (62,3 мг), представлену в таблиці 2, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 4, стадія (1), у прикладі 2, стадія (2), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (325 мг), представленої формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і 2-аміно-N,N-диметилацетаміду (189 мг) як вихідних речовин.

Приклад 158

Сполуку (50,1 мг), представлену в таблиці 2, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 4, стадії (1) і (6), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (500 мг), представленої формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і бензиламіну (622 мкл) як вихідних речовин.

Приклад 159

Сполуку (34,9 мг), представлену в таблиці 2, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 4, стадії (1) і (6), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (500 мг), представленої формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і циклопропілметиламіну (487 мкл) як вихідних речовин.

Приклад 160

(1) Сполуку (500 мг), представлену формулою (A) і отриману в прикладі 1, стадія (5), і 1-(дифенілметил)-3-аміноазетидину гідрохлорид (783 мг) розчиняли в суміші ацетонітрилу й хлороформу (1/1, 6 мл), до розчину додавали 1,8-діазабіцикло[5.4.0]-7-ундецен (400 мкл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі в плин 16 годин. Реакційну суміш

концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (гексан/ацетон/триетиламін = 10/10/0,2) з одержанням карбаматної сполуки (0,83 г).

- 5 (2) Сполуку (200 мг), представлену в таблиці 2, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (0,83 г), отриманої на описаній вище стадії (1), і N,N-діетил-N'-метилетан-1,2-діамін (0,40 г) як вихідних речовин.

Приклад 161

- 10 Сполуку (190 мг), отриману в прикладі 160, розчиняли в тетрагідрофурані (5 мл), до розчину додавали 20 % гідроксид паладію на вугіллі (800 мг), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 2 діб під тиском 1 атм водню. Реакційну суміш фільтрували через целіт, фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 10/1/0,1) з одержанням сполуки (110 мг), представленій в таблиці 2.

Приклад 162

- 15 Сполуку (54 мг), отриману в прикладі 161, розчиняли в тетрагідрофурані (5 мл), до розчину додавали метансульфонілхлорид (5 мкл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 30 хвилин. До реакційної суміші додавали насичений водний гідрокарбонат натрію, і екстрагували отриману суміш хлороформом. Органічний шар промивали насиченим водним хлоридом натрію, сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. 20 Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом препаративної тонкошарової хроматографії (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 10/1/0,1) з одержанням сполуки (52 мг), представленій в таблиці 2.

Приклад 163

- 25 (1) Сполуку (500 мг), представлену формулою (A) і отриману в прикладі 1, стадія (5), і сполуку (1,10 г), отриману в довідковому прикладі 73, розчиняли в хлороформі (2 мл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 3 годин. До реакційної суміші додавали 1,1,3,3-тетраметилгуанідин (72 мкл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 16 годин. До реакційної суміші додавали 1,1,3,3-тетраметилгуанідин (72 мкл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 24 годин. До 30 реакційної суміші додавали насичений водний хлорид амонію, і екстрагували отриману суміш хлороформом. Органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28% водний аміак = 200/1/0,1) з одержанням карбаматної сполуки (0,29 г).

- 35 (2) Сполуку (77 мг), представлену в таблиці 2, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (140 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), і N,N-діетил-N'-метилетан-1,2-діаміну (190 мг) як вихідних речовин.

Приклад 164

- 40 (1) Карбаматну сполуку (0,36 г) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 163, стадія (1), шляхом використання сполуки (500 мг), представленій формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і сполуки (0,96 г), отриманої в довідковому прикладі 74, як вихідних речовин.

- 45 (2) Сполуку (118 мг), представлену в таблиці 2, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (180 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), і N,N-діетил-N'-метилетан-1,2-діаміну (240 мг) як вихідних речовин.

Приклад 165

- 50 (1) Карбаматну сполуку (150 мг) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 163, стадія (1), шляхом використання сполуки (500 мг), представленій формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і сполуки (0,78 г), отриманої в довідковому прикладі 75, як вихідних речовин.

(2) Сполуку (100 мг), представлену в таблиці 2, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (140 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), і N,N-діетил-N'-метилетан-1,2-діаміну (0,18 мл) як вихідних речовин.

Приклад 166

- 55 (1) Карбаматну сполуку (1,71 г) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (1), шляхом використання сполуки (1,91 г), представленій формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і 3-аміно-1-дифенілметилазетидину (2,75 г) як вихідних речовин.

- 60 (2) Сполуку (1,7 г), отриману на описаній вище стадії (1), розчиняли в тетрагідрофурані (5 мл), до розчину додавали 20 % гідроксид паладію на вугіллі (3,4 г), і перемішували отриману суміш протягом ночі при кімнатній температурі під тиском 1 атм водню. До реакційної суміші

додавали суміш хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 10/1/0,1, і перемішували отриману суміш протягом 0,5 години. Реакційну суміш фільтрували, фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 100/1/0,1 → 10/1/0,1) з одержанням сполуки зі знятим захистом (877 мг).

(3) Сполуку зі знятим захистом (149 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 71, стадія (2), і в прикладі 2, стадія (2), шляхом використання сполуки (200 мг), отриманої на описаній вище стадії (2), як вихідної речовини.

(4) Сполуку (31 мг), представлену в таблиці 2, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання сполуки (50 мг), отриманої на описаній вище стадії (3), як вихідної речовини.

Приклад 167

(1) Карбаматну сполуку (0,34 г) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (1), шляхом використання сполуки (500 мг), представленної формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і 1,3-діаміно-2-пропанолу (0,51 г) як вихідних речовин.

(2) Метансульфонільну сполуку одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 162, шляхом використання сполуки (155 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

(3) Сполуку (52 мг), представлену в таблиці 2, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки, отриманої на описаній вище стадії (2), і N,N-діетил-N'-метилетан-1,2-діаміну (0,23 мл) як вихідних речовин.

Приклад 168

(1) Карбаматну сполуку (0,34 г) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (1), шляхом використання сполуки (500 мг), представленної формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і 1,3-діаміно-2-пропанолу (0,51 г) як вихідних речовин.

(2) Метансульфонільну сполуку одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 162, шляхом використання сполуки (155 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

(3) Сполуку (28 мг), представлену в таблиці 2, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки, отриманої на описаній вище стадії (2), і N,N-діетил-N'-метилетан-1,2-діаміну (230 мкл) як вихідних речовин.

Приклад 169

(1) Представлену формулою (SM1) сполуку (2,0 г), отриману способом, описаним у міжнародній патентній публікації WO 93/21199, розчиняли в ацетонітрилі (20 мл), до розчину додавали імідазол (900 мг) і О-бензилгідроксиламіну гідрохлорид (1,76 г), і перемішували отриману суміш при нагріванні зі зворотним холодильником протягом 4 годин. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску, до отриманого залишку додавали етилацетат і насичений водний гідрокарбонат натрію, і розділяли шари. Органічний шар промивали насиченим водним гідрокарбонатом натрію, сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 100/1/0,1 → 10/1/0,1) з одержанням карбаматної сполуки (722 мг).

(2) Епоксисполуку (163 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 2, стадія (2), у прикладі 1, стадії (1) і (3), у прикладі 4, стадія (6), і в прикладі 1, стадія (4), шляхом використання сполуки (722 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

(3) Сполуку (33,2 мг), представлену в таблиці 2, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання сполуки (50,0 мг), отриманої на описаній вище стадії (2), як вихідної речовини.

Приклад 170

(1) Сполуку (113 мг), отриману в прикладі 169, стадія (2), розчиняли в метанолі (3 мл), до розчину додавали 10 % паладоване вугілля (113 мг), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 6 годин під тиском 1 атм водню. Реакційну суміш фільтрували, а потім концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску. Отриманий залишок розчиняли в метанолі (3 мл), до розчину додавали 10 % паладоване вугілля (220 мг), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 11 годин під тиском 1 атм водню. Реакційну суміш фільтрували, потім концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 100/1/0,1 → 10/1/0,1) з одержанням дебензилованої сполуки (77,7 мг).

(2) Сполуку (37,3 мг), представлену в таблиці 2, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання сполуки (77,7 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 171

5 (1) Епоксисполуку (355 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 169, стадія (1), у прикладі 2, стадія (2), у прикладі 1, стадії (1) і (3), у прикладі 4, стадія (6), і в прикладі 1, стадія (4), шляхом використання представленої формулою (SM1) сполуки (4,0 г), отриманої способом, описаним у міжнародній патентній публікації WO 93/21199, і О-метилгідроксиламіну гідрохлориду (1,8 г) як вихідних речовин.

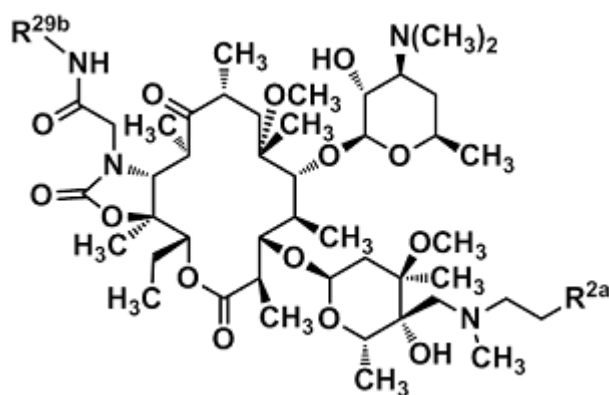
10 (2) Сполуку (55,6 мг), представлену в таблиці 2, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання сполуки (100 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклади 172-182

15 Нижче представлені способи одержання сполук, представлених формулою (D) значеннями, які характеризуються, R^{29b} і R^{2a} , визначеними в таблиці 3.

Формула (D)

Формула 33



20

Таблиця 3-1

При- клад	R^{29b}	R^{2a}	ESI MS (M+H)	$^1\text{H-NMP}$, CDCl_3 , δ (м. ч.)
172			1062	(400 МГц): 0,68 (т, J=7,32 Гц, 3H) 0,99 (д, J=6,84 Гц, 3H) 1,03 (т, J=7,08 Гц, 6H) 1,08 (д, J=7,57 Гц, 3H) 1,12 (д, J=7,08 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,17-1,26 (м, 1H) 1,18 (д, J=7,08 Гц, 3H) 1,19 (д, J=6,35 Гц, 3H) 1,24 (д, J=6,10 Гц, 3H) 1,37 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,46-1,90 (м, 7H) 1,94-2,06 (м, 2H) 2,10 (д, J=14,65 Гц, 1H) 2,28 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,38-2,65 (м, 10H) 2,80-2,89 (м, 2H) 2,92 (с, 3H) 3,07 (кв, J=6,84 Гц, 1H) 3,17 (дд, J=10,25, 7,08 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,40-3,51 (м, 2H) 3,65 (д, J=7,32 Гц, 1H) 3,71 (д, J=9,52 Гц, 1H) 3,78 (с, 1H) 4,09 (кв, J=6,35 Гц, 1H) 4,26 (д, J=14,16 Гц, 1H) 4,30 (дд, J=14,41, 4,64 Гц, 1H) 4,62 (д, J=17,09 Гц, 1H) 4,67 (дд, J=14,65, 6,84 Гц, 1H) 4,96-5,02 (м, 2H) 5,75-6,81 (м, 1H) 7,18-7,32 (м, 5H)

173			1074,7	(500 МГц): 0,69 (т, J=7,40 Гц, 3H) 0,95-1,28 (м, 25H) 1,30-1,45 (м, 7H) 1,46-2,20 (м, 12H) 2,29 (с, 6H) 2,32-2,70 (м, 9H) 2,82-2,96 (м, 6H) 3,02-3,20 (м, 4H) 3,28 (с, 3H) 3,42-3,50 (м, 1H) 3,64-3,73 (м, 2H) 3,78 (с, 1H) 4,10 (кв, J=6,31 Гц, 1H) 4,21-4,36 (м, 2H) 4,41 (д, J=7,40 Гц, 1H) 4,55-4,69 (м, 2H) 4,97-5,06 (м, 2H) 6,79 (т, J=5,76 Гц, 1H) 7,16-7,34 (м, 5H)
174			1076,8	(600 МГц): 0,68 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,94-1,13 (м, 18H) 1,14-1,26 (м, 13H) 1,37 (с, 3H) 1,39-1,41 (м, 3H) 1,47-1,60 (м, 1H) 1,61-1,78 (м, 4H) 1,81-1,89 (м, 2H) 1,95-2,10 (м, 2H) 2,28 (с, 6H) 2,32-2,64 (м, 11H) 2,80-2,99 (м, 6H) 3,02-3,10 (м, 1H) 3,14-3,20 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,43-3,50 (м, 1H) 3,62-3,74 (м, 2H) 3,78 (с, 1H) 4,04-4,12 (м, 1H) 4,23-4,33 (м, 2H) 4,38-4,43 (м, 1H) 4,58-4,71 (м, 2H) 4,95-5,04 (м, 2H) 6,74-6,80 (м, 1H) 7,17-7,32 (м, 5H)
175			1088,8	(500 МГц): 0,08-0,13 (м, 2H) 0,45-0,53 (м, 2H) 0,69 (т, J=7,26 Гц, 3H) 0,84-0,93 (м, 1H) 0,97-1,28 (м, 25H) 1,34-1,39 (м, 3H) 1,39-1,42 (м, 3H) 1,46-2,14 (м, 10H) 2,26-2,30 (м, 6H) 2,30-2,70 (м, 12H) 2,81-2,88 (м, 2H) 2,91 (с, 3H) 3,07 (кв, J=6,88 Гц, 1H) 3,18 (дд, J=10,32, 7,26 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,42-3,51 (м, 1H) 3,63-3,73 (м, 2H) 3,78 (с, 1H) 4,09 (кв, J=6,12 Гц, 1H) 4,23-4,34 (м, 2H) 4,41 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,57-4,69 (м, 2H) 4,96-5,03 (м, 2H) 6,76 (дд, J=6,50, 4,97 Гц, 1H) 7,18-7,23 (м, 1H) 7,24-7,31 (м, 4H)
176			1090,8	(500 МГц): 0,69 (т, J=7,27 Гц, 3H) 0,91 (т, J=7,27 Гц, 3H) 0,95-1,57 (м, 36H) 1,61-2,12 (м, 8H) 2,29 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,38-2,66 (м, 10H) 2,78-2,94 (м, 5H) 3,04-3,11 (м, 1H) 3,18 (дд, J=10,28, 7,27 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,42-3,52 (м, 1H) 3,61-3,73 (м, 2H) 3,78 (с, 1H) 4,06-4,14 (м, 1H) 4,22-4,35 (м, 2H) 4,41 (д, J=7,13 Гц, 1H) 4,56-4,70 (м, 2H) 4,96-5,03 (м, 2H) 6,82 (дд, J=6,44, 5,07 Гц, 1H) 7,14-7,33 (м, 5H)
177			1048,7	(400 МГц): 0,85 (т, J=7,3 Гц, 3H) 0,98-1,05 (м, 9H) 1,07-1,25 (м, 20H) 1,37 (с, 3H) 1,39 (с, 3H) 1,45-1,56 (м, 1H) 1,62-1,68 (м, 1H) 1,70-1,78 (м, 2H) 1,81-1,91 (м, 2H) 1,97 (дд, J=14,9, 4,9 Гц, 1H) 2,03 (д, J=13,9 Гц, 1H) 2,09 (д, J=14,9 Гц, 1H) 2,28 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,40-2,61 (м, 10H) 2,83 (д, J=14,6 Гц, 1H) 2,89 (дд, J=9,5, 7,1 Гц, 1H) 2,95 (с, 3H) 3,09 (кв, J=6,8 Гц, 1H) 3,18 (дд, J=10,3, 7,3 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,36 (дт, J=15,8, 4,6 Гц, 1H) 3,41-3,52 (м, 2H) 3,56-3,66 (м, 1H) 3,66-3,73 (м, 3H) 4,03-4,12 (м, 2H) 4,26 (дт, J=15,8, 4,6 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,3 Гц, 1H) 5,00 (д, J=3,7 Гц, 1H) 5,43 (дд, J=10,9, 1,8 Гц, 1H) 7,12 (тт, J=6,7, 2,0 Гц, 1H) 7,30-7,37 (м, 4H) 7,73 (с, 1H)

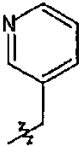
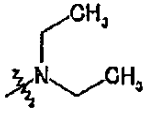
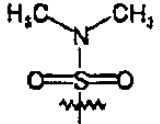
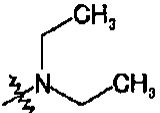

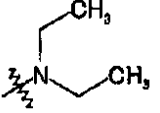
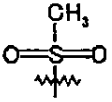
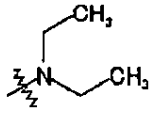
178			1063	(400 МГц): 0,68 (т, J=7,32 Гц, 3H) 0,99 (д, J=6,84 Гц, 3H) 1,03 (т, J=7,08 Гц, 6H) 1,08 (д, J=7,57 Гц, 3H) 1,12 (д, J=7,08 Гц, 3H) 1,17 (с, 3H) 1,17-1,26 (м, 1H) 1,20 (д, J=6,10 Гц, 6H) 1,24 (д, J=6,10 Гц, 3H) 1,37 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,48-1,88 (м, 7H) 1,97-2,07 (м, 2H) 2,09 (д, J=14,89 Гц, 1H) 2,28 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,38-2,65 (м, 10H) 2,84 (д, J=14,65 Гц, 1H) 2,84-2,91 (м, 1H) 2,89 (с, 3H) 3,07 (кв, J=7,08 Гц, 1H) 3,18 (дд, J=10,25, 7,32 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,40-3,50 (м, 2H) 3,64 (д, J=7,57 Гц, 1H) 3,69 (д, J=9,03 Гц, 1H) 3,77 (с, 1H) 4,09 (кв, J=6,35 Гц, 1H) 4,27 (д, J=17,09 Гц, 1H) 4,31 (дд, J=14,89, 4,88 Гц, 1H) 4,40 (д, J=7,32 Гц, 1H) 4,67 (д, J=10,09 Гц, 1H) 4,70 (дд, J=14,41, 6,84 Гц, 1H) 4,91 (дд, J=10,74, 1,95 Гц, 1H) 4,97-5,01 (м, 1H) 6,99 (дд, J=11,96, 5,13 Гц, 1H) 7,23 (дд, J=7,32, 4,88 Гц, 1H) 7,69 (дт, J=5,86, 1,95 Гц, 1H) 8,48 (дд, J=4,88, 1,71 Гц, 1H) 8,52 (д, J=1,71 Гц, 1H)
-----	---	---	------	--

Таблица 3-2

При-клад	R ^{29b}	R ^{2a}	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
179			1079	(400 МГц): 0,84 (т, J=7,32 Гц, 3H) 1,02 (д, J=7,32 Гц, 3H) 1,03 (т, J=7,08 Гц, 6H) 1,07 (д, J=7,81 Гц, 3H) 1,12 (д, J=6,84 Гц, 3H) 1,14 (с, 3H) 1,17 (д, J=6,35 Гц, 3H) 1,20 (д, J=8,30 Гц, 3H) 1,22 (д, J=6,10 Гц, 3H) 1,35 (с, 3H) 1,42 (с, 3H) 1,46-1,58 (м, 1H) 1,62-1,69 (м, 1H) 1,69-1,75 (м, 2H) 1,86-1,95 (м, 3H) 2,00 (т, J=15,4 Гц, 1H) 2,08 (д, J=14,9 Гц, 1H) 2,28 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,38-2,65 (м, 10H) 2,74 (с, 6H) 2,79-2,89 (м, 2H) 2,95 (с, 3H) 3,01 (кв, J=7,08 Гц, 1H) 3,18 (дд, J=10,3, 7,32 Гц, 1H) 3,27 (с, 3H) 3,39-3,50 (м, 1H) 3,59-3,72 (м, 3H) 4,07-4,25 (м, 2H) 4,36-4,47 (м, 2H) 4,96 (д, J=4,40 Гц, 1H)
180			1000,7	(400 МГц): 0,84-0,91 (м, 3H) 0,96-1,30 (м, 29H) 1,38 (с, 3H) 1,43 (с, 3H) 1,52-1,83 (м, 5H) 1,83-2,15 (м, 5H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,38-2,66 (м, 9H) 2,79-3,00 (м, 5H) 3,04-3,13 (м, 1H) 3,13-3,23 (м, 1H) 3,24-3,32 (м, 4H) 3,34-3,51 (м, 3H) 3,62-3,68 (м, 1H) 3,70-3,76 (м, 1H) 3,78 (с, 1H) 4,04-4,14 (м, 1H) 4,22 (д, J=17,1 Гц, 1H) 4,40 (д, J=7,1 Гц, 1H) 4,58 (д, J=16,8 Гц, 1H) 4,95-5,02 (м, 1H) 5,10 (д, J=10,0 Гц, 1H) 6,36-6,47 (м, 1H)
181			1050	(400 МГц): 0,85 (т, J=7,32 Гц, 3H) 0,99-1,35 (м, 28H) 1,38 (с, 3H) 1,42 (с, 3H) 1,44-1,80 (м, 5H) 1,81-2,15 (м, 5H) 2,36 (с, 6H) 2,40 (с, 3H) 2,50-2,73 (м, 10H) 2,73-2,90 (м, 2H) 2,93 (с, 3H) 2,99 (с, 3H) 3,15-3,25 (м, 1H) 3,27 (с, 3H) 3,35-3,73 (м, 5H) 4,02-4,18 (м, 2H) 4,41 (д, J=7,32 Гц, 1H) 4,43-4,50 (м, 1H) 4,98 (ушир. с, 1H) 5,70 (ушир. с, 1H)

182			1065	(400 МГц): 0,87 (т, J=7,32 Гц, 3H) 1,02 (д, J=6,84 Гц, 3H) 1,06 (д, J=7,57 Гц, 3H) 1,16-1,26 (м, 19H) 1,16 (с, 3H) 1,22 (д, J=6,10 Гц, 6H) 1,33 (с, 3H) 1,42 (с, 3H) 1,43-1,53 (м, 1H) 1,62-1,76 (м, 3H) 1,88-2,12 (м, 5H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,39-2,48 (м, 1H) 2,50-2,87 (м, 10H) 2,91 (с, 3H) 2,99 (кв, J=6,84 Гц, 1H) 3,17 (дд, J=10,25, 7,32 Гц, 1H) 3,27 (с, 3H) 3,36-3,50 (м, 2H) 3,59 (д, J=7,32 Гц, 1H) 3,66-3,73 (м, 2H) 3,68 (с, 1H) 4,12 (кв, J=5,86 Гц, 1H) 4,13-4,23 (м, 1H) 4,38 (д, J=7,32 Гц, 1H) 4,45 (д, J=7,58 Гц, 1H) 4,98 (с, 1H) 5,20-5,33 (м, 1H) 5,77-5,96 (м, 1H)
-----	--	--	------	---

Приклад 172

Сполуку (54 мг), представлену в таблиці 3, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 2, стадії (1) і (2), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (100 мг), представленої формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і сполуки (94 мг), отриманої в довідковому прикладі 88, як вихідних речовин.

Приклад 173

(1) Деацетиловану сполуку (1,95 г) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 15, стадія (1), і в прикладі 2, стадія (2), шляхом використання сполуки (5,0 г), представленої формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і 2-аміно-N-бензилацетаміду гідрохлориду (5,71 г) як вихідних речовин.

(2) Сполуку (130 мг), представлену в таблиці 3, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (200 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), і сполуки (91,6 мг), отриманої в довідковому прикладі 1, як вихідних речовин.

Приклад 174

Сполуку (102 мг), представлену в таблиці 3, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (200 мг), отриманої в прикладі 173, стадія (1), і сполуки (92,9 мг), отриманої в довідковому прикладі 4, як вихідних речовин.

Приклад 175

Сполуку (126 мг), представлену в таблиці 3, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (200 мг), отриманої в прикладі 173, стадія (1), і сполуки (100,6 мг), отриманої в довідковому прикладі 5, як вихідних речовин.

Приклад 176

Сполуку (141 мг), представлену в таблиці 3, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (200 мг), отриманої в прикладі 173, стадія (1), і сполуки (101,9 мг), отриманої в довідковому прикладі 3, як вихідних речовин.

Приклад 177

(1) Деацетиловану сполуку (93,6 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 2, стадії (1) і (2), шляхом використання сполуки (200 мг), представленої формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і сполуки (171 мг), отриманої в довідковому прикладі 89, як вихідних речовин.

(2) Сполуку (39,8 мг), представлену в таблиці 3, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання сполуки (50 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 178

Сполуку (62 мг), представлену в таблиці 3, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 2, стадії (1) і (2), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (100 мг), представленої формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і сполуки (94 мг), отриманої в довідковому прикладі 90, як вихідних речовин.

Приклад 179

Сполуку (49 мг), представлену в таблиці 3, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 2, стадії (1) і (2), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (100 мг), представленої формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і сполуки (83 мг), отриманої в довідковому прикладі 92, як вихідних речовин.

Приклад 180

(1) Деацетиловану сполуку (133 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 2, стадії (1) і (2), шляхом використання сполуки (200 мг), представленої формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і сполуки (116 мг), отриманої в довідковому прикладі 94, як вихідних речовин.

- 5 (2) Сполуку (43,9 мг), представлену в таблиці 3, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання сполуки (50 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 181

- 10 Сполуку (45 мг), представлену в таблиці 3, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 2, стадії (1) і (2), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (100 мг), представленої формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і сполуки (87 мг), отриманої в довідковому прикладі 91, як вихідних речовин.

Приклад 182

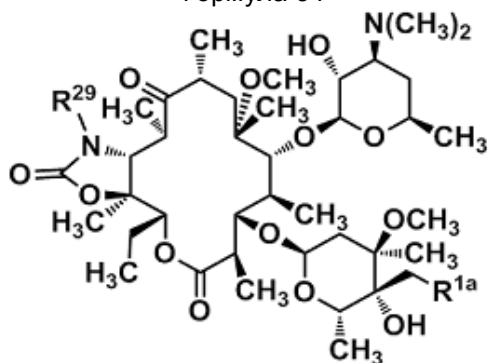
- 15 Сполуку (50 мг), представлену в таблиці 3, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 2, стадії (1) і (2), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (131 мг), представленої формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і сполуки (125 мг), отриманої в довідковому прикладі 95, як вихідних речовин.

Приклади 183-188

- 20 Нижче представлені способи одержання сполук, які представлені формулою (E) і характеризуються значеннями R^{29} і R^{1a} , визначеними в таблиці 4.


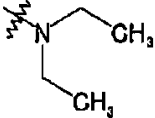

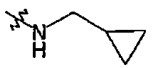
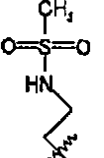
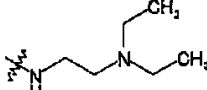
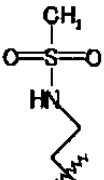
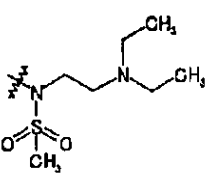
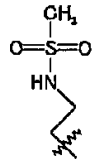
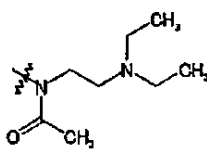
Формула (E)

Формула 34



Таблиця 4

При- клад	R^{29}	R^{1a}	ESI MS (M+H)	^1H -ЯМР, CDCl_3 , δ (м. ч.)
183			901,8	(600 МГц): 0,84 (т, J=7,57 Гц, 3H) 1,03 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,09 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,12 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,18 (с, 3H) 1,18-1,24 (м, 10H) 1,38 (с, 3H) 1,39 (с, 3H) 1,46-1,76 (м, 4H) 1,85-2,04 (м, 4H) 2,12-2,17 (м, 1H) 2,22-2,27 (м, 7H) 2,30 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,36-2,66 (м, 6H) 2,79-2,90 (м, 2H) 3,02 (с, 3H) 3,09 (с, 3H) 3,17-3,22 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,38-3,42 (м, 1H) 3,43-3,51 (м, 1H) 3,56 (с, 1H) 3,67-3,70 (м, 1H) 3,70-3,75 (м, 1H) 4,09-4,14 (м, 1H) 4,42 (д, J=6,88 Гц, 1H) 4,92-5,01 (м, 2H)

184			1007,6	(500 МГц): 0,83 (т, J=7,40 Гц, 3H) 0,98-1,03 (м, 9H) 1,08-1,16 (м, 12H) 1,20-1,28 (м, 7H) 1,39 (с, 6H) 1,48-1,80 (м, 8H) 1,87-2,00 (м, 3H) 2,03-2,13 (м, 2H) 2,31 (с, 6H) 2,42-2,52 (м, 1H) 2,55-2,76 (м, 5H) 2,82 (д, J=15,08 Гц, 1H) 2,85-2,93 (м, 1H) 3,01 (с, 3H) 3,06-3,13 (м, 1H) 3,16-3,23 (м, 1H) 3,29 (с, 3H) 3,42-3,51 (м, 3H) 3,59-3,76 (м, 5H) 4,07-4,15 (м, 1H) 4,43 (д, J=7,13 Гц, 1H) 4,95-5,03 (м, 2H) 5,41-5,49 (м, 1H) 6,46 (т, J=4,80 Гц, 1H) 8,25 (д, J=4,66 Гц, 2H)
185			1005,7	(600 МГц): 0,08-0,13 (м, 2H) 0,45-0,51 (м, 2H) 0,83 (т, J=7,57 Гц, 3H) 0,87-0,93 (м, 1H) 1,01 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,10 (д, J=7,79 Гц, 3H) 1,13 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,15 (с, 3H) 1,17 (д, J=6,42 Гц, 3H) 1,18-1,26 (м, 7H) 1,39 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,47-1,79 (м, 8H) 1,87-1,98 (м, 3H) 2,02-2,08 (м, 1H) 2,28 (с, 6H) 2,39-2,50 (м, 4H) 2,57-2,65 (м, 1H) 2,86-2,93 (м, 2H) 3,01 (с, 3H) 3,06-3,12 (м, 1H) 3,16-3,21 (м, 1H) 3,29 (с, 3H) 3,41-3,50 (м, 2H) 3,55-3,77 (м, 6H) 4,27-4,32 (м, 1H) 4,39-4,44 (м, 1H) 4,94-5,02 (м, 2H) 5,40-5,45 (м, 1H) 6,44-6,48 (м, 1H) 8,24 (д, J=4,59 Гц, 2H)
186			1022,7	(600 МГц): 0,83-0,91 (м, 6H) 0,99-1,04 (м, 6H) 1,09-1,33 (м, 19H) 1,40 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,54-1,67 (м, 2H) 1,74 (д, J=6,42 Гц, 2H) 1,84-2,06 (м, 4H) 2,28 (с, 6H) 2,33-2,38 (м, 1H) 2,40-2,68 (м, 10H) 2,88-2,95 (м, 2H) 2,98 (с, 3H) 3,05 (с, 3H) 3,09-3,14 (м, 1H) 3,16-3,20 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,30-3,36 (м, 1H) 3,49-3,57 (м, 2H) 3,59 (с, 1H) 3,70 (д, J=7,34 Гц, 2H) 3,77-3,83 (м, 1H) 3,84-3,91 (м, 1H) 4,23 (кв, J=6,42 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,93-5,00 (м, 2H) 5,48-5,58 (м, 1H)
187			1100,6	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,00-1,07 (м, 9H) 1,07-1,22 (м, 13H) 1,27 (с, 3H) 1,33 (д, J=6,42 Гц, 3H) 1,41 (с, 3H) 1,42 (с, 3H) 1,56 (с, 8H) 2,23-2,31 (м, 7H) 2,50-2,70 (м, 8H) 2,80 (с, 3H) 2,85-2,95 (м, 1H) 2,99 (с, 3H) 3,02 (с, 3H) 3,10-3,14 (м, 1H) 3,15-3,22 (м, 1H) 3,25 (с, 3H) 3,27-3,42 (м, 4H) 3,52-3,68 (м, 4H) 3,77-3,83 (м, 2H) 3,84-3,91 (м, 1H) 4,29-4,34 (м, 1H) 4,41 (д, J=6,88 Гц, 1H) 4,90-4,98 (м, 2H) 5,54 (т, J=5,73 Гц, 1H)
188			1064,6	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,26 Гц, 3H) 0,99-1,30 (м, 28H) 1,40 (с, 3H) 1,41 (с, 3H) 1,51-2,03 (м, 9H) 2,11-2,16 (м, 3H) 2,25-2,31 (м, 6H) 2,37-2,63 (м, 7H) 2,87-2,93 (м, 1H) 2,99 (с, 3H) 3,03 (с, 3H) 3,09-3,15 (м, 2H) 3,17-3,23 (м, 1H) 3,28-3,61 (м, 9H) 3,63-3,91 (м, 5H) 4,19 (кв, J=6,50 Гц, 1H) 4,39 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,86-4,98 (м, 2H) 5,49-5,55 (м, 1H)

Приклад 183

(1) Епоксисполуку (1,92 г) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 2, стадії (1) і (2), у прикладі 1, стадії (1) і (3), у прикладі 4, стадія (6), і в прикладі 1, стадія (4), шляхом

використання представленої формулою (SM1) сполуки (5,0 г), отриманої способом, описаним у міжнародній патентній публікації WO 93/21199, і 40 % водного метиламіну (4,7 мл) як вихідних речовин.

(2) Сполуку (245 мг), представлену в таблиці 4, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (300 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 184

Сполуку (62 мг), представлену в таблиці 4, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (50 мг), отриманої в прикладі 6, стадія (4), і діетиламіну (56 мкл) як вихідних речовин.

Приклад 185

Сполуку (55 мг), представлену в таблиці 4, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (50 мг), отриманої в прикладі 6, стадія (4), і циклопропілметиламіну (38 мг) як вихідних речовин.

Приклад 186

Сполуку (881 мг), представлену в таблиці 4, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (1 г), отриманої в прикладі 86, стадія (1), і N,N-діетилетилен-1,2-діаміну (320,6 мг) як вихідних речовин.

Приклад 187

Сполуку (18 мг), представлену в таблиці 4, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 71, стадія (2), шляхом використання сполуки (50 мг), отриманої в прикладі 186, як вихідної речовини.

Приклад 188

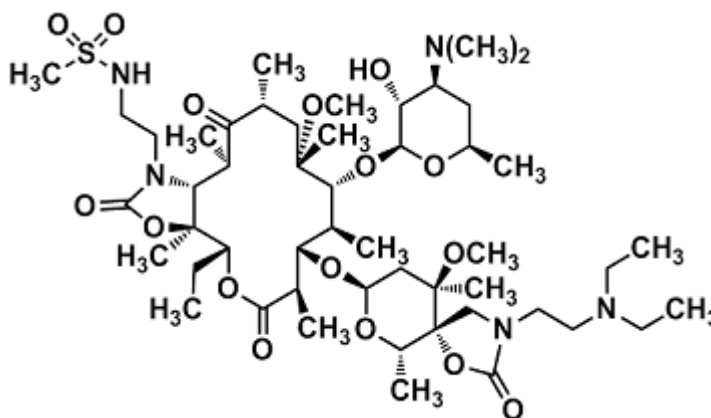
Сполуку (100 мг), отриману в прикладі 186, розчиняли в хлороформі (1,0 мл), до розчину додавали оцтовий ангідрид (9,2 мкл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 4 годин. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску, до отриманого залишку додавали насичений водний гідрокарбонат натрію й етилацетат, і розділяли шари. Органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 30/1/0,1→10/1/0,1) з одержанням сполуки (54 мг), представленої в таблиці 4.

Приклад 189

Нижче представлений спосіб одержання сполуки, представленої формулою (F).

Формула (F)

Формула 35



Приклад 189

Сполуку (30 мг), отриману в прикладі 186, розчиняли в хлороформі (1 мл), і додавали до розчину піридин (47,5 мкл). До реакційної суміші протягом 1,5 годин при охолодженні на льоді додавали розчин трифосгену (8,7 мг) у хлороформі (0,1 мл), і перемішували отриману суміш. До реакційної суміші додавали дистильовану воду й хлороформ, і розділяли шари. Органічний шар концентрували в умовах зниженого тиску з одержанням залишку. Отриманий залишок очищали методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 30/1/0,1→10/1/0,1) з одержанням згаданої вище цільової сполуки (20 мг).

MC (ESI) m/z = 1048,6 $[M+H]^+$

^1H -ЯМР (600 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 0,86 (т, $J=7,22$ Гц, 3H), 0,97-1,04 (м, 9H), 1,09-1,28 (м, 19H), 1,40 (с, 6H), 1,52-1,68 (м, 3H), 1,74 (д, $J=6,19$ Гц, 2H), 1,85-1,97 (м, 3H), 2,17 (д, $J=15,28$ Гц,

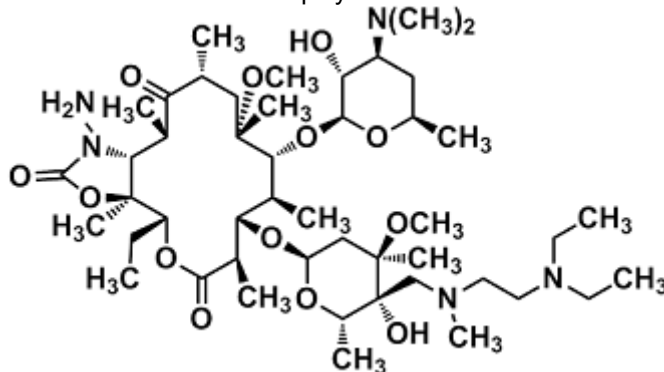
1H), 2,29 (с, 6H), 2,36-2,43 (м, 1H), 2,50-2,65 (м, 6H), 2,91-3,08 (м, 8H), 3,09-3,14 (м, 1H), 3,16-3,21 (м, 1H), 3,27-3,48 (м, 7H), 3,52-3,66 (м, 3H), 3,72 (т, J=9,50 Гц, 2H), 3,77-3,91 (м, 2H), 4,25 (кв, J=6,19 Гц, 1H), 4,36 (д, J=7,02 Гц, 1H), 4,94-4,99 (м, 2H), 5,48-5,53 (м, 1H)

Приклад 190

- 5 Нижче представлений спосіб одержання сполуки, представленої формулою (G).

Формула (G)

Формула 36



Приклад 190

- 10 (1) Циклізовану сполуку (414 мг) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (1), шляхом використання сполуки (400 мг), представленої формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і моногідрату гідрозину (90 мкл) як вихідних речовин.

- 15 (2) Сполуку (100 мг), отриману на описаній вище стадії (1), 4-диметиламінопіридин (6 мг) і триетиламін (83 мкл) розчиняли в хлороформі (4 мл) і диметилформаміді (1 мл), до розчину додавали розчин сульфамойлхлориду (41 мг) у хлороформі (1 мл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 11 годин. До реакційної суміші додавали 4-диметиламінопіридин (12 мг), триетиламін (165 мкл) і сульфамойлхлорид (80 мг), отриману суміш додатково перемішували при кімнатній температурі протягом 2 годин, а потім при 40 °C протягом 3 годин. До реакційної суміші додавали насичений водний гідрокарбонат натрію й етилацетат, розділяли шари, і екстрагували водний шар етилацетатом. Об'єднаний органічний шар промивали насиченим водним хлоридом натрію, потім сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом препаративної тонкошарової хроматографії (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 15/1/0,1) з одержанням сульфамойльної сполуки (48 мг).

- 25 (3) Деацетиловану сполуку (20 мг) і деацетиловану сполуку (9,2 мг), ізомеризовану по 10-положенню, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (2), шляхом використання сполуки (47 мг), отриманої на описаній вище стадії (2), як вихідної речовини.

- 30 (4) Згадану вище цільову сполуку (3 мг) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання деацетилованої сполуки (9,2 мг), ізомеризованої по 10-положенню й отриманої на описаній вище стадії (3), як вихідної речовини.

МС (ESI) $m/z = 930 [M+H]^+$

- 35 ¹H-ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ (м. ч.): 0,86 (т, J=7,6 Гц, 3H), 1,01 (т, J=6,8 Гц, 6H), 1,03 (д, J=7,1 Гц, 3H), 1,07 (д, J=7,1 Гц, 3H), 1,13-1,20 (м, 10H), 1,23-1,27 (м, 6H), 1,34 (с, 3H), 1,54-1,68 (м, 3H), 1,63 (с, 3H), 1,76-1,85 (м, 2H), 1,90-2,09 (м, 6H), 2,29 (с, 6H), 2,33 (с, 3H), 2,38-2,64 (м, 8H), 2,72-2,90 (м, 2H), 3,14-3,19 (м, 1H), 3,20 (с, 3H), 3,26-3,30 (м, 1H), 3,30 (с, 3H), 3,39 (д, J=2,4 Гц, 1H), 3,41-3,47 (м, 1H), 3,55 (дд, J=7,8, 2,6 Гц, 1H), 3,60-3,62 (м, 2H), 3,79-3,81 (м, 1H), 3,83 (с, 1H), 4,14 (кв, J=6,1 Гц, 1H), 4,34 (д, J=t, 3 Гц, 1H), 4,91 (дд, J=10,5, 2,0 Гц, 1H), 5,09 (д, J=4,6 Гц, 1H)

Приклади 191-232

- 40 Нижче представлені способи одержання сполук, які представлені формулою (H) і характеризуються значеннями R^{29c} і R^{2b}, визначеними в таблиці 5.

Формула (H)
Формула 37

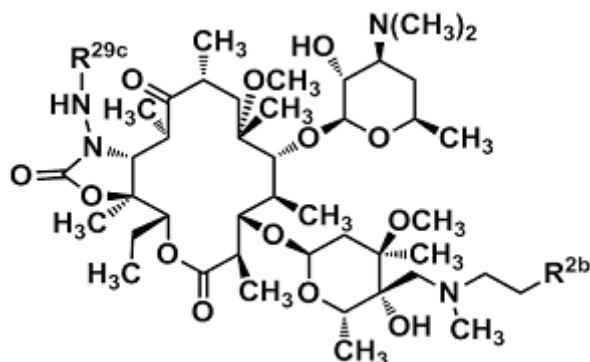
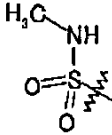
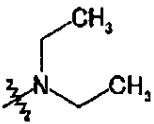
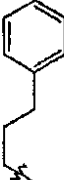
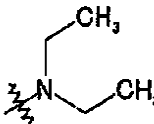
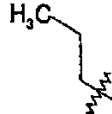
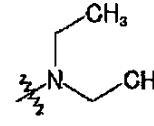
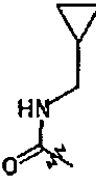
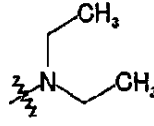


Таблица 5-1

При- клад	R ^{29c}	R ^{2b}	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
191	H		930	(400 МГц): 0,83 (т, J=7,3 Гц, 3H) 1,02 (т, J=7,1 Гц, 6H) 1,07 (д, J=6,6 Гц, 3H) 1,08 (д, J=7,3 Гц, 3H) 1,15 (д, J=8,1 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,18 (д, J=6,4 Гц, 3H) 1,20 (д, J=7,3 Гц, 3H) 1,23 (д, J=6,1 Гц, 3H) 1,36 (с, 3H) 1,39 (с, 3H) 1,46-1,56 (м, 1H) 1,58-1,68 (м, 1H) 1,74-1,78 (м, 2H) 1,82-2,04 (м, 5H) 2,08 (д, J=14,9 Гц, 1H) 2,28 (с, 6H) 2,33 (с, 3H) 2,40-2,68 (м, 9H) 2,83 (д, J=14,7 Гц, 1H) 2,88 (дд, J=9,5, 2,0 Гц, 1H) 3,02 (с, 3H) 3,04-3,09 (м, 1H) 3,17 (дд, J=10,3, 7,3 Гц, 1H) 3,27 (с, 3H) 3,40-3,50 (м, 2H) 3,60 (с, 1H) 3,68 (д, J=7,3 Гц, 1H) 3,71 (д, J=9,3 Гц, 1H) 4,09 (кв, J=6,4 Гц, 1H) 4,40 (д, J=7,3 Гц, 1H) 4,50 (с, 1H) 4,98 (д, J=3,9 Гц, 1H) 5,02 (дд, J=10,7, 2,2 Гц, 1H)
192			1008	(400 МГц): 0,89 (т, J=7,3 Гц, 3H) 1,01 (т, 7,1 Гц, 3H) 1,02 (д, J=7,1 Гц, 3H) 1,06 (д, J=6,6 Гц, 3H) 1,08 (д, J=6,6 Гц, 3H) 1,16 (д, J=7,1 Гц, 3H) 1,20 (д, J=7,3 Гц, 3H) 1,22 (д, J=6,1 Гц, 3H) 1,37 (с, 3H) 1,45 (с, 3H) 1,51-1,58 (м, 1H) 1,61-1,67 (м, 1H) 1,71-2,02 (м, 8H) 2,09 (д, J=14,7 Гц, 1H) 2,28 (с, 6H) 2,33 (с, 3H) 2,40-2,80 (м, 12H) 2,67-2,74 (м, 1H) 2,79-2,91 (м, 5H) 3,07 (с, 3H) 3,16 (3, 3H) 3,16-3,19 (м, 2H) 3,23-3,27 (м, 1H) 3,27 (с, 3H) 3,39-3,52 (м, 2H) 3,69-3,75 (м, 2H) 3,92 (с, 1H) 4,05 (кв, J=6,4 Гц, 1H) 4,44 (д, J=7,3 Гц, 1H) 4,95-4,99 (м, 1H) 5,40 (дд, J=10,3, 3,2 Гц, 1H)

193			1023	(400 МГц): 0,83 (т, J=7,6 Гц, 3H) 1,02 (т, J=7,1 Гц, 3H) 1,06 (д, J=6,8 Гц, 3H) 1,09 (д, J=7,3 Гц, 3H) 1,15 (д, J=7,3 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,19 (д, J=6,4 Гц, 3H) 1,22 (д, J=4,9 Гц, 3H) 1,23 (д, J=6,1 Гц, 3H) 1,36 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,48-1,56 (м, 2H) 1,62-1,68 (м, 2H) 1,74-2,02 (м, 8H) 2,09 (д, J=14,9 Гц, 1H) 2,28 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,39-2,68 (м, 11H) 2,80-2,92 (м, 3H) 3,02 (с, 3H) 3,18 (дд, J=10,3, 7,3 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,38-3,50 (м, 2H) 3,61 (с, 1H) 3,68 (д, J=7,3 Гц, 1H) 3,74 (д, J=4,2 Гц, 1H) 4,09 (кв, J=6,4 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,3 Гц, 1H) 4,50 (с, 2H) 4,98-5,00 (м, 1H) 5,02 (дд, J=10,7, 2,0 Гц, 1H)
194			1048	(400 МГц): 0,82 (т, J=7,3 Гц, 3H) 1,02 (т, J=7,1 Гц, 6H) 1,05 (д, J=7,6 Гц, 3H) 1,11 (д, J=7,6 Гц, 3H) 1,14 (д, J=9,1 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,19 (д, J=6,1 Гц, 3H) 1,22 (д, J=7,1 Гц, 3H) 1,23 (д, J=6,10 Гц, 3H) 1,37 (с, 3H) 1,39 (с, 3H) 1,47-1,56 (м, 1H) 1,62-1,93 (м, 9H) 1,99-2,06 (м, 2H) 2,09 (д, J=14,7 Гц, 1H) 2,28 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,38-2,67 (м, 10H) 2,73 (т, J=7,8 Гц, 2H) 2,83 (д, J=14,9 Гц 1H) 2,86-2,96 (м, 3H) 3,02 (с, 3H) 3,10-3,20 (м, 2H) 3,28 (с, 3H) 3,42-3,51 (м, 2H) 3,70-3,75 (м, 2H) 3,79 (с, 1H) 4,10 (кв, J=6,4 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,1 Гц, 1H) 4,99-5,06 (м, 2H) 5,46 (т, J=4,9 Гц, 1H) 7,12-7,17 (м, 1H) 7,19-7,27 (м, 4H)
195			972	(400 МГц): 0,83 (т, J=7,3 Гц, 3H) 0,97 (т, J=7,5 Гц, 3H) 1,01 (д, J=7,1 Гц, 3H) 1,04 (д, J=6,4 Гц, 3H) 1,11 (д, J=7,6 Гц, 3H) 1,14 (д, J=7,6 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,19 (д, J=6,4 Гц, 3H) 1,23 (д, J=6,4 Гц, 3H) 1,37 (с, 3H) 1,41 (с, 3H) 1,46-2,02 (м, 14H) 2,09 (д, J=14,9 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,32 (с, 3H) 2,40-2,70 (м, 9H) 2,77-2,86 (м, 3H) 2,88-2,96 (м, 1H) 3,08 (с, 3H) 3,01-3,20 (м, 2H) 3,28 (с, 3H) 3,42-3,52 (м, 1H) 3,69-3,76 (м, 2H) 3,79 (с, 1H) 4,10 (кв, J=6,4 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,3 Гц, 1H) 4,99-5,01 (м, 1H) 5,04 (дд, J=11,0, 2,0 Гц, 1H) 5,37 (т, J=5,4 Гц, 1H)
196			1027,7	(400 МГц): 0,84-0,91 (м, 3H) 0,18-0,22 (м, 2H) 0,40-0,48 (м, 2H) 0,90 (т, J=7,3 Гц, 1H) 0,96-1,25 (м, 26H) 1,36 (с, 3H) 1,44 (с, 3H) 1,50-1,88 (м, 8H) 1,89-2,05 (м, 3H) 2,09 (д, J=14,9 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,38-2,71 (м, 10H) 2,80-2,90 (м, 2H) 2,91 (с, 3H) 2,93-3,01 (м, 1H) 3,08 (кв, J=6,8 Гц, 1H) 3,14-3,26 (м, 2H) 3,27 (с, 3H) 3,36-3,52 (м, 2H) 3,66 (д, J=7,1 Гц, 1H) 3,72 (д, J=9,0 Гц, 1H) 3,79 (с, 1H) 4,07 (кв, J=6,3 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,3 Гц, 1H) 4,97 (д, J=4,4 Гц, 1H) 5,24-5,30 (ra, 2H) 5,34 (д, J=10,3 Гц, 1H) 7,67 (с, 1H)

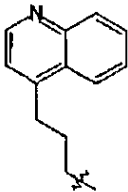
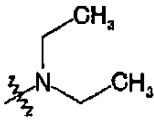
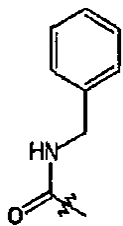
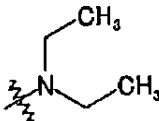
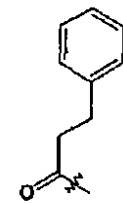
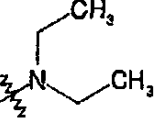
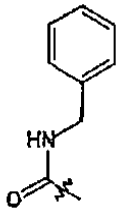
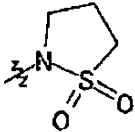
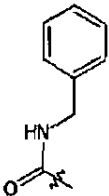
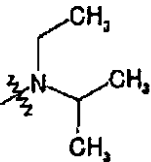
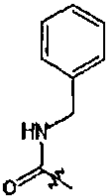
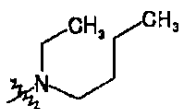
197			1099	(400 МГц): 0,76 (т, J=7,3 Гц, 3H) 1,02 (т, J=7,1 Гц, 6H) 1,06 (д, J=6,8 Гц, 3H) 1,11 (д, J=7,3 Гц, 3H) 1,15 (д, J=7,3 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,19 (д, J=6,1 Гц, 3H) 1,23 (д, J=5,6 Гц, 3H) 1,38 (с, 3H) 1,39 (с, 3H) 1,46-1,56 (м, 1H) 1,62-1,68 (м, 1H) 1,72-1,93 (м, 5H) 1,99-2,12 (м, 6H) 2,28 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,39-2,68 (м, 10H) 2,83 (д, J=14,7 Гц, 1H) 2,88-3,10 (м, 3H) 3,05 (с, 3H) 3,16-3,31 (м, 4H) 3,28 (с, 3H) 3,46-3,52 (м, 2H) 3,72 (дд, J=9,8, 7,1 Гц, 1H) 3,79 (с, 1H) 4,10 (кв, J=6,4 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,3 Гц, 1H) 4,98-5,03 (м, 2H) 5,61-5,65 (м, 1H) 7,29 (д, J=4,4 Гц, 1H) 7,50-7,55 (м, 1H) 7,64-7,68 (м, 1H) 8,08 (д, J=8,6 Гц, 1H) 8,13 (д, J=8,3 Гц, 1H) 8,78 (д, J=4,39 Гц, 1H)
-----	---	---	------	---

Таблица 5-2

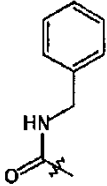
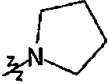
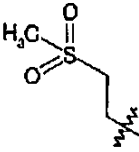
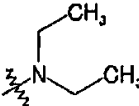
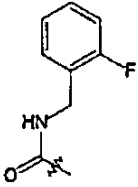
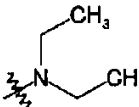
При-клад	R ^{29c}	R ^{2b}	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
198			1063	(400 МГц): 0,78 (т, J=7,3 Гц, 3H) 1,02 (т, J=7,1 Гц, 6H) 1,05-1,09 (м, 6H) 1,12 (д, J=6,8 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,19 (д, J=6,4 Гц, 3H) 1,20 (д, J=7,3 Гц, 3H) 1,23 (д, J=6,1 Гц, 3H) 1,34 (с, 3H) 1,41 (с, 3H) 1,48-1,57 (м, 1H) 1,61-1,90 (м, 8H) 1,97 (дд, J=10,0, 4,9 Гц, 1H) 2,01 (с, 1H) 2,09 (д, J=14,6 Гц, 1H) 2,28 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,39-2,67 (м, 11H) 2,80-2,86 (м, 3H) 2,88 (с, 3H) 3,06 (кв, J=6,8 Гц, 1H) 3,16 (дд, J=10,0, 7,1 Гц, 1H) 3,27 (с, 1H) 3,40-3,49 (м, 2H) 3,66 (д, J=7,1 Гц, 1H) 3,72 (д, J=8,8 Гц, 1H) 3,78 (с, 1H) 4,07 (кв, J=6,4 Гц, 1H) 4,30 (дд, J=14,4, 4,6 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,3 Гц, 1H) 4,53 (дд, J=14,4, 6,6 Гц, 1H) 5,00 (д, J=3,4 Гц, 1H) 5,24 (д, J=10,0 Гц, 1H) 5,43-5,49 (м, 1H) 7,18-7,34 (м, 5H) 7,76 (с, 1H)
199			1062	(400 МГц): 0,93 (т, J=7,3 Гц, 3H) 1,01 (д, J=7,1 Гц, 3H) 1,03 (д, J=7,3 Гц, 3H) 1,05-1,09 (м, 5H) 1,13 (д, J=6,6 Гц, 3H) 1,14 (д, J=7,3 Гц, 3H) 1,15 (с, 3H) 1,16 (д, J=6,5 Гц, 3H) 1,20 (д, J=7,3 Гц, 3H) 1,21 (д, J=5,9 Гц, 3H) 1,33 (с, 3H) 1,42 (с, 3H) 1,48-1,56 (м, 1H) 1,61-1,67 (м, 1H) 1,74-1,85 (м, 3H) 1,90-2,05 (м, 3H) 2,08 (д, J=14,9 Гц, 1H) 2,28 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,39-2,63 (м, 12H) 2,77-2,82 (м, 2H) 2,85 (с, 3H) 2,99-3,07 (м, 3H) 3,16 (дд, J=10,0, 7,3 Гц, 1H) 3,26 (с, 3H) 3,42-3,52 (м, 2H) 3,63 (с, 1H) 3,67-3,70 (м, 2H) 4,04 (кв, J=6,4 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,3 Гц, 1H) 4,94-4,99 (м, 1H) 5,75-5,82 (м, 1H) 7,17-7,31 (м, 5H) 8,55 (с, 1H)

200			1111	(400 МГц): 0,78 (т, J=7,3 Гц, 3H) 0,91 (т, J=7,3 Гц, 6H) 1,07 (д, J=7,6 Гц, 3H) 1,08 (д, J=6,6 Гц, 3H) 1,13 (д, J=9,5 Гц, 3H) 1,15 (с, 3H) 1,18 (д, J=6,6 Гц, 3H) 1,20 (д, J=8,8 Гц, 3H) 1,23 (д, J=6,4 Гц, 3H) 1,34 (с, 3H) 1,42 (с, 3H) 1,48-1,90 (м, 8H) 1,96 (дд, J=15,1, 5,4 Гц, 1H) 2,03-2,11 (м, 2H) 2,28 (с, 6H) 2,34-2,39 (м, 1H) 2,40 (с, 3H) 2,60-2,74 (м, 3H) 2,82-2,92 (м, 2H) 2,88 (с, 3H) 3,04-3,20 (м, 4H) 3,28 (с, 3H) 3,28-3,32 (м, 2H) 3,39-3,45 (м, 1H) 3,46 (с, 1H) 3,63 (д, J=7,3 Гц, 1H) 3,74 (д, J=8,8 Гц, 1H) 3,78 (с, 1H) 4,10 (кв, J=6,6 Гц, 1H) 4,31 (дд, J=14,4, 4,9 Гц, 1H) 4,39 (д, J=7,1 Гц, 1H) 4,51 (дд, J=14,7, 6,6 Гц, 1H) 4,58 (с, 1H) 4,99 (д, J=4,9 Гц, 1H) 5,26 (д, J=10,0 Гц, 1H) 5,41-5,45 (м, 1H) 7,19-7,34 (м, 5H) 7,75 (с, 1H)
201			1077	(400 МГц): 0,78 (т, J=7,3 Гц, 3H) 0,92 (т, J=7,3 Гц, 3H) 0,95-0,98 (м, 6H) 1,08 (д, J=6,8 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,1 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,20 (с, 3H) 1,21 (д, J=7,6 Гц, 3H) 1,23 (д, J=6,4 Гц, 3H) 1,35 (с, 3H) 1,42 (с, 3H) 1,48-1,90 (м, 11H) 1,94-2,03 (м, 2H) 2,06 (д, J=14,2 Гц, 1H) 2,28 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,40-2,60 (м, 5H) 2,82-2,87 (м, 2H) 2,88 (с, 3H) 3,07 (кв, J=7,3 Гц, 1H) 3,17 (дд, J=10,3, 7,3 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,44 (с, 1H) 3,44-3,49 (м, 1H) 3,66 (д, J=7,3 Гц, 1H) 3,73 (д, J=8,6 Гц, 1H) 3,79 (с, 1H) 4,07 (кв, J=6,6 Гц, 1H) 4,31 (дд, J=14,2, 4,6 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,3 Гц, 1H) 4,53 (дд, J=14,4, 6,4 Гц, 1H) 5,01 (д, J=4,1 Гц, 1H) 5,21-5,29 (м, 2H) 5,44-5,48 (м, 1H) 7,15-7,35 (м, 5H) 7,77 (с, 1H)
202			1091	(400 МГц): 0,78 (т, J=7,6 Гц, 3H) 0,90 (т, J=7,3 Гц, 3H) 1,02 (т, J=7,1 Гц, 6H) 1,07 (д, J=7,6 Гц, 3H) 1,08 (д, J=7,6 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,1 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,19 (д, J=5,9 Гц, 3H) 1,21-1,32 (м, 4H) 1,35 (с, 3H) 1,38-1,44 (м, 1H) 1,42 (с, 3H) 1,48-1,90 (м, 14H) 1,97 (дд, J=14,7, 4,9 Гц, 1H) 2,01-2,06 (м, 1H) 2,08 (д, J=14,7 Гц, 1H) 2,28 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,38-2,66 (м, 9H) 2,80-2,87 (м, 2H) 2,89 (с, 3H) 3,07 (кв, J=6,4 Гц, 1H) 3,17 (дд, J=10,3, 7,3 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,41-3,51 (м, 2H) 3,66 (д, J=7,1 Гц, 1H) 3,73 (д, J=9,0 Гц, 1H) 3,79 (с, 1H) 4,08 (кв, J=6,4 Гц, 1H) 4,32 (дд, J=14,4, 4,6 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,3 Гц, 1H) 4,53 (дд, J=14,4, 6,4 Гц, 1H) 5,00 (д, J=4,4 Гц, 1H) 5,25 (д, J=10,5 Гц, 1H) 5,43-5,48 (м, 1H) 7,19-7,35 (м, 5H) 7,74 (с, 1H)

203			1075	(400 МГц): 0,79 (т, J=7,6 Гц, 3H) 1,07 (д, J=6,8 Гц, 3H) 1,08 (д, J=6,8 Гц, 3H) 1,09 (д, J=5,9 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,1 Гц, 3H) 1,15 (с, 3H) 1,19 (д, J=6,1 Гц, 3H) 1,21 (д, J=7,1 Гц, 3H) 1,23 (д, J=6,1 Гц, 3H) 1,34 (с, 3H) 1,42 (с, 3H) 1,48-2,18 (м, 16H) 2,28 (с, 6H) 2,31-2,36 (м, 1H) 2,37 (с, 3H) 2,38-2,47 (м, 1H) 2,60-2,67 (м, 3H) 2,81-2,96 (м, 3H) 2,88 (с, 3H) 3,07 (кв, J=7,1 Гц, 1H) 3,13-3,19 (м, 2H) 3,28 (с, 3H) 3,42-3,50 (м, 2H) 3,68 (д, J=7,1 Гц, 1H) 3,72 (д, J=9,3 Гц, 1H) 3,79 (с, 1H) 4,08 (кв, J=6,4 Гц, 1H) 4,33 (дд, J=14,4, 4,9 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,3 Гц, 1H) 4,52 (дд, J=14,4, 6,4 Гц, 1H) 4,98-5,02 (м, 1H) 5,27 (д, J=9,8 Гц, 1H) 5,41-5,47 (м, 1H) 7,19-7,35 (м, 5H) 7,76 (с, 1H)
204			1089	(400 МГц): 0,085-0,11 (м, 2H) 0,46-0,51 (м, 2H) 0,78 (т, J=7,3 Гц, 3H) 0,84-0,93 (м, 1H) 1,03 (т, J=7,3 Гц, 3H) 1,07 (д, J=7,3 Гц, 3H) 1,08 (д, J=6,8 Гц, 3H) 1,13 (д, J=6,8 Гц, 3H) 1,17 (с, 3H) 1,19 (д, J=6,4 Гц, 3H) 1,20 (д, J=5,1 Гц, 3H) 1,23 (д, J=6,1 Гц, 3H) 1,35 (с, 3H) 1,42 (с, 3H) 1,48-1,90 (м, 8H) 1,94-2,06 (м, 2H) 2,10 (д, J=14,7 Гц, 1H) 2,28 (с, 6H) 2,31-2,68 (м, 8H) 2,36 (с, 3H) 2,81-2,86 (м, 2H) 2,88 (с, 3H) 3,06 (кв, J=6,8 Гц, 1H) 3,17 (дд, J=10,3, 7,3 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,40-3,51 (м, 2H) 3,67 (д, J=7,1 Гц, 1H) 3,73 (д, J=8,8 Гц, 1H) 3,79 (с, 1H) 4,08 (кв, J=6,4 Гц, 1H) 4,31 (дд, J=14,4, 4,6 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,1 Гц, 1H) 4,53 (дд, J=14,7, 6,4 Гц, 1H) 4,99-5,01 (м, 1H) 5,00 (д, J=3,7 Гц, 1H) 5,25 (д, J=9,8 Гц, 1H) 5,43-5,48 (м, 1H) 7,18-7,35 (м, 5H) 7,76 (с, 1H)

Таблица 5-3

При- клад	R ^{29c}	R ^{2b}	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
205			1091	(400 МГц): 0,79 (т, J=7,32 Гц, 3H) 1,01 (д, J=5,86 Гц, 6H) 1,03 (д, J=5,62 Гц, 6H) 1,08 (д, J=7,60 Гц, 3H) 1,08 (д, J=6,80 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,57 Гц, 3H) 1,14 (с, 3H) 1,18 (д, J=6,35 Гц, 3H) 1,20 (д, J=7,32 Гц, 3H) 1,23 (д, J=6,10 Гц, 3H) 1,26-1,24 (м, 1H) 1,35 (с, 3H) 1,42 (с, 3H) 1,50-1,92 (м, 6H) 1,93-2,08 (м, 3H) 2,29 (с, 6H) 2,36 (с, 3H) 2,38-2,69 (м, 6H) 2,81-2,87 (м, 2H) 2,88 (с, 3H) 2,99-3,09 (м, 3H) 3,17 (дд, J=10,3, 7,32 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,39-3,50 (м, 1H) 3,65 (д, J=7,08 Гц, 1H) 3,74 (д, J=9,03 Гц, 1H) 3,79 (с, 3H) 4,08 (кв, J=6,35 Гц, 1H) 4,31 (дд, J=14,5, 4,76 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,32 Гц, 1H) 4,53 (дд, J=14,5, 6,59 Гц, 1H) 5,00 (д, J=4,64 Гц, 1H) 5,26 (д, J=10,7 Гц, 1H) 5,51 (ушир. с, 1H) 7,18-7,35 (м, 5H) 7,74 (с, 1H)

206			1061	(400 МГц): 0,79 (т, J=7,32 Гц, 3H) 1,08 (т, J=7,32 Гц, 3H) 1,08 (д, J=6,59 Гц, 3H) 1,13 (д, J=6,84 Гц, 3H) 1,17 (с, 3H) 1,19 (д, J=6,35 Гц, 3H) 1,21 (д, J=6,84 Гц, 3H) 1,23 (д, J=6,10 Гц, 3H) 1,26-1,24 (м, 1H) 1,34 (с, 3H) 1,42 (с, 3H) 1,49-1,91 (м, 10H) 1,96 (дд, J=14,77, 5,00 Гц, 1H) 2,03 (д, J=14,77 Гц, 1H) 2,15 (д, J=14,9 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,36 (с, 3H) 2,40-2,47 (м, 1H) 2,49-2,71 (м, 9H) 2,84-2,88 (м, 2H) 2,88 (с, 3H) 3,07 (кв, J=7,00 Гц, 1H) 3,17 (дд, J=10,3, 7,10 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,37-3,52 (м, 1H) 3,67 (д, J=7,20 Гц, 1H) 3,72 (д, J=10,8 Гц, 1H) 3,79 (с, 3H) 4,10 (кв, J=6,35 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,10 Гц, 1H) 4,32 (дд, J=14,4, 4,88 Гц, 1H) 4,52 (дд, J=14,4, 6,23 Гц, 1H) 4,99 (д, J=3,66 Гц, 1H) 5,27 (д, J=10,3 Гц, 1H) 5,41-5,47 (м, 1H) 7,18-7,36 (м, 5H) 7,74 (с, 1H)
207			1036	(400 МГц): 0,87 (т, J=7,32 Гц, 3H) 1,02 (т, J=7,08 Гц, 6H) 1,03 (д, J=7,08 Гц, 3H) 1,11 (д, J=7,57 Гц, 3H) 1,15 (д, J=8,30 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,17-1,26 (м, 1H) 1,19 (д, J=6,10 Гц, 3H) 1,20 (д, J=5,62 Гц, 3H) 1,24 (д, J=6,10 Гц, 3H) 1,38 (с, 3H) 1,41 (с, 3H) 1,49-2,06 (м, 8H) 2,09 (д, J=14,65 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,35-2,70 (м, 10H) 2,83 (д, J=12,94 Гц, 1H) 2,88-2,96 (м, 1H) 3,00-3,12 (м, 1H) 3,05 (с, 3H) 3,14-3,21 (м, 2H) 3,24 (с, 3H) 3,26-3,52 (м, 5H) 3,28 (с, 3H) 3,68 (д, J=10,25 Гц, 1H) 3,72 (д, J=7,08 Гц, 1H) 3,74 (с, 1H) 4,09 (кв, J=6,35 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,32 Гц, 1H) 4,91 (дд, J=10,99, 1,95 Гц, 1H) 4,96-5,01 (м, 1H) 5,90-5,94 (м, 1H)
208			1081	(400 МГц): 0,85 (т, J=7,32 Гц, 3H) 1,04 (т, J=6,84 Гц, 6H) 1,07 (д, J=7,57 Гц, 3H) 1,08 (д, J=6,83 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,08 Гц, 3H) 1,17 (с, 3H) 1,19 (д, J=6,35 Гц, 3H) 1,20 (д, J=5,37 Гц, 3H) 1,23 (д, J=6,10 Гц, 3H) 1,34 (с, 3H) 1,42 (с, 3H) 1,48-1,96 (м, 7H) 1,96-2,03 (м, 1H) 2,10 (д, J=14,9 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,38-2,64 (м, 10H) 2,84 (д, J=14,9 Гц, 1H) 3,07 (кв, J=7,08 Гц, 1H) 3,17 (дд, J=10,3, 2,93 Гц, 1H) 3,27 (с, 3H) 3,37-3,51 (м, 2H) 3,66 (д, J=7,32 Гц, 1H) 3,69 (д, J=9,03 Гц, 1H) 3,78 (с, 1H) 4,07 (кв, J=6,35 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,08 Гц, 1H) 4,43 (дд, J=15,1, 7,08 Гц, 1H) 4,54 (дд, J=15,1, 6,35 Гц, 1H) 4,97 (д, J=3,66 Гц, 1H) 5,31 (д, J=9,03 Гц, 1H) 5,49-5,57 (м, 1H) 6,99 (дт, J=8,30, 1,22 Гц, 1H) 7,06 (дт, J=7,57, 1,22 Гц, 1H) 7,19-7,26 (м, 1H) 7,41 (дт, J=7,57, 1,71 Гц, 1H) 7,57 (с, 1H)

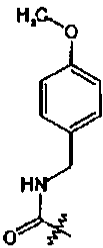
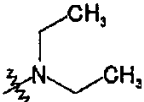
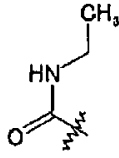
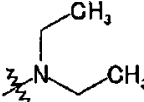
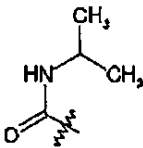
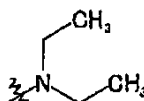
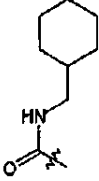
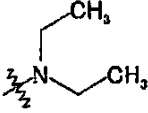
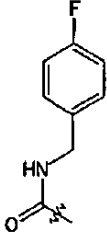
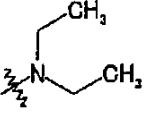
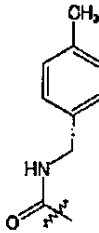
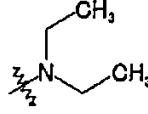
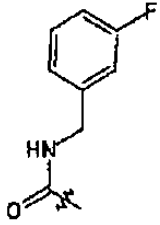
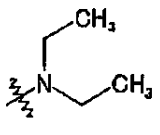
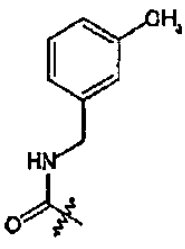
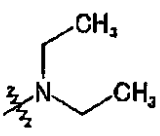
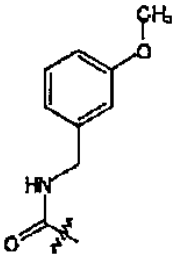
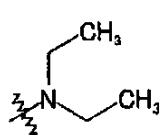
209			1093	(400 МГц): 0,79 (т, J=7,32 Гц, 3H) 1,03 (т, J=7,08 Гц, 6H) 1,08 (д, J=7,08 Гц, 6H) 1,13 (д, J=7,08 Гц, 3H) 1,17 (с, 3H) 1,17 (д, J=6,18 Гц, 3H) 1,21 (д, J=7,32 Гц, 3H) 1,23 (д, J=6,10 Гц, 3H) 1,24-1,26 (м, 1H) 1,36 (с, 3H) 1,42 (с, 3H) 1,49-1,96 (м, 1H) 1,64-1,90 (м, 5H) 1,95-2,06 (м, 2H) 2,10 (д, J=14,9 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,40-2,68 (м, 10H) 2,81-2,90 (м, 2H) 2,91 (с, 3H) 3,07 (кв, J=7,08 Гц, 1H) 3,17 (дд, J=10,3, 7,32 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,40-3,51 (м, 1H) 3,67 (д, J=7,08 Гц, 1H) 3,73 (д, J=8,79 Гц, 1H) 3,78 (с, 3H) 3,78 (с, 1H) 4,07 (кв, J=6,18 Гц, 1H) 4,27 (дд, J=14,1, 4,88 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,32 Гц, 1H) 4,44 (дд, J=14,1, 5,98 Гц, 1H) 5,00 (д, J=3,66 Гц, 1H) 5,25 (д, J=9,52 Гц, 1H) 5,39 (с, 1H) 6,79-6,84 (м, 2H) 7,22-7,27 (м, 2H) 7,72 (с, 1H)
210			1001	(400 МГц): 0,89 (т, J=7,32 Гц, 3H) 1,02 (т, J=7,08 Гц, 6H) 1,08 (д, J=7,32 Гц, 6H) 1,13 (д, J=6,10 Гц, 3H) 1,14 (т, J=7,08 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,17 (д, J=6,35 Гц, 3H) 1,17-1,26 (м, 1H) 1,21 (д, J=7,08 Гц, 3H) 1,23 (д, J=5,62 Гц, 3H) 1,36 (с, 3H) 1,44 (с, 3H) 1,50-2,06 (м, 8H) 2,09 (д, J=14,89 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,39-2,70 (м, 10H) 2,79-2,91 (м, 2H) 2,92 (с, 3H) 3,07 (кв, J=6,59 Гц, 1H) 3,17 (дд, J=10,01, 7,08 Гц, 1H) 3,21-3,32 (м, 2H) 3,28 (с, 3H) 3,38-3,52 (м, 1H) 3,65 (д, J=7,08 Гц, 1H) 3,73 (д, J=9,03 Гц, 1H) 3,78 (с, 1H) 4,08 (кв, J=5,86 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,32 Гц, 1H) 4,98 (д, J=4,40 Гц, 1H) 5,10-5,17 (м, 1H) 5,31 (д, J=10,01 Гц, 1H) 7,62 (с, 1H)
211			1015	(400 МГц): 0,90 (т, J=7,32 Гц, 3H) 1,02 (т, J=7,08 Гц, 6H) 1,08 (д, J=7,08 Гц, 6H) 1,11-1,22 (м, 13H) 1,16 (с, 3H) 1,21 (д, J=7,32 Гц, 3H) 1,23 (д, J=5,86 Гц, 3H) 1,36 (с, 3H) 1,43 (с, 3H) 1,50-2,06 (м, 8H) 2,09 (д, J=14,65 Гц, 1H) 2,28 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,39-2,68 (м, 10H) 2,79-2,90 (м, 2H) 2,93 (с, 3H) 3,06 (кв, J=7,32 Гц, 1H) 3,17 (дд, J=10,25, 7,32 Гц, 1H) 3,27 (с, 3H) 3,37-3,52 (м, 1H) 3,67 (д, J=7,08 Гц, 1H) 3,72 (д, J=9,03 Гц, 1H) 3,75 (с, 1H) 3,87-3,98 (м, 1H) 4,07 (кв, J=6,35 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,32 Гц, 1H) 4,88 (д, J=7,32 Гц, 1H) 4,98 (д, J=3,91 Гц, 1H) 5,37 (д, J=10,25 Гц, 1H) 7,61 (с, 1H)

Таблица 5-4

При- клад	R ^{29c}	R ^{2b}	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
212			1069	(400 МГц): 0,88 (т, J=7,32 Гц, 3H) 1,02 (т, J=7,08 Гц, 6H) 1,08 (д, J=7,08 Гц, 6H) 1,13 (д, J=7,08 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,17-1,26 (м, 1H) 1,17 (д, J=6,59 Гц, 3H) 1,21 (д, J=6,35 Гц, 3H) 1,23 (д, J=5,86 Гц, 3H) 1,36 (с, 3H) 1,43 (с, 3H) 1,50-2,05 (м, 19H) 2,09 (д, J=14,89 Гц, 1H) 2,28 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,38-2,69 (м, 10H) 2,79-2,89 (м, 2H) 2,90 (с, 3H) 2,90-3,02 (м, 1H) 3,07 (кв, J=6,84 Гц, 1H) 3,12-3,20 (м, 2H) 3,27 (с, 3H) 3,37-3,51 (м, 1H) 3,67 (д, J=7,08 Гц, 1H) 3,72 (д, J=9,03 Гц, 1H) 3,78 (с, 1H) 4,07 (кв, J=6,35 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,32 Гц, 1H) 4,98 (д, J=3,66 Гц, 1H) 5,15-5,24 (м, 1H) 5,32 (д, J=10,50 Гц, 1H) 7,61 (с, 1H)
213			1081	(400 МГц): 0,79 (т, J=7,20 Гц, 3H) 1,03 (т, J=7,08 Гц, 6H) 1,08 (д, J=7,08 Гц, 6H) 1,13 (д, J=7,08 Гц, 3H) 1,17 (с, 3H) 1,19 (д, J=6,10 Гц, 3H) 1,21 (д, J=7,32 Гц, 3H) 1,23 (д, J=9,03 Гц, 3H) 1,24-1,25 (м, 1H) 1,35 (с, 3H) 1,42 (с, 3H) 1,50-1,90 (м, 6H) 1,96-2,02 (м, 2H) 2,10 (д, J=14,9 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,40-2,67 (м, 10H) 2,82-2,86 (м, 2H) 2,87 (с, 3H) 3,07 (кв, J=7,08 Гц, 1H) 3,17 (дд, J=10,3, 7,32 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,41-3,51 (м, 1H) 3,67 (д, J=7,32 Гц, 1H) 3,73 (д, J=9,28 Гц, 1H) 3,79 (с, 1H) 4,08 (кв, J=6,10 Гц, 1H) 4,27 (дд, J=14,8, 4,76 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,32 Гц, 1H) 4,49 (дд, J=14,8, 6,47 Гц, 1H) 5,00 (д, J=3,17 Гц, 1H) 5,21 (д, J=9,28 Гц, 1H) 5,50-5,54 (м, 1H) 6,94-7,00 (м, 2H) 7,28-7,33 (м, 2H) 7,72 (с, 1H)
214			1077	(400 МГц): 0,80 (т, J=7,32 Гц, 3H) 1,03 (т, J=7,08 Гц, 6H) 1,08 (д, J=6,84 Гц, 6H) 1,13 (д, J=6,84 Гц, 3H) 1,17 (с, 3H) 1,19 (д, J=6,27 Гц, 3H) 1,21 (д, J=7,08 Гц, 3H) 1,23 (д, J=6,10 Гц, 3H) 1,23-1,25 (м, 1H) 1,35 (с, 3H) 1,42 (с, 3H) 1,47-1,90 (м, 6H) 1,94-2,03 (м, 2H) 2,10 (д, J=14,9 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,31 (с, 3H) 2,35 (с, 3H) 2,40-2,67 (м, 10H) 2,81-2,88 (м, 2H) 2,90 (с, 3H) 3,08 (кв, J=6,84 Гц, 1H) 3,17 (дд, J=10,3, 7,32 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,40-3,50 (м, 1H) 3,67 (д, J=7,32 Гц, 1H) 3,73 (д, J=9,03 Гц, 1H) 3,78 (с, 1H) 4,08 (кв, J=6,27 Гц, 1H) 4,29 (дд, J=14,3, 4,52 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,32 Гц, 1H) 4,47 (дд, J=14,3, 6,10 Гц, 1H) 5,00 (д, J=3,17 Гц, 1H) 5,27 (д, J=9,77 Гц, 1H) 5,38 (с, 1H) 7,09 (д, J=7,81 Гц, 2H) 7,21 (д, J=7,81 Гц, 2H) 7,71 (с, 1H)

215			1081	(400 МГц): 0,80 (т, J=7,20 Гц, 3H) 1,03 (т, J=7,20 Гц, 6H) 1,08 (д, J=7,57 Гц, 3H) 1,08 (д, 7,08 Гц, 3H) 1,13 (д, J=6,84 Гц, 3H) 1,17 (с, 3H) 1,19 (д, J=6,35 Гц, 3H) 1,21 (д, J=7,57 Гц, 3H) 1,23 (д, J=6,10 Гц, 3H) 1,24-1,25 (м, 1H) 1,35 (с, 3H) 1,42 (с, 3H) 1,51-1,90 (м, 6H) 1,95-2,02 (м, 2H) 2,10 (д, J=14,9 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,40-2,69 (м, 10H) 2,82-2,86 (м, 2H) 2,87 (с, 3H) 3,07 (кв, J=7,08 Гц, 1H) 3,17 (дд, J=10,3, 7,32 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,39-3,51 (м, 1H) 3,67 (д, J=7,32 Гц, 1H) 3,71 (д, J=8,79 Гц, 1H) 3,80 (с, 1H) 4,08 (кв, J=6,35 Гц, 1H) 4,30 (дд, J=14,9, 4,88 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,32 Гц, 1H) 4,52 (дд, J=14,9, 6,59 Гц, 1H) 4,99 (д, J=3,42 Гц, 1H) 5,20 (д, J=9,52 Гц, 1H) 5,58 (с, 1H) 6,92 (м, 1H) 7,06 (м, 1H) 7,13 (д, J=7,57 Гц, 1H) 7,22-7,28 (м, 1H) 7,75 (с, 1H)
216			1077	(400 МГц): 0,80 (т, J=7,32 Гц, 3H) 1,03 (т, J=7,08 Гц, 6H) 1,08 (д, J=7,57 Гц, 3H) 1,08 (д, J=6,92 Гц, 3H) 1,13 (д, J=6,84 Гц, 3H) 1,17 (с, 3H) 1,19 (д, J=6,35 Гц, 3H) 1,21 (д, J=7,81 Гц, 3H) 1,23 (д, J=6,10 Гц, 3H) 1,23-1,25 (м, 1H) 1,35 (с, 3H) 1,42 (с, 3H) 1,49-1,90 (м, 6H) 1,95-2,02 (м, 2H) 2,10 (д, J=14,9 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,31 (с, 3H) 2,35 (с, 3H) 2,41-2,66 (м, 10H) 2,81-2,87 (м, 2H) 2,91 (с, 3H) 3,07 (кв, J=6,92 Гц, 1H) 3,17 (дд, J=10,3, 7,32 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,38-3,51 (м, 1H) 3,68 (д, J=7,08 Гц, 1H) 3,73 (д, J=8,79 Гц, 1H) 3,78 (с, 1H) 4,08 (кв, J=6,35 Гц, 1H) 4,28 (дд, J=14,4, 4,64 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,32 Гц, 1H) 4,48 (дд, J=14,4, 6,35 Гц, 1H) 5,00 (д, J=3,42 Гц, 1H) 5,28 (д, J=9,28 Гц, 1H) 5,36-5,39 (м, 1H) 7,04 (д, J=7,57 Гц, 1H) 7,11-7,20 (м, 3H) 7,74 (с, 1H)
217			1093	(400 МГц): 0,80 (т, J=7,32 Гц, 3H) 1,03 (т, J=7,08 Гц, 6H) 1,08 (д, J=7,32 Гц, 3H) 1,08 (д, J=6,84 Гц, 3H) 1,13 (д, J=6,84 Гц, 3H) 1,17 (с, 3H) 1,19 (д, J=6,59 Гц, 3H) 1,20 (д, J=7,81 Гц, 3H) 1,23 (д, J=6,10 Гц, 3H) 1,23-1,25 (м, 1H) 1,35 (с, 3H) 1,42 (с, 3H) 1,50-1,90 (м, 6H) 1,95-2,01 (м, 2H) 2,10 (д, J=14,9 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,40-2,68 (м, 10H) 2,81-2,88 (м, 2H) 2,89 (с, 3H) 3,07 (кв, J=6,84 Гц, 1H) 3,17 (дд, J=10,1, 7,32 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,40-3,51 (м, 1H) 3,67 (д, J=7,08 Гц, 1H) 3,73 (д, J=9,28 Гц, 1H) 3,79 (с, 3H) 3,79 (с, 1H) 4,08 (кв, J=6,59 Гц, 1H) 4,30 (дд, J=14,5, 4,76 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,32 Гц, 1H) 4,51 (дд, J=14,5, 6,47 Гц, 1H) 4,99 (д, J=3,42 Гц, 1H) 5,26 (д, J=9,28 Гц, 1H) 5,45-5,48 (м, 1H) 6,77 (дд, J=8,18, 2,32 Гц, 1H) 6,88-6,93 (м, 2H) 7,20 (т, J=8,18 Гц, 1H) 7,73 (с, 1H)

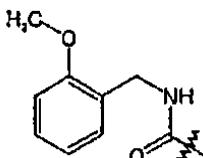
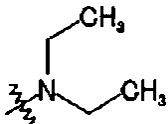
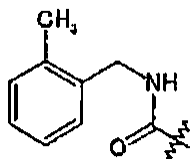
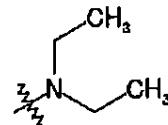
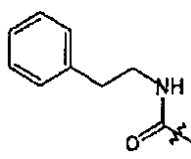
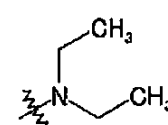
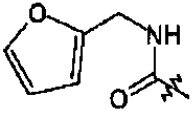
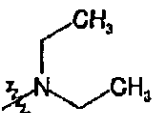
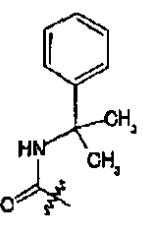
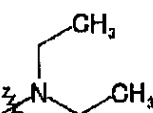
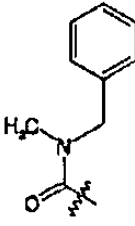
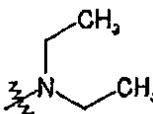
218			1093	(400 МГц): 0,86 (т, J=7,32 Гц, 3H) 1,03 (т, J=7,08 Гц, 6H) 1,06 (д, J=7,81 Гц, 3H) 1,09 (д, J=6,84 Гц, 3H) 1,14 (д, J=7,08 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,17-1,26 (м, 1H) 1,18 (д, J=6,35 Гц, 3H) 1,20 (д, J=6,84 Гц, 3H) 1,23 (д, J=6,10 Гц, 3H) 1,32 (с, 3H) 1,42 (с, 3H) 1,48-2,02 (м, 8H) 2,10 (д, J=14,65 Гц, 1H) 2,28 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,40-2,66 (м, 10H) 2,78-2,86 (м, 2H) 2,83 (с, 3H) 3,06 (кв, J=6,84 Гц, 1H) 3,17 (дд, J=10,25, 7,32 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,37-3,52 (м, 2H) 3,66 (д, J=7,08 Гц, 1H) 3,70 (д, J=8,55 Гц, 1H) 3,74 (с, 1H) 4,06 (кв, J=6,35 Гц, 1H) 4,34-4,49 (м, 3H) 4,98 (д, J=3,66 Гц, 1H) 5,38-5,51 (м, 2H) 6,83 (д, J=8,06 Гц, 1H) 6,87 (т, J=7,32 Гц, 1H) 7,18-7,31 (м, 2H) 7,73 (с, 1H)
-----	---	---	------	---

Таблица 5-5

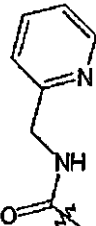
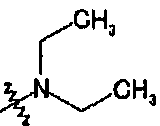
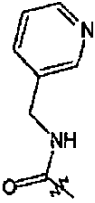
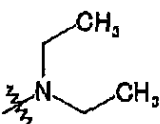
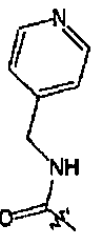
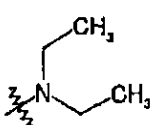
При- клад	R ^{29c}	R ^{2b}	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
219			1077	(400 МГц): 0,76 (т, J=7,32 Гц, 3H) 1,03 (т, J=7,08 Гц, 6H) 1,08 (д, J=6,35 Гц, 6H) 1,13 (д, J=6,84 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,17-1,26 (м, 1H) 1,19 (д, J=6,35 Гц, 3H) 1,20 (д, J=6,35 Гц, 3H) 1,24 (д, J=5,86 Гц, 3H) 1,36 (с, 3H) 1,41 (с, 3H) 1,47-1,90 (м, 5H) 1,94-2,06 (м, 3H) 2,10 (д, J=14,65 Гц, 1H) 2,28 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,35 (с, 3H) 2,39-2,70 (м, 10H) 2,79-2,87 (м, 2H) 2,93 (с, 3H) 3,07 (кв, J=6,35 Гц, 1H) 3,17 (дд, J=10,25, 7,32 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,36-3,52 (м, 2H) 3,68 (д, J=7,08 Гц, 1H) 3,73 (д, J=9,28 Гц, 1H) 3,79 (с, 1H) 4,08 (кв, J=6,35 Гц, 1H) 4,29 (дд, J=14,4 Гц, 4,40 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,32 Гц, 1H) 4,56 (дд, J=14,40, 6,84 Гц, 1H) 5,00 (д, J=3,42 Гц, 1H) 5,21 (д, J=10,01 Гц, 1H) 5,30-5,38 (м, 1H) 7,08-7,15 (м, 3H) 7,25-7,29 (м, 1H) 7,71 (с, 1H)
220			1077	(400 МГц): 0,86 (т, J=7,32 Гц, 3H) 1,02 (т, J=7,08 Гц, 6H) 1,07 (д, J=7,08 Гц, 6H) 1,13 (д, J=7,08 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,17-1,26 (м, 1H) 1,17 (д, J=6,59 Гц, 3H) 1,20 (д, J=7,32 Гц, 3H) 1,23 (д, J=6,10 Гц, 3H) 1,34 (с, 3H) 1,42 (с, 3H) 1,48-2,04 (м, 8H) 2,09 (д, J=14,89 Гц, 1H) 2,28 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,38-2,67 (м, 10H) 2,78-2,87 (м, 4H) 2,88 (с, 3H) 3,06 (кв, J=6,84 Гц, 1H) 3,17 (дд, J=10,25, 7,32 Гц, 1H) 3,27 (с, 3H) 3,36-3,50 (м, 3H) 3,51-3,62 (м, 1H) 3,66 (д, J=7,08 Гц, 1H) 3,71 (д, J=9,28 Гц, 1H) 3,74 (с, 1H) 4,06 (кв, J=6,35 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,32 Гц, 1H) 4,97 (д, J=3,42 Гц, 1H) 5,13-5,28 (м, 2H) 7,16-7,32 (м, 5H) 7,62 (с, 1H)

221			1053	(400 МГц): 0,88 (т, J=7,57 Гц, 3H) 1,03 (т, J=7,32 Гц, 6H) 1,07 (д, J=7,57 Гц, 3H) 1,08 (д, J=6,84 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,08 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,17-1,26 (м, 1H) 1,18 (д, J=6,35 Гц, 3H) 1,21 (д, J=7,57 Гц, 3H) 1,23 (д, J=6,10 Гц, 3H) 1,34 (с, 3H) 1,43 (с, 3H) 1,49-2,06 (м, 8H) 2,09 (д, J=14,89 Гц, 1H) 2,28 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,38-2,66 (м, 10H) 2,79-2,86 (м, 2H) 2,84 (с, 3H) 3,06 (кв, J=7,08 Гц, 1H) 3,17 (дд, J=10,01, 7,08 Гц, 1H) 3,27 (с, 3H) 3,38-3,52 (м, 2H) 3,66 (д, J=7,08 Гц, 1H) 3,71 (д, J=8,55 Гц, 1H) 3,76 (с, 1H) 4,07 (кв, J=6,35 Гц, 1H) 4,34 (дд, J=15,63, 5,13 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,08 Гц, 1H) 4,49 (дд, J=15,63, 6,10 Гц, 1H) 4,98 (д, J=3,66 Гц, 1H) 5,32-5,48 (м, 2H) 6,21-6,28 (м, 2H) 7,24-7,32 (м, 1H) 7,74 (с, 1H)
222			1091	(400 МГц): 0,79 (т, J=7,32 Гц, 3H) 1,04 (т, J=7,20 Гц, 6H) 1,07 (д, J=6,59 Гц, 3H) 1,08 (д, J=6,84 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,08 Гц, 3H) 1,17 (с, 3H) 1,19 (д, J=6,10 Гц, 3H) 1,21 (д, J=6,84 Гц, 3H) 1,23 (д, J=6,10 Гц, 3H) 1,23-1,25 (м, 1H) 1,36 (с, 3H) 1,43 (с, 3H) 1,50-1,92 (м, 6H) 1,96-2,02 (м, 2H) 2,10 (д, J=14,9 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,40-2,68 (м, 10H) 2,82-2,89 (м, 2H) 2,94 (с, 3H) 3,06 (кв, J=6,84 Гц, 1H) 3,17 (дд, J=10,1, 7,32 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,40-3,51 (м, 1H) 3,66 (д, J=7,32 Гц, 1H) 3,77 (д, J=9,03 Гц, 1H) 3,80 (с, 1H) 4,10 (кв, J=6,10 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,32 Гц, 1H) 5,02 (д, J=3,91 Гц, 1H) 5,17 (д, J=9,77 Гц, 1H) 5,48 (с, 1H) 7,16-7,20 (м, 1H) 7,28-7,32 (м, 2H) 7,47-7,50 (м, 2H) 7,67 (с, 1H)
223			1077	(400 МГц): 0,94 (т, J=7,32 Гц, 3H) 1,03 (т, J=7,08 Гц, 6H) 1,07 (д, J=7,32 Гц, 3H) 1,14-1,25 (м, 16H) 1,16 (с, 3H) 1,33 (с, 3H) 1,44 (с, 3H) 1,48-1,87 (м, 6H) 1,92-2,01 (м, 2H) 2,10 (д, J=14,7 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,41-2,62 (м, 10H) 2,76-2,86 (м, 2H) 2,80 (с, 3H) 2,92 (с, 3H) 3,09 (кв, J=6,67 Гц, 1H) 3,17 (дд, J=10,3, 7,32 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,44-3,52 (м, 1H) 3,63 (с, 1H) 3,68 (д, J=6,80 Гц, 1H) 3,72 (д, J=8,40 Гц, 1H) 4,07 (кв, J=6,35 Гц, 1H) 4,43 (д, J=7,32 Гц, 1H) 4,49 (д, J=15,1 Гц, 1H) 4,58 (д, J=15,1 Гц, 1H) 5,01 (д, J=3,66 Гц, 1H) 5,85 (дд, J=10,1, 3,05 Гц, 1H) 7,23-7,31 (м, 5H) 8,18 (с, 1H)

224			1079	(400 МГц): 0,64 (т, J=7,32 Гц, 3H) 1,03 (т, J=7,08 Гц, 6H) 1,07 (д, J=7,57 Гц, 3H) 1,10 (д, J=7,08 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,08 Гц, 3H) 1,17 (с, 3H) 1,17-1,26 (м, 7H) 1,24 (д, J=6,10 Гц, 3H) 1,38 (с, 3H) 1,41 (с, 3H) 1,47-1,83 (м, 5H) 1,99-2,06 (м, 3H) 2,10 (д, J=14,65 Гц, 1H) 2,28 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,38-2,63 (м, 9H) 2,66-2,76 (м, 1H) 2,80-2,91 (м, 2H) 2,94 (с, 3H) 3,07 (кв, J=7,08 Гц, 1H) 3,17 (дд, J=10,50, 7,32 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,40-3,51 (м, 2H) 3,66 (д, J=7,08 Гц, 1H) 3,73 (д, J=9,28 Гц, 1H) 3,87 (с, 1H) 4,08 (кв, J=6,35 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,08 Гц, 1H) 4,51 (дд, J=14,65, 3,42 Гц, 1H) 4,83-4,92 (м, 1H) 4,98-5,02 (м, 1H) 5,10 (дд, J=14,65, 6,59 Гц, 1H) 6,88-6,95 (м, 1H) 7,20-7,30 (м, 3H) 7,38 (д, J=7,08 Гц, 2H) 8,94 (с, 1H)
225			1113	(400 МГц): 0,71 (т, J=7,20 Гц, 3H) 1,05 (т, J=7,08 Гц, 6H) 1,06 (д, J=5,62 Гц, 3H) 1,07 (д, J=6,67 Гц, 3H) 1,12 (д, J=7,08 Гц, 3H) 1,17 (д, J=6,84 Гц, 3H) 1,18 (с, 3H) 1,21-1,25 (м, 7H) 1,35 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,46-1,54 (м, 1H) 1,65-2,13 (м, 8H) 2,29 (с, 6H) 2,36 (с, 3H) 2,41-2,65 (м, 10H) 2,79-2,87 (м, 2H) 2,92 (с, 3H) 3,06 (кв, J=6,67 Гц, 1H) 3,17 (дд, J=10,1, 7,20 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,45-3,51 (м, 1H) 3,67 (д, J=7,08 Гц, 1H) 3,71 (д, J=8,79 Гц, 1H) 3,78 (с, 1H) 4,09 (кв, J=6,84 Гц, 1H) 4,34 (с, 1H) 4,42 (д, J=7,20 Гц, 1H) 4,77 (дд, J=14,4, 4,15 Гц, 1H) 4,99 (д, J=3,17 Гц, 1H) 5,03 (дд, J=14,4, 6,59 Гц, 1H) 5,22 (д, J=9,77 Гц, 1H) 5,51 (ушир. с, 1H) 7,37-7,57 (м, 4H) 7,75-7,89 (м, 3H) 8,07-8,11 (м, 1H)

Таблица 5-6

При-клад	R ^{29c}	R ^{2b}	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
226			1113	(400 МГц): 0,72 (т, J=7,32 Гц, 3H) 1,06 (т, J=7,08 Гц, 6H) 1,07 (д, J=7,57 Гц, 3H) 1,09 (д, J=7,08 Гц, 3H) 1,14 (д, J=7,32 Гц, 3H) 1,16 (д, J=7,32 Гц, 3H) 1,18 (с, 3H) 1,19 (д, J=6,35 Гц, 3H) 1,23 (д, J=6,10 Гц, 3H) 1,27-1,25 (м, 1H) 1,35 (с, 3H) 1,42 (с, 3H) 1,47-1,55 (м, 1H) 1,65-2,12 (м, 8H) 2,30 (с, 6H) 2,36 (с, 3H) 2,43-2,67 (м, 10H) 2,81-2,87 (м, 2H) 2,93 (с, 3H) 3,08 (кв, J=7,08 Гц, 1H) 3,18 (дд, J=10,5, 7,08 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,43-3,50 (м, 1H) 3,67 (д, J=7,08 Гц, 1H) 3,73 (д, J=8,79 Гц, 1H) 3,81 (с, 1H) 4,09 (кв, J=7,32 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,08 Гц, 1H) 4,51 (дд, J=14,8, 5,25 Гц, 1H) 4,68 (дд, J=14,8, 6,35 Гц, 1H) 4,96-4,98 (м, 1H) 5,26 (д, J=10,0 Гц, 1H) 5,58-5,61 (м, 1H) 7,40-7,48 (м, 3H) 7,76-7,82 (м, 5H)

227			1064	(400 МГц): 0,89 (т, J=7,45 Гц, 3H) 1,03 (т, J=7,20 Гц, 6H) 1,06 (д, J=7,32 Гц, 3H) 1,11 (д, J=6,84 Гц, 3H) 1,13-1,25 (м, 13H) 1,15 (с, 3H) 1,33 (с, 3H) 1,44 (с, 3H) 1,51-1,59 (м, 1H) 1,61-2,12 (м, 8H) 2,28 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,40-2,67 (м, 10H) 2,77-2,85 (м, 2H) 2,83 (с, 3H) 3,08 (кв, J=6,84 Гц, 1H) 3,17 (дд, J=10,1, 7,32 Гц, 1H) 3,27 (с, 3H) 3,41-3,50 (м, 1H) 3,65 (д, J=7,32 Гц, 1H) 3,69 (д, J=8,79 Гц, 1H) 3,76 (с, 1H) 4,05 (кв, J=6,35 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,32 Гц, 1H) 4,52 (дд, J=16,0, 5,00 Гц, 1H) 4,58 (дд, J=16,0, 5,37 Гц, 1H) 4,94 (д, J=3,66 Гц, 1H) 5,51 (д, J=8,54 Гц, 1H) 6,19 (т, J=5,13 Гц, 1H) 7,14 (дд, J=7,51, 4,88 Гц, 1H) 7,33 (д, J=7,51 Гц, 1H) 7,63 (тд, J=7,51, 1,79 Гц, 1H) 7,88 (с, 1H) 8,49 (д, J=4,88 Гц, 1H)
228			1064	(400 МГц): 0,80 (т, J=7,20 Гц, 3H) 1,04 (т, J=7,45 Гц, 6H) 1,07 (д, J=8,06 Гц, 6H) 1,13 (д, J=7,08 Гц, 3H) 1,17 (с, 3H) 1,19 (д, J=6,43 Гц, 3H) 1,21 (д, J=6,84 Гц, 1H) 1,23 (д, J=6,10 Гц, 1H) 1,21-1,25 (м, 1H) 1,34 (с, 3H) 1,42 (с, 3H) 1,50-2,12 (м, 9H) 2,29 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,41-2,67 (м, 10H) 2,79-2,88 (м, 2H) 2,80 (с, 3H) 3,06 (кв, J=8,06 Гц, 1H) 3,17 (дд, J=10,3, 7,32 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,43-3,50 (м, 1H) 3,64 (д, J=7,60 Гц, 1H) 3,68 (д, J=8,80 Гц, 1H) 3,77 (с, 1H) 4,08 (кв, J=6,43 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,32 Гц, 1H) 4,34 (дд, J=14,9, 5,13 Гц, 1H) 4,52 (дд, J=14,9, 6,35 Гц, 1H) 4,98-5,00 (м, 1H) 5,18 (д, J=10,3 Гц, 1H) 5,70-5,74 (м, 1H) 7,22-7,26 (м, 1H) 7,75 (с, 1H) 7,77 (дт, J=7,81, 1,95 Гц, 1H) 8,49 (дд, J=4,88, 1,95 Гц, 1H) 8,54 (д, J=1,95 Гц, 1H)
229			1064	(400 МГц): 0,80 (т, J=7,32 Гц, 3H) 1,04 (т, J=7,20 Гц, 6H) 1,08 (д, J=7,57 Гц, 3H) 1,09 (д, J=6,84 Гц, 3H) 1,14 (д, J=7,08 Гц, 3H) 1,17 (с, 3H) 1,18-1,25 (м, 10H) 1,36 (с, 3H) 1,44 (с, 3H) 1,53-2,11 (м, 9H) 2,29 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,41-2,70 (м, 10H) 2,82-2,87 (м, 2H) 2,88 (с, 3H) 3,08 (кв, J=6,84 Гц, 1H) 3,17 (дд, J=10,4, 7,32 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,42-3,50 (м, 1H) 3,66 (д, J=7,32 Гц, 1H) 3,71 (д, J=9,03 Гц, 1H) 3,81 (с, 1H) 4,09 (кв, J=6,27 Гц, 1H) 4,31 (дд, J=15,8, 5,49 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,32 Гц, 1H) 4,57 (дд, J=15,8, 6,47 Гц, 1H) 4,98 (д, J=2,93 Гц, 1H) 5,17 (д, J=9,77 Гц, 1H) 5,77-5,81 (м, 1H) 7,25-7,28 (м, 2H) 7,80 (с, 1H) 8,52 (дд, J=4,52, 1,59 Гц, 1H)

230			1035	(400 МГц): 0,79 (т, J=7,32 Гц, 3H) 1,07 (д, J=7,57 Гц, 6H) 1,08 (д, J=6,84 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,08 Гц, 3H) 1,18 (с, 3H) 1,20 (д, J=6,35 Гц, 3H) 1,20 (д, J=5,37 Гц, 3H) 1,23 (д, J=6,10 Гц, 3H) 1,35 (с, 3H) 1,42 (с, 3H) 1,47-1,60 (м, 1H) 1,62-1,93 (м, 5H) 1,96 (дд, J=14,9, 5,13 Гц, 1H) 2,03 (д, J=14,9, 1H) 2,15 (д, J=14,6 Гц, 1H) 2,26 (с, 6H) 2,30 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,35-2,69 (м, 6H) 2,82 (д, J=14,6 Гц, 1H) 2,88 (с, 3H) 3,07 (кв, J=6,35 Гц, 1H) 3,18 (дд, J=10,3, 7,32 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,35-3,53 (м, 2H) 3,68 (д, J=7,32 Гц, 1H) 3,72 (д, J=9,03 Гц, 1H) 3,79 (с, 1H) 4,10 (кв, J=6,35 Гц, 1H) 4,32 (дд, J=14,4, 4,64 Гц, 1H) 4,43 (д, J=7,32 Гц, 1H) 4,52 (дд, J=14,4, 6,35 Гц, 1H) 5,00 (д, J=3,42 Гц, 1H) 5,27 (д, J=10,3 Гц, 1H) 5,40-5,49 (м, 1H) 7,19-7,35 (м, 5H) 7,73 (с, 1H)
231			1064	(400 МГц): 0,35-0,40 (м, 0,8H) 0,91-0,96 (м, 2,2H) 1,03 (т, J=7,08 Гц, 6H) 1,06 (д, J=7,57 Гц, 3H) 1,11 (д, J=6,84 Гц, 3H) 1,13 (д, J=8,06 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,16-1,26 (м, 10H) 1,31-1,43 (м, 6H) 1,63-1,85 (м, 6H) 1,93-2,05 (м, 3H) 2,10 (д, J=14,7 Гц, 1H) 2,28 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,40-2,61 (м, 10H) 2,75-2,90 (м, 5H) 2,99-3,05 (м, 1H) 3,17 (дд, J=10,3, 7,32 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,43-3,51 (м, 1H) 3,64-3,77 (м, 2H) 3,67 (с, 1H) 4,07 (м, 1H) 4,42 (д, J=7,32 Гц, 1H) 5,00 (м, 1H) 5,12-5,24 (м, 2H) 5,48-5,52 (м, 0,35H) 5,66-5,69 (м, 0,65H) 7,23-7,40 (м, 5H) 7,93 (с, 0,35H) 8,09 (с, 0,65H)
232			1050,7	(600 МГц): 0,91 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,00-1,04 (м, 6H) 1,07 (д, J=7,79 Гц, 3H) 1,13-1,18 (м, 12H) 1,19 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,20-1,25 (м, 1H) 1,23 (д, J=6,42 Гц, 3H) 1,38 (с, 3H) 1,44 (с, 3H) 1,50-1,56 (м, 1H) 1,62-1,67 (м, 1H) 1,74-1,83 (м, 3H) 1,90-1,96 (м, 2H) 1,98-2,02 (м, 1H) 2,09 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,28 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,40-2,66 (м, 10H) 2,77-2,85 (м, 2H) 2,91 (с, 3H) 3,05 (кв, J=6,88 Гц, 1H) 3,15-3,20 (м, 1H) 3,20 (с, 3H) 3,27 (с, 3H) 3,41 (ушир. с, 1H) 3,44-3,50 (м, 1H) 3,67-3,71 (м, 3H) 3,88-3,97 (м, 2H) 4,03-4,08 (м, 1H) 4,42 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,95-4,96 (м, 1H) 5,62-5,65 (м, 1H) 9,29 (ушир. с, 1H)

Приклад 191

Сполуку (14 мг), представлену в таблиці 5, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання деацетилованої сполуки (20 мг), отриманої в прикладі 190, стадія (3), як вихідної речовини.

Приклад 192

(1) Сполуку (245 мг), отриману в прикладі 190, стадія (1), розчиняли в хлористому метилені (2 мл), до розчину додавали триетиламін (25 мкл), при охолодженні на льоді до суміші додавали метансульфонілхлорид (6,9 мкл), і перемішували отриману суміш при тій же температурі протягом 1 години. До реакційної суміші додавали етилацетат і насичений водний гідрокарбонат натрію, розділяли шари, і екстрагували водний шар етилацетатом. Об'єднаний органічний шар промивали насиченим водним хлоридом натрію, сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали

отриманий залишок методом препаративної тонкошарової хроматографії (ізопропіловий ефір/метанол/триетиламін = 9/1/1) з одержанням метансульфонільної сполуки (22 мг).

(2) Сполуку (10 мг), представлену в таблиці 5, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 4, стадія (6), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (21 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 193

(1) Сполуку (30 мг), отриману в прикладі 190, стадія (1), і 4-диметиламінопіридин (1 мг) розчиняли в хлороформі (1 мл), до розчину додавали триетиламін (15 мкл) і метилсульфамоїлхлорид (12 мг), і перемішували отриману суміш при 70 °C протягом 2 годин. До реакційної суміші додавали насичений водний гідрокарбонат натрію й етилацетат, розділяли шари, і екстрагували водний шар етилацетатом. Об'єднаний органічний шар промивали насиченим водним хлоридом натрію, потім сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом препаративної тонкошарової хроматографії (хлороформ/метанол = 10/1) з одержанням метилсульфамоїльної сполуки (23 мг).

(2) Сполуку (8 мг), представлену в таблиці 5, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 4, стадія (6), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (23 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 194

(1) Сполуку (50 мг), отриману в прикладі 190, стадія (1), і 3-фенілпропіональдегід (10 мкл) розчиняли в хлороформі (1 мл), до розчину додавали оцтову кислоту (18 мкл) і ціаноборгідрид натрію (13 мг), і перемішували отриману суміш протягом ночі при кімнатній температурі. До реакційної суміші додавали етилацетат і насичений водний гідрокарбонат натрію, і розділяли шари. Органічний шар промивали насиченим водним хлоридом натрію, сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом препаративної тонкошарової хроматографії (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 20/1/0,1) з одержанням фенілпропільної сполуки (20 мг).

(2) Сполуку зі знятим захистом (17 мг) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (2), шляхом використання сполуки (47 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

(3) Сполуку (24 мг), представлену в таблиці 5, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання сполуки (33 мг), отриманої на описаній вище стадії (2), як вихідної речовини.

Приклад 195

Сполуку (43 мг), представлену в таблиці 5, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 194, стадія (1), у прикладі 2, стадія (2), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (70 мг), отриманої в прикладі 190, стадія (1), і пропіональдегіду (24 мкл) як вихідних речовин.

Приклад 196

(1) Сполуку (2,0 г), отриману в прикладі 190, стадія (1), розчиняли в піридині (23,4 мл), до розчину при кімнатній температурі додавали біс(4-нітрофеніл)карбонат (1,08 г), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 3 годин. До реакційної суміші додавали етилацетат і насичений водний гідрокарбонат натрію, і розділяли шари. Потім органічний шар двічі промивали насиченим водним гідрокарбонатом натрію й однократно 0,75 % водним гідроксидом натрію, сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, отриманий залишок розчиняли в піридині (20 мл), до розчину при кімнатній температурі додавали біс(4-нітрофеніл)карбонат (542 мг), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 1 години. До реакційної суміші додавали етилацетат і насичений водний гідрокарбонат натрію, і розділяли шари. Потім органічний шар однократно промивали насиченим водним гідрокарбонатом натрію й двічі насиченим водним хлоридом натрію, сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (гексан/ацетон = 90/10→34/66) з одержанням карбаматної сполуки (2,28 г).

(2) Сполуку (100 мг), отриману на описаній вище стадії (1), розчиняли в тетрагідрофурані (0,5 мл), до розчину при кімнатній температурі додавали циклопропілметиламін (17,2 мкл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 45 хвилин. До реакційної суміші додавали етилацетат і насичений водний гідрокарбонат натрію, розділяли шари, і двічі промивали органічний шар насиченим водним гідрокарбонатом натрію. Органічний шар сушили

над безводним сульфатом натрію й фільтрували, а потім концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску з одержанням сечовинної сполуки (91,5 мг).

(3) Сполуку (67,9 мг), представлену в таблиці 5, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 4, стадія (6), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (91,5 мг), отриманої на описаній вище стадії (2), як вихідної речовини.

Приклад 197

Сполуку (38 мг), представлену в таблиці 5, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 194, стадія (1), у прикладі 2, стадія (2), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (70 мг), отриманої в прикладі 190, стадія (1), і 3-(хінолін-4-іл)пропанолу (20 мг), отриманого описаним у літературі способом (Journal of Medicinal Chemistry, 1998, vol. 41, No. 21, p. 4080) як вихідних речовин.

Приклад 198

(1) Сполуку (87 мг), отриману в прикладі 190, стадія (1), розчиняли в толуолі (2 мл), і додавали до розчину бензилізоціанат (14 мкл). До суміші при охолодженні на льоді додавали 1,4-діазабіцикло[2.2.2]октан (4,7 мкл), отриману суміш нагрівали до кімнатної температури й перемішували протягом 2 годин. До реакційної суміші додавали етилацетат і насичений водний гідрокарбонат натрію, розділяли шари, і екстрагували водний шар етилацетатом. Об'єднаний органічний шар промивали насиченим водним хлоридом натрію, сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом препаративної тонкошарової хроматографії (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 20/1/0,1) з одержанням бензилсечовинної сполуки (62 мг).

(2) Сполуку зі знятим захистом (55 мг) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (2), шляхом використання сполуки (62 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

(3) Сполуку (20 мг), представлену в таблиці 5, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання сполуки (55 мг), отриманої на описаній вище стадії (2), як вихідної речовини.

Приклад 199

(1) 3-Фенілпропіонову кислоту (12 мг) розчиняли в тетрагідрофурані (2 мл), і при охолодженні на льоді до розчину додавали триетиламін (12 мкл) і ізобутилхлороформіат (11 мкл). Реакційну суміш перемішували при тій же температурі протягом 1 години, а потім до реакційної суміші при -78 °C по краплях повільно додавали розчин сполуки, отриманої в прикладі 190, стадія (1), у тетрагідрофурані (1 мл). Реакційну суміш поступово нагрівали до кімнатної температури й перемішували протягом ночі. Потім до реакційної суміші додавали етилацетат і насичений водний гідрокарбонат натрію, і розділяли шари. Водний шар екстрагували етилацетатом, об'єднаний органічний шар промивали насиченим водним хлоридом натрію, сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом препаративної тонкошарової хроматографії (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 20/1/0,1) з одержанням фенілпропіонамідної сполуки (22 мг).

(2) Сполуку (15 мг), представлену в таблиці 5, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 4, стадія (6), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (22 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 200

Сполуку (35 мг), представлену в таблиці 5, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (50 мг), отриманої в прикладі 198, стадія (2), і сполуки (48 мг), отриманої в довідковому прикладі 2, як вихідних речовин.

Приклад 201

Сполуку (35 мг), представлену в таблиці 5, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (60 мг), отриманої в прикладі 198, стадія (2), і сполуки (46 мг), отриманої в довідковому прикладі 4, як вихідних речовин.

Приклад 202

Сполуку (60 мг), представлену в таблиці 5, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (60 мг), отриманої в прикладі 198, стадія (2), і сполуки (51 мг), отриманої в довідковому прикладі 3, як вихідних речовин.

Приклад 203

Сполуку (45 мг), представлену в таблиці 5, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (60 мг), отриманої в прикладі 198, стадія (2), і сполуки (46 мг), отриманої в довідковому прикладі 1, як вихідних речовин.

Приклад 204

Сполуку (49 мг), представлену в таблиці 5, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (60 мг), отриманої в прикладі 198, стадія (2), і сполуки (51 мг), отриманої в довідковому прикладі 5, як вихідних речовин.

5 Приклад 205

Сполуку (58 мг), представлену в таблиці 5, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (70 мг), отриманої в прикладі 198, стадія (2), і сполуки (24 мг), отриманої в довідковому прикладі 98, як вихідних речовин.

Приклад 206

10 Сполуку (36 мг), представлену в таблиці 5, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (50 мг), отриманої в прикладі 198, стадія (2), і сполуки (14 мг), отриманої в довідковому прикладі 99, як вихідних речовин.

Приклад 207

15 (1) Сполуку (99 мг), представлену формулою (A) і отриману в прикладі 1, стадія (5), розчиняли в 1-метил-2-піролідіноні (1 мл), до розчину додавали сполуку (119 мг), отриману в довідковому прикладі 96, і 1,8-діазабіцикло[5.4.0]-7-ундецен (169 мкл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 3 годин. До реакційної суміші додавали дистильовану воду й етилацетат, і розділяли шари. Органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували, а потім концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску з одержанням циклізованої сполуки (170 мг).

20 (2) Сполуку (7,7 мг), представлену в таблиці 5, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 2, стадія (2), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (170 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 208

25 Сполуку (46 мг), представлену в таблиці 5, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 198, стадія (1), у прикладі 2, стадія (2), і в прикладі 129, стадія (3), шляхом використання сполуки (300 мг), отриманої в прикладі 190, стадія (1), і 2-фторбензилізоціанату (55 мкл) як вихідних речовин.

Приклад 209

30 Сполуку (19 мг), представлену в таблиці 5, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 198, стадія (1), у прикладі 2, стадія (2), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (300 мг), отриманої в прикладі 190, стадія (1), і 4-метоксибензилізоціанату (66 мкл) як вихідних речовин.

Приклад 210

35 Сполуку (56 мг), представлену в таблиці 5, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 198, стадія (1), у прикладі 2, стадія (2), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (300 мг), отриманої в прикладі 190, стадія (1), і етилізоціанату (99 мкл) як вихідних речовин.

Приклад 211

40 Сполуку (74 мг), представлену в таблиці 5, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 198, стадія (1), у прикладі 2, стадія (2), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (300 мг), отриманої в прикладі 190, стадія (1), і ізопропілізоціанату (123 мкл) як вихідних речовин.

Приклад 212

45 Сполуку (70 мг), представлену в таблиці 5, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 198, стадія (1), у прикладі 2, стадія (2), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (300 мг), отриманої в прикладі 190, стадія (1), і циклогексанметилізоціанату (178,3 мкл) як вихідних речовин.

Приклад 213

50 (1) Сполуку зі знятим захистом (122 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 198, стадія (1), і в прикладі 2, стадія (2), шляхом використання сполуки (300 мг), отриманої в прикладі 190, стадія (1), і 4-фторбензилізоціанату (59 мкл) як вихідних речовин.

(2) Сполуку (32 мг), представлену в таблиці 5, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання сполуки (51 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

55 Приклад 214

(1) Сполуку зі знятим захистом (122 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 198, стадія (1), і в прикладі 2, стадія (2), шляхом використання сполуки (301 мг), отриманої в прикладі 190, стадія (1), і 4-метилбензилізоціанату (65 мкл) як вихідних речовин.

(2) Сполуку (33 мг), представлену в таблиці 5, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання сполуки (52 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 215

5 (1) Сполуку зі знятим захистом (196 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 198, стадія (1), і в прикладі 2, стадія (2), шляхом використання сполуки (300 мг), отриманої в прикладі 190, стадія (1), і 3-фторбензилізоціанату (59 мкл) як вихідних речовин.

(2) Сполуку (29 мг), представлену в таблиці 5, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання сполуки (50 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 216

(1) Сполуку зі знятим захистом (167 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 198, стадія (1), і в прикладі 2, стадія (2), шляхом використання сполуки (300 мг), отриманої в прикладі 190, стадія (1), і 3-метилбензилізоціанату (65 мкл) як вихідних речовин.

15 (2) Сполуку (31 мг), представлену в таблиці 5, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання сполуки (50 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 217

20 (1) Сполуку зі знятим захистом (167 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 198, стадія (1), і в прикладі 2, стадія (2), шляхом використання сполуки (300 мг), отриманої в прикладі 190, стадія (1), і 3-метоксибензилізоціанату (66 мкл) як вихідних речовин.

(2) Сполуку (30 мг), представлену в таблиці 5, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання сполуки (50 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 218

25 Сполуку (113 мг), представлену в таблиці 5, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 198, стадія (1), у прикладі 2, стадія (2), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (300 мг), отриманої в прикладі 190, стадія (1), і 2-метоксибензилізоціанату (192 мкл) як вихідних речовин.

Приклад 219

30 Сполуку (39 мг), представлену в таблиці 5, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 198, стадія (1), у прикладі 2, стадія (2), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (300 мг), отриманої в прикладі 190, стадія (1), і 2-метилбензилізоціанату (173 мкл) як вихідних речовин.

Приклад 220

35 Сполуку (57 мг), представлену в таблиці 5, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 198, стадія (1), у прикладі 2, стадія (2), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (300 мг), отриманої в прикладі 190, стадія (1), і фенетилізоціанату (173 мкл) як вихідних речовин.

Приклад 221

40 Сполуку (42 мг), представлену в таблиці 5, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 198, стадія (1), у прикладі 2, стадія (2), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (300 мг), отриманої в прикладі 190, стадія (1), і фурфурілізоціанату (134 мкл) як вихідних речовин.

Приклад 222

45 Сполуку (35 мг), представлену в таблиці 5, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 196, стадія (2), у прикладі 2, стадія (2), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (100 мг), отриманої в прикладі 196, стадія (1), і 2-фенілпропан-2-аміну (29 мкл) як вихідних речовин.

Приклад 223

50 (1) Сполуку (100 мг), отриману в прикладі 196, стадія (1), розчиняли в піридині (1 мл), до розчину при кімнатній температурі додавали N-метил-1-фенілметанамін (26 мкл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 4,5 годин. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (етилацетат/метанол/28 % водний аміак = 13/1/0,1) з одержанням сечовинної сполуки (81,4 мг).

55 (2) Сполуку (42 мг), представлену в таблиці 5, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 2, стадія (2), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (81 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 224

(1) Сполуку (100 мг), отриману в прикладі 190, стадія (1), розчиняли в толуолі (2 мл), до розчину додавали 1,4-діазабіцикло[2.2.2]октан (2,7 мг), бензилізотіоціанат (31,4 мкл) і піридин (19,2 мкл), і перемішували отриману суміш при 50 °С протягом 1 години й при 60 °С в плин 4 годин. До реакційної суміші додавали дистильовану воду й етилацетат, розділяли шари, і концентрували органічний шар в умовах зниженого тиску з одержанням тіосечовинної сполуки (147 мг).

(2) Сполуку (25 мг), представлену в таблиці 5, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 4, стадія (6), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (147 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 225

Сполуку (38 мг), представлену в таблиці 5, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 223, стадія (1), у прикладі 4, стадія (6), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (150 мг), отриманої в прикладі 196, стадія (1), і нафталін-1-ілметанаміну (44 мкл) як вихідних речовин.

Приклад 226

Сполуку (17 мг), представлену в таблиці 5, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 223, стадія (1), у прикладі 4, стадія (6), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (150 мг), отриманої в прикладі 196, стадія (1), і нафталін-2-ілметанаміну гідрохлориду (58 мг) як вихідних речовин.

Приклад 227

Сполуку (54 мг), представлену в таблиці 5, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 223, стадія (1), у прикладі 4, стадія (6), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (150 мг), отриманої в прикладі 196, стадія (1), і піридин-2-ілметанаміну (46 мкл) як вихідних речовин.

Приклад 228

Сполуку (41 мг), представлену в таблиці 5, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 223, стадія (1), у прикладі 4, стадія (6), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (150 мг), отриманої в прикладі 196, стадія (1), і піридин-3-ілметанаміну (45 мкл) як вихідних речовин.

Приклад 229

Сполуку (36 мг), представлену в таблиці 5, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 223, стадія (1), у прикладі 4, стадія (6), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (100 мг), отриманої в прикладі 196, стадія (1), і піридин-4-ілметанаміну (30 мкл) як вихідних речовин.

Приклад 230

Сполуку (65 мг), представлену в таблиці 5, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 129, стадія (3), шляхом використання сполуки (78 мг), отриманої в прикладі 198, стадія (2), і N,N,N'-триметилетан-1,2-діаміну (33 мкл) як вихідних речовин.

Приклад 231

(1) Сполуку (200 мг), отриману в прикладі 190, стадія (1), розчиняли в тетрагідрофурані (2 мл), до розчину додавали піридин (58 мкл) і бензилхлороформіат (68 мкл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 10 хвилин. До реакційної суміші додавали дистильовану воду й етилацетат, і розділяли шари. Органічний шар промивали насиченим водним хлоридом натрію, а потім сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (етилацетат/метанол/28 % водний аміак = 8/1/0,1) з одержанням бензилкарбаматної сполуки (191 мг).

(2) Сполуку зі знятим захистом (156 мг) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (6), шляхом використання сполуки (186 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

(3) Сполуку (65 мг), представлену в таблиці 5, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання сполуки (60 мг), отриманої на описаній вище стадії (2), як вихідної речовини.

Приклад 232

(1) Сполуку (100 мг), отриману в прикладі 190, стадія (1), розчиняли в диметилформаміді (2 мл), до розчину додавали 4-диметиламінопіридин (29 мг), триетиламін (66 мкл), гідроксибензотриазол (55 мг), метансульфонілоцтову кислоту (49 мг) і N-етил-N'-(3-диметиламінопропіл)карбодііміду гідрохлорид (68 мг), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 16 годин. До реакційної суміші додавали етилацетат і насичений водний розчин хлориду амонію, і розділяли шари. Органічний шар промивали насиченим

водним гідрокарбонатом натрію й насиченим водним хлоридом натрію, потім сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 100/1/0,1 → 5/1/0,1) з одержанням амідної сполуки (102 мг).

(2) Сполуку (43,2 мг), представлену в таблиці 5, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 4, стадія (6), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (102 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 233: Синтез сполуки формули (C), де R являє собою (диметиламіно)метиленаміногрупу

(1) Сполуку (80 мг), отриману в прикладі 190, стадія (1), і 4-диметиламінопіридин (58 мг) розчиняли в диметилформаміді (1 мл), до розчину додавали диметилсульфамойлхлорид (55 мг), і перемішували отриману суміш при 75 °C протягом 10 годин. До реакційної суміші додавали етилацетат і насичений водний гідрокарбонат натрію, розділяли шари, і екстрагували водний шар етилацетатом. Об'єднаний органічний шар промивали насиченим водним хлоридом натрію, сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом препаративної тонкошарової хроматографії (ізопропіловий ефір/метанол/триетиламін = 9/1/1) з одержанням диметиламідинової сполуки (55 мг).

(2) Вказану в заголовку сполуку (30 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 4, стадія (6), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (55 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

МС (ESI) m/z = 985 $[M+H]^+$

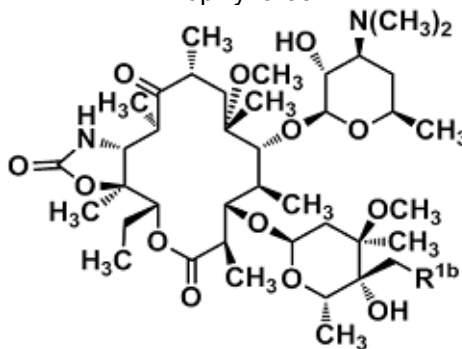
¹H-ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ (м. ч.): 0,85 (т, J=7,3 Гц, 3H), 1,00 (д, J=7,1 Гц, 3H), 1,02 (д, J=7,1 Гц, 3H), 1,03 (д, J=6,1 Гц, 3H), 1,11 (д, J=6,8 Гц, 3H), 1,15 (с, 3H), 1,18 (д, J=6,4 Гц, 3H), 1,22 (д, J=6,1 Гц, 3H), 1,24 (д, J=7,1 Гц, 3H), 1,41 (с, 3H), 1,43 (с, 3H), 1,48-1,65 (м, 5H), 1,77 (дд, J=14,7, 1,9 Гц, 1H), 1,84-2,02 (м, 4H), 2,08 (д, J=14,9 Гц, 1H), 2,25 (с, 6H), 2,33 (с, 3H), 2,36-2,62 (м, 9H), 2,72-2,85 (м, 7H), 2,91-3,01 (м, 2H), 3,07-3,15 (м, 3H), 3,26 (с, 3H), 3,27 (с, 3H), 3,38-3,46 (м, 2H), 3,70 (д, J=7,6 Гц, 1H), 3,80 (д, J=10,0 Гц, 1H), 4,13 (кв, J=6,4 Гц, 1H), 4,25 (с, 1H), 4,33 (д, J=7,3 Гц, 1H), 5,01 (д, J=4,2 Гц, 1H), 5,21 (дд, J=10,5, 2,2 Гц, 1H), 7,76 (с, 1H)

Приклади 234-330

Нижче представлені способи одержання сполук, представлених формулою (I), з визначеним у таблиці 6 значенням R^{1b}.

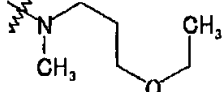
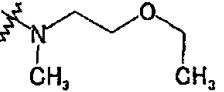
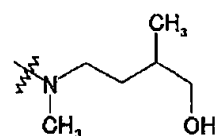
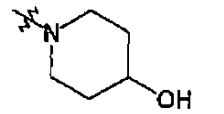
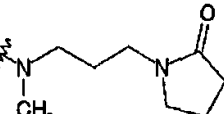
Формула (I)

Формула 38



Таблиця 6-1

Приклад	R ^{1b}	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
234		827,8	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,40 Гц, 3H) 1,04-1,26 (м, 25H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,46-1,58 (м, 1H) 1,62-2,09 (м, 12H) 2,16-2,39 (м, 4H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,39-2,48 (м, 1H) 2,50-2,65 (м, 3H) 2,77-2,92 (м, 4H) 2,96 (с, 3H) 3,11-3,21 (м, 2H) 3,28 (с, 3H) 3,41-3,51 (м, 1H) 3,64 (д, J=7,40 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,79 (д, J=8,50 Гц, 1H) 4,10 (м, 1H) 4,40 (д, J=7,40 Гц, 1H) 4,99 (д, J=4,94 Гц, 1H) 5,10 (дд, J=10,70, 2,19 Гц, 1H) 5,78 (с, 1H)

235		902,6	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,08 (д, J=7,79 Гц, 3H) 1,09-1,25 (м, 22H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,48-1,54 (м, 1H) 1,63-2,08 (м, 10H) 2,29 (с, 6H) 2,32 (с, 3H) 2,39-2,70 (м, 4H) 2,79-2,91 (м, 3H) 2,96 (с, 3H) 3,15-3,21 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,39-3,49 (м, 6H) 3,64 (д, J=7,34 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,79 (д, J=8,25 Гц, 1H) 4,05-4,16 (м, 1H) 4,40 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,99 (д, J=5,04 Гц, 1H) 5,08-5,14 (м, 1H) 5,77 (с, 1H)
236		888,6	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,57 Гц, 3H) 1,07 (д, J=7,79 Гц, 3H) 1,11 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,13-1,25 (м, 19H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,48-1,56 (м, 1H) 1,62-1,68 (м, 1H) 1,70-1,91 (м, 4H) 1,97 (д, J=5,50 Гц, 1H) 2,02-2,06 (м, 1H) 2,10 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,38 (с, 3H) 2,41-2,46 (м, 1H) 2,51-2,57 (м, 1H) 2,64-2,71 (м, 1H) 2,74-2,90 (м, 4H) 2,96 (с, 3H) 3,15-3,20 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,41-3,52 (м, 5H) 3,65 (д, J=7,34 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,78 (д, J=8,71 Гц, 1H) 4,07-4,13 (м, 1H) 4,40 (д, J=6,88 Гц, 1H) 4,99 (д, J=4,58 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,55, 2,29 Гц, 1H) 5,76 (с, 1H)
237		902,6	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,91-0,94 (м, 3H) 1,07 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,11 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,13-1,26 (м, 16H) 1,28-1,35 (м, 1H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,48-1,98 (м, 9H) 2,01-2,08 (м, 2H) 2,29 (с, 6H) 2,33 (с, 3H) 2,39-2,47 (м, 1H) 2,49-2,64 (м, 3H) 2,78-2,90 (м, 3H) 2,96 (с, 3H) 3,16-3,21 (м, 1H) 3,29 (с, 3H) 3,41-3,50 (м, 3H) 3,62-3,65 (м, 1H) 3,68 (с, 1H) 3,79 (д, J=8,71 Гц, 1H) 4,08-4,13 (м, 1H) 4,38-4,41 (м, 1H) 4,96-5,00 (м, 1H) 5,08-5,13 (м, 1H) 5,76 (с, 1H)
238		886,6	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,16 (д, J=15,59 Гц, 3H) 1,16 (д, J=2,75 Гц, 3H) 1,05-1,27 (м, 16H) 1,37 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,55 (ушир. с, 10H) 1,93-2,08 (м, 3H) 2,29 (ушир. с, 6H) 2,39-2,47 (м, 1H) 2,50-2,57 (м, 1H) 2,74-2,91 (м, 7H) 2,96 (с, 3H) 3,15-3,20 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,38-3,46 (м, 2H) 3,63 (д, J=7,34 Гц, 1H) 3,68 (с, 1H) 3,78-3,80 (м, 1H) 4,08-4,12 (м, 1H) 4,39 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,98 (д, J=5,04 Гц, 1H) 5,09-5,12 (м, 1H) 5,77 (с, 1H)
239		941,6	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,07 (д, J=7,79 Гц, 3H) 1,09-1,17 (м, 12H) 1,18-1,25 (м, 7H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,49-1,56 (м, 1H) 1,64-2,07 (м, 12H) 2,29 (с, 6H) 2,33 (с, 3H) 2,35-2,58 (м, 7H) 2,79-2,91 (м, 3H) 2,96 (с, 3H) 3,14-3,20 (м, 1H) 3,25-3,32 (м, 4H) 3,35-3,46 (м, 3H) 3,63 (д, J=7,34 Гц, 1H) 3,68 (с, 1H) 3,78 (д, J=7,79 Гц, 1H) 4,10 (д, J=6,42 Гц, 1H) 4,39 (д, J=6,88 Гц, 1H) 4,98 (д, J=5,04 Гц, 1H) 5,08-5,13 (м, 1H) 5,77 (с, 1H)

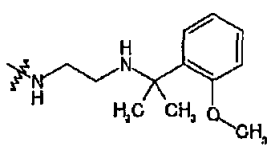
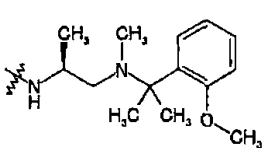
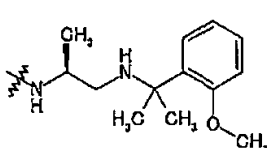
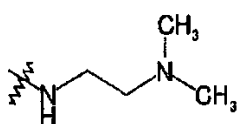
240		993,7	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,07 (д, J=7,79 Гц, 3H) 1,09-1,23 (м, 19H) 1,37 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,72 (с, 6H) 1,46-1,97 (м, 7H) 2,00-2,04 (м, 1H) 2,24-2,32 (м, 9H) 2,38-2,44 (м, 1H) 2,50-2,58 (м, 1H) 2,59-2,66 (м, 2H) 2,79-2,91 (м, 3H) 2,95 (с, 3H) 3,14-3,19 (м, 1H) 3,27 (с, 3H) 3,39-3,42 (м, 1H) 3,44-3,51 (м, 1H) 3,63 (д, J=7,34 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,78 (д, J=7,79 Гц, 1H) 3,87 (с, 3H) 4,18 (д, J=6,42 Гц, 1H) 4,39 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,97 (д, J=4,13 Гц, 1H) 5,09-5,13 (м, 1H) 5,76 (с, 1H) 6,89-6,94 (м, 2H) 7,21-7,26 (м, 2H)
241		1021,7	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,40 Гц, 3H) 0,91 (д, J=5,76 Гц, 3H) 1,06-1,16 (м, 12H) 1,16-1,28 (м, 10H) 1,37 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,44 (с, 6H) 1,48-2,04 (м, 10H) 2,10-2,21 (м, 5H) 2,29 (с, 6H) 2,38-2,58 (м, 3H) 2,61-2,71 (м, 1H) 2,78-2,92 (м, 2H) 2,96 (с, 3H) 3,10 (д, J=13,44 Гц, 1H) 3,15-3,21 (м, 1H) 3,31 (с, 3H) 3,37-3,42 (м, 1H) 3,45-3,54 (м, 1H) 3,66-3,71 (м, 2H) 3,74-3,84 (м, 4H) 4,15-4,21 (м, 1H) 4,44 (д, J=7,40 Гц, 1H) 4,98 (ушир. с, 1H) 5,12 (дд, J=10,56, 2,33 Гц, 1H) 5,77 (с, 1H) 6,85-6,92 (м, 2H) 7,18-7,23 (м, 1H) 7,42 (д, J=7,40 Гц, 1H)
242		1007,7	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,40 Гц, 3H) 0,95 (д, J=6,31 Гц, 3H) 1,05-1,27 (м, 22H) 1,37 (с, 3H) 1,39-1,43 (м, 3H) 1,46-1,57 (м, 7H) 1,59-1,65 (м, 1H) 1,69-2,07 (м, 8H) 2,14-2,23 (м, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,30-2,66 (м, 5H) 2,79-2,91 (м, 3H) 2,95 (с, 3H) 3,14-3,20 (м, 1H) 3,29 (с, 3H) 3,38-3,44 (м, 1H) 3,45-3,52 (м, 1H) 3,64 (д, J=7,13 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,78 (д, J=8,23 Гц, 1H) 3,88 (с, 3H) 4,16-4,23 (м, 1H) 4,41 (д, J=7,40 Гц, 1H) 4,98 (д, J=3,84 Гц, 1H) 5,08-5,14 (м, 1H) 5,77 (с, 1H) 6,89-6,96 (м, 2H) 7,19-7,25 (м, 2H)

Таблица 6-2

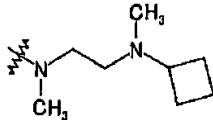
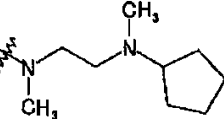
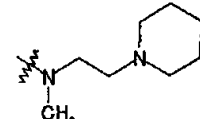
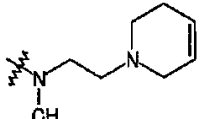
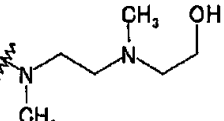
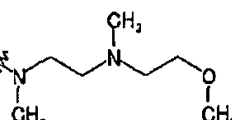
Приклад	R ^{1b}	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
243		873,7	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,27 Гц, 3H) 1,05-1,28 (м, 22H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,48-2,08 (м, 8H) 2,22 (с, 6H) 2,23 (с, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,33-2,47 (м, 4H) 2,49-2,59 (м, 1H) 2,64-2,73 (м, 2H) 2,79-2,92 (м, 3H) 2,95 (с, 3H) 3,18 (дд, J=10,15, 7,40 Гц, 1H) 3,29 (с, 3H) 3,49-3,58 (м, 1H) 3,64 (д, J=7,68 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,79 (д, J=7,95 Гц, 1H) 4,24 (д, J=6,58 Гц, 1H) 4,40 (д, J=7,40 Гц, 1H) 4,98 (д, J=4,39 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,70, 2,19 Гц, 1H) 5,78 (с, 1H)

244		915,7	(500 МГц): 0,83-0,90 (м, 6H) 1,05-1,29 (м, 22H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,43-2,13 (м, 12H) 2,23 (с, 3H) 2,26-2,65 (м, 16H) 2,77-2,92 (м, 3H) 2,96 (с, 3H) 3,18 (дд, J=10,32, 7,26 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,43-3,51 (м, 1H) 3,66 (д, J=7,26 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,77 (д, J=8,41 Гц, 1H) 4,09 (кв, J=6,24 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,99 (д, J=4,59 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,70, 2,29 Гц, 1H) 5,77 (с, 1H)
245		915,7	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,45 Гц, 3H) 0,99 (м, 6H) 1,05-1,26 (м, 22H) 1,36-1,41 (м, 6H) 1,52 (м, 1H) 1,62-1,92 (м, 5H) 1,93-2,05 (м, 2H) 2,11 (д, J=14,91 Гц, 1H) 2,21 (с, 3H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,35-2,63 (м, 6H) 2,77-2,93 (м, 4H) 2,96 (с, 3H) 3,18 (дд, J=10,32, 7,26 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,43-3,51 (м, 1H) 3,66 (д, J=7,26 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,77 (д, J=8,41 Гц, 1H) 4,09 (кв, J=6,50 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,99 (д, J=4,20 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,70, 2,29 Гц, 1H) 5,77 (с, 1H)
246		829,7	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,94-1,26 (м, 31H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,49-2,08 (м, 9H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,39-2,59 (м, 7H) 2,78-2,99 (м, 7H) 3,15-3,20 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,43-3,50 (м, 1H) 3,65 (д, J=7,34 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,78 (д, J=8,71 Гц, 1H) 4,08 (кв, J=6,11 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,99 (д, J=4,58 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,55, 2,29 Гц, 1H) 5,76 (с, 1H)
247		913,7	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,45 Гц, 3H) 1,06-1,27 (м, 22H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,46-2,14 (м, 9H) 2,24 (с, 3H) 2,30 (с, 6H) 2,33 (с, 3H) 2,35-2,67 (м, 6H) 2,77-2,92 (м, 3H) 2,96 (с, 3H) 2,97-3,08 (м, 2H) 3,16-3,21 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,43-3,51 (м, 1H) 3,66 (д, J=7,26 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,78 (д, J=8,79 Гц, 1H) 4,09 (кв, J=6,50 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,99 (д, J=4,59 Гц, 1H) 5,08-5,20 (м, 3H) 5,77 (с, 1H) 5,81-5,92 (м, 1H)
248		929,7	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,26 Гц, 3H) 0,90 (т, J=7,26 Гц, 3H) 1,03-1,48 (м, 32H) 1,48-2,05 (м, 8H) 2,11 (д, J=14,52 Гц, 1H) 2,23 (с, 3H) 2,29 (с, 6H) 2,31-2,67 (м, 7H) 2,77-2,91 (м, 3H) 2,96 (с, 3H) 3,18 (дд, J=10,32, 7,26 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,43-3,51 (м, 1H) 3,66 (д, J=7,26 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,77 (д, J=8,79 Гц, 1H) 4,09 (кв, J=6,50 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,99 (д, J=4,20 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,51, 2,48 Гц, 1H) 5,76(з, 1H)

249		929,7	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,40 Гц, 3H) 1,03-1,26 (м, 31H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,46-1,94 (м, 8H) 1,97-2,02 (м, 2H) 2,08 (д, J=14,53 Гц, 1H) 2,22 (с, 3H) 2,29 (с, 6H) 2,33 (с, 3H) 2,37-2,57 (м, 4H) 2,77-2,92 (м, 3H) 2,96 (с, 3H) 3,14-3,21 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,42-3,52 (м, 1H) 3,65 (д, J=7,40 Гц, 1H) 3,67-3,72 (м, 1H) 3,78 (д, J=8,78 Гц, 1H) 4,07 (кв, J=6,31 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,13 Гц, 1H) 4,99 (дд, J=4,25, 2,06 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,56, 2,33 Гц, 1H) 5,76 (с, 1H)
250		929,8	(500 МГц): 0,83-0,97 (м, 9H) 1,06-1,27 (м, 22H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,48-2,13 (м, 11H) 2,21 (с, 3H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,39-2,63 (м, 7H) 2,76-2,92 (м, 3H) 2,96 (с, 3H) 3,18 (дд, J=10,15, 7,40 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,42-3,51 (м, 1H) 3,66 (д, J=6,31 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,78 (д, J=8,78 Гц, 1H) 4,08 (кв, J=6,31 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,40 Гц, 1H) 4,99 (д, J=4,39 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,56, 2,33 Гц, 1H) 5,76 (с, 1H)
251		929,7	(600 МГц): 0,83-0,91 (м, 9H) 1,04-1,27 (м, 22H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,44-2,12 (м, 12H) 2,19 (с, 3H) 2,30 (ушир. с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,37-2,65 (м, 6H) 2,78-2,91 (м, 3H) 2,96 (с, 3H) 3,15-3,21 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,41-3,50 (м, 1H) 3,61-3,66 (м, 1H) 3,67-3,70 (м, 1H) 3,75-3,81 (м, 1H) 4,05-4,13 (м, 1H) 4,38-4,43 (м, 1H) 4,96-5,01 (м, 1H) 5,07-5,15 (м, 1H) 5,76 (с, 1H)
252		913,7	(500 МГц): 0,38-0,47 (м, 4H) 0,86 (т, J=7,40 Гц, 3H) 1,04-1,28 (м, 22H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,47-2,11 (м, 12H) 2,30 (ушир. с, 6H) 2,33 (с, 3H) 2,34 (с, 3H) 2,40-2,67 (м, 6H) 2,77-2,91 (м, 3H) 2,96 (с, 3H) 3,15-3,21 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,42-3,51 (м, 1H) 3,65 (д, J=7,13 Гц, 1H) 3,67-3,70 (м, 1H) 3,77 (д, J=8,50 Гц, 1H) 4,07 (кв, J=6,31 Гц, 1H) 4,40 (д, J=7,40 Гц, 1H) 4,98 (д, J=4,66 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,70, 2,19 Гц, 1H) 5,76 (с, 1H)

Таблица 6-3

Приклад	R ^{1b}	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
253		927,7	(600 МГц): 0,09-0,12 (м, 2H) 0,47-0,54 (м, 2H) 0,83-0,88 (м, 4H) 1,05-1,26 (м, 22H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,47-2,05 (м, 9H) 2,13 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,23-2,33 (м, 10H) 2,35 (с, 3H) 2,40-2,67 (м, 6H) 2,77-2,91 (м, 3H) 2,96 (с, 3H) 3,15-3,21 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,44-3,51 (м, 1H) 3,66 (д, J=7,34 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,77 (д, J=8,25 Гц, 1H) 4,10 (кв, J=6,27 Гц, 1H) 4,41 (д, J=6,88 Гц, 1H) 4,98 (д, J=4,13 Гц, 1H) 5,08-5,15 (м, 1H) 5,76 (с, 1H)

254		927,7	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,40 Гц, 3H) 1,06-1,26 (м, 22H) 1,38 (с, 3H) 1,39-1,42 (м, 3H) 1,47-2,17 (м, 20H) 2,29 (с, 6H) 2,32-2,35 (м, 3H) 2,40-2,64 (м, 4H) 2,75-2,92 (м, 4H) 2,96 (с, 3H) 3,15-3,22 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,42-3,51 (м, 1H) 3,66 (д, J=7,40 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,78 (д, J=8,50 Гц, 1H) 4,09 (кв, J=6,22 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,13 Гц, 1H) 4,99 (д, J=4,66 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,70, 2,19 Гц, 1H) 5,77 (с, 1H)
255		941,7	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,27 Гц, 3H) 1,04-1,28 (м, 22H) 1,33-2,15 (м, 23H) 2,23 (с, 3H) 2,29 (с, 6H) 2,33 (с, 3H) 2,38-2,92 (м, 10H) 2,96 (с, 3H) 3,15-3,21 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,43-3,50 (м, 1H) 3,65 (д, J=7,40 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,77 (д, J=7,95 Гц, 1H) 4,08 (кв, J=6,31 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,40 Гц, 1H) 4,99 (д, J=4,11 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,70, 2,19 Гц, 1H) 5,76 (с, 1H)
256		927,7	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,40 Гц, 3H) 1,04-1,26 (м, 22H) 1,37 (с, 3H) 1,39-2,05 (м, 20H) 2,13 (д, J=14,81 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,31-2,67 (м, 10H) 2,76-2,91 (м, 3H) 2,96 (с, 3H) 3,18 (дд, J=10,15, 7,13 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,44-3,53 (м, 1H) 3,64-3,72 (м, 2H) 3,76 (д, J=8,50 Гц, 1H) 4,09 (кв, J=6,31 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,13 Гц, 1H) 4,98 (д, J=3,29 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,70, 2,19 Гц, 1H) 5,77 (с, 1H)
257		925,7	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,40 Гц, 3H) 1,05-1,28 (м, 22H) 1,37 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,48-2,05 (м, 8H) 2,13 (д, J=14,81 Гц, 3H) 2,30 (с, 6H) 2,36 (с, 3H) 2,41-2,74 (м, 8H) 2,79-3,05 (м, 8H) 3,15-3,21 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,43-3,51 (м, 1H) 3,66 (д, J=7,13 Гц, 1H) 3,68-3,70 (м, 1H) 3,76 (д, J=8,23 Гц, 1H) 4,09 (кв, J=6,67 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,40 Гц, 1H) 4,97 (с, 1H) 5,07-5,16 (м, 1H) 5,60-5,79 (м, 3H)
258		917,7	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,05-1,27 (м, 22H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,45-1,97 (м, 9H) 2,01-2,05 (м, 1H) 2,10-2,15 (м, 1H) 2,30 (ушир. с, 6H) 2,33 (з 3H) 2,36 (с, 3H) 2,42-2,67 (м, 8H) 2,79-2,90 (м, 3H) 2,95 (с, 3H) 3,16-3,22 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,44-3,50 (м, 1H) 3,58-3,63 (м, 2H) 3,65-3,67 (м, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,77 (д, J=8,71 Гц, 1H) 4,10 (кв, J=6,57 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,98 (д, J=4,58 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=11,00, 2,29 Гц, 1H) 5,76 (с, 1H)
259		931,7	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,06-1,26 (м, 22H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,47-2,12 (м, 8H) 2,17 (с, 3H) 2,29 (ушир. с, 9H) 2,34 (с, 3H) 2,41-2,68 (м, 6H) 2,78-2,91 (м, 3H) 2,96 (с, 3H) 3,16-3,21 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,34 (с, 3H) 3,44-3,51 (м, 3H) 3,65 (д, J=7,34 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,78 (д, J=8,71 Гц, 1H) 4,09 (кв, J=6,27 Гц, 1H) 4,41 (д, J=6,88 Гц, 1H) 4,99 (д, J=4,13 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=11,00, 2,29 Гц, 1H) 5,76 (с, 1H)

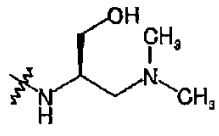
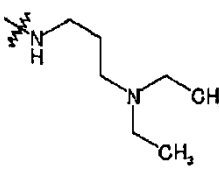
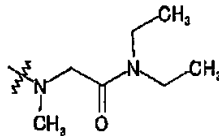
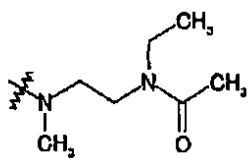
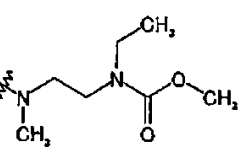
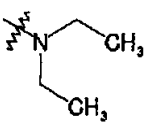
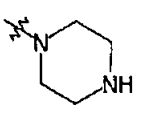
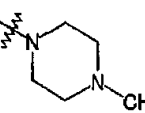
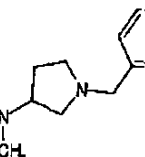
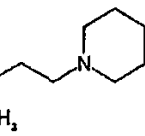
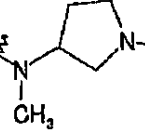
260		903,6	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,45 Гц, 3H) 1,05-1,29 (м, 22H) 1,38 (с, 3H) 1,41 (с, 3H) 1,48-1,58 (м, 1H) 1,64-1,95 (м, 7H) 2,04 (д, J=15,29 Гц, 1H) 2,28 (с, 6H) 2,29 (с, 6H) 2,31-2,59 (м, 6H) 2,72-2,97 (м, 7H) 3,18 (дд, J=9,94, 7,26 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,49-3,57 (м, 2H) 3,59-3,71 (м, 3H) 3,79 (д, J=8,41 Гц, 1H) 4,29 (д, J=6,50 Гц, 1H) 4,38 (д, J=6,88 Гц, 1H) 4,96 (д, J=4,97 Гц, 1H) 5,10 (дд, J=10,70, 2,29 Гц, 1H) 5,78 (с, 1H)
261		915,7	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,26 Гц, 3H) 1,01 (т, J=7,07 Гц, 6H) 1,06-1,16 (м, 15H) 1,17-1,26 (м, 7H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,47-1,97 (м, 10H) 2,01-2,07 (м, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,37 (д, J=13,76 Гц, 1H) 2,40-2,57 (м, 8H) 2,65 (т, J=6,69 Гц, 2H) 2,76-2,92 (м, 3H) 2,95 (с, 3H) 3,18 (дд, J=10,32, 7,26 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,51-3,58 (м, 1H) 3,64 (д, J=7,64 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,79 (д, J=8,41 Гц, 1H) 4,24 (кв, J=6,50 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,97 (д, J=4,59 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,51, 2,10 Гц, 1H) 5,77 (с, 1H)
262		929,7	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,26 Гц, 3H) 1,05-1,24 (м, 28H) 1,37 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,48-2,09 (м, 10H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (д, J=15,67 Гц, 1H) 2,39-2,58 (м, 5H) 2,78-2,91 (м, 2H) 2,96 (с, 3H) 3,08-3,19 (м, 2H) 3,21-3,29 (м, 4H) 3,36 (кв, J=6,88 Гц, 3H) 3,42-3,49 (м, 3H) 3,64 (д, J=7,64 Гц, 1H) 3,68 (с, 1H) 3,78 (д, J=8,41 Гц, 1H) 4,11 (д, J=6,50 Гц, 1H) 4,40 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,99 (д, J=4,97 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,70, 2,29 Гц, 1H) 5,77 (с, 1H)

Таблица 6-4

Приклад	R ^{1b}	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
263		929,7	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,03-1,27 (м, 25H) 1,37 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,48-1,97 (м, 8H) 2,04-2,09 (м, 4H) 2,30 (с, 6H) 2,41 (с, 3H) 2,50-2,93 (м, 6H) 2,95 (с, 3H) 3,15-3,21 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,31-3,46 (м, 5H) 3,50-3,55 (м, 1H) 3,62 (д, J=7,34 Гц, 1H) 3,68 (с, 1H) 3,79 (д, J=8,71 Гц, 1H) 4,10 (д, J=6,42 Гц, 1H) 4,37-4,39 (м, 1H) 4,98 (д, J=5,50 Гц, 1H) 5,10 (дд, J=10,55, 2,29 Гц, 1H) 5,77 (с, 1H)
264		945,7	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,40 Гц, 3H) 1,05-1,27 (м, 25H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,48-2,10 (м, 10H) 2,29 (с, 6H) 2,35-2,58 (м, 5H) 2,79-2,91 (м, 3H) 2,96 (с, 3H) 3,14-3,46 (м, 10H) 3,63 (д, J=7,40 Гц, 1H) 3,66-3,70 (м, 4H) 3,79 (д, J=8,50 Гц, 1H) 4,10 (д, J=6,58 Гц, 1H) 4,39 (д, J=7,13 Гц, 1H) 4,98 (д, J=4,94 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,56, 2,33 Гц, 1H) 5,78 (с, 1H)

265		858,6	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,97-1,28 (м, 28H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,48-2,11 (м, 10H) 2,30 (с, 6H) 2,41-2,58 (м, 2H) 2,63-2,75 (м, 3H) 2,79-2,91 (м, 3H) 2,96 (с, 3H) 3,18 (дд, J=10,09, 7,34 Гц, 1H) 3,29 (с, 3H) 3,43-3,50 (м, 1H) 3,65 (д, J=7,34 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,79 (д, J=8,25 Гц, 1H) 4,11 (кв, J=6,42 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,98 (д, J=5,04 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,55, 2,29 Гц, 1H) 5,77 (с, 1H)
266		871,6	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,06-1,25 (м, 22H) 1,36-1,39 (м, 3H) 1,39 (с, 3H) 1,48-2,09 (м, 13H) 2,29 (с, 6H) 2,40-2,46 (м, 1H) 2,51-2,58 (м, 1H) 2,74-2,92 (м, 7H) 2,96 (с, 3H) 3,18 (дд, J=10,09, 7,34 Гц, 1H) 3,29 (с, 3H) 3,39-3,47 (м, 1H) 3,63 (д, J=7,34 Гц, 1H) 3,68 (с, 1H) 3,79 (д, J=8,71 Гц, 1H) 4,11 (кв, J=6,42 Гц, 1H) 4,39 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,98 (д, J=5,04 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,55, 2,29 Гц, 1H) 5,79 (с, 1H)
267		885,6	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,45 Гц, 3H) 1,04-1,27 (м, 22H) 1,37 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,47-2,10 (м, 12H) 2,27-2,32 (м, 9H) 2,38-2,93 (м, 10H) 2,96 (с, 3H) 3,17 (дд, J=10,32, 7,26 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,38-3,47 (м, 1H) 3,63 (д, J=7,64 Гц, 1H) 3,68 (с, 1H) 3,79 (д, J=8,41 Гц, 1H) 4,10 (кв, J=6,37 Гц, 1H) 4,39 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,98 (д, J=4,97 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,70, 2,29 Гц, 1H) 5,77 (с, 1H)
268		975,7	(500 МГц): 0,85 (т, J=7,40 Гц, 3H) 1,03-1,25 (м, 22H) 1,37 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,47-2,07 (м, 11H) 2,28 (с, 6H) 2,33 (с, 3H) 2,37-2,64 (м, 5H) 2,69-2,91 (м, 4H) 2,95 (с, 3H) 3,14-3,20 (м, 1H) 3,25-3,29 (м, 2H) 3,37-3,52 (м, 3H) 3,60-3,71 (м, 3H) 3,77 (д, J=8,50 Гц, 1H) 4,05-4,12 (м, 1H) 4,38 (дд, J=7,27, 3,70 Гц, 1H) 4,97 (д, J=4,94 Гц, 1H) 5,10 (дд, J=10,70, 2,19 Гц, 1H) 5,77 (с, 1H) 7,23-7,34 (м, 5H)
269		943,7	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,40 Гц, 3H) 1,04-1,29 (м, 22H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,48-2,23 (м, 16H) 2,29 (с, 6H) 2,32-2,67 (м, 9H) 2,70-2,92 (м, 5H) 2,93-2,97 (м, 3H) 3,18 (дд, J=10,28, 7,27 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,43-3,52 (м, 1H) 3,63-3,73 (м, 3H) 3,76 (д, J=8,50 Гц, 1H) 4,09 (кв, J=6,22 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,13 Гц, 1H) 4,98 (д, J=3,29 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,70, 2,19 Гц, 1H) 5,78 (с, 1H)
270		899,8	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,45 Гц, 3H) 1,05-1,27 (м, 22H) 1,37 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,48-2,08 (м, 12H) 2,28-2,34 (м, 12H) 2,35-2,69 (м, 6H) 2,78-2,92 (м, 3H) 2,96 (с, 3H) 3,18 (дд, J=10,32, 7,26 Гц, 1H) 3,29 (с, 3H) 3,39-3,51 (м, 2H) 3,64 (дд, J=7,26, 3,06 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,78 (д, J=8,79 Гц, 1H) 4,10 (кв, J=6,24 Гц, 1H) 4,40 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,98 (д, J=4,59 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,70, 2,29 Гц, 1H) 5,77 (с, 1H)

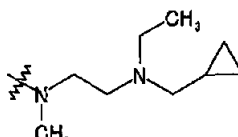
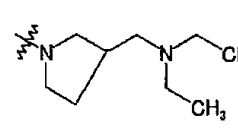
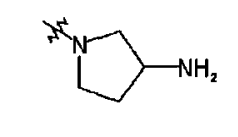
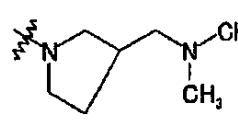
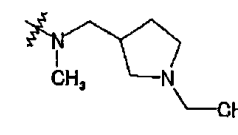
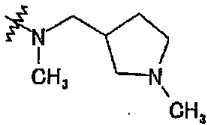
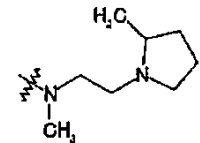
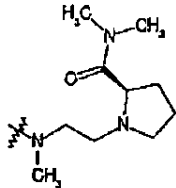
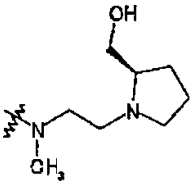
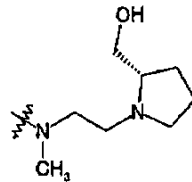
271		941,8	(500 МГц): 0,05-0,12 (м, 2H) 0,44-0,53 (м, 2H) 0,81-0,91 (м, 4H) 1,00-1,28 (м, 25H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,47-2,13 (м, 9H) 2,24-2,70 (м, 18H) 2,78-2,92 (м, 3H) 2,96 (с, 3H) 3,18 (дд, J=10,32, 7,26 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,43-3,51 (м, 1H) 3,66 (д, J=7,26 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,77 (д, J=8,79 Гц, 1H) 4,05-4,13 (м, 1H) 4,41 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,99 (д, J=4,20 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,70, 2,29 Гц, 1H) 5,77 (с, 1H)
272		941,8	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,40 Гц, 3H) 0,96-1,02 (м, 6H) 1,06-1,27 (м, 22H) 1,38 (с, 3H) 1,39-1,42 (м, 3H) 1,43-1,58 (м, 2H) 1,62-1,68 (м, 1H) 1,70-2,00 (м, 7H) 2,04-2,09 (м, 1H) 2,13-2,19 (м, 1H) 2,26-2,58 (м, 4H) 2,74-2,91 (м, 3H) 2,92-2,98 (м, 4H) 3,17 (дд, J=10,28, 7,27 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,37-3,48 (м, 1H) 3,64 (дд, J=7,40, 1,65 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,79 (д, J=8,50 Гц, 1H) 4,10 (кв, J=6,31 Гц, 1H) 4,40 (д, J=7,13 Гц, 1H) 4,99 (д, J=4,94 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,42, 2,19 Гц, 1H) 5,77 (с, 1H)
273		871,7	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,40 Гц, 3H) 1,05-1,28 (м, 22H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,49-2,23 (м, 13H) 2,29 (с, 5H) 2,39-2,58 (м, 2H) 2,67-3,01 (м, 8H) 3,16-3,23 (м, 1H) 3,29 (с, 3H) 3,38-3,47 (м, 1H) 3,52-3,59 (м, 1H) 3,63 (д, J=7,40 Гц, 1H) 3,68 (с, 1H) 3,79 (д, J=8,23 Гц, 1H) 4,11 (кв, J=6,12 Гц, 1H) 4,40 (д, J=7,13 Гц, 1H) 4,99 (д, J=5,21 Гц, 1H) 5,10 (дд, J=10,56, 2,33 Гц, 1H) 5,80 (с, 1H)

Таблица 6-5

Приклад	R ^{1b}	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
274		913,8	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,40 Гц, 3H) 1,08 (д, J=7,40 Гц, 3H) 1,09-1,17 (м, 12H) 1,17-1,28 (м, 7H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,44-1,57 (м, 2H) 1,62-2,09 (м, 10H) 2,13-2,27 (м, 9H) 2,29 (с, 6H) 2,32-2,58 (м, 4H) 2,79-3,00 (м, 7H) 3,17 (дд, J=10,28, 7,27 Гц, 1H) 3,25-3,30 (м, 3H) 3,37-3,48 (м, 1H) 3,62-3,67 (м, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,79 (д, J=8,78 Гц, 1H) 4,10 (кв, J=6,30 Гц, 1H) 4,40 (д, J=7,13 Гц, 1H) 4,99 (д, J=4,94 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,70, 2,19 Гц, 1H) 5,77 (с, 1H)
275		927,8	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,26 Гц, 3H) 1,05-1,29 (м, 25H) 1,35-1,44 (м, 7H) 1,49-1,58 (м, 1H) 1,63-2,19 (м, 11H) 2,29 (с, 6H) 2,31-2,33 (м, 3H) 2,38-2,58 (м, 7H) 2,68-2,76 (м, 1H) 2,77-2,93 (м, 3H) 2,96 (с, 3H) 3,18 (дд, J=9,94, 7,26 Гц, 1H) 3,27-3,30 (м, 3H) 3,38-3,47 (м, 2H) 3,63 (д, J=7,64 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,79 (д, J=8,79 Гц, 1H) 4,11 (кв, J=6,37 Гц, 1H) 4,40 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,98 (д, J=4,97 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,70, 2,29 Гц, 1H) 5,77 (с, 1H)

276		913,8	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,45 Гц, 3H) 1,07 (д, J=7,26 Гц, 3H) 1,09-1,17 (м, 12H) 1,18-1,27 (м, 7H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,45-1,58 (м, 2H) 1,63-2,09 (м, 9H) 2,12-2,27 (м, 9H) 2,29 (с, 6H) 2,33-2,59 (м, 4H) 2,79-2,91 (м, 3H) 2,92-2,99 (м, 4H) 3,18 (дд, J=10,32, 7,26 Гц, 1H) 3,28 (д, J=0,76 Гц, 3H) 3,39-3,47 (м, 1H) 3,61-3,66 (м, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,79 (д, J=8,41 Гц, 1H) 4,10 (кв, J=5,99 Гц, 1H) 4,40 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,99 (д, J=4,97 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,70, 2,29 Гц, 1H) 5,77 (с, 1H)
277		927,8	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,40 Гц, 3H) 1,05-1,28 (м, 25H) 1,35-1,47 (м, 7H) 1,47-1,58 (м, 1H) 1,63-2,22 (м, 13H) 2,29 (с, 6H) 2,34-2,38 (м, 4H) 2,41-2,73 (м, 5H) 2,76-2,94 (м, 4H) 2,96 (с, 3H) 3,18 (дд, J=10,15, 7,13 Гц, 2H) 3,26-3,30 (м, 3H) 3,42-3,50 (м, 1H) 3,62-3,70 (м, 2H) 3,77 (т, J=7,82 Гц, 1H) 4,09 (кв, J=6,31 Гц, 1H) 4,37-4,44 (м, 1H) 4,98 (д, J=4,66 Гц, 1H) 5,08-5,14 (м, 1H) 5,77 (с, 1H)
278		984,9	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,40 Гц, 3H) 1,07 (д, J=7,40 Гц, 3H) 1,09-1,18 (м, 12H) 1,18-1,27 (м, 7H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,48-1,59 (м, 1H) 1,64-2,18 (м, 13H) 2,30 (с, 6H) 2,32-2,38 (м, 4H) 2,39-2,74 (м, 5H) 2,79-2,91 (м, 4H) 2,93-2,98 (м, 6H) 3,09 (с, 3H) 3,18 (дд, J=10,28, 7,27 Гц, 1H) 3,21-3,29 (м, 4H) 3,36-3,48 (м, 2H) 3,63 (д, J=7,68 Гц, 1H) 3,68 (с, 1H) 3,78 (д, J=7,95 Гц, 1H) 4,10 (кв, J=6,31 Гц, 1H) 4,39 (д, J=7,13 Гц, 1H) 4,98 (д, J=4,94 Гц, 1H) 5,10 (дд, J=10,56, 2,33 Гц, 1H) 5,77 (с, 1H)
279		943,9	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,26 Гц, 3H) 1,07 (д, J=7,64 Гц, 3H) 1,11 (д, J=7,26 Гц, 3H) 1,14 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,17-1,26 (м, 13H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,48-2,06 (м, 13H) 2,12 (д, J=14,91 Гц, 1H) 2,25-2,33 (м, 7H) 2,35 (с, 3H) 2,39-2,48 (м, 3H) 2,49-2,58 (м, 1H) 2,69-2,91 (м, 5H) 2,93-3,00 (м, 4H) 3,18 (дд, J=10,32, 7,26 Гц, 1H) 3,23-3,31 (м, 4H) 3,36-3,49 (м, 3H) 3,58-3,66 (м, 2H) 3,68 (с, 1H) 3,78 (д, J=8,41 Гц, 1H) 4,10 (кв, J=6,24 Гц, 1H) 4,39 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,98 (д, J=4,59 Гц, 1H) 5,10 (дд, J=10,70, 2,29 Гц, 1H) 5,76 (с, 1H)
280		943,8	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,26 Гц, 3H) 1,07 (д, J=7,64 Гц, 3H) 1,11 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,14 (д, J=6,50 Гц, 3H) 1,17 (с, 3H) 1,18-1,27 (м, 10H) 1,37 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,47-1,58 (м, 1H) 1,62-2,04 (м, 11H) 2,14 (д, J=14,91 Гц, 1H) 2,27-2,34 (м, 7H) 2,36 (с, 3H) 2,41-2,72 (м, 6H) 2,79-2,92 (м, 4H) 2,96 (с, 3H) 3,18 (дд, J=9,94, 7,26 Гц, 1H) 3,24-3,31 (м, 4H) 3,36-3,43 (м, 1H) 3,43-3,51 (м, 1H) 3,60-3,64 (м, 1H) 3,66-3,70 (м, 2H) 3,75 (д, J=8,79 Гц, 1H) 4,09 (кв, J=6,50 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,98 (д, J=4,59 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,70, 2,29 Гц, 1H) 5,77 (с, 1H)

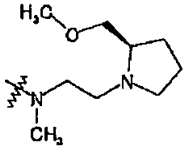
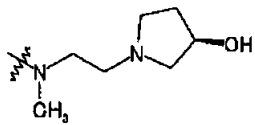
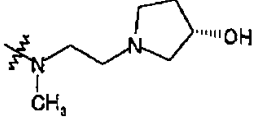
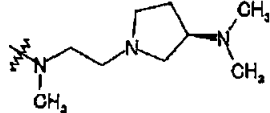
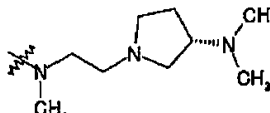
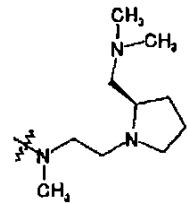
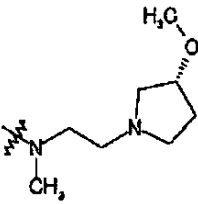
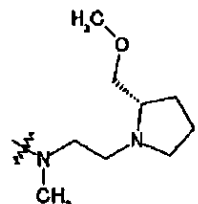
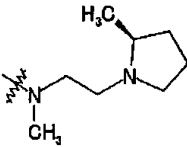
281		957,9	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,40 Гц, 3H) 1,08 (д, J=7,40 Гц, 3H) 1,11 (д, J=7,13 Гц, 3H) 1,13-1,26 (м, 16H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,49-2,21 (м, 14H) 2,29 (с, 6H) 2,31-2,37 (м, 4H) 2,40-2,70 (м, 5H) 2,78-2,91 (м, 3H) 2,96 (с, 3H) 3,01-3,09 (м, 1H) 3,13-3,21 (м, 2H) 3,26-3,32 (м, 4H) 3,34 (с, 3H) 3,37-3,50 (м, 3H) 3,65 (д, J=7,40 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,79 (д, J=8,23 Гц, 1H) 4,09 (кв, J=6,12 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,13 Гц, 1H) 4,99 (д, J=4,66 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,56, 2,33 Гц, 1H) 5,76 (с, 1H)
282		929,8	(500 МГц): 0,85 (т, J=7,27 Гц, 3H) 1,04-1,26 (м, 22H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,47-2,06 (м, 10H) 2,11-2,33 (м, 9H) 2,34-2,58 (м, 7H) 2,60-2,70 (м, 2H) 2,77-3,03 (м, 8H) 3,18 (дд, J=10,28, 7,27 Гц, 1H) 3,27 (с, 3H) 3,44-3,52 (м, 1H) 3,65-3,71 (м, 2H) 3,75 (д, J=8,50 Гц, 1H) 4,09 (кв, J=6,31 Гц, 1H) 4,25-4,32 (м, 1H) 4,41 (д, J=7,13 Гц, 1H) 4,96 (д, J=4,11 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,56, 2,33 Гц, 1H) 5,78 (с, 1H)
283		929,8	(500 МГц): 0,85 (т, J=7,40 Гц, 3H) 1,03-1,28 (м, 22H) 1,37 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,47-2,06 (м, 9H) 2,11-2,34 (м, 9H) 2,37 (с, 3H) 2,41-2,65 (м, 7H) 2,75-2,99 (м, 8H) 3,18 (дд, J=10,15, 7,40 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,43-3,50 (м, 1H) 3,66 (д, J=7,13 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,75 (д, J=8,50 Гц, 1H) 4,07 (кв, J=6,31 Гц, 1H) 4,29-4,35 (м, 1H) 4,41 (д, J=7,40 Гц, 1H) 4,95 (д, J=4,11 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,70, 2,19 Гц, 1H) 5,79 (с, 1H)

Таблица 6-6

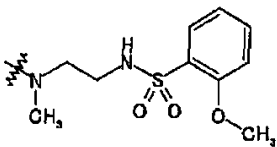
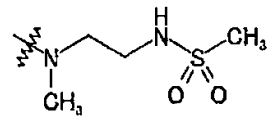
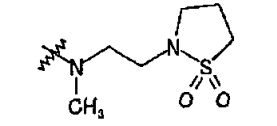
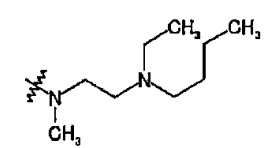
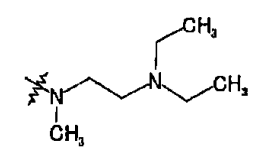
Приклад	R ^{1b}	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
284		956,9	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,26 Гц, 3H) 1,04-1,27 (м, 22H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,49-1,59 (м, 1H) 1,62-2,15 (м, 11H) 2,21 (с, 6H) 2,29 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,41-2,67 (м, 7H) 2,74-2,92 (м, 6H) 2,96 (с, 3H) 3,18 (дд, J=10,13, 7,45 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,43-3,51 (м, 1H) 3,63-3,71 (м, 2H) 3,77 (д, J=8,41 Гц, 1H) 4,06-4,13 (м, 1H) 4,41 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,98 (д, J=4,59 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,70, 2,29 Гц, 1H) 5,78 (с, 1H)
285		956,8	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,26 Гц, 3H) 1,05-1,26 (м, 22H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,48-2,15 (м, 12H) 2,21 (с, 6H) 2,29 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,40-2,67 (м, 7H) 2,71-2,93 (м, 6H) 2,94-2,98 (м, 3H) 3,18 (дд, J=10,32, 7,26 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,44-3,49 (м, 1H) 3,65 (д, J=7,26 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,77 (д, J=8,41 Гц, 1H) 4,09 (кв, J=6,50 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,98 (д, J=4,59 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,51, 2,10 Гц, 1H) 5,78 (с, 1H)

286		970,9	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,40 Гц, 3H) 1,08 (д, J=7,40 Гц, 3H) 1,11 (д, J=7,13 Гц, 3H) 1,14 (д, J=6,58 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,17 (д, J=6,58 Гц, 3H) 1,19-1,27 (м, 7H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,46-2,17 (м, 16H) 2,20-2,31 (м, 13H) 2,36 (с, 3H) 2,37-2,57 (м, 5H) 2,63-2,72 (м, 1H) 2,78-2,91 (м, 3H) 2,96 (с, 3H) 3,01-3,10 (м, 1H) 3,18 (дд, J=10,15, 7,13 Гц, 2H) 3,28 (с, 3H) 3,36-3,51 (м, 2H) 3,64 (д, J=7,40 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,79 (д, J=7,95 Гц, 1H) 4,09 (кв, J=6,49 Гц, 1H) 4,40 (д, J=7,13 Гц, 1H) 4,99 (д, J=4,66 Гц, 1H) 5,10 (дд, J=10,56, 2,33 Гц, 1H) 5,76 (с, 1H)
287		943,7	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,26 Гц, 3H) 1,07 (д, J=7,26 Гц, 3H) 1,11 (д, J=7,26 Гц, 3H) 1,12-1,27 (м, 16H) 1,40 (с, 3H) 1,38 (с, 3H) 1,47-1,58 (м, 1H) 1,64-1,75 (м, 2H) 1,77-1,91 (м, 4H) 1,91-2,06 (м, 3H) 2,11 (д, J=14,52 Гц, 1H) 2,30 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,40-2,69 (м, 9H) 2,79-2,91 (м, 4H) 2,96 (с, 3H) 3,18 (дд, J=10,32, 7,26 Гц, 1H) 3,27 (с, 3H) 3,28 (с, 3H) 3,42-3,50 (м, 1H) 3,65 (д, J=7,26 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,77 (д, J=8,41 Гц, 1H) 3,89-3,95 (м, 1H) 4,10 (кв, J=6,24 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,98 (д, J=4,59 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,51, 2,10 Гц, 1H) 5,77 (с, 1H)
288		957,7	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,40 Гц, 3H) 1,07 (д, J=7,40 Гц, 3H) 1,11 (д, J=6,86 Гц, 3H) 1,13-1,26 (м, 16H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,48-2,11 (м, 14H) 2,17-2,24 (м, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,36 (с, 3H) 2,37-2,47 (м, 2H) 2,49-2,66 (м, 4H) 2,79-2,92 (м, 3H) 2,96 (с, 3H) 3,00-3,07 (м, 1H) 3,14-3,20 (м, 2H) 3,26-3,30 (м, 4H) 3,33 (с, 3H) 3,36-3,41 (м, 1H) 3,42-3,49 (м, 1H) 3,66 (д, J=7,13 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,77 (д, J=8,23 Гц, 1H) 4,09 (кв, J=6,30 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,40 Гц, 1H) 4,99 (д, J=4,11 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,56, 2,33 Гц, 1H) 5,77 (с, 1H)
289		927,8	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,45 Гц, 3H) 1,05-1,19 (м, 18H) 1,19-1,26 (м, 7H) 1,35-1,46 (м, 7H) 1,52 (дд, J=10,51, 7,07 Гц, 1H) 1,62-2,18 (м, 13H) 2,29 (с, 6H) 2,30-2,38 (м, 4H) 2,39-2,47 (м, 1H) 2,49-2,60 (м, 2H) 2,63-2,73 (м, 1H) 2,78-2,94 (м, 5H) 2,94-2,98 (м, 3H) 3,12-3,22 (м, 2H) 3,28 (с, 3H) 3,42-3,51 (м, 2H) 3,62-3,66 (м, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,78 (д, J=8,79 Гц, 1H) 4,09 (кв, J=6,50 Гц, 1H) 4,40 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,99 (д, J=4,97 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,70, 2,29 Гц, 1H) 5,76 (с, 1H)

290		927,8	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,40 Гц, 3H) 1,04-1,26 (м, 25H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,48-1,58 (м, 1H) 1,63-2,21 (м, 15H) 2,29 (с, 6H) 2,36 (с, 3H) 2,41-2,48 (м, 1H) 2,50-2,58 (м, 1H) 2,65 (т, J=6,72 Гц, 2H) 2,77-2,94 (м, 4H) 2,96 (с, 3H) 3,13-3,21 (м, 2H) 3,28 (с, 3H) 3,42-3,51 (м, 1H) 3,66 (д, J=7,40 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,77 (д, J=8,50 Гц, 1H) 4,09 (кв, J=6,31 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,40 Гц, 1H) 4,98 (д, J=4,11 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,56, 2,33 Гц, 1H) 5,78 (с, 1H)
291		956,7	(500 МГц): 0,83-0,89 (м, 3H) 1,06-1,29 (м, 22H) 1,36-1,42 (м, 6H) 1,47-1,58 (м, 1H) 1,64-2,15 (м, 9H) 2,28-2,32 (м, 6H) 2,37 (с, 3H) 2,41-2,90 (м, 12H) 2,94-2,97 (м, 3H) 3,16-3,37 (м, 6H) 3,41-3,50 (м, 1H) 3,63-3,72 (м, 2H) 3,75-3,85 (м, 4H) 4,10 (кв, J=6,12 Гц, 1H) 4,37-4,44 (м, 1H) 4,97 (д, J=4,66 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,56, 2,33 Гц, 1H) 5,75-5,79 (м, 1H)
292		941,7	(500 МГц): 0,83-0,92 (м, 6H) 1,07 (д, J=7,64 Гц, 3H) 1,11 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,13-1,26 (м, 16H) 1,34-1,47 (м, 7H) 1,47-1,58 (м, 1H) 1,61-2,21 (м, 16H) 2,29 (с, 6H) 2,34-2,37 (м, 3H) 2,40-2,69 (м, 4H) 2,79-2,97 (м, 7H) 3,18 (дд, J=10,32, 7,26 Гц, 2H) 3,28 (с, 3H) 3,36-3,50 (м, 2H) 3,62-3,70 (м, 2H) 3,75-3,81 (м, 1H) 4,05-4,12 (м, 1H) 4,38-4,43 (м, 1H) 4,99 (д, J=4,97 Гц, 1H) 5,08-5,13 (м, 1H) 5,76 (с, 1H)
293		941,7	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,45 Гц, 3H) 1,05-1,28 (м, 28H) 1,33-1,42 (м, 7H) 1,48-1,58 (м, 1H) 1,63-2,08 (м, 11H) 2,29 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,40-2,47 (м, 1H) 2,50-2,68 (м, 7H) 2,79-2,91 (м, 3H) 2,96 (с, 3H) 3,18 (дд, J=10,32, 7,26 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,38-3,48 (м, 2H) 3,64 (д, J=7,26 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,79 (д, J=8,41 Гц, 1H) 4,09 (кв, J=6,12 Гц, 1H) 4,40 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,99 (д, J=4,97 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,32, 2,29 Гц, 1H) 5,76 (с, 1H)

Таблица 6-7

Приклад	R ^{1b}	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
294		941,7	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,40 Гц, 3H) 0,95-1,00 (м, 6H) 1,06-1,26 (м, 22H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,48-2,10 (м, 13H) 2,29 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,38-2,90 (м, 10H) 2,96 (с, 3H) 3,18 (дд, J=10,28, 7,27 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,42-3,50 (м, 1H) 3,65 (д, J=7,40 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,78 (д, J=8,78 Гц, 1H) 4,08 (кв, J=6,31 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,40 Гц, 1H) 4,99 (д, J=4,39 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,56, 2,33 Гц, 1H) 5,77 (с, 1H)

295		1029,5	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,01-1,27 (м, 22H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,49-2,09 (м, 9H) 2,18 (с, 3H) 2,28 (с, 6H) 2,38-3,03 (м, 11H) 3,15-3,19 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,38-3,44 (м, 2H) 3,61 (д, J=7,79 Гц, 1H) 3,68 (с, 1H) 3,77-3,80 (м, 1H) 4,00 (с, 3H) 4,12 (кв, J=6,42 Гц, 1H) 4,37 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,96-5,00 (м, 1H) 5,12 (с, 2H) 5,77 (с, 1H) 7,06 (д, J=8,25 Гц, 1H) 7,10 (м, 1H) 7,53-7,58 (м, 1H) 7,89-7,92 (м, 1H)
296		937,6	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,57 Гц, 2H) 1,06-1,27 (м, 22H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,48-1,92 (м, 7H) 2,06 (д, J=15,13 Гц, 1H) 2,14 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,39-2,91 (м, 6H) 2,95 (с, 3H) 2,96 (с, 3H) 3,15-3,25 (м, 3H) 3,30 (с, 3H) 3,39-3,45 (м, 2H) 3,59 (д, J=7,79 Гц, 1H) 3,68 (с, 1H) 3,80 (с, 1H) 4,18 (кв, J=6,27 Гц, 1H) 4,37 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,76-4,80 (м, 1H) 4,96 (д, J=5,04 Гц, 1H) 5,10 (дд, J=10,55, 2,29 Гц, 1H) 5,77 (с, 1H)
297		963,5	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,57 Гц, 2H) 1,05-1,26 (м, 22H) 1,38 (с, 3H) 1,39-1,41 (м, 3H) 1,49-2,11 (м, 9H) 2,29 (с, 6H) 2,33-2,45 (м, 6H) 2,50-2,92 (м, 6H) 2,95 (с, 3H) 3,12-3,21 (м, 4H) 3,26-3,33 (м, 5H) 3,39-3,47 (м, 2H) 3,61-3,64 (м, 1H) 3,68 (с, 1H) 3,79 (д, J=8,25 Гц, 1H) 4,11 (кв, J=6,27 Гц, 1H) 4,39 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,99 (д, J=5,04 Гц, 1H) 5,10 (дд, J=10,77, 2,52 Гц, 1H) 5,76 (с, 1H)
298		943,8	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,90 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,01 (т, J=7,11 Гц, 3H) 1,07 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,11 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,14 (д, J=6,42 Гц, 3H) 1,15 (с, 3H) 1,24 (д, J=7,79 Гц, 3H) 1,24 (д, J=11,46 Гц, 3H) 1,24 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,16-1,32 (м, 4H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,36-1,91 (м, 9H) 2,04 (с, 3H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,36-2,64 (м, 8H) 2,82 (с, 3H) 2,96 (с, 3H) 3,15-3,20 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,40 (с, 1H) 3,44-3,49 (м, 1H) 3,65-3,67 (м, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,77-3,79 (м, 1H) 4,06-4,10 (м, 1H) 4,41 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,98-5,01 (м, 1H) 5,08-5,13 (м, 1H) 5,76 (3,1H)
299		915,7	(400 МГц): 0,86 (т, J=7,3 Гц, 3H) 1,01-1,26 (м, 25H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,44-1,92 (м, 8H) 1,96 (дд, J=14,9, 4,9, 1H) 2,03 (д, J=15,1 Гц, 1H) 2,09 (д, J=14,6 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,39-2,65 (м, 10H) 2,77-2,92 (м, 3H) 2,96 (с, 3H) 3,18 (дд, J=10,3, 7,3 Гц 1H) 3,28 (с, 3H) 3,38-3,52 (м, 2H) 3,66 (д, J=7,3 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,78 (д, J=8,3 Гц, 1H) 4,09 (кв, J=6,3 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,3 Гц, 1H) 4,99 (д, J=4,4 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,7, 2,2 Гц, 1H) 5,77 (с, 1H)

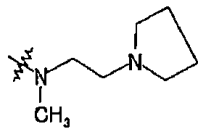
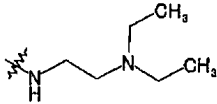
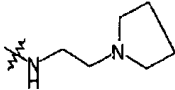
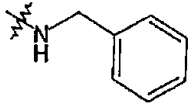
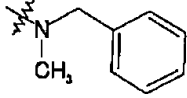
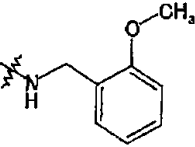
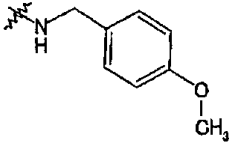
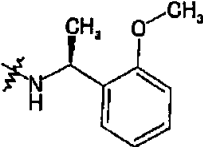
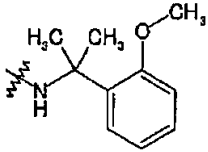
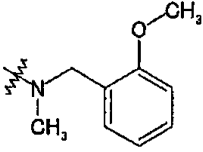
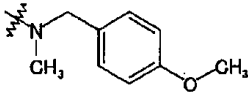
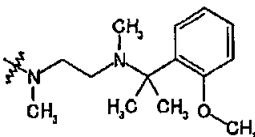
300		913,7	(400 МГц): 0,86 (т, J=7,4 Гц, 3H) 1,08 (д, J=6,3 Гц, 3H) 1,11 (д, J=7,1 Гц, 3H) 1,13-1,28 (м, 16H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,47-1,91 (м, 9H) 1,95 (дд, J=14,8, 4,8 Гц, 1H) 2,02 (д, J=14,6 Гц, 1H) 2,14 (д, J=14,9 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 3,36 (с, 3H) 2,39-2,72 (м, 9H) 2,75-2,92 (м, 3H) 2,96 (с, 3H) 3,18 (дд, J=10,4, 7,2 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,37-3,52 (м, 2H) 3,66 (д, J=7,3 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,77 (д, J=8,5 Гц, 1H) 4,10 (кв, J=6,3 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,3 Гц, 1H) 4,98 (д, J=4,2 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,5, 2,2 Гц, 1H) 5,77 (с, 1H)
301		901,7	(400 МГц): 0,86 (т, J=7,4 Гц, 3H) 1,00 (д, J=7,1 Гц, 3H) 1,01 (д, J=7,3 Гц, 3H) 1,08 (д, J=7,6 Гц, 1H) 1,10-1,27 (м, 19H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,47-1,58 (м, 1H) 1,61-1,99 (м, 8H) 2,04 (д, J=14,4 Гц, 1H) 2,28 (с, 6H) 2,37 (д, J=13,4 Гц, 1H) 2,40-2,58 (м, 8H) 2,61-2,69 (м, 2H) 2,76-2,93 (м, 3H) 2,96 (с, 3H) 3,18 (дд, J=10,3, 7,3 Гц, 1H) 3,29 (с, 3H) 3,49-3,58 (м, 1H) 3,64 (д, J=7,3 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,79 (д, J=8,1 Гц, 1H) 4,23 (кв, J=6,3 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,3 Гц, 1H) 4,98 (д, J=4,4 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,7, 2,2 Гц, 1H) 5,77 (с, 1H)
302		899,6	(400 МГц): 0,86 (т, J=7,4 Гц, 3H) 1,05-1,27 (м, 22H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,46-1,98 (м, 12H) 2,04 (д, J=14,6 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,39-2,62 (м, 8H) 2,70-2,92 (м, 5H) 2,95 (с, 3H) 3,18 (дд, J=10,0, 7,3 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,51-3,60 (м, 1H) 3,64 (д, J=7,3 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,79 (д, J=8,5 Гц, 1H) 4,25 (кв, J=6,2 Гц, 1H) 4,40 (д, J=7,1 Гц, 1H) 4,97 (д, J=4,6 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,6, 2,1 Гц, 1H) 5,77 (с, 1H)

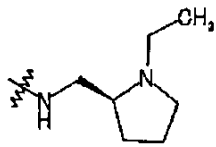
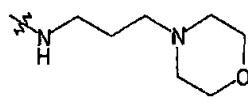
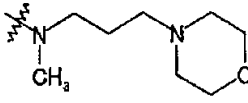
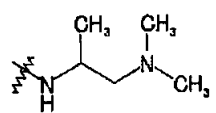
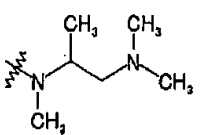
Таблица 6-8

Приклад	R ^{1b}	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
303		892,6	(400 МГц): 0,86 (т, J=7,3 Гц, 3H) 1,06-1,21 (м, 24H) 1,37 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,47-1,68 (м, 5H) 1,70-1,94 (м, 6H) 2,03 (д, J=15,4 Гц, 1H) 2,22-2,47 (м, 2H) 2,51-2,57 (м, 1H) 2,79-2,89 (м, 3H) 2,94 (с, 3H) 3,15 (дд, J=10,3, 7,1 Гц, 1H) 3,27 (с, 3H) 3,44-3,50 (м, 1H) 3,60 (д, J=7,6 Гц, 1H) 3,68 (с, 1H) 3,72-3,83 (м, 3H) 4,08-4,12 (м, 1H) 4,29 (кв, J=6,0 Гц, 1H) 4,37 (д, J=7,1 Гц, 1H) 4,95 (д, J=4,6 Гц, 1H) 5,10 (дд, J=10,5, 2,2 Гц, 1H) 5,77 (1H, с) 7,23-7,35 (м, 5H)

304		906,6	(400 МГц): 0,86 (т, J=7,3 Гц, 3H) 1,09 (д, J=7,6 Гц, 3H) 1,11 (д, J=7,1 Гц, 3H) 1,12-1,29 (м, 15H) 1,38 (с, 3H) 1,41 (с, 3H) 1,47-1,94 (м, 7H) 1,99 (дд, J=15,1, 5,4 Гц, 1H) 2,09 (д, J=14,6 Гц, 1H) 2,17 (д, J=14,9 Гц, 1H) 2,23 (с, 3H) 2,30 (с, 6H) 2,40-2,50 (м, 1H) 2,80-2,91 (м, 2H) 2,97 (с, 3H) 3,01 (с, 1H) 3,19 (дд, J=10,1, 7,4 Гц, 1H) 3,31 (с, 3H) 3,39-3,49 (м, 2H) 3,62-3,71 (м, 4H) 3,81 (д, J=8,1 Гц, 1H) 4,16 (кв, J=6,1 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,3 Гц, 1H) 4,80 (с, 1H) 5,01 (д, J=4,9 Гц, 1H) 5,10 (дд, J=10,5, 2,0 Гц, 1H) 5,78 (1H, с) 7,24-7,38 (м, 5H)
305		922,6	(400 МГц): 0,85 (т, J=7,4 Гц, 3H) 0,91 (д, J=6,1 Гц, 3H) 1,00-1,11 (м, 13H) 1,13 (д, J=6,6 Гц, 3H) 1,20 (д, J=7,3 Гц, 3H) 1,24 (с, 1H) 1,33 (с, 3H) 1,39 (с, 3H) 1,44-1,92 (м, 13H) 1,94-1,98 (м, 2H) 2,17-2,27 (м, 7H) 2,47-2,57 (м, 2H) 2,78-2,88 (м, 2H) 2,94 (с, 3H) 3,04-3,11 (м, 2H) 3,25 (с, 3H) 3,35 (с, 1H) 3,55 (д, J=7,1 Гц, 1H) 3,68 (с, 1H) 3,75 (д, J=8,8 Гц, 1H) 3,86 (с, 3H) 4,06 (кв, J=6,3 Гц, 1H) 4,33 (д, J=7,3 Гц, 1H) 4,96 (т, J=2,9 Гц, 1H) 5,10 (дд, J=10,7, 2,2 Гц, 1H) 5,76 (с, 1H) 6,86-6,94 (м, 2H) 7,18-7,26 (м, 2H)
306		922,7	(400 МГц): 0,86 (т, J=7,3 Гц, 3H) 1,04-1,17 (м, 20H) 1,20 (д, J=7,6 Гц, 3H) 1,37 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,48-1,94 (м, 7H) 2,02 (д, J=14,6 Гц, 1H) 2,27 (с, 6H) 2,33-2,44 (м, 2H) 2,49-2,58 (м, 1H) 2,79-2,89 (м, 3H) 2,94 (с, 3H) 3,16 (дд, J=10,1, 7,2 Гц, 1H) 3,27 (с, 3H) 3,45-3,54 (м, 1H) 3,60 (д, J=7,6 Гц, 1H) 3,62-3,81 (м, 8H) 4,18 (с, 1H) 4,28 (кв, J=6,3 Гц, 1H) 4,38 (д, J=7,1 Гц, 1H) 4,95 (д, J=4,9 Гц, 1H) 5,10 (дд, J=10,6, 2,1 Гц, 1H) 5,77 (с, 1H) 6,86 (д, J=8,3 Гц, 2H) 7,18 (д, J=8,5 Гц, 2H)
307		936,6	(400 МГц): 0,85 (т, J=7,4 Гц, 3H) 0,99 (д, J=6,1 Гц, 3H) 1,02-1,17 (м, 16H) 1,20 (д, J=7,3 Гц, 3H) 1,33-1,42 (м, 9H) 1,46-1,93 (м, 7H) 1,93-2,01 (м, 2H) 2,05 (д, J=13,7 Гц, 1H) 2,24 (с, 6H) 2,26-2,35 (м, 1H) 2,53 (т, J=7,7 Гц, 1H) 2,76-2,90 (м, 3H) 2,94 (с, 3H) 3,12 (дд, J=10,3, 7,3 Гц, 1H) 3,25 (с, 3H) 3,27-3,40 (м, 2H) 3,58 (д, J=7,3 Гц, 1H) 3,68 (с, 1H) 3,77 (д, J=8,5 Гц, 1H) 4,35 (д, J=7,3 Гц, 1H) 4,96 (д, J=2,7 Гц, 1H) 5,10 (дд, J=10,5, 2,2 Гц, 1H) 5,77 (с, 1H) 6,84-6,95 (м, 2H) 7,13-7,25 (м, 2H)

308		950,6	(400 МГц): 0,85 (т, J=7,4 Гц, 3H) 0,99 (д, J=6,1 Гц, 3H) 1,02-1,17 (м, 16H) 1,20 (д, J=7,3 Гц, 3H) 1,33-1,42 (м, 9H) 1,46-1,93 (м, 7H) 1,93-2,01 (м, 2H) 2,05 (д, J=13,7 Гц, 1H) 2,24 (с, 6H) 2,26-2,35 (м, 1H) 2,53 (т, J=7,7 Гц, 1H) 2,76-2,90 (м, 3H) 2,94 (с, 3H) 3,12 (дд, J=10,3, 7,3 Гц, 1H) 3,25 (с, 3H) 3,27-3,40 (м, 2H) 3,58 (д, J=7,3 Гц, 1H) 3,68 (с, 1H) 3,77 (д, J=8,5 Гц, 1H) 4,35 (д, J=7,3 Гц, 1H) 4,96 (д, J=2,7 Гц, 1H) 5,10 (дд, J=10,5, 2,2 Гц, 1H) 5,77 (с, 1H) 6,84-6,95 (м, 2H) 7,13-7,25 (м, 2H)
309		936	(400 МГц): 0,86 (т, J=7,32 Гц, 3H) 1,09 (д, J=7,57 Гц, 3H) 1,11 (д, J=7,32 Гц, 3H) 1,14 (д, J=6,59 Гц, 3H) 1,17-1,26 (м, 13H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,46-1,93 (м, 7H) 1,98-2,16 (м, 3H) 2,18 (с, 3H) 2,30 (с, 6H) 2,40-2,59 (м, 2H) 2,79-2,95 (м, 3H) 2,97 (с, 3H) 3,19 (дд, J=9,77, 7,08 Гц, 1H) 3,31 (с, 3H) 3,38-3,51 (м, 2H) 3,66 (д, J=7,57 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,80 (д, J=8,30 Гц, 1H) 3,86 (с, 3H) 4,14 (кв, J=6,83 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,32 Гц, 1H) 5,02 (д, J=3,91 Гц, 1H) 5,07-5,15 (м, 1H) 5,78 (с, 1H) 6,86-6,93 (м, 1H) 7,16-7,20 (м, 1H) 7,26-7,30 (м, 1H)
310		936	(400 МГц): 0,86 (т, J=7,32 Гц, 3H) 1,08 (д, J=7,57 Гц, 3H) 1,11 (д, J=7,08 Гц, 3H) 1,14 (д, J=6,59 Гц, 3H) 1,17 (с, 3H) 1,17-1,26 (м, 1H) 1,22 (д, J=6,10 Гц, 9H) 1,38 (с, 3H) 1,41 (с, 3H) 1,98 (дд, J=14,89, 5,13 Гц, 1H) 2,09 (д, J=14,65 Гц, 1H) 2,10-2,22 (м, 1H) 2,20 (с, 3H) 2,30 (с, 6H) 2,40-2,60 (м, 2H) 2,79-2,93 (м, 3H) 2,97 (с, 3H) 3,19 (дд, J=10,25, 7,32 Гц, 1H) 3,31 (с, 3H) 3,39-3,49 (м, 2H) 3,50-3,65 (м, 1H) 3,65 (д, J=7,57 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,79-3,82 (м, 1H) 3,81 (с, 3H) 4,14 (кв, J=6,10 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,32 Гц, 1H) 5,00 (д, J=4,88 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,50, 2,20 Гц, 1H) 5,78 (с, 1H) 6,84-6,89 (м, 2H) 7,17-7,22 (м, 2H)
311		1021,7	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,45 Гц, 3H) 1,04-1,28 (м, 22H) 1,37-1,46 (м, 12H) 1,49-1,58 (м, 1H) 1,62-2,07 (м, 9H) 2,18 (с, 3H) 2,23-2,33 (м, 9H) 2,40-2,57 (м, 5H) 2,78-2,91 (м, 3H) 2,96 (с, 3H) 3,18 (дд, J=10,32, 7,26 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,40-3,48 (м, 1H) 3,64 (д, J=7,26 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,76-3,81 (м, 4H) 4,08 (кв, J=6,37 Гц, 1H) 4,40 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,99 (д, J=4,97 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,70, 2,29 Гц, 1H) 5,77 (с, 1H) 6,84-6,91 (м, 2H) 7,14-7,21 (м, 1H) 7,61 (м, 1H)

Таблиця 6-9

Приклад	R ^{1b}	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
312		913,6	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,06-1,23 (м, 25H) 1,38 (с, 3H) 1,39-1,41 (м, 3H) 1,48-2,20 (м, 15H) 2,29 (с, 6H) 2,39-2,93 (м, 10H) 2,95 (с, 3H) 3,16-3,20 (м, 1H) 3,29 (с, 3H) 3,50-3,55 (м, 1H) 3,64 (д, J=7,79 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,80 (д, J=8,25 Гц, 1H) 4,24 (кв, J=6,42 Гц, 1H) 4,40 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,97 (д, J=4,58 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,55, 2,29 Гц, 1H) 5,77 (с, 1H)
313		929,7	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,06-1,26 (м, 22H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,48-2,08 (м, 10H) 2,29 (с, 6H) 2,34-2,70 (м, 10H) 2,79-2,90 (м, 3H) 2,95 (с, 3H) 3,16-3,21 (м, 1H) 3,29 (с, 3H) 3,40 (с, 1H) 3,51-3,59 (м, 1H) 3,62-3,66 (м, 1H) 3,66-3,73 (м, 5H) 3,77-3,81 (м, 1H) 4,25 (кв, J=6,11 Гц, 1H) 4,40 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,52 (ушир. с, 1H) 4,97 (д, J=5,04 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,32, 2,06 Гц, 1H) 5,77 (с, 1H)
314		943,8	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,57 Гц, 3H) 1,04-1,28 (м, 22H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,49-2,06 (м, 11H) 2,25-2,62 (м, 19H) 2,78-2,91 (м, 3H) 2,96 (с, 3H) 3,15-3,21 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,38 (ушир. с, 1H) 3,41-3,49 (м, 1H) 3,65 (д, J=7,34 Гц, 1H) 3,68-3,74 (м, 5H) 3,78 (д, J=7,79 Гц, 1H) 4,08 (кв, J=6,42 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,98 (д, J=4,58 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,77, 2,52 Гц, 1H) 5,77 (с, 1H)
315		887,7	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,45 Гц, 3H) 0,92-1,01 (м, 3H) 1,05-1,27 (м, 22H) 1,35-1,44 (м, 6H) 1,48-2,10 (м, 9H) 2,16-2,33 (м, 13H) 2,40-3,04 (м, 10H) 3,18 (дд, J=10,32, 7,26 Гц, 1H) 3,29 (с, 3H) 3,48-3,59 (м, 1H) 3,61-3,71 (м, 2H) 3,74-3,83 (м, 1H) 4,17-4,31 (м, 1H) 4,37-4,45 (м, 1H) 4,94-5,01 (м, 1H) 5,07-5,15 (м, 1H) 5,78 (с, 1H)
316		901,8	(500 МГц): 0,83-0,95 (м, 6H) 1,05-1,27 (м, 22H) 1,35-1,43 (м, 6H) 1,53 (тд, J=7,06, 3,70 Гц, 1H) 1,62-2,07 (м, 9H) 2,19-2,37 (м, 16H) 2,42-2,58 (м, 2H) 2,77-2,91 (м, 4H) 2,96 (с, 3H) 3,16-3,22 (м, 1H) 3,26-3,31 (м, 3H) 3,46-3,57 (м, 1H) 3,63-3,82 (м, 3H) 4,08-4,14 (м, 1H) 4,39-4,48 (м, 1H) 4,95-5,02 (м, 1H) 5,08-5,15 (м, 1H) 5,74-5,81 (м, 1H)

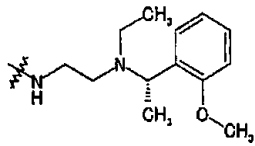
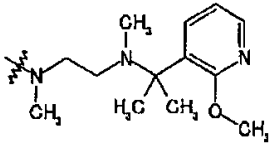
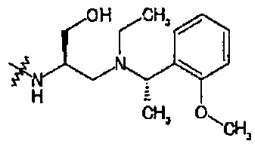
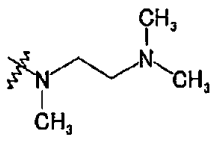
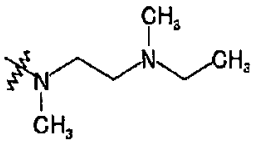
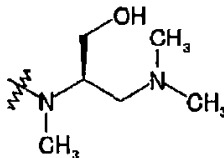
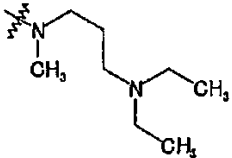
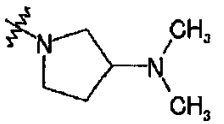
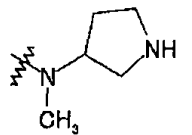
317		1007,7	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,45 Гц, 3H) 0,96 (т, J=6,88 Гц, 3H) 1,05-1,24 (м, 22H) 1,28 (д, J=6,50 Гц, 3H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,48-1,65 (м, 2H) 1,70-2,07 (м, 6H) 2,25-2,32 (м, 7H) 2,38-2,66 (м, 8H) 2,76-2,91 (м, 3H) 2,96 (с, 3H) 3,17 (дд, J=10,32, 7,26 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,44-3,52 (м, 1H) 3,65 (д, J=7,26 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,76-3,83 (м, 4H) 4,15-4,23 (м, 1H) 4,33-4,43 (м, 2H) 4,98 (д, J=4,59 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,70, 2,29 Гц, 1H) 5,77 (с, 1H) 6,86 (д, J=8,03 Гц, 1H) 6,93 (т, J=7,07 Гц, 1H) 7,18-7,23 (м, 1H) 7,31 (д, J=7,26 Гц, 1H)
318		1022,7	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,40 Гц, 3H) 1,05-1,27 (м, 22H) 1,35-1,44 (м, 12H) 1,48-1,58 (м, 1H) 1,62-2,08 (м, 9H) 2,19 (с, 3H) 2,26 (с, 3H) 2,29 (с, 6H) 2,36-2,58 (м, 5H) 2,77-2,91 (м, 3H) 2,96 (с, 3H) 3,18 (дд, J=10,15, 7,13 Гц, 1H) 3,29 (с, 3H) 3,39-3,48 (м, 1H) 3,64 (д, J=7,40 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,79 (д, J=8,50 Гц, 1H) 3,92-3,93 (м, 3H) 4,09 (кв, J=6,40 Гц, 1H) 4,40 (д, J=7,13 Гц, 1H) 5,00 (д, J=4,94 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,56, 2,33 Гц, 1H) 5,77 (с, 1H) 6,82 (дд, J=7,54, 4,80 Гц, 1H) 7,93-8,02 (м, 2H)
318		1037,7	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,57 Гц, 3H) 0,94 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,03-1,24 (м, 22H) 1,32-1,43 (м, 10H) 1,49-2,06 (м, 9H) 2,28 (с, 6H) 2,36-2,57 (м, 5H) 2,63-2,90 (м, 6H) 2,94 (с, 3H) 3,16 (дд, J=10,09, 7,34 Гц, 1H) 3,27 (с, 3H) 3,40-3,69 (м, 5H) 3,78 (д, J=8,25 Гц, 1H) 3,80-3,84 (м, 3H) 4,23 (кв, J=6,27 Гц, 1H) 4,36 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,44 (кв, J=6,88 Гц, 1H) 4,95 (д, J=5,04 Гц, 1H) 5,10 (дд, J=10,32, 2,52 Гц, 1H) 5,76 (с, 1H) 6,87-6,97 (м, 2H) 7,22-7,30 (м, 2H)
320		887,6	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,06-1,26 (м, 22H) 1,38 (с, 3H) 1,39-1,41 (м, 3H) 1,49-2,05 (м, 7H) 2,14 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,24 (с, 6H) 2,29 (с, 6H) 2,31-2,66 (м, 10H) 2,79-2,91 (м, 3H) 2,96 (с, 3H) 3,18 (дд, J=10,09, 7,34 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,39 (с, 1H) 3,44-3,51 (м, 1H) 3,67 (д, J=7,34 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,77 (д, J=8,71 Гц, 1H) 4,10 (д, J=6,42 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,98 (д, J=4,13 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,55, 2,29 Гц, 1H) 5,76 (с, 1H)
321		901,7	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,45 Гц, 3H) 1,03-1,27 (м, 25H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (б, 3H) 1,48-2,05 (м, 8H) 2,12 (д, J=14,52 Гц, 1H) 2,23 (с, 3H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,35-2,66 (м, 8H) 2,79-2,93 (м, 3H) 2,96 (с, 3H) 3,18 (дд, J=10,32, 7,26 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,44-3,51 (м, 1H) 3,66 (д, J=7,26 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,77 (д, J=8,41 Гц, 1H) 4,09 (кв, J=6,50 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,99 (д, J=4,59 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,51, 2,10 Гц, 1H) 5,77 (с, 1H)

Таблица 6-10

Приклад	R ^{1b}	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
322		917,7	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,08 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,11 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,12-1,18 (м, 9H) 1,18-1,27 (м, 7H) 1,37 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,49-1,57 (м, 1H) 1,65-1,75 (м, 2H) 1,77-1,92 (м, 3H) 1,93-1,99 (м, 1H) 2,02-2,07 (м, 1H) 2,12 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,27 (с, 3H) 2,29 (с, 6H) 2,32 (с, 6H) 2,40-2,57 (м, 3H) 2,73 (т, J=11,46 Гц, 1H) 2,79-2,90 (м, 3H) 2,96 (с, 3H) 3,09-3,14 (м, 1H) 3,18 (дд, J=10,09, 7,34 Гц, 1H) 3,29 (с, 3H) 3,40-3,47 (м, 1H) 3,63 (д, J=7,34 Гц, 1H) 3,68 (с, 1H) 3,77-3,83 (м, 2H) 3,84-3,88 (м, 1H) 4,12 (кв, J=6,27 Гц, 1H) 4,40 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,98 (д, J=5,04 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,55, 2,29 Гц, 1H) 5,77 (с, 1H)
323		929,7	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,45 Гц, 3H) 1,02 (т, J=7,07 Гц, 6H) 1,05-1,18 (м, 15H) 1,19-1,26 (м, 7H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,48-1,57 (м, 1H) 1,60-2,08 (м, 10H) 2,29 (с, 6H) 2,32 (с, 3H) 2,38-2,60 (м, 10H) 2,78-2,91 (м, 3H) 2,96 (с, 3H) 3,18 (дд, J=10,32, 7,26 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,41-3,48 (м, 1H) 3,64 (д, J=7,26 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,79 (д, J=8,41 Гц, 1H) 4,10 (кв, J=6,12 Гц, 1H) 4,40 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,98 (д, J=4,97 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,32, 2,29 Гц, 1H) 5,77 (с, 1H)
324		899,8	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,27 Гц, 3H) 1,05-1,25 (м, 22H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,47-2,34 (м, 23H) 2,38-3,01 (м, 13H) 3,14-3,21 (м, 1H) 3,26-3,31 (м, 3H) 3,38-3,48 (м, 1H) 3,62-3,65 (м, 1H) 3,68 (с, 1H) 3,79 (д, J=8,50 Гц, 1H) 4,07-4,15 (м, 1H) 4,39 (дд, J=7,13, 2,19 Гц, 1H) 4,98 (д, J=4,94 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,70, 2,19 Гц, 1H) 5,78 (с, 1H)
325		885,8	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,45 Гц, 3H) 1,05-1,29 (м, 22H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,48-1,57 (м, 1H) 1,61-1,69 (м, 1H) 1,70-2,17 (м, 10H) 2,29 (с, 6H) 2,31 (с, 3H) 2,40-2,48 (м, 1H) 2,49-2,58 (м, 1H) 2,78-3,06 (м, 10H) 3,18 (дд, J=10,32, 7,26 Гц, 1H) 3,29 (с, 3H) 3,35-3,48 (м, 2H) 3,61-3,65 (м, 1H) 3,68 (с, 1H) 3,78 (д, J=8,41 Гц, 1H) 4,12 (кв, J=6,50 Гц, 1H) 4,40 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,98 (д, J=4,97 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,70, 2,29 Гц, 1H) 5,80 (с, 1H)

326		951,6	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,07 (д, J=7,79 Гц, 3H) 1,11 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,13-1,15 (м, 6H) 1,21 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,21 (д, J=8,71 Гц, 3H) 1,22 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,17-1,25 (м, 1H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,48-1,92 (м, 6H) 1,93-1,98 (м, 1H) 2,03-2,08 (м, 1H) 2,09-2,13 (м, 1H) 2,29 (ушир. с, 6H) 2,41 (с, 3H) 2,41-2,47 (м, 1H) 2,49-2,58 (м, 1H) 2,83 (с, 3H) 2,89 (с, 3H) 2,69-2,94 (м, 5H) 2,95 (с, 3H) 3,15-3,28 (м, 3H) 3,29 (с, 3H) 3,39-3,47 (м, 2H) 3,62 (д, J=7,34 Гц, 1H) 3,68 (с, 1H) 3,79 (д, J=8,25 Гц, 1H) 4,09-4,15 (м, 1H) 4,33-4,41 (м, 2H) 4,98 (д, J=5,04 Гц, 1H) 5,08-5,12 (м, 1H) 5,76 (с, 1H)
327		1043,6	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,40 Гц, 3H) 1,05-1,27 (м, 22H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,48-1,59 (м, 1H) 1,69-2,14 (м, 8H) 2,33 (с, 6H) 2,40 (с, 3H) 2,46-2,59 (м, 2H) 2,72-2,91 (м, 7H) 2,96 (с, 3H) 3,16-3,38 (м, 6H) 3,41-3,49 (м, 1H) 3,63 (д, J=7,68 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,78 (д, J=8,23 Гц, 1H) 3,93 (с, 3H) 4,11 (кв, J=6,31 Гц, 1H) 4,40 (д, J=7,40 Гц, 1H) 4,98 (д, J=4,94 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,56, 2,33 Гц, 1H) 5,77 (с, 1H) 6,99-7,07 (м, 2H) 7,49-7,56 (м, 1H) 7,90 (дд, J=7,82, 1,78 Гц, 1H)
328		965,6	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,07 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,10-1,25 (м, 22H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,48-1,98 (м, 7H) 2,03-2,13 (м, 2H) 2,30 (ушир. с, 6H) 2,40 (с, 3H) 2,41-2,47 (м, 1H) 2,50-2,58 (м, 1H) 2,85 (с, 3H) 2,70-2,93 (м, 6H) 2,95 (с, 3H) 3,14-3,21 (м, 1H) 3,24-3,31 (м, 6H) 3,39-3,46 (м, 2H) 3,62 (д, J=7,34 Гц, 1H) 3,68 (с, 1H) 3,79 (д, J=8,25 Гц, 1H) 4,09-4,14 (м, 1H) 4,38 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,98 (д, J=5,04 Гц, 1H) 5,10 (дд, J=10,55, 2,29 Гц, 1H) 5,76 (с, 1H)
329		929,8	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,45 Гц, 3H) 0,98-1,29 (м, 25H) 1,34-1,42 (м, 6H) 1,49-2,00 (м, 9H) 2,29 (с, 6H) 2,41-2,70 (м, 7H) 2,76-2,84 (м, 1H) 2,86-2,91 (м, 1H) 2,94 (с, 3H) 3,13-3,28 (м, 7H) 3,31 (с, 3H) 3,48-3,55 (м, 1H) 3,68-3,75 (м, 4H) 4,18-4,25 (м, 1H) 4,41 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,48 (с, 3H) 4,90-4,97 (м, 1H) 5,11 (дд, J=10,51, 2,48 Гц, 1H)
330		901,8	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,40 Гц, 3H) 1,08 (д, J=7,68 Гц, 3H) 1,09-1,15 (м, 9H) 1,17 (д, J=6,31 Гц, 3H) 1,19-1,26 (м, 7H) 1,38 (с, 3H) 1,39-1,42 (м, 3H) 1,49-1,56 (м, 1H) 1,59-1,68 (м, 3H) 1,70-1,93 (м, 4H) 1,94-2,06 (м, 3H) 2,20 (с, 6H) 2,26-2,30 (м, 10H) 2,39-2,60 (м, 5H) 2,78-2,91 (м, 3H) 2,96 (с, 3H) 3,18 (дд, J=10,28, 7,27 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,38-3,48 (м, 2H) 3,64 (д, J=7,40 Гц, 1H) 3,69 (с, 1H) 3,78 (д, J=8,23 Гц, 1H) 4,09 (кв, J=6,31 Гц, 1H) 4,40 (д, J=7,13 Гц, 1H) 4,98 (д, J=4,39 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,56, 2,33 Гц, 1H) 5,77 (с, 1H)

Приклад 234

(1) Кларитроміцин (200 г) розчиняли в хлороформі (1 л), до розчину по краплях додавали оцтовий ангідрид (88,3 мл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 1 години. До реакційної суміші додавали 4-диметиламінопіридин (16,3 г), і перемішували отриману суміш протягом ночі. До реакційної суміші додавали насичений водний гідрокарбонат натрію, розділяли шари, отриманий органічний шар промивали насиченим водним гідрокарбонатом натрію, сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску до випадання в осад твердої речовини, потім до фільтрату додавали етилацетат, і знову концентрували отриману суміш в умовах зниженого тиску. Отриману суспензію фільтрували, отриману тверду речовину промивали сумішшю гексану й етилацетату (3/1) з одержанням захищеної сполуки (138,4 г). Маточний розчин концентрували в умовах зниженого тиску, і піддавали отриманий залишок тій же операції з одержанням захищеної сполуки (66,2 г).

(2) Сполуку (212 г), отриману на описаній вище стадії (1), розчиняли в суміші тетрагідрофурану й диметилформаміду (2/1, 900 мл), до розчину додавали 1,1'-карбонілдіімідазол (132 г) і 1,8-діазабіцикло[5.4.0]-7-ундецен (7,6 мл), і перемішували отриману суміш при 40 °C протягом 5 годин і при кімнатній температурі протягом 4 доби. Реакційну суміш охолоджували до -20 °C, а потім барботували реакційну суміш газоподібним аміаком. Реакційну суміш нагрівали до -10 °C, додатково барботували реакційну суміш газоподібним аміаком протягом 1 години, а потім перемішували реакційну суміш протягом ночі при кімнатній температурі. До реакційної суміші додавали трет-бутоксид калію (47,2 г), і перемішували отриману суміш протягом 0,5 години. Потім до реакційної суміші додавали етилацетат і насичений водний гідрокарбонат натрію, і розділяли шари. Отриманий органічний шар промивали дистильованою водою й насиченим водним хлоридом амонію, потім сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Отриманий фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску з одержанням карбаматної сполуки (274 г).

(3) Сполуку зі знятим захистом (140,1 г) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (2), шляхом використання сполуки (274 г), отриманої на описаній вище стадії (2), як вихідної речовини.

(4) Ацетильну сполуку (46,6 г) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 1, стадія (1), шляхом використання сполуки (50 г), отриманої на описаній вище стадії (3), як вихідної речовини.

(5) Епоксисполуку (3,56 г) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 1, стадія (3), у прикладі 4, стадія (6), і в прикладі 1, стадія (4), шляхом використання сполуки (46,6 г), отриманої на описаній вище стадії (4), як вихідної речовини.

(6) Сполуку (75 мг), представлену в таблиці 6, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (100 мг), отриманої на описаній вище стадії (5), і (S)-1-(1-етилпіролідін-2-іл)-N-метилметанаміну (90,7 мг) як вихідних речовин.

У прикладах 235-316, сполуки, представлені в таблиці 6, синтезували тим же способом, що й описаний у прикладі 1, стадія (8), шляхом використання сполуки, отриманої в прикладі 234, стадія (5) і відповідних амінів.

Приклад 317

Сполуку (66,4 мг), отриману в прикладі 234, стадія (5), і сполуку (47 мг), отриману в довідковому прикладі 102, розчиняли в бутанолі (425 мкл), і перемішували розчин при 120 °C протягом 6 годин. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом препаративної тонкошарової хроматографії (хлороформ/метанол/28% водний аміак = 10/1/0,1) з одержанням сполуки (49 мг), представлені в таблиці 6.

У прикладах 318-321, сполуки, представлені в таблиці 6, синтезували тим же способом, що й описаний у прикладі 317, шляхом використання сполуки, отриманої в прикладі 234, стадія (5) і відповідних амінів.

Приклад 322

Сполуку (100 мг), отриману в прикладі 234, стадія (5), і сполуку (114 мг), отриману в довідковому прикладі 110, розчиняли в етанолі (5 мл), до розчину додавали діізопропілетиламін (170 мкл), і перемішували отриману суміш при 90 °C протягом 18 годин. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску, до отриманого залишку додавали бутанол (2 мл), і перемішували отриману суміш при 130 °C протягом 3 годин. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску, до отриманого залишку додавали насичений водний хлорид амонію, і екстрагували отриману суміш хлороформом. Органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали

отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 30/1/0,1) з одержанням сполуки (28 мг), представленої в таблиці 6.

Приклад 323

5 Сполуку (56 мг), представлену в таблиці 6, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 73, стадія (1), шляхом використання сполуки (0,15 г), отриманої в прикладі 261, як вихідної речовини.

Приклад 324

10 Сполуку (49 мг), представлену в таблиці 6, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 73, стадія (1), шляхом використання сполуки (50 мг), отриманої в прикладі 273, як вихідної речовини.

Приклад 325

15 Сполуку (100 мг), отриману в прикладі 268, розчиняли в метанолі (0,5 мл), до розчину додавали 20 % гідроксид паладію на вугіллі (50 мг), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 4 годин під тиском 1 атм водню. До реакційної суміші додавали суміш хлороформу, метанолу й 28 % водного аміаку (10/1/0,1, 5 мл), і перемішували отриману суміш протягом 0,5 години. Реакційну суміш фільтрували, фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ → хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 10/1/0,1) з одержанням сполуки (47 мг), представленої в таблиці 6.

20 Приклад 326

(1) Сполуку-аддукт (532 мг) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (500 мг), отриманої в прикладі 234, стадія (5), і N,N'-диметилетилен-1,2-діаміну (325 мг) як вихідних речовин.

25 (2) Сполуку (170 мг), представлену в таблиці 6, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 71, стадія (2), шляхом використання сполуки (200 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 327

30 Сполуку (49 мг), представлену в таблиці 6, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 71, стадія (2), шляхом використання сполуки (50 мг), отриманої в прикладі 326, стадія (1), і 2-метоксибензолсульфонілхлориду (11,8 мг) як вихідних речовин.

Приклад 328

(1) Сполуку-аддукт (445 мг) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (500 мг), отриманої в прикладі 234, стадія (5), і N-бензил-N-етил-N'-метилетилен-1,2-діаміну (600 мг) як вихідних речовин.

35 (2) Сполуку (153 мг), представлену в таблиці 6, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 325 і прикладі 71, стадія (2), шляхом використання сполуки (200 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 329

40 (1) Сполуку-аддукт (0,21 г) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (200 мг), отриманої в прикладі 234, стадія (5), і 40 % розчину метиламіну в метанолі (260 мкл) як вихідних речовин.

45 (2) Сполуку (100 мг), отриману на описаній вище стадії (1), і хлорацетилхлорид (60 мкл) розчиняли в хлороформі (3 мл), до розчину додавали насичений водний гідрокарбонат натрію (3 мл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 3 годин. Шари реакційної суміші розділяли, органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Отриманий фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску з одержанням ацильної сполуки.

50 (3) Сполуку, отриману на описаній вище стадії (2), розчиняли в ацетонітрилі (6 мл), до розчину додавали діетиламін (130 мкл) і піридин (100 мкл), і перемішували отриману суміш при 70 °C протягом 16 годин. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску з одержанням аміносполуки.

(4) Сполуку (40 мг), представлену в таблиці 6, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (6), шляхом використання сполуки, отриманої на описаній вище стадії (3), як вихідної речовини.

55 Приклад 330

60 (1) Сполуку (200 мг), отриману в прикладі 234, стадія (5), і N-карбобензилокси-1,3-діамінопропану гідрохлорид (312 мг) розчиняли в етанолі (5 мл), до розчину додавали діізопропілетиламін (225 мкл), і перемішували отриману суміш при 90 °C протягом 18 годин. До реакційної суміші додавали насичений водний хлорид амонію, і екстрагували водний шар хлороформом. Органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували, а

потім концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску. Отриманий залишок очищали методом препаративної тонкошарової хроматографії (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 30/1/0,1) з одержанням карбаматної сполуки (200 мг).

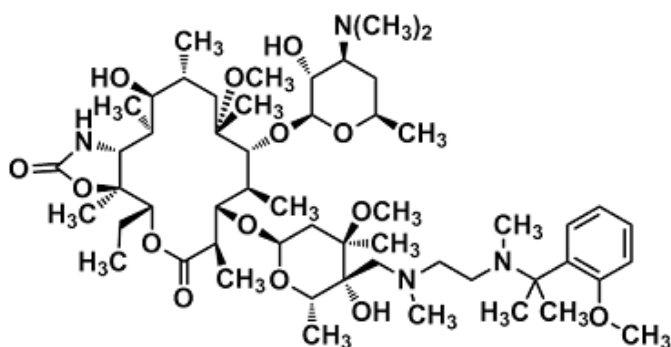
- (2) Сполуку (40 мг), представлену в таблиці 6, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 166, стадія (2), і в прикладі 73, стадія (1), шляхом використання сполуки (50 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 331

Нижче представлений спосіб одержання сполуки, представленої формулою (J).

Формула (J)

Формула 39



Приклад 331

- Сполуку (20 мг), отриману в прикладі 311, розчиняли в метанолі (0,5 мл), до розчину при охолодженні на льоді додавали боргідрид натрію (1,1 мг), і перемішували отриману суміш протягом 0,5 години. До реакційної суміші додавали боргідрид натрію (4 мг), і перемішували отриману суміш протягом 0,5 години. До реакційної суміші додавали тетрагідрофуран (0,5 мл) і боргідрид натрію (4 мг), і перемішували отриману суміш протягом 0,5 години. До реакційної суміші додавали насичений водний гідрокарбонат натрію й етилацетат, і розділяли шари. Органічний шар промивали насиченим водним гідрокарбонатом натрію й насиченим водним хлоридом натрію, потім сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методами колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 30/1/0,1→10/1/0,1) і препаративної тонкошарової хроматографії (хлороформ/метанол/28% водний аміак = 10/1/0,1) з одержанням згаданої вище цільової сполуки (5 мг).

МС (ESI) $m/z = 1023,8 [M+H]^+$

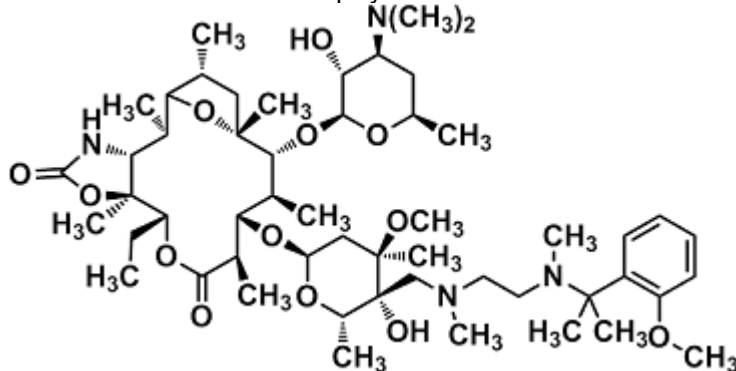
- ^1H -ЯМР (600 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 0,86 (т, $J=7,34$ Гц, 3H), 0,96 (д, $J=6,88$ Гц, 3H), 1,04 (д, $J=6,42$ Гц, 3H), 1,09-1,15 (м, 6H), 1,17-1,34 (м, 13H), 1,39-1,58 (м, 14H), 1,61-1,67 (м, 1H), 1,78-2,08 (м, 7H), 2,18 (с, 3H), 2,26 (с, 3H), 2,28 (с, 6H), 2,39-2,66 (м, 4H), 2,82 (д, $J=16,05$ Гц, 1H), 2,91-2,97 (м, 1H), 3,14-3,20 (м, 1H), 3,28 (с, 3H), 3,40-3,45 (м, 1H), 3,57-3,61 (м, 1H), 3,71-3,75 (м, 1H), 3,76-3,82 (м, 4H), 4,10-4,18 (м, 1H), 4,39 (д, $J=6,88$ Гц, 1H), 5,01-5,05 (м, 2H), 5,06-5,11 (м, 1H), 6,85-6,90 (м, 2H), 7,15-7,19 (м, 1H), 7,60-7,64 (м, 1H)

Приклад 332

Нижче представлений спосіб одержання сполуки, представленої формулою (K).

Формула (K)

Формула 40



Приклад 332

(1) Еритроміцин А (150 г) розчиняли в толуолі (530 мл), до розчину додавали карбонат калію (75 г) і етиленкарбонат (75 г), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 5 діб. До реакційної суміші додавали етилацетат, отриману суміш фільтрували через целіт, а потім послідовно промивали фільтрат двічі дистильованою водою й двічі насиченим водним хлоридом натрію. Органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували, потім фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і додавали до отриманого залишку діетиловий ефір. Кристалічні речовини, які випали в осад, збирали шляхом фільтрування з одержанням карбонатної сполуки (79,9 г).

(2) Сполуку (45 г), отриману на описаній вище стадії (1), розчиняли в диметилформаміді (225 мл), до розчину додавали 1,1,3,3-тетраметилгуанідин (15 мл), і перемішували отриману суміш при 100 °С протягом 3 годин. До реакційної суміші додавали етилацетат і дистильовану воду, і розділяли шари. Органічний шар послідовно промивали дистильованою водою й насиченим водним хлоридом натрію, а потім сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (етилацетат/метанол/28 % водний аміак = 30/1/0,1→10/1/0,1) з одержанням енової сполуки (37,5 г).

(3) Сполуку (37 г), отриману на описаній вище стадії (2), розчиняли в диметилформаміді (250 мл), до розчину додавали хлорид амонію (1,4 г) і гексаметилдисилазан (22 мл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 4 годин. До реакційної суміші додавали етилацетат і дистильовану воду, розділяли шари, а потім промивали органічний шар двічі дистильованою водою й насиченим водним хлоридом натрію. Органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували, а потім концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску з одержанням захищеної сполуки (43,6 г).

(4) Сполуку (43,6 г), отриману на описаній вище стадії (3), розчиняли в суміші тетрагідрофурану й диметилформаміду (5/3, 222 мл), до розчину при охолодженні на льоді додавали 1,1'-карбонілдіімідазол (12,4 г) і 5 % гідрид натрію (2,7 г), і перемішували отриману суміш протягом 1 години при охолодженні на льоді. До реакційної суміші при охолодженні на льоді додавали етилацетат і дистильовану воду, розділяли шари, а потім промивали органічний шар двічі дистильованою водою й насиченим водним хлоридом натрію. Органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували, а потім концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску з одержанням імідазолілкарбонільної сполуки (52,0 г).

(5) Сполуку (15,0 г), отриману на описаній вище стадії (4), розчиняли в суміші тетрагідрофурану й ацетонітрилу (3/2, 125 мл), до розчину додавали 28 % водний аміак (60 мл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 69 годин. До реакційної суміші додавали етилацетат і дистильовану воду, і розділяли шари. Потім органічний шар промивали насиченим водним хлоридом натрію, а потім сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (гексан/ацетон = 5/1→3/1) з одержанням карбаматної сполуки (5,64 г).

(6) Сполуку (1,35 г), отриману на описаній вище стадії (5), розчиняли в етанолі (12 мл), до розчину при охолодженні на льоді додавали боргідрид натрію (565 мг), і перемішували отриману суміш протягом ночі при кімнатній температурі. До реакційної суміші додавали етилацетат і дистильовану воду, розділяли шари, органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, отриманий залишок розчиняли в тетрагідрофурані (13 мл), до розчину додавали 1М розчин тетрабутиламонію фториду в тетрагідрофурані (2,98 мл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 3,5 годин. До реакційної суміші додавали етилацетат і воду, розділяли шари, органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 97/3/0,3) з одержанням спиртової сполуки (582 мг).

(7) Ацетильну сполуку (515 мг) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 1, стадія (1), шляхом використання сполуки (510 мг), отриманої на описаній вище стадії (6), як вихідної речовини.

(8) Сполуку (100 мг), отриману на описаній вище стадії (7), розчиняли в хлороформі (1,0 мл), до розчину при охолодженні на льоді додавали піридин (670 мкл) і розчин трифосгену (222 мг) у хлороформі (1,0 мл), і перемішували отриману суміш протягом 5 годин при нагріванні до кімнатної температури. До реакційної суміші додавали етилацетат і насичений водний гідрокарбонат натрію, розділяли шари, і органічний шар промивали насиченим водним гідрокарбонатом натрію, а потім сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували.

Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом препаративної тонкошарової хроматографії (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 97/3/0,3), а потім додатково очищали методом препаративної тонкошарової хроматографії (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 90/7/0,7) з одержанням ефірної сполуки (48,1 мг).

5 (9) Сполуку зі знятим захистом (52,0 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 1, стадія (3), у прикладі 1, стадія (4), і в прикладі 4, стадія (6), шляхом використання сполуки (69,6 мг), отриманої на описаній вище стадії (8), як вихідної речовини.

10 (10) Згадану вище цільову сполуку (34,3 мг) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (30,0 мг), отриманої на описаній вище стадії (9), і сполуки (12,9 мг), отриманої в довідковому прикладі 104, як вихідних речовин.

МС (FAB) $m/z = 991,6 [M+H]^+$

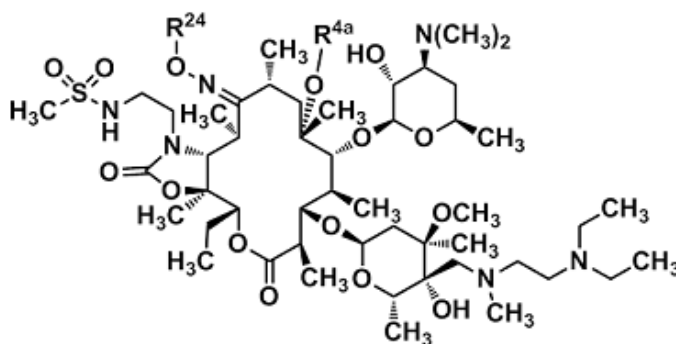
15 ^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 0,92 (т, $J=7,4$ Гц, 3H), 1,01-1,10 (м, 9H), 1,13 (с, 3H), 1,15-1,30 (м, 9H), 1,36-1,49 (м, 12H), 1,49-1,88 (м, 9H), 1,91-2,11 (м, 4H), 2,18 (с, 3H), 2,20-2,37 (м, 10H), 2,36-2,59 (м, 4H), 2,58-2,74 (м, 3H), 2,80 (д, $J=14,4$ Гц, 1H), 3,19 (дд, $J=10,1, 7,4$ Гц, 1H), 3,30 (с, 3H), 3,40-3,51 (м, 1H), 3,61 (д, $J=10,3$ Гц, 1H), 3,81 (с, 3H), 3,91 (д, $J=9,8$ Гц, 1H), 4,05-4,16 (м, 2H), 4,33 (д, $J=7,3$ Гц, 1H), 4,91 (дд, $J=9,9, 3,1$ Гц, 1H), 5,21 (с, 1H), 5,35 (д, $J=4,9$ Гц, 1H), 6,84-6,94 (м, 2H), 7,14-7,23 (м, 1H), 7,56-7,64 (м, 1H)

Приклади 333-336

20 Нижче представлені способи одержання сполук, які представлені формулою (L), і характеризуються визначеними в таблиці 7 значеннями R^{24} і R^{4a} .

Формула (L)



Формула 41



25

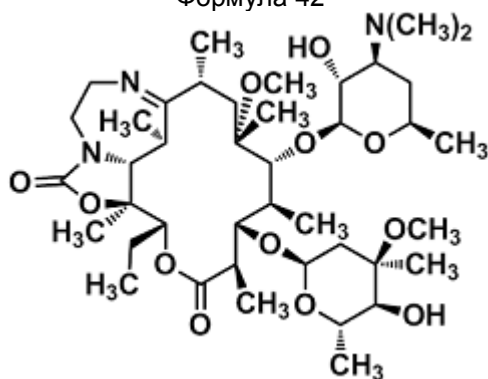
Таблица 7

При- клад	R^{24}	R^{4a}	ESI MS (M+H)	^1H -ЯМР, CDCl_3 , δ (м. ч.)
333			1065,7	(500 МГц): 0,85 (т, $J=7,26$ Гц, 3H) 0,95 (д, $J=7,26$ Гц, 3H) 1,00-1,06 (м, 6H) 1,06 (д, $J=6,88$ Гц, 3H) 1,08 (д, $J=7,26$ Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,18-1,21 (м, 6H) 1,24 (д, $J=6,12$ Гц, 3H) 1,24-1,27 (м, 1H) 1,34-1,42 (м, 1H) 1,40 (с, 3H) 1,45 (с, 3H) 1,53-1,61 (м, 2H) 1,63-1,67 (м, 1H) 1,85-1,98 (м, 2H) 1,98-2,05 (м, 2H) 2,09 (д, $J=14,91$ Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,40-2,63 (м, 8H) 2,41-2,46 (м, 1H) 2,61-2,66 (м, 1H) 2,84 (д, $J=14,91$ Гц, 1H) 2,90-2,96 (м, 1H) 2,99 (с, 3H) 3,09 (с, 3H) 3,17-3,22 (м, 1H) 3,27 (с, 3H) 3,35-3,53 (м, 3H) 3,63-3,72 (м, 3H) 3,69 (с, 1H) 3,78 (с, 3H) 3,88-4,01 (м, 2H) 4,08-4,14 (м, 1H) 4,40 (д, $J=7,26$ Гц, 1H) 4,94-5,00 (м, 2H) 5,74-5,80 (м, 1H)

334	H		1051,7	(600 МГц): 0,84 (т, J=7,57 Гц, 3H) 0,98 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,00-1,04 (м, 6H) 1,07 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,10 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,18-1,21 (м, 6H) 1,22-1,27 (м, 1H) 1,24 (д, J=5,96 Гц, 3H) 1,39 (с, 3H) 1,40-1,44 (м, 1H) 1,49 (с, 3H) 1,51-1,58 (м, 1H) 1,59-1,62 (м, 1H) 1,63-1,67 (м, 1H) 1,85-1,93 (м, 2H) 1,95-2,05 (м, 2H) 2,10 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,39-2,62 (м, 10H) 2,82-2,86 (м, 1H) 2,86-2,93 (м, 1H) 2,98 (с, 3H) 3,12 (с, 3H) 3,17-3,22 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,37-3,42 (м, 1H) 3,44-3,49 (м, 1H) 3,54-3,61 (м, 2H) 3,61-3,73 (м, 3H) 3,70 (с, 1H) 3,77-3,83 (м, 2H) 4,11 (кв, J=6,42 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,85-4,89 (м, 1H) 4,98 (д, J=4,58 Гц, 1H) 5,84-5,88 (м, 1H) 7,85 (с, 1H)
335	H	H	1037,7	(600 МГц): 0,83 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,00-1,10 (м, 15H) 1,15 (с, 3H) 1,17-1,27 (м, 10H) 1,41 (с, 3H) 1,44-1,68 (м, 4H) 1,53 (с, 3H) 1,88-2,14 (м, 5H) 2,30 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,39-2,67 (м, 9H) 2,69-2,92 (м, 3H) 2,98 (с, 3H) 3,22-4,16 (м, 11H) 3,27 (с, 3H) 4,35-4,38 (м, 1H) 4,84-4,89 (м, 1H) 4,91-4,93 (м, 1H)
336		H	1051,7	(600 МГц): 0,85 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,98-1,04 (м, 9H) 1,07-1,11 (м, 6H) 1,15 (с, 3H) 1,17-1,20 (м, 6H) 1,23 (д, J=5,96 Гц, 3H) 1,24-1,28 (м, 1H) 1,43 (с, 3H) 1,47 (с, 3H) 1,51-1,62 (м, 3H) 1,62-1,67 (м, 1H) 1,89-1,97 (м, 3H) 1,99-2,04 (м, 1H) 2,09 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,40-2,62 (м, 9H) 2,65-2,71 (м, 1H) 2,83 (д, J=14,67 Гц, 2H) 3,01 (с, 3H) 3,20-3,25 (м, 1H) 3,27 (с, 3H) 3,28-3,35 (м, 2H) 3,38 (ушир. с, 1H) 3,44-3,49 (м, 1H) 3,51 (д, J=7,34 Гц, 1H) 3,76-3,81 (м, 1H) 3,83 (с, 3H) 3,86-3,92 (м, 1H) 3,98 (ушир. с, 1H) 4,04 (д, J=8,25 Гц, 1H) 4,08-4,16 (м, 2H) 4,40 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,90-4,95 (м, 2H) 5,51 (т, J=5,96 Гц, 1H)

Формула (SM2)

Формула 42



5

Приклад 333

(1) Ацетильну сполуку (9,74 г) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 1, стадія (1), шляхом використання представленої формулою (SM2) сполуки (13,9 г), отриманої

описаним у літературі способом (The Journal of Antibiotics, 2001, vol. 54, No. 8, p. 664), як вихідної речовини.

(2) Епоксисполуку (1,58 г) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 1, стадія (3), у прикладі 4, стадія (6), і в прикладі 1, стадія (4), шляхом використання сполуки (2,0 г), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

(3) Сполуку-аддукт (329 мг) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання сполуки (300 мг), отриманої на описаній вище стадії (2), як вихідної речовини.

(4) Сполуку (30 мг), отриману на описаній вище стадії (3), розчиняли в етанолі (2 мл), до розчину додавали імідазол (13,0 мг) і О-метилгідроксиламіну гідрохлорид (13,3 мг), і перемішували отриману суміш при нагріванні зі зворотним холодильником протягом 10 годин. До реакційної суміші додавали хлороформ і насичений водний хлорид амонію, розділяли шари, і екстрагували водний шар хлороформом. Органічний шар фільтрували з використанням фазового сепаратора для додаткового розділення шарів, отриманий органічний шар концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом препаративної тонкошарової хроматографії (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 10/1/0,1) з одержанням оксимної сполуки (12,1 мг).

(5) Сполуку (5,4 мг), представлену в таблиці 7, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 162, шляхом використання сполуки (12 мг), отриманої на описаній вище стадії (4), як вихідної речовини.

Приклад 334

(1) Сполуку (158 мг), отриману в прикладі 333, стадія (3), розчиняли в етанолі (4 мл), до розчину додавали імідазол (68,6 мг) і гідроксиламіну гідрохлорид (58,4 мг), і перемішували отриману суміш при нагріванні зі зворотним холодильником протягом 1 години. До реакційної суміші додавали хлороформ і насичений водний гідрокарбонат натрію, розділяли шари, і екстрагували водний шар хлороформом. Органічний шар фільтрували з використанням фазового сепаратора для додаткового розділення шарів, отриманий органічний шар концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 100/1/0,1→10/1/0,1) з одержанням оксимної сполуки (172 мг).

(2) Сполуку (49,8 мг), представлену в таблиці 7, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 162, шляхом використання сполуки (120 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 335

(1) 6-О-аліперитроміцин А (7,62 г), отриманий способом, описаним у міжнародній патентній публікації WO 97/42204, розчиняли в суміші хлороформу й піридину (5/1, 120 мл), до розчину додавали 4-диметиламінопіридин (1,20 г), до суміші при охолодженні на льоді по краплях додавали розчин оцтового ангідриду (2,33 мл) у хлороформі (10 мл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 17 годин. До реакційної суміші додавали оцтовий ангідрид (466 мкл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 1 години. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску, до отриманого залишку додавали етилацетат і дистильовану воду, і розділяли шари. Органічний шар промивали насиченим водним хлоридом амонію й насиченим водним хлоридом натрію, сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 100/1/0,1→20/1/0,1) з одержанням силільної сполуки (4,74 г).

(2) Імідазолілкарбонільну сполуку (5,5 г) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 1, стадія (5), шляхом використання сполуки (4,74 г), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

(3) Сполуку (5,5 г), отриману на описаній вище стадії (2), розчиняли в суміші тетрагідрофурану й диметилформаміду (3/1, 80 мл), до розчину додавали етилендіамін (3,7 мл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 18 годин. До реакційної суміші додавали дистильовану воду (12 мл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 20 годин. До реакційної суміші додавали етилацетат і дистильовану воду, розділяли шари, органічний шар промивали водним гідрокарбонатом натрію й насиченим водним хлоридом натрію, сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Отриманий фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску з одержанням карбаматної сполуки (5,26 г).

(4) Сполуку (5,26 г), отриману на описаній вище стадії (3), розчиняли в толуолі (55 мл), до розчину додавали оцтову кислоту (813 мкл), і перемішували отриману суміш при 120 °C

протягом 2 годин. Реакційну суміш залишали охолоджуватися до кімнатної температури, потім до реакційної суміші послідовно додавали насичений водний гідрокарбонат натрію й дистильовану воду, і розділяли шари. Органічний шар промивали насиченим водним гідрокарбонатом натрію, сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 100/1/0,1→10/1/0,1) з одержанням імінової сполуки (3,87 г).

(5) Епоксисполуку (247 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 2, стадія (2), у прикладі 1, стадії (1), (3) і (4), і в прикладі 4, стадія (6), шляхом використання сполуки (598 мг), отриманої на описаній вище стадії (4), як вихідної речовини.

(6) Сполуку-аддукт (163 мг) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання сполуки (153 мг), отриманої на описаній вище стадії (5), як вихідної речовини.

(7) Оксимну сполуку (43,2 мг) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 334, стадія (1), шляхом використання сполуки (40 мг), отриманої на описаній вище стадії (6), як вихідної речовини.

(8) Сполуку (41,2 мг), отриману на описаній вище стадії (7), розчиняли в тетрагідрофурані (1 мл), до розчину при охолодженні на льоді додавали триетиламін (6,3 мкл) і метансульфонілхлорид (3,5 мкл), і перемішували отриману суміш при тій же температурі протягом 45 хвилин. До реакційної суміші додавали хлороформ і насичений водний гідрокарбонат натрію, розділяли шари, і екстрагували водний шар хлороформом. Органічний шар фільтрували з використанням фазового сепаратора для додаткового розділення шарів, отриманий органічний шар концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом препаративної тонкошарової хроматографії (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 10/1/0,1) з одержанням метансульфонільної сполуки (22,1 мг).

(9) Сполуку (21,6 мг), отриману на описаній вище стадії (8), розчиняли в суміші діоксану й дистильованої води (6/1, 0,7 мл), до розчину в атмосфері азоту додавали мурашину кислоту (5,7 мкл), триетиламін (8,4 мкл), трифенілфосфін (16,8 мг) і ацетат паладію(II) (3,6 мг), і перемішували отриману суміш при нагріванні зі зворотним холодильником протягом 16 годин. Реакційну суміш залишали охолоджуватися до кімнатної температури, а потім до суміші додавали етилацетат і насичений водний гідрокарбонат натрію. Шари розділяли, органічний шар промивали насиченим водним хлоридом натрію, сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і послідовно очищали отриманий залишок методами колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28% водний аміак = 100/1/0,1→5/1/0,1) і препаративної тонкошарової хроматографії (хлороформ/метанол/28% водний аміак = 10/1/0,1) з одержанням сполуки (1,3 мг), представленої в таблиці 7.

Приклад 336

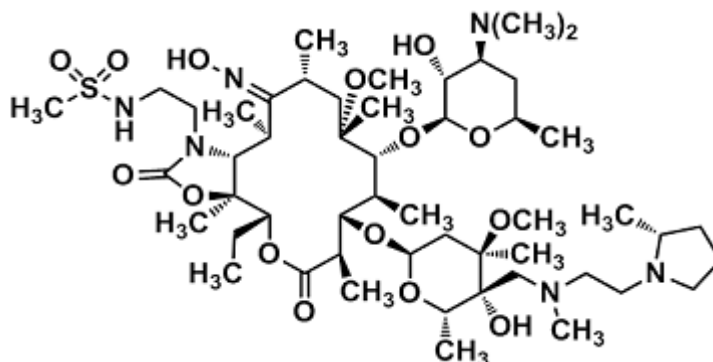
Сполуку (27,7 мг), представлену в таблиці 7, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 333, стадія (4), у прикладі 335, стадії (8) і (9), шляхом використання сполуки (120 мг), отриманої в прикладі 335, стадія (6), як вихідної речовини.

Приклад 337

Нижче представлений спосіб одержання сполуки, представленої формулою (M).

Формула (M)

Формула 43



Приклад 337

(1) Згадану вище цільову сполуку (89,7 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 4, стадія (8), у прикладі 334, стадія (1), і в прикладі 162, шляхом використання сполуки

(120 мг), отриманої в прикладі 333, стадія (2), і сполуки (105 мг), отриманої в довідковому прикладі 1, як вихідних речовин.

МС (ESI) $m/z = 1063,7 [M+H]^+$

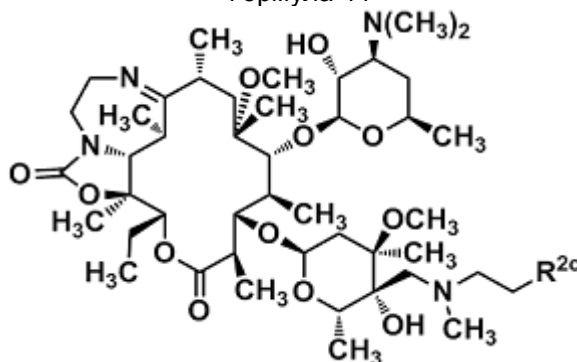
^1H -ЯМР (600 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 0,84 (т, $J=7,34$ Гц, 3H), 0,98 (д, $J=6,88$ Гц, 3H), 1,06-1,11 (м, 9H), 1,15 (с, 3H), 1,18-1,22 (м, 6H), 1,23-1,25 (м, 1H), 1,24 (д, $J=5,96$ Гц, 3H), 1,39 (с, 3H), 1,40-1,44 (м, 2H), 1,49 (с, 3H), 1,52-1,70 (м, 4H), 1,73-1,80 (м, 1H), 1,85-1,94 (м, 3H), 1,95-2,05 (м, 2H), 2,08-2,19 (м, 3H), 2,29 (с, 6H), 2,31-2,35 (м, 1H), 2,37 (с, 3H), 2,40-2,46 (м, 1H), 2,57-2,67 (м, 3H), 2,84-2,94 (м, 3H), 2,98 (с, 3H), 3,12 (с, 3H), 3,13-3,17 (м, 1H), 3,20 (дд, $J=10,32, 7,11$ Гц, 1H), 3,28 (с, 3H), 3,36-3,42 (м, 1H), 3,42-3,49 (м, 1H), 3,54-3,61 (м, 2H), 3,62-3,66 (м, 1H), 3,67-3,73 (м, 3H), 3,77-3,85 (м, 2H), 4,08-4,15 (м, 1H), 4,41 (д, $J=7,34$ Гц, 1H), 4,88 (дд $J=11,00, 1,83$ Гц, 1H), 4,99 (д, $J=4,58$ Гц, 1H), 5,87 (ушир. с, 1H), 7,88 (ушир. с, 1H)

Приклади 338 і 339

Нижче представлені способи одержання сполук, які представлені формулою (N), і характеризуються значеннями R^{2c} , визначеними в таблиці 8.

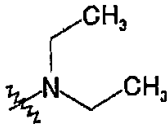
Формула (N)

Формула 44



Таблиця 8

Приклад	R^{2c}	ESI MS ($M+H$)	^1H -ЯМР, CDCl_3 , δ (м. ч.)
338		1046,7	(600 МГц): 0,84 (т, $J=7,34$ Гц, 3H) 1,04 (д, $J=6,88$ Гц, 3H) 1,07 (д, $J=7,79$ Гц, 3H) 1,13 (с, 3H) 1,17-1,26 (м, 13H) 1,39-1,45 (м, 12H) 1,49-1,66 (м, 4H) 1,85-1,91 (м, 2H) 1,95-2,00 (м, 1H) 2,01-2,07 (м, 2H) 2,18 (с, 3H) 2,26 (с, 3H) 2,29 (с, 6H) 2,40-2,47 (м, 3H) 2,51-2,58 (м, 1H) 2,58-2,64 (м, 1H) 2,66-2,72 (м, 1H) 2,73-2,78 (м, 1H) 2,79-2,89 (м, 2H) 2,99-3,05 (м, 1H) 3,10 (с, 3H) 3,16-3,21 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,34-3,40 (м, 1H) 3,41-3,47 (м, 1H) 3,64-3,68 (м, 2H) 3,73-3,83 (м, 3H) 3,80 (с, 3H) 3,96-4,00 (м, 1H) 4,11 (кв, $J=6,42$ Гц, 1H) 4,41 (д, $J=7,34$ Гц, 1H) 4,98-4,99 (м, 1H) 5,00-5,01 (м, 1H) 6,85-6,90 (м, 2H) 7,15-7,19 (м, 1H) 7,61 (д, $J=7,34$ Гц, 1H)

339		940,7	(600 МГц): 0,84 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,00-1,05 (м, 9H) 1,08 (с, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,18-1,22 (м, 9H) 1,21-1,27 (м, 1H) 1,24 (д, J=6,42 Гц, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,41 (с, 3H) 1,48-1,55 (м, 1H) 1,56-1,67 (м, 3H) 1,84-1,91 (м, 2H) 1,94-2,05 (м, 2H) 2,10 (д, J=15,13 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,40-2,62 (м, 9H) 2,65-2,72 (м, 1H) 2,73-2,77 (м, 1H) 2,81-2,88 (м, 2H) 2,99-3,04 (м, 1H) 3,09 (с, 3H) 3,19 (дд, J=10,55, 7,34 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,37 (ушир. с, 1H) 3,44-3,50 (м, 1H) 3,65-3,69 (м, 2H) 3,73-3,84 (м, 3H) 3,95-4,01 (м, 1H) 4,09-4,13 (м, 1H) 4,42 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,96-5,01 (м, 2H)
-----	---	-------	--

Приклад 338

5 Сполуку (61,9 мг), представлену в таблиці 8, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (60 мг), отриманої в прикладі 333, стадія (2), і сполуки (53 мг), отриманої в довідковому прикладі 104, як вихідних речовин.

Приклад 339

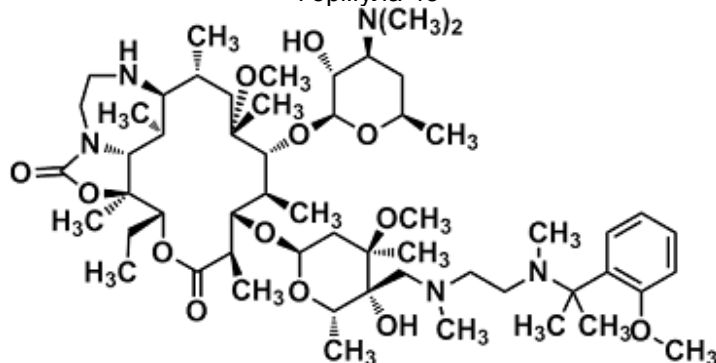
10 Сполуку (52,0 мг), представлену в таблиці 8, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 11, шляхом використання сполуки (50 мг), отриманої в прикладі 333, стадія (2), як вихідної речовини.

Приклад 340

Нижче представлений спосіб одержання сполуки, представленої формулою (O).

Формула (O)

Формула 45



15

Приклад 340

(1) Сполуку (80 мг), отриману в прикладі 333, стадія (2), розчиняли в етанолі (1,5 мл), до розчину додавали оцтову кислоту (50 мкл), до суміші при охолодженні на льоді додавали ціаноборгидрид натрію (31 мг), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 2 діб. До реакційної суміші додавали насичений водний гідрокарбонат натрію й етилацетат, і розділяли шари. Органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом препаративної тонкошарової хроматографії (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 10/1/0,1) з одержанням відновленої сполуки (50,9 мг).

25 (2) Згадану вище цільову сполуку (43,9 мг) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (47,2 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), і сполуки (41,2 мг), отриманої в довідковому прикладі 104, як вихідних речовин.

МС (ESI) m/z = 1048,8 [M+H]⁺

30 ¹H-ЯМР (600 МГц, CDCl₃) δ (м. ч.): 0,84 (т, J=7,57 Гц, 3H), 0,95 (д, J=7,34 Гц, 3H), 1,06-1,11 (м, 6H), 1,13 (с, 3H), 1,20 (д, J=6,42 Гц, 3H), 1,22 (д, J=7,34 Гц, 3H), 1,23-1,26 (м, 1H), 1,24 (д, J=6,42 Гц, 3H), 1,36 (ушир. с, 3H), 1,38-1,40 (м, 3H), 1,40-1,45 (м, 8H), 1,50-1,57 (м, 1H), 1,64 (д, J=11,92 Гц, 1H), 1,86-2,08 (м, 6H), 2,10-2,16 (м, 1H), 2,18 (с, 3H), 2,26 (с, 3H), 2,29 (с, 6H), 2,40-2,50 (м, 3H), 2,51-2,59 (м, 1H), 2,59-2,67 (м, 1H), 2,78 (д, J=12,84 Гц, 1H), 2,83 (д, J=14,67 Гц, 1H), 2,85-2,95 (м, 2H), 3,15-3,21 (м, 2H), 3,28 (с, 3H), 3,29-3,31 (м, 3H), 3,36-3,40 (м, 1H), 3,40-3,46 (м, 1H), 3,67 (с, 1H), 3,75 (д, J=7,79 Гц, 1H), 3,80 (с, 3H), 3,84 (д, J=9,63 Гц, 1H), 3,97-4,01 (м, 1H),

35

4,11-4,17 (м, 1H), 4,41 (д, J=6,88 Гц, 1H), 4,96 (д, J=9,63 Гц, 1H), 5,02 (д, J=5,04 Гц, 1H), 6,85-6,90 (м, 2H), 7,14-7,19 (м, 1H), 7,62 (д, J=6,88 Гц, 1H)

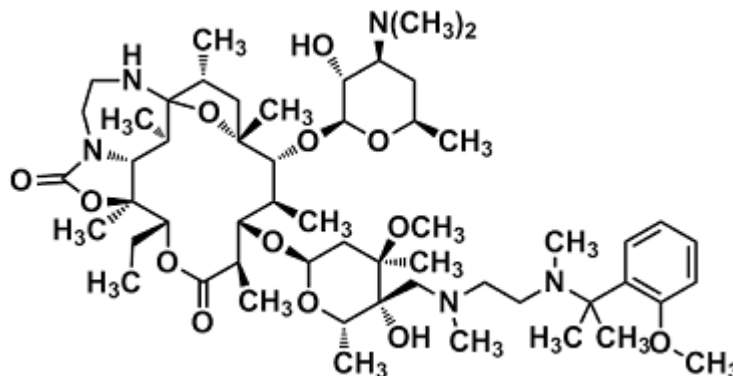
Приклад 341

Нижче представлений спосіб одержання сполуки, представленої формулою (P).

5

Формула (P)

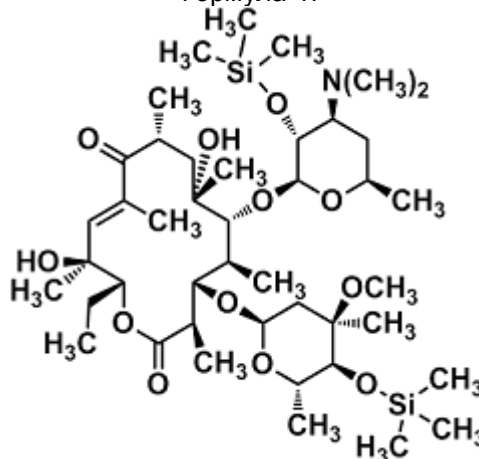
Формула 46



Формула (SM3)

Формула 47

10



Приклад 341

(1) Імідазолілкарбонільну сполуку (29,1 г) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 1, стадія (5), шляхом використання представленої формулою (SM3) сполуки (22,6 г), отриманої описаним у літературі способом (The Journal of Antibiotics, 2003, vol. 56, p. 1062), як вихідної речовини.

15

(2) Сполуку (2,09 г), отриману на описаній вище стадії (1), і етилендіамін (1,5 мл) розчиняли в суміші тетрагідрофурану й диметилформаміду (3/1, 20 мл), і перемішували розчин при кімнатній температурі протягом 16 годин. До реакційної суміші додавали дистильовану воду, і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 9 годин. До реакційної суміші додавали етилацетат, розділяли шари, отриманий органічний шар промивали насиченим водним хлоридом натрію, сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, отриманий залишок і етилендіамін (1,5 мл) розчиняли в суміші тетрагідрофурану й диметилформаміду (3/1, 20 мл), до розчину додавали трет-бутоксид калію (0,25 г), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 0,5 годин. До реакційної суміші додавали насичений водний хлорид амонію, для коректування значення рН суміші до 9 до суміші додавали насичений водний гідрокарбонат натрію, і екстрагували отриману суміш хлороформом. Органічний шар промивали насиченим водним хлоридом натрію, сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, отриманий залишок розчиняли в тетрагідрофурані (40 мл), до розчину додавали 1M розчин тетрабутиламонію фториду в тетрагідрофурані (4 мл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 2 годин. До реакційної суміші додавали дистильовану воду, і екстрагували отриману суміш етилацетатом. До водного шару додавали насичений водний гідрокарбонат натрію, і екстрагували отриману суміш хлороформом. Органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували.

20

25

30

35

Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску. Отриманий залишок розчиняли в етанолі (20 мл), до розчину додавали оцтову кислоту (0,44 мл), і перемішували отриману суміш при 60 °С протягом 16 годин. До реакційної суміші додавали насичений водний гідрокарбонат натрію, і екстрагували отриману суміш етилацетатом. Органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (гексан/ацетон/триетиламін = 20/10/0,2→5/10/0,2) з одержанням карбаматної сполуки (262 мг).

(3) Епоксисполуку (50 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 1, стадії (1), (3) і (4), шляхом використання сполуки (73 мг), отриманої на описаній вище стадії (2), як вихідної речовини.

(4) Згадану вище цільову сполуку (40 мг) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (50 мг), отриманої на описаній вище стадії (3), і сполуки (38 мг), отриманої в довідковому прикладі 104, як вихідних речовин.

МС (ESI) $m/z = 1032,8 [M+H]^+$

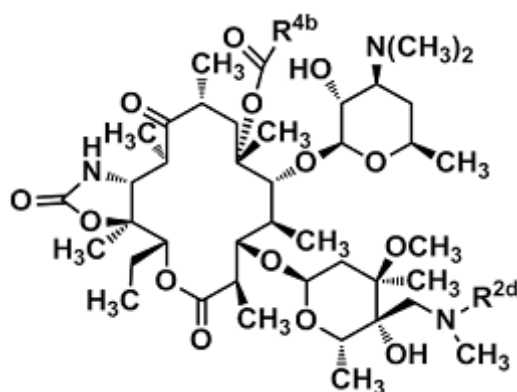
^1H -ЯМР (500 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 0,85-0,92 (м, 6H), 0,97 (д, $J=6,86$ Гц, 3H), 1,07-1,15 (м, 9H), 1,15-1,28 (м, 7H), 1,32 (с, 3H), 1,38-1,60 (м, 10H), 1,65-1,72 (м, 1H), 1,76-1,96 (м, 5H), 2,02-2,10 (м, 2H), 2,13-2,20 (м, 4H), 2,22-2,33 (м, 9H), 2,38-2,73 (м, 6H), 2,75-2,85 (м, 3H), 3,17-3,34 (м, 7H), 3,37-3,49 (м, 3H), 3,80 (ушир. с, 3H), 4,09-4,16 (м, 2H), 4,24 (д, $J=7,13$ Гц, 1H), 4,32 (с, 1H), 4,94 (дд, $J=10,70$, 1,92 Гц, 1H), 5,00 (д, $J=4,39$ Гц, 1H), 6,84-6,92 (м, 2H), 7,15-7,21 (м, 1H), 7,58-7,65 (м, 1H)

Приклади 342-349

Нижче представлені способи одержання сполук, які представлені формулою (Q), і характеризуються значеннями R^{4b} і R^{2d} , визначеними в таблиці 9.

Формула (Q)

Формула 48



Таблиця 9-1

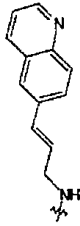

При- клад	R^{4b}	R^{2d}	ESI MS ($M+H$)	^1H -ЯМР, CDCl_3 , δ (м. ч.)
342			1050,7	(600 МГц): 0,85 (т, $J=7,34$ Гц, 3H) 1,13 (с, 3H) 1,15-1,19 (м, 9H) 1,20-1,24 (м, 9H) 1,23-1,26 (м, 1H) 1,38-1,41 (м, 3H) 1,43 (ушир.с, 6H) 1,53-1,61 (м, 1H) 1,61-1,66 (м, 1H) 1,71-1,79 (м, 2H) 1,74 (с, 3H) 1,87-1,95 (м, 2H) 1,96-2,01 (м, 1H) 2,02-2,09 (м, 2H) 2,18 (с, 3H) 2,25 (с, 3H) 2,29 (с, 6H) 2,39-2,49 (м, 3H) 2,52-2,62 (м, 2H) 2,72-2,82 (м, 2H) 2,93-2,99 (м, 1H) 3,05-3,10 (м, 1H) 3,15-3,21 (м, 1H) 3,26 (с, 3H) 3,42-3,54 (м, 2H) 3,57 (с, 1H) 3,79 (с, 3H) 3,85-3,91 (м, 1H) 3,96-4,03 (м, 1H) 4,26 (д, $J=5,50$ Гц, 1H) 4,46-4,51 (м, 1H) 4,56 (д, $J=7,34$ Гц, 1H) 5,00-5,05 (м, 1H) 5,13 (дд, $J=11,00$, 1,83 Гц, 1H) 5,83 (с, 1H) 6,84-6,91 (м, 2H) 7,15-7,20 (м, 1H) 7,59 (д, $J=7,79$ Гц, 1H)

343			916,6	(600 МГц): 0,85 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,14-1,19 (м, 12H) 1,21 (д, J=5,96 Гц, 3H) 1,22-1,24 (м, 3H) 1,22-1,26 (м, 1H) 1,27 (д, J=6,42 Гц, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,49-1,56 (м, 1H) 1,62-1,68 (м, 1H) 1,72 (с, 3H) 1,73-1,79 (м, 2H) 1,85-1,92 (м, 2H) 1,94-2,00 (м, 1H) 2,02-2,10 (м, 1H) 2,19-2,23 (м, 1H) 2,23-2,24 (м, 6H) 2,29 (с, 6H) 2,33 (с, 3H) 2,34-2,41 (м, 2H) 2,43-2,50 (м, 1H) 2,53-2,61 (м, 2H) 2,71-2,76 (м, 1H) 2,79 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,91-2,98 (м, 1H) 3,04-3,10 (м, 1H) 3,16-3,21 (м, 1H) 3,26 (с, 3H) 3,40-3,46 (м, 1H) 3,52-3,57 (м, 1H) 3,58 (с, 1H) 3,85 (д, J=10,55 Гц, 1H) 4,00-4,07 (м, 1H) 4,35 (д, J=5,04 Гц, 1H) 4,46 (ушир. с, 1H) 4,58 (д, J=7,34 Гц, 1H) 5,02 (дд, J=5,04, 2,75 Гц, 1H) 5,14 (дд, J=11,23, 2,06 Гц, 1H) 5,83 (с, 1H)
344			1078,9	(600 МГц): 0,84 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,13 (с, 3H) 1,15-1,18 (м, 6H) 1,19-1,24 (м, 10H) 1,31 (д, J=6,42 Гц, 3H) 1,40-1,45 (м, 9H) 1,55-1,63 (м, 2H) 1,66 (с, 3H) 1,72-1,77 (м, 1H) 1,78-1,82 (м, 1H) 1,87-1,92 (м, 2H) 1,94-1,99 (м, 1H) 2,06-2,11 (м, 1H) 2,14-2,17 (м, 1H) 2,17-2,20 (м, 3H) 2,25 (с, 3H) 2,29 (с, 6H) 2,40-2,51 (м, 3H) 2,54-2,64 (м, 5H) 2,66-2,73 (м, 1H) 2,78-2,83 (м, 1H) 2,83-2,89 (м, 3H) 2,91-2,98 (м, 1H) 3,16-3,21 (м, 2H) 3,26 (с, 3H) 3,38-3,43 (м, 1H) 3,50-3,56 (м, 1H) 3,53 (с, 1H) 3,69-3,74 (м, 1H) 3,79 (с, 3H) 4,03 (кв, J=6,42 Гц, 1H) 4,59-4,62 (м, 1H) 4,86 (д, J=4,58 Гц, 1H) 5,04-5,07 (м, 1H) 5,10-5,15 (м, 1H) 5,59-5,62 (м, 1H) 6,84-6,90 (м, 2H) 7,14-7,19 (м, 1H) 7,61 (д, J=7,34 Гц, 1H)
345			944,7	(600 МГц): 0,84 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,16 (т, J=6,65 Гц, 6H) 1,18-1,20 (м, 6H) 1,20-1,23 (м, 6H) 1,22-1,26 (м, 1H) 1,33 (д, J=6,42 Гц, 3H) 1,42 (с, 3H) 1,52-1,57 (м, 1H) 1,65 (с, 3H) 1,70-1,77 (м, 2H) 1,78-1,81 (м, 1H) 1,85-1,96 (м, 3H) 2,13-2,20 (м, 1H) 2,22-2,26 (м, 1H) 2,24 (ушир. с, 6H) 2,30 (ушир. с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,35-2,40 (м, 2H) 2,47-2,63 (м, 9H) 2,66-2,72 (м, 1H) 2,79-2,83 (м, 1H) 2,84-2,88 (м, 1H) 2,90-2,96 (м, 1H) 3,17-3,22 (м, 2H) 3,26 (с, 3H) 3,38-3,44 (м, 1H) 3,53 (с, 1H) 3,55-3,61 (м, 1H) 3,69-3,72 (м, 1H) 4,07 (кв, J=6,42 Гц, 1H) 4,62 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,87-4,91 (м, 1H) 5,03 (т, J=4,13 Гц, 1H) 5,11-5,15 (м, 1H) 5,62 (с, 1H)

346			1064,9	(600 МГц): 0,85 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,12-1,18 (м, 12H) 1,19-1,26 (м, 10H) 1,39 (с, 3H) 1,41-1,46 (м, 6H) 1,52-1,60 (м, 1H) 1,61-1,65 (м, 1H) 1,71-1,77 (м, 2H) 1,73 (с, 3H) 1,85-2,08 (м, 5H) 2,18 (с, 3H) 2,25 (с, 3H) 2,29 (с, 6H) 2,39-2,48 (м, 3H) 2,52-2,63 (м, 2H) 2,72 (д, J=5,04 Гц, 3H) 2,75-2,82 (м, 2H) 2,92-2,98 (м, 1H) 3,06 (кв, J=6,57 Гц, 1H) 3,18 (дд, J=10,32, 7,11 Гц, 1H) 3,26 (с, 3H) 3,38-3,47 (м, 1H) 3,48-3,52 (м, 1H) 3,53-3,54 (м, 1H) 3,80 (с, 3H) 3,85 (д, J=9,20 Гц, 1H) 3,99-4,03 (м, 1H) 4,20-4,24 (м, 1H) 4,52-4,56 (м, 2H) 5,01-5,04 (м, 1H) 5,10-5,14 (м, 1H) 5,83 (с, 1H) 6,85-6,91 (м, 2H) 7,17 (т, J=7,34 Гц, 1H) 7,60 (д, J=7,79 Гц, 1H)
347			930,7	(600 МГц): 0,85 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,12-1,18 (м, 9H) 1,18 (с, 3H) 1,21-1,24 (м, 6H) 1,23-1,25 (м, 1H) 1,28 (д, J=6,42 Гц, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,53-1,66 (м, 2H) 1,72 (с, 3H) 1,73-1,77 (м, 2H) 1,86-2,06 (м, 4H) 2,21 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,23-2,25 (м, 6H) 2,30 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,34-2,39 (м, 2H) 2,43-2,51 (м, 1H) 2,53-2,62 (м, 2H) 2,72 (д, J=5,04 Гц, 3H) 2,73-2,78 (м, 1H) 2,80 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,91-2,97 (м, 1H) 3,06 (кв, J=6,42 Гц, 1H) 3,19 (дд, J=10,09, 7,34 Гц, 1H) 3,26 (с, 3H) 3,39-3,45 (м, 1H) 3,52-3,58 (м, 1H) 3,55 (с, 1H) 3,84 (дд, J=10,55, 1,38 Гц, 1H) 4,06 (кв, J=6,42 Гц, 1H) 4,30 (д, J=5,04 Гц, 1H) 4,47-4,51 (м, 1H) 4,57 (д, J=6,88 Гц, 1H) 5,02 (дд, J=5,04, 3,21 Гц, 1H) 5,12 (дд, J=11,00, 1,83 Гц, 1H) 5,84 (с, 1H)

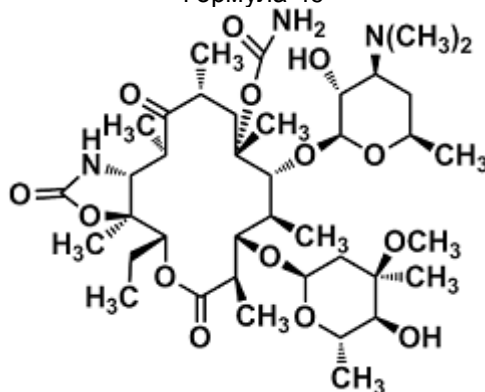
Таблица 9-2

При- клад	R ^{4b}	R ^{2d}	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
348			1083,7	(600 МГц): 0,82 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,13-1,19 (м, 15H) 1,23 (д, J=5,96 Гц, 3H) 1,24-1,29 (м, 1H) 1,31 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,51-1,59 (м, 1H) 1,65 (д, J=11,92 Гц, 1H) 1,72-1,79 (м, 2H) 1,77 (с, 3H) 1,84-1,96 (м, 3H) 2,03-2,09 (м, 1H) 2,17-2,24 (м, 1H) 2,22-2,24 (м, 6H) 2,30 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,34-2,38 (м, 2H) 2,44-2,50 (м, 1H) 2,53-2,63 (м, 2H) 2,75-2,83 (м, 2H) 2,90-2,97 (м, 1H) 3,06-3,11 (м, 1H) 3,17-3,21 (м, 1H) 3,26 (с, 3H) 3,45 (ушир. с, 1H) 3,53-3,58 (м, 1H) 3,59 (с, 1H) 3,84-3,91 (м, 2H) 4,01-4,10 (м, 2H) 4,29 (д, J=4,58 Гц, 1H) 4,57 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,88-4,92 (м, 1H) 4,95-4,97 (м, 1H) 5,13 (д, J=11,00 Гц, 1H) 5,83 (с, 1H) 6,51 (дт, J=15,82, 6,08 Гц, 1H) 6,74 (д, J=16,05 Гц, 1H) 7,35 (дд, J=8,02, 4,36 Гц, 1H) 7,77 (с, 1H) 7,88-7,92 (м, 1H) 8,02 (д, J=8,71 Гц, 1H) 8,19 (д, J=8,25 Гц, 1H) 8,81-8,84 (м, 1H)

349			1026,7	(600 МГц): 0,82 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,12-1,19 (м, 15H) 1,22 (с, 3H) 1,24-1,28 (м, 1H) 1,27 (д, J=6,42 Гц, 3H) 1,39 (с, 3H) 1,52-1,60 (м, 1H) 1,63-1,68 (м, 1H) 1,70-1,80 (м, 2H) 1,78-1,79 (м, 3H) 1,85-1,92 (м, 2H) 1,95-2,03 (м, 2H) 2,07 (дд, J=15,13, 11,00 Гц, 1H) 2,30 (ушир. с, 6H) 2,36 (с, 6H) 2,42-2,49 (м, 1H) 2,73 (д, J=14,21 Гц, 1H) 2,77-2,83 (м, 1H) 2,94-2,99 (м, 1H) 3,06-3,11 (м, 1H) 3,17-3,21 (м, 1H) 3,26 (с, 3H) 3,49-3,54 (м, 1H) 3,59 (с, 1H) 3,84-3,92 (м, 2H) 4,02-4,09 (м, 2H) 4,21 (д, J=5,50 Гц, 1H) 4,55 (д, J=6,88 Гц, 1H) 4,93-4,98 (м, 2H) 5,13 (д, J=9,17 Гц, 1H) 5,82 (с, 1H) 6,51 (дт, J=15,93, 6,02 Гц, 1H) 6,74 (д, J=16,05 Гц, 1H) 7,33-7,37 (м, 1H) 7,75-7,79 (м, 1H) 7,91 (дд, J=8,94, 1,60 Гц, 1H) 8,03 (д, J=8,71 Гц, 1H) 8,19 (д, J=7,79 Гц, 1H) 8,83 (дд, J=4,13, 1,38 Гц, 1H)
-----	---	---	--------	---

Формула (SM4)

Формула 49



5 Приклад 342

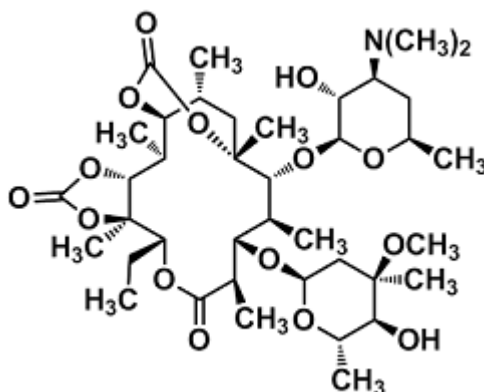
(1) Епоксисполуку (111 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 1, стадії (1) і (3), у прикладі 4, стадія (6), і в прикладі 1, стадія (4), шляхом використання представленої формулою (SM4) сполуки (335 мг), отриманої способом, описаним у міжнародній патентній публікації WO 08/014221, як вихідної речовини.

10 (2) Сполуку (79,7 мг), представлену в таблиці 9, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (105 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), і сполуки (91,5 мг), отриманої в довідковому прикладі 104, як вихідних речовин.

Приклад 343

15 Сполуку (28,3 мг), представлену в таблиці 9, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (100 мг), отриманої в прикладі 342, стадія (1), і N,N,N'-триметилетилен-1,2-діаміну (64 мкл) як вихідних речовин.

Формула (SM5)
Формула 50



5 Приклад 344

(1) Представлену формулою (SM5) сполуку (600 мг), отриману описаним у літературі способом (Journal of Medicinal Chemistry, 2003, vol. 46, p. 2706), розчиняли в тетрагідрофурані (10 мл), до розчину додавали 50 % водний диметиламін (687 мкл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 2,5 доби. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 100/1/0,1→20/1/0,1) з одержанням амідної сполуки (599 мг).

(2) Епоксисполуку (166 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 1, стадії (1), (3) і (4), шляхом використання сполуки (590 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

(3) Сполуку (162 мг), отриману на описаній вище стадії (2), розчиняли в суміші тетрагідрофурану й диметилформаміду (2/1, 3 мл), до розчину при охолодженні на льоді додавали 1,1'-карбонілдіімідазол (62,5 мг) і 60 % гідрід натрію (13,1 мг), і перемішували отриману суміш протягом 15 хвилин. До реакційної суміші додавали водний гідрокарбонат натрію й етилацетат, розділяли шари, і органічний шар промивали насиченим водним гідрокарбонатом натрію. Органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, отриманий залишок розчиняли в суміші тетрагідрофурану й ацетонітрилу (2/1, 3 мл), до розчину додавали 28 % водний аміак (587 мкл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 40 годин. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 100/1/0,1→30/1/0,1) з одержанням карбаматної сполуки (84,5 мг).

(4) Сполуку зі знятим захистом (79,2 мг) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (6), шляхом використання сполуки (84,5 мг), отриманої на описаній вище стадії (3), як вихідної речовини.

(5) Сполуку (16,8 мг), представлену в таблиці 9, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (40 мг), отриманої на описаній вище стадії (4), і сполуки (33,7 мг), отриманої в довідковому прикладі 104, як вихідних речовин.

Приклад 345

Сполуку (16,5 мг), представлену в таблиці 9, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (35 мг), отриманої в прикладі 344, стадія (4), як вихідної речовини.

Приклад 346

(1) Епоксисполуку (0,69 г) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 344, стадія (1), у прикладі 1, стадії (1), (3) і (4), шляхом використання представленої формулою (SM5) сполуки (900 мг), отриманої описаним у літературі способом (Journal of Medicinal Chemistry, 2003, vol. 46, p. 2706), і 40 % водного метиламіну (887 мкл) як вихідних речовин.

(2) Карбаматну сполуку (269 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 344, стадія (3), і в прикладі 4, стадія (6), шляхом використання сполуки (0,47 г), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

(3) Сполуку (57,6 мг), представлену в таблиці 9, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (90 мг), отриманої на описаній вище стадії (2), і сполуки (77,1 мг), отриманої в довідковому прикладі 104, як вихідних речовин.

Приклад 347

Сполуку (24,0 мг), представлену в таблиці 9, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (40 мг), отриманої в прикладі 346, стадія (2), як вихідної речовини.

5 Приклад 348

(1) Амідну сполуку (730 мг) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 344, стадія (1), шляхом використання представленої формулою (SM5) сполуки (900 мг), отриманої описаним у літературі способом (Journal of Medicinal Chemistry, 2003, vol. 46, p. 2706), і аліламіну (257 мкл) як вихідних речовин.

10 (2) Сполуку (350 мг), отриману на описаній вище стадії (1), розчиняли в ацетонітрилі (8 мл), до розчину в атмосфері азоту додавали 6-бромхінолін (190 мкл), триетиламін (330 мкл), три-О-толілфосфін (144 мг) і ацетат паладію(II) (53,2 мг), і перемішували отриману суміш при 130 °C протягом 25 хвилин в умовах мікрохвильової обробки. До реакційної суміші додавали етилацетат і насичений водний гідрокарбонат натрію, і розділяли шари. Органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 1/0/0→100/1/0,1→20/1/0,1) з одержанням сполуки-аддукту (326 мг).

20 (3) Епоксисполуку (31,9 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 1, стадії (1), (3) і (4), у прикладі 344, стадія (3), і прикладі 4, стадія (6), шляхом використання сполуки (326 мг), отриманої на описаній вище стадії (2), як вихідної речовини.

(4) Сполуку (7,0 мг), представлену в таблиці 9, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (14,0 мг), отриманої на описаній вище стадії (3), як вихідної речовини.

25 Приклад 349

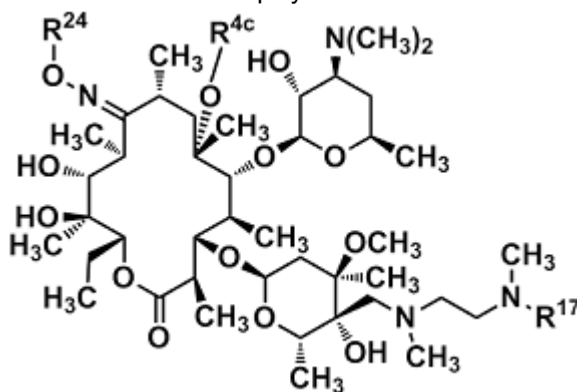
Сполуку (8,0 мг), представлену в таблиці 9, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (14,0 мг), отриманої в прикладі 348, стадія (3), і 50 % водного диметиламіну (6,4 мкл) як вихідних речовин.

Приклади 350 і 351

30 Нижче представлені способи одержання сполук, які представлені формулою (R), і характеризуються значеннями R^{24} і R^{17} , визначеними в таблиці 10, і в яких R^{4c} являє собою метильну групу.

Формула (R)

Формула 51



35

Таблиця 10

Приклад	R ²⁴	R ¹⁷	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
350			960	(400 МГц): 0,86 (т, J=7,57 Гц, 3H) 1,04 (д, J=7,32 Гц, 3H) 1,06 (д, J=7,57 Гц, 3H) 1,12 (с, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,19 (д, J=6,35 Гц, 6H) 1,20-1,30 (м, 1H) 1,24 (д, J=6,10 Гц, 3H) 1,27 (д, J=7,08 Гц, 3H) 1,38 (с, 3H) 1,40-1,58 (м, 4H) 1,62-2,07 (м, 12H) 2,14 (д, J=14,65 Гц, 1H) 2,24 (с, 6H) 2,30 (с, 3H) 2,35 (с, 3H) 2,36-2,66 (м, 8H) 2,70-2,90 (м, 6H) 2,95-3,12 (м, 1H) 3,09 (с, 3H) 3,21 (дд, J=10,25, 7,32 Гц, 1H) 3,29 (с, 3H) 3,30-3,52 (м, 2H) 3,65 (д, J=7,32 Гц, 1H) 3,76 (д, J=9,52 Гц, 1H) 3,95-4,02 (м, 2H) 4,13 (кв, J=6,10 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,32 Гц, 1H) 5,00 (д, J=4,64 Гц, 1H) 5,14 (дд, J=11,23, 2,20 Гц, 1H)
351			1094	(400 МГц): 0,83 (т, J=7,57 Гц, 3H) 1,04 (д, J=7,08 Гц, 3H) 1,06 (д, J=7,32 Гц, 3H) 1,12 (с, 6H) 1,18 (д, J=6,35 Гц, 3H) 1,19 (д, J=7,08 Гц, 3H) 1,20-1,30 (м, 1H) 1,23 (д, J=6,10 Гц, 3H) 1,27 (д, J=7,08 Гц, 3H) 1,39 (с, 3H) 1,43 (с, 3H) 1,44 (с, 3H) 1,44-1,80 (м, 8H) 1,86-2,08 (м, 7H) 2,18 (с, H) 2,26 (с, 3H) 2,30 (с, 6H) 2,39-2,90 (м, 1H) 3,06-3,11 (м, 1H) 3,10 (с, 3H) 3,20 (дд, J=10,25, 7,08 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,30-3,48 (м, 2H) 3,64 (д, J=7,32 Гц, 1H) 3,78 (д, J=9,52 Гц, 1H) 3,80 (с, 3H) 3,95-4,02 (м, 2H) 4,11 (кв, J=6,35 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,32 Гц, 1H) 5,02 (д, J=4,64 Гц, 1H) 5,14 (дд, J=11,23, 2,20 Гц, 1H) 6,86-6,91 (м, 2H) 7,15-7,20 (м, 1H) 7,59-7,64 (м, 1H)

Приклад 350

(1) Кларитроміцин (312 мг), сполуку (693 мг), отриману в довідковому прикладі 97, і імідазол (171 мг) розчиняли в етанолі (3,1 мл), і перемішували розчин при 70 °С протягом 3 діб. До реакційної суміші додавали насичений водний гідрокарбонат натрію й хлороформ, розділяли шари, органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (етилацетат → етилацетат/етанол/28 % водний аміак = 5/1/0,1) з одержанням оксимної сполуки. До зібраного 4-нітробензил-(R)-3-(аміноокси)піперидин-1-карбоксилату додавали 4 М розчин соляної кислоти в діоксані (523 мкл), а потім концентрували суміш в умовах зниженого тиску. Шляхом використання отриманого гідрохлориду (410 мг), кларитроміцину (185 мг) і імідазолу (101 мг) проводили реакції й очищення тими ж способами, що й описані вище, з одержанням оксимної сполуки (усього 698 мг).

(2) 2-Ацетильну сполуку (303 мг) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 1, стадія (1), шляхом використання сполуки (348 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

(3) Кетонову сполуку (339 мг) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 6, стадія (3), шляхом використання сполуки (272 мг), отриманої на описаній вище стадії (2), як вихідної речовини.

(4) Сполуку зі знятим захистом (214 мг) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (6), шляхом використання сполуки (339 мг), отриманої на описаній вище стадії (3), як вихідної речовини.

(5) Епоксисполуку (54 мг) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 1, стадія (4), шляхом використання сполуки (169 мг), отриманої на описаній вище стадії (4), як вихідної речовини.

5 (6) Сполуку-аддукт (11 мг) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 129, стадія (3), шляхом використання сполуки (16 мг), отриманої на описаній вище стадії (5), і N,N,N'-триметилетан-1,2-діаміну (8,1 мкл) як вихідних речовин.

10 (7) Сполуку (11 мг), отриману на описаній вище стадії (6), розчиняли в суміші діоксану й дистильованої води (2/1, 228 мкл), до розчину в атмосфері аргону додавали 5 % паладоване вугілля (11 мг), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 4 годин під тиском 1 атм водню. Реакційну суміш фільтрували через целіт, потім концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом препаративної тонкошарової хроматографії (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 10/1/0,1) з одержанням сполуки (6,9 мг), представленої в таблиці 10.

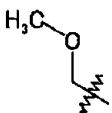
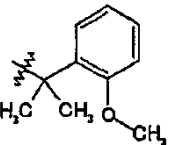
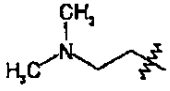
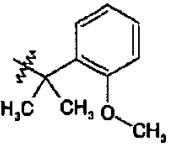
Приклад 351

15 Сполуку (14 мг), представлену в таблиці 10, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 129, стадія (3), і в прикладі 350, стадія (7), шляхом використання сполуки (38 мг), отриманої в прикладі 350, стадія (5), і сполуки (35 мг), отриманої в довідковому прикладі 104, як вихідних речовин.

Приклади 352 і 353

20 Нижче представлені способи одержання сполук, які представлені формулою (R), і характеризуються значеннями R^{24} і R^{17} , визначеними в таблиці 11, і в яких R^{4c} являє собою атом водню.

Таблиця 11

Приклад	R^{24}	R^{17}	ESI MS (M+H)	^1H -ЯМР, CDCl_3 , δ (м. ч.)
352			1041,8	(400 МГц): 0,84 (т, J=7,3 Гц, 3H) 1,05 (д, J=7,1 Гц, 3H) 1,07-1,30 (м, 22H) 1,38-1,73 (м, 14H) 2,18 (с, 3H) 2,22-2,36 (м, 9H) 2,38-2,74 (м, 6H) 2,76-2,94 (м, 2H) 3,10 (с, 1H) 3,22 (дд, J=9,9, 7,2 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,37-3,50 (м, 5H) 3,60 (д, J=7,1 Гц, 1H) 3,70-3,84 (м, 5H) 4,04 (д, J=9,3 Гц, 1H) 4,09 (кв, J=6,2 Гц, 1H) 4,26 (с, 1H) 4,41 (д, J=7,3 Гц, 1H) 4,98 (д, J=4,9 Гц, 1H) 5,04 (д, J=7,3 Гц, 1H) 5,10 (дд, J=11,2, 2,0 Гц, 1H) 5,14 (д, J=7,3 Гц, 1H) 6,84-6,92 (м, 2H) 7,18 (т, J=7,3 Гц, 1H) 7,61 (д, J=7,3 Гц, 1H)
353			1068,8	(400 МГц): 0,83 (т, J=7,3 Гц, 3H) 1,00 (д, J=6,8 Гц, 3H) 1,05-1,28 (м, 21H) 1,39-1,69 (м, 15H) 1,86-2,09 (м, 6H) 2,18 (с, 3H) 2,20 (с, 6H) 2,26 (с, 3H) 2,30 (с, 6H) 2,38-2,68 (м, 6H) 2,82 (д, J=14,9 Гц, 1H) 2,85-2,95 (м, 2H) 3,17 (с, 1H) 3,23 (дд, J=9,9, 7,2 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,33-3,39 (м, 1H) 3,39-3,49 (м, 1H) 3,52 (д, J=8,3 Гц, 1H) 3,62-3,72 (м, 1H) 3,80 (с, 3H) 3,93 (с, 1H) 4,08-4,17 (м, 3H) 4,23 (д, J=10,0 Гц, 1H) 4,37 (д, J=7,3 Гц, 1H) 4,62-4,73 (м, 1H) 4,95 (д, J=4,9 Гц, 1H) 5,12 (дд, J=11,1, 2,1 Гц, 1H) 5,88 (с, 1H) 6,85-6,90 (м, 2H) 7,14-7,20 (м, 1H) 7,62-7,67 (м, 1H)

25 Приклад 352

(1) 9-оксим (Е)-еритроміцину А (22,0 г), отриманий описаним у літературі способом (The Journal of Antibiotics, 1991, vol. 44, No. 3, p. 313), розчиняли в тетрагідрофурані (250 мл), до розчину додавали порошковий 85 % гідроксид калію (2,3 г), тетрабутиламонію бромід (473 мг), і 2-хлорбензилхлорид (4,5 мл), і перемішували отриману суміш при 45 °С протягом 2 годин.

30 Реакційну суміш вливали в дистильовану воду при охолодженні на льоді, до суміші додавали

етилацетат, і розділяли шари. Водний шар екстрагували етилацетатом, органічні шари об'єднували, потім двічі промивали дистильованою водою й насиченим водним хлоридом амонію, а потім органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, отриманий залишок розчиняли в етилацетаті, до розчину додавали гексан, і збирали тверду речовину, яка випала в осад, шляхом фільтрування з одержанням алкільної сполуки (14,5 г). Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, до отриманого залишку додавали етилацетат і гексан, і подібним чином обробляли суміш із одержанням алкільної сполуки (5,16 г).

(2) Ацетильну сполуку (13,7 г) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 1, стадія (1), шляхом використання сполуки (13,0 г), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

(3) Кетонову сполуку (4,97 г) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 1, стадія (3), шляхом використання сполуки (5,00 г), отриманої на описаній вище стадії (2), як вихідної речовини.

(4) Сполуку зі знятим захистом (4,74 г) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (6), шляхом використання сполуки (4,97 г), отриманої на описаній вище стадії (3), як вихідної речовини.

(5) Епоксисполуку (4,67 г) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 1, стадія (4), шляхом використання сполуки (4,74 г), отриманої на описаній вище стадії (4), як вихідної речовини.

(6) До сполуки (800 мг), отриманому на описаній вище стадії (5), в атмосфері аргону додавали 5 % паладоване вугілля (1,77 г), амонію форміат (114 мг), метанол (17 мл) і мурашину кислоту (850 мкл), і перемішували отриману суміш при 45 °C протягом 2,5 годин під тиском 1 атм водню. Реакційну суміш фільтрували, а потім концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску. До отриманого залишку додавали етилацетат і насичений водний гідрокарбонат натрію, розділяли шари, органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 95/5/0,5) з одержанням оксимної сполуки (190 мг).

(7) Сполуку (50 мг), отриману на описаній вище стадії (6), розчиняли в тетрагідрофурані (500 мкл), до розчину додавали при кімнатній температурі гідроксид калію (4,42 мг) і метоксиметилхлорид (6,0 мкл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 55 хвилин. До реакційної суміші додавали етилацетат і дистильовану воду, розділяли шари, органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 94/6/0,6) з одержанням метоксиметильної сполуки (32,0 мг).

(8) Сполуку (20,0 мг), представлену в таблиці 11, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (22,0 мг), отриманої на описаній вище стадії (7), і сполуки (12,9 мг), отриманої в довідковому прикладі 104, як вихідних речовин.

Приклад 353

(1) До сполуки (150 мг), отриманої в прикладі 352, стадія (6), при кімнатній температурі додавали тетрагідрофуран (1,5 мл), 2-хлор-N,N-диметилетанаміну гідрохлорид (34,1 мг) і порошковий 85 % гідроксид калію (26,5 мг), і перемішували отриману суміш протягом ночі при 60 °C. Потім до суміші додавали 2-хлор-N,N-диметилетанаміну гідрохлорид (34,1 мг) і порошковий 85 % гідроксид калію (26,5 мг), і перемішували отриману суміш при 50 °C протягом 5 годин. До реакційної суміші додавали етилацетат і насичений водний гідрокарбонат натрію, і розділяли шари. Органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом препаративної тонкошарової хроматографії (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 9/0,8/0,08) з одержанням диметиламіноетильної сполуки (63,1 мг).

(2) Сполуку (31,0 мг), представлену в таблиці 11, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (37,0 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), і сполуки (10,5 мг), отриманої в довідковому прикладі 104, як вихідних речовин.

Приклади 354-362

Нижче представлені способи одержання сполук, які представлені формулою (S), з визначеними в таблиці 12 значеннями R^{1c}.

Формула (S)

Формула 52

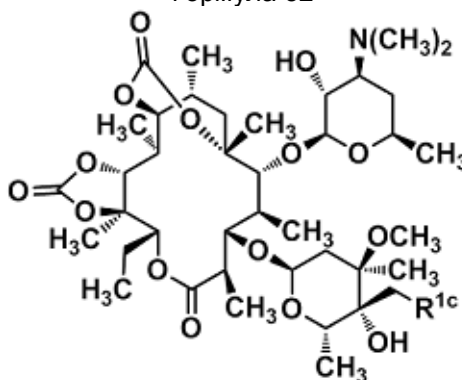
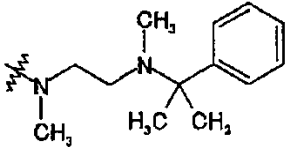
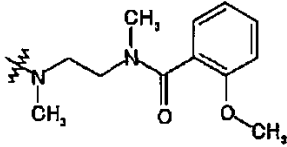


Таблица 12-1

Приклад	R ^{1c}	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
354		1036	(400 МГц): 0,88 (т, J=7,57 Гц, 3H) 1,11 (д, J=5,62 Гц, 9H) 1,12 (с, 3H) 1,17 (д, J=6,35 Гц, 3H) 1,20-1,30 (м, 1H) 1,22 (д, J=5,86 Гц, 3H) 1,24 (д, J=5,86 Гц, 3H) 1,44 (с, 6H) 1,48 (с, 3H) 1,50-2,15 (м, 9H) 1,69 (с, 3H) 2,18 (с, 3H) 2,26 (с, 3H) 2,29 (с, 6H) 2,37-2,71 (м, 7H) 2,74-2,83 (м, 1H) 2,82 (д, J=14,89 Гц, 1H) 3,21 (дд, J=10,25, 7,32 Гц, 1H) 3,24 (с, 3H) 3,40-3,55 (м, 2H) 3,81 (с, 3H) 3,81-3,84 (м, 1H) 3,93 (дд, J=8,55, 2,20 Гц, 1H) 4,09 (кв, J=6,35 Гц, 1H) 4,14 (д, J=9,52 Гц, 1H) 4,33 (д, J=7,08 Гц, 1H) 4,68 (с, 1H) 4,93 (д, J=4,36 Гц, 1H) 5,05 (дд, J=10,74, 2,44 Гц, 1H) 6,85-6,92 (м, 2H) 7,15-7,22 (м, 1H) 7,60 (д, J=7,32 Гц, 1H)
355		1037	(400 МГц): 0,88 (т, J=7,57 Гц, 3H) 1,11 (д, J=7,57 Гц, 9H) 1,13 (с, 3H) 1,18 (д, J=6,35 Гц, 3H) 1,20-1,30 (м, 1H) 1,23 (д, J=7,08 Гц, 3H) 1,24 (д, J=6,10 Гц, 3H) 1,42 (с, 6H) 1,48 (с, 3H) 1,50-2,14 (м, 9H) 1,69 (с, 3H) 2,19 (с, 3H) 2,26 (с, 3H) 2,30 (с, 6H) 2,34-2,70 (м, 7H) 2,74-2,85 (м, 1H) 2,84 (д, J=14,65 Гц, 1H) 3,22 (дд, J=10,01, 7,08 Гц, 1H) 3,25 (с, 3H) 3,40-3,56 (м, 2H) 3,81 (д, J=9,03 Гц, 1H) 3,90-3,96 (м, 1H) 3,93 (с, 3H) 4,09 (кв, J=6,35 Гц, 1H) 4,15 (д, J=9,28 Гц, 1H) 4,33 (д, J=7,32 Гц, 1H) 4,68 (с, 1H) 4,94 (д, J=4,64 Гц, 1H) 5,05 (дд, J=10,74, 2,44 Гц, 1H) 6,82 (дд, J=7,32, 4,88 Гц, 1H) 7,96 (дд, J=7,57, 1,71 Гц, 1H) 8,02 (дд, J=4,64, 1,71 Гц, 1H)
356		1022,6	(400 МГц): 0,88 (т, J=7,3 Гц, 3H) 0,92-1,02 (м, 3H) 1,05-1,36 (м, 26H) 1,48 (с, 3H) 1,51-1,75 (м, 2H) 1,75-2,19 (м, 7H) 2,27 (с, 6H) 2,38-2,87 (м, 14H) 3,16-3,26 (м, 4H) 3,44-3,58 (м, 1H) 3,75-3,85 (м, 4H) 3,93 (дд, J=10,4, 2,3 Гц, 1H) 4,16 (д, J=9,3 Гц, 1H) 4,20-4,29 (м, 1H) 4,33 (д, J=7,3 Гц, 1H) 4,35-4,45 (м, 1H) 4,69 (с, 1H) 4,92 (д, J=4,4 Гц, 1H) 5,05 (дд, J=10,4, 2,3 Гц, 1H) 6,86 (д, J=8,1 Гц, 1H) 6,94 (т, J=7,2 Гц, 1H) 7,17-7,37 (м, 2H)

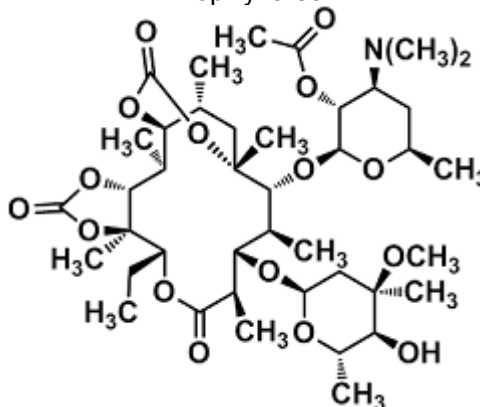
357		1052 FAB MASS	(400 МГц): 0,88 (т, J=7,3 Гц, 3H) 1,02-1,25 (м, 26H) 1,35 (д, J=6,8 Гц, 3H) 1,48 (с, 3H) 1,51-1,67 (м, 3H) 1,68 (с, 3H) 1,74-1,91 (м, 5H) 2,02 (д, J=14,6 Гц 1H) 2,11 (т, J=13,7 Гц, 1H) 2,28 (с, 6H) 2,33-2,61 (м, 6H) 2,64-2,86 (м, 5H) 3,15-3,22 (м, 1H) 3,23 (с, 3H), 3,41-3,62 (м, 3H), 3,76 (д, J=9,3 Гц, 1H) 3,83 (с, 3H) 3,94 (дд, J=8,8, 2,0 Гц, 1H) 4,16 (д, J=9,0 Гц, 1H) 4,25-4,31 (м, 2H) 4,46 (кв, J=6,8 Гц, 1H) 4,68 (с, 1H), 4,90 (д, J=4,4 Гц, 1H) 5,05 (дд, J=10,6, 2,3 Гц, 1H) 6,89 (д, J=8,1 Гц, 1H) 6,95 (т, J=7,1 Гц, 1H) 7,22-7,30 (м, 2H)
358		902 FAB MASS	(400 МГц): 0,88 (т, J=7,3 Гц, 3H) 1,08-1,26 (м, 21H) 1,48 (с, 3H) 1,49-1,61 (м, 2H) 1,66-1,71 (м, 5H) 1,94 (дд J=14,8, 4,8 Гц, 2H), 2,01 (д, J=13,9 Гц, 1H) 2,09 (д, J=12,7 Гц, 1H) 2,16 (д, J=14,9 Гц, 1H) 2,27 (с, 6H) 2,30 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,39-2,58 (м 4H) 2,58-2,69 (м, 1H) 2,75-2,87 (м, 2H) 3,21 (дд, J=10,1, 7,4 Гц, 1H) 3,25 (с, 3H) 3,44-3,53 (м, 2H) 3,83 (д, J=9,0 Гц, 1H) 3,93 (дд, J=8,5, 2,2 Гц, 1H) 4,08-4,14 (м, 2H) 4,33 (д, J=7,3 Гц, 1H) 4,69 (с, 1H) 4,91 (д, J=3,9 Гц, 1H) 5,05 (дд, J=10,6, 2,6 Гц, 1H)
359		1036	(400 МГц): 0,88 (т, J=7,57 Гц, 3H) 0,92 (д, J=6,10 Гц, 3H) 1,11 (д, J=6,84 Гц, 6H) 1,12 (д, J=7,08 Гц, 3H) 1,14 (с, 3H) 1,19 (д, J=6,10 Гц, 3H) 1,20 (д, J=6,10 Гц, 3H) 1,20-1,30 (м, 1H) 1,23 (д, J=7,08 Гц, 3H) 1,44 (с, 6H) 1,48 (с, 3H) 1,50-2,28 (м, 9H) 1,69 (с, 3H) 2,13 (с, 3H) 2,28 (с, 6H) 2,39-2,52 (м, 4H) 2,64-2,72 (м, 1H) 2,76-2,85 (м, 1H) 3,04 (д, J=13,18 Гц, 1H) 3,20 (дд, J=10,01, 7,32 Гц, 1H) 3,27 (с, 3H) 3,44-3,56 (м, 2H) 3,80 (с, 3H) 3,80-3,87 (м, 1H) 3,94 (дд, J=8,30, 1,71 Гц, 1H) 4,14 (д, J=9,52 Гц, 1H) 4,21 (кв, J=6,10 Гц, 1H) 4,34 (д, J=7,08 Гц, 1H) 4,68 (с, 1H) 4,91-4,95 (м, 1H) 5,06 (дд, J=10,74, 2,69 Гц, 1H) 6,86-6,92 (м, 2H) 7,18-7,23 (м, 1H) 7,41-7,45 (м, 1H)
360		1037	(400 МГц): 0,88 (т, J=7,32 Гц, 3H) 0,93 (д, J=6,10 Гц, 3H) 1,10 (с, 3H) 1,11 (д, J=6,59 Гц, 6H) 1,12 (д, J=7,08 Гц, 3H) 1,14 (с, 3H) 1,19 (д, J=6,59 Гц, 3H) 1,20-1,30 (м, 1H) 1,21 (д, J=6,35 Гц, 3H) 1,23 (д, J=9,28 Гц, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,42 (с, 3H) 1,48 (с, 6H) 1,52-1,90 (м, 5H) 1,69 (с, 3H) 1,92-2,19 (м, 5H) 2,12 (с, 3H) 2,23-2,32 (м, 1H) 2,28 (с, 6H) 2,35-2,53 (м, 4H) 2,60-2,71 (м, 1H) 2,76-2,85 (м, 1H) 3,02 (д, J=13,18 Гц, 1H) 3,20 (дд, J=10,25, 7,32 Гц, 1H) 3,27 (с, 3H) 3,47-3,56 (м, 2H) 3,83 (д, J=8,79 Гц, 1H) 3,92-3,96 (м, 1H) 3,93 (с, 3H) 4,14 (д, J=9,52 Гц, 1H) 4,23 (кв, J=6,35 Гц, 1H) 4,34 (д, J=7,08 Гц, 1H) 4,68 (с, 1H) 4,91-4,95 (м, 1H) 5,06 (дд, J=10,50, 2,44 Гц, 1H) 6,83 (дд, J=7,57, 4,88 Гц, 1H) 7,73 (дд, J=7,32, 1,71 Гц, 1H) 8,04 (дд, J=4,64, 1,71 Гц, 1H)

Таблиця 12-2

Приклад	R ^{1c}	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
361		1006	(400 МГц): 0,88 (т, J=7,32 Гц, 3H) 1,11 (д, J=5,13 Гц, 9H) 1,12 (с, 3H) 1,19 (д, J=6,35 Гц, 3H) 1,20-1,30 (м, 1H) 1,23 (д, J=7,08 Гц, 3H) 1,24 (д, J=5,86 Гц, 3H) 1,35 (с, 6H) 1,48 (с, 3H) 1,50-1,89 (м, 5H) 1,70 (с, 3H) 1,94-2,15 (м, 4H) 1,98 (с, 3H) 2,22-2,56 (м, 7H) 2,26 (с, 3H) 2,28 (с, 6H) 2,75-2,84 (м, 2H) 3,20 (дд, J=10,01, 7,08 Гц, 1H) 3,25 (с, 3H) 3,41-3,54 (м, 2H) 3,82 (д, J=9,03 Гц, 1H) 3,94 (дд, J=8,79, 2,20 Гц, 1H) 4,08 (кв, J=6,35 Гц, 1H) 4,15 (д, J=9,28 Гц, 1H) 4,33 (д, J=7,08 Гц, 1H) 4,69 (с, 1H) 4,96 (д, J=4,15 Гц, 1H) 5,06 (дд, J=10,74, 2,44 Гц, 1H) 7,15-7,20 (м, 1H) 7,24-7,31 (м, 2H) 7,52-7,56 (м, 2H)
362		1022	(400 МГц): 0,88 (т, J=7,20 Гц, 3H) 1,00-1,28 (м, 21H) 1,27-1,45 (м, 2H) 1,48 (с, 6H) 1,52-1,74 (м, 4H) 1,76-2,12 (м, 8H) 2,16 (д, J=14,9 Гц, 1H) 2,27 і 2,30 (кожний с, 6H) 2,39-2,47 (м, 5H) 2,49 (с, 3H) 2,73-2,84 (м, 1H) 2,86 (с, 3H) 2,91 (д, J=14,9 Гц, 1H) 3,17-3,21 (м, 1H) 3,22 і 3,26 (кожний с, 3H) 3,37-3,54 (м, 1H) 3,76 і 3,80 (кожний д, J=8,54 Гц, 1H) 3,84 і 3,87 (кожний с, 3H) 3,91-3,96 (м, 1H) 4,02-4,23 (м, 2H) 4,30 і 4,33 (кожний д, J=7,07 Гц, 1H) 4,67 і 4,68 (кожний с, 1H) 4,91 і 4,93 (кожний д, J=4,64 Гц, 1H) 5,02-5,08 (м, 1H) 6,92 (д, J=8,3 Гц, 1H) 6,99 (д, J=7,45 Гц, 1H) 7,17-7,24 (м, 1H) 7,35 (т, J=7,81 Гц, 1H)

Формула (SM6)

Формула 53



5 Приклад 354

(1) Кетонову сполуку (18,4 г) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 1, стадія (3), шляхом використання представленої формулою (SM6) сполуки (10 г), отриманої описаним у літературі способом (Journal of Medicinal Chemistry, 2003, vol. 46, No. 13, p. 2706), як вихідної речовини.

- 10 (2) Сполуку (18,4 г), отриману на описаній вище стадії (1), розчиняли в метанолі (200 мл), і перемішували розчин при 50 °С протягом 5 годин. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ → хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 40/1/0,1). Отримана речовина
- 15 додатково очищали методом колонкової хроматографії на силікагелі (етилацетат → хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 10/1/0,1), а потім розчиняли в етилацетаті (30 мл). До

розчину при перемішуванні додавали гексан (18 мл), і збирали тверду речовину, яка випала в осад, шляхом фільтрування з одержанням сполуки зі знятим захистом (6,95 г).

(3) Епоксисполуку (1,49 г) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 1, стадія (4), шляхом використання сполуки (1,88 г), отриманої на описаній вище стадії (2), як вихідної речовини.

(4) Сполуку (40 мг), отриману на описаній вище стадії (3), розчиняли в етанолі (200 мкл), до розчину додавали сполуку (36 мг), отриману в довідковому прикладі 104, і перемішували отриману суміш при 40 °С протягом 15 годин. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом препаративної тонкошарової хроматографії (хлороформ → хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 10/1/0,1), а потім знову очищали методом препаративної тонкошарової хроматографії (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 5/1/0,1) з одержанням сполуки (19,8 мг), представленої в таблиці 12.

Приклад 355

Сполуку (37 мг), представлену в таблиці 12, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 354, стадія (4), шляхом використання сполуки (80 мг), отриманої в прикладі 354, стадія (3), і сполуки (48 мг), отриманої в довідковому прикладі 105, як вихідних речовин.

Приклад 356

До сполуки (30,0 мг), отриманої в прикладі 354, стадія (3), і тріс(трифторметансульфонат)ітербію (23,3 мг) додавали тетрагідрофуран (300 мкл) і сполуку (22,2 мг), отриману в довідковому прикладі 102, отриману суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 5 хвилин, а потім концентрували в умовах зниженого тиску до перетворення в подібну до сиропу речовини. Отриманий залишок перемішували при 75 °С протягом 12 годин, а потім очищали реакційну суміш методом препаративної тонкошарової хроматографії (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 10/1/0,1) з одержанням сполуки (7,2 мг), представленої в таблиці 12.

Приклад 357

Сполуку (24,3 мг), представлену в таблиці 12, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 356, шляхом використання сполуки (30 мг), отриманої в прикладі 354, стадія (3), і сполуки (25,0 мг), отриманої в довідковому прикладі 103, як вихідних речовин.

Приклад 358

Сполуку (10,1 мг), представлену в таблиці 12, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 356, шляхом використання сполуки (30 мг), отриманої в прикладі 354, стадія (3), і N,N,N'-триметилетан-1,2-діаміну (23,3 мг) як вихідних речовин.

Приклад 359

Сполуку (10 мг), отриману в прикладі 354, стадія (3), і сполуки (5,9 мг), отримане в довідковому прикладі 107, розчиняли в диметилформаміді (50 мкл), до розчину додавали йодид калію (21 мг), і перемішували отриману суміш при 50 °С протягом 24 годин. До реакційної суміші додавали дистильовану воду й етилацетат, розділяли шари, органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом препаративної тонкошарової хроматографії (хлористий метилен/етанол/28 % водний аміак = 11/1/0,1) з одержанням сполуки (5,1 мг), представленої в таблиці 12.

Приклад 360

Сполуку (37 мг), представлену в таблиці 12, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 359, шляхом використання сполуки (64 мг), отриманої в прикладі 354, стадія (3), і сполуки (38 мг), отриманої в довідковому прикладі 108, як вихідних речовин.

Приклад 361

Сполуку (94 мг), представлену в таблиці 12, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 359, шляхом використання сполуки (80 мг), отриманої в прикладі 354, стадія (3), і сполуки (47 мг), отриманої в довідковому прикладі 109, як вихідних речовин.

Приклад 362

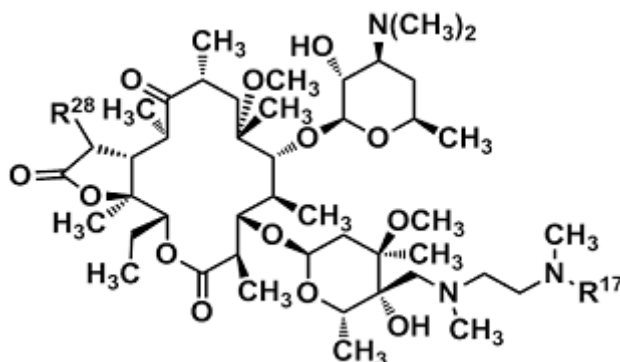
Сполуку (68 мг), представлену в таблиці 12, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 359, шляхом використання сполуки (60 мг), отриманої в прикладі 354, стадія (3), і сполуки (34 мг), отриманої в довідковому прикладі 101, як вихідних речовин.

Приклади 363-366

Нижче представлені способи одержання сполук, які представлені формулою (Т), з визначеними в таблиці 13 значеннями R²⁸ і R¹⁷.

Формула (Т)

Формула 54

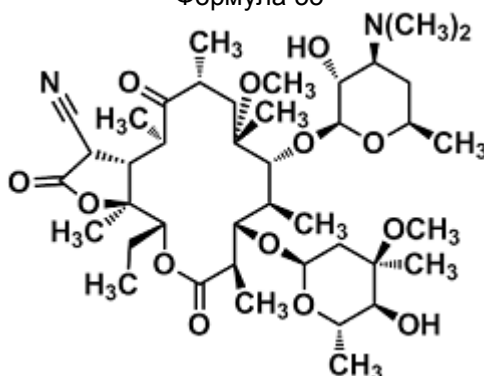


Таблиця 13

Приклад	R ²⁸	R ¹⁷	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
363			1045,7	(500 МГц): 0,90 (т, J=7,26 Гц, 3H) 1,04 (д, J=6,50 Гц, 3H) 1,07-1,28 (м, 19H) 1,39 (с, 3H) 1,41-1,50 (м, 9H) 1,53-1,69 (м, 2H) 1,73-2,07 (м, 7H) 2,18 (с, 3H) 2,22-2,34 (м, 9H) 2,39-2,65 (м, 6H) 2,78-2,91 (м, 2H) 2,99-3,05 (м, 1H) 3,06-3,13 (м, 4H) 3,18 (дд, J=9,94, 7,26 Гц, 1H) 3,29 (с, 3H) 3,42-3,50 (м, 1H) 3,72 (д, J=6,88 Гц, 1H) 3,77-3,86 (м, 4H) 4,05 (кв, J=6,12 Гц, 1H) 4,44 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,72 (с, 1H) 4,99 (д, J=4,59 Гц, 1H) 5,24 (дд, J=10,13, 2,10 Гц, 1H) 6,84-6,92 (м, 2H) 7,14-7,22 (м, 1H) 7,55-7,63 (м, 1H)
364			1093,8	(500 МГц): 0,88 (т, J=7,40 Гц, 3H) 1,06-1,14 (м, 9H) 1,16-1,27 (м, 13H) 1,38 (с, 3H) 1,44 (с, 3H) 1,49-2,05 (м, 8H) 2,16 (д, J=14,81 Гц, 1H) 2,22-2,26 (м, 7H) 2,30 (с, 6H) 2,33-2,64 (м, 11H) 2,70-2,90 (м, 3H) 3,02-3,08 (м, 1H) 3,10-3,17 (м, 4H) 3,19 (дд, J=10,28, 7,27 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,46-3,54 (м, 1H) 3,73-3,79 (м, 2H) 4,09 (кв, J=6,22 Гц, 1H) 4,35-4,54 (м, 4H) 4,97-5,01 (м, 1H) 5,42 (дд, J=10,42, 2,47 Гц, 1H) 5,65 (ушир. с, 2H) 8,21 (с, 1H) 8,36 (с, 1H)
365			1066,9	(500 МГц): 0,87 (т, J=7,40 Гц, 3H) 1,06-1,14 (м, 12H) 1,16 (д, J=6,58 Гц, 3H) 1,19-1,26 (м, 7H) 1,38 (с, 3H) 1,40-1,46 (м, 9H) 1,49-2,07 (м, 9H) 2,18 (с, 3H) 2,25 (с, 3H) 2,29 (с, 6H) 2,42 (с, 3H) 2,43-2,65 (м, 7H) 2,78-2,89 (м, 2H) 2,98-3,05 (м, 1H) 3,10 (с, 3H) 3,19 (дд, J=10,28, 7,27 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,41-3,47 (м, 1H) 3,68-3,81 (м, 5H) 4,04-4,11 (м, 1H) 4,22-4,26 (м, 1H) 4,43 (д, J=7,40 Гц, 1H) 4,99 (д, J=4,39 Гц, 1H) 5,55 (дд, J=10,28, 2,61 Гц, 1H) 6,84-6,91 (м, 2H) 7,14-7,21 (м, 1H) 7,60 (д, J=7,13 Гц, 1H)

366			932,8	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,40 Гц, 3H) 1,06-1,13 (м, 9H) 1,15-1,27 (м, 13H) 1,37 (с, 3H) 1,42 (с, 3H) 1,49-1,58 (м, 1H) 1,62-1,75 (м, 2H) 1,79-2,04 (м, 5H) 2,16 (д, J=14,53 Гц, 1H) 2,24 (с, 6H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,35-2,39 (м, 2H) 2,42 (с, 3H) 2,43-2,49 (м, 1H) 2,50-2,66 (м, 4H) 2,78-2,88 (м, 2H) 2,98-3,04 (м, 1H) 3,09 (с, 3H) 3,16-3,22 (м, 1H) 3,27 (с, 3H) 3,47-3,54 (м, 1H) 3,71-3,78 (м, 2H) 4,09 (кв, J=6,30 Гц, 1H) 4,24 (д, J=0,82 Гц, 1H) 4,45 (д, J=7,40 Гц, 1H) 4,98 (дд, J=5,07, 1,78 Гц, 1H) 5,55 (дд, J=10,42, 2,47 Гц, 1H)
-----	--	--	-------	--

Формула (SM7)
Формула 55



5

Приклад 363

(1) Ацетилну сполуку (1,17 г) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 1, стадія (1), шляхом використання представленої формулою (SM7) сполуки (1,5 г), отриманої способом, описаним у міжнародній патентній публікації WO 03/042228, як вихідної речовини.

10 (2) Епоксисполуку (35 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 6, стадія (3), у прикладі 4, стадія (6), і в прикладі 1, стадія (4), шляхом використання сполуки (100 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

(3) Сполуку (31 мг), представлену в таблиці 13, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (35 мг), отриманої на описаній вище стадії (2), і сполуки (31 мг), отриманої в довідковому прикладі 104, як вихідних речовин.

Приклад 364

(1) Епоксисполуку (0,64 г) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 6, стадія (3), і в прикладі 1, стадія (4), шляхом використання 11,12-карбонату 2'-О-ацетил-6-О-метилеритроміцину А (1,11 г), отриманого способом, описаним у публікації заявки на видачу патенту Японії № 1/96190), яка не пройшла експертизу, як вихідної речовини.

(2) Сполуку (0,64 г), отриману на описаній вище стадії (1), розчиняли в хлороформі (16 мл), до розчину додавали хлороцтовий ангідрид (0,28 г), піридин (0,14 мл) і 4-диметиламінопіридин (50 мг), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 2 годин. До реакційної суміші додавали хлороцтовий ангідрид (0,28 г), піридин (0,14 мл) і 4-диметиламінопіридин (50 мг), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 2 годин. До реакційної суміші додавали насичений водний гідрокарбонат натрію, і екстрагували отриману суміш хлороформом. Органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, а потім очищали отриманий залишок методами колонкової хроматографії на силікагелі (гексан/ацетон/триетиламін = 30/10/0,2→20/10/0,2) і колонкової хроматографії на силікагелі (гексан/ацетон/триетиламін = 20/10/0,2) з одержанням складноефірної сполуки (0,65 г).

(3) Сполуку (0,22 г), отриману в довідковому прикладі 76, розчиняли в диметилформаміді (50 мл), до розчину додавали 70 % гідрид натрію (38 мг), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 1 години. До реакційної суміші додавали розчин сполуки (0,45 г), отриманої на описаній вище стадії (2), у диметилформаміді (10 мл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 5 годин. До реакційної суміші додавали 70 % гідрид

натрію (20 мг), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 1 години. До реакційної суміші додавали насичений водний хлорид амонію, і екстрагували отриману суміш етилацетатом. Органічний шар промивали насиченим водним хлоридом натрію, потім сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (гексан/ацетон/триетиламін = 20/10/0,2) з одержанням лактонової сполуки (176 мг).

(4) Сполуку зі знятим захистом (78 мг) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (6), шляхом використання сполуки (176 мг), отриманої на описаній вище стадії (3), як вихідної речовини.

(5) Сполуку (34 мг), представлену в таблиці 13, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (78 мг), отриманої на описаній вище стадії (4), і N,N,N'-триметилетилен-1,2-діаміну (40 мг) як вихідних речовин.

Приклад 365

(1) Сполуку (200 мг), отриману в прикладі 364, стадія (2), розчиняли в диметилформаміді (10 мл), до розчину додавали метантиолят натрію (25 мг), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 5 годин. До реакційної суміші додавали насичений водний хлорид амонію, і екстрагували отриману суміш етилацетатом. Органічний шар промивали насиченим водним хлоридом натрію, потім сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, отриманий залишок розчиняли в тетрагідрофурані (6 мл) і диметилформаміді (2 мл), до розчину додавали трет-бутоксид калію (29 мг), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 1 години. До реакційної суміші додавали насичений водний хлорид амонію, і екстрагували отриману суміш етилацетатом. Органічний шар промивали насиченим водним хлоридом натрію, потім сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (гексан/ацетон/триетиламін = 30/10/0,2 → 20/10/0,2) з одержанням лактонової сполуки (137 мг).

(2) Сполуку зі знятим захистом (45 мг) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (6), шляхом використання сполуки (137 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

(3) Сполуку (49 мг), представлену в таблиці 13, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (84 мг), отриманої на описаній вище стадії (2), і сполуки (72 мг), отриманої в довідковому прикладі 104, як вихідних речовин.

Приклад 366

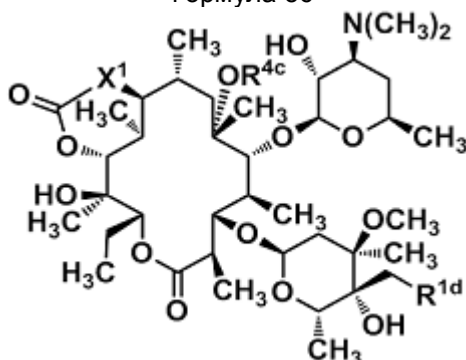
(1) Сполуку (54 мг), представлену в таблиці 13, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (72 мг), отриманої в прикладі 365, стадія (2), і N,N,N'-триметилетилен-1,2-діаміну (56 мкл) як вихідних речовин.

Приклади 367 і 368

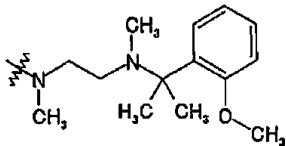
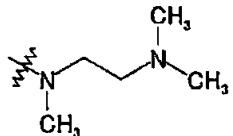
Нижче представлені способи одержання сполук, представлених формулою (U), і характеризуються значеннями R^{1d} , визначеними в таблиці 14, у яких X^1 являє собою NH, і R^{4c} являє собою атом водню.

Формула (U)

Формула 56



Таблиця 14

Приклад	R ^{1d}	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
367		1009,9	(600 МГц): 0,94 (т, J=7,57 Гц, 3H) 1,04-1,08 (м, 1H) 1,09 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,11 (с, 3H) 1,13-1,16 (м, 9H) 1,19 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,22-1,25 (м, 9H) 1,24-1,29 (м, 1H) 1,43 (с, 6H) 1,45-1,52 (м, 1H) 1,64-1,68 (м, 1H) 1,75-1,81 (м, 1H) 1,88-1,97 (м, 3H) 1,98-2,03 (м, 2H) 2,15 (с, 3H) 2,14-2,17 (м, 1H) 2,24 (с, 3H) 2,24-2,28 (м, 1H) 2,31 (с, 6H) 2,39-2,62 (м, 6H) 2,78 (д, J=14,21 Гц, 1H) 2,91-2,95 (м, 1H) 3,26-3,32 (м, 1H) 3,27 (с, 3H) 3,36-3,41 (м, 1H) 3,52-3,57 (м, 1H) 3,58-3,60 (м, 1H) 3,80 (с, 3H) 3,94-3,97 (м, 1H) 4,04 (кв, J=6,11 Гц, 1H) 4,08-4,12 (м, 1H) 4,18-4,22 (м, 1H) 4,53 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,84-4,88 (м, 1H) 4,89-4,91 (м, 1H) 4,93-4,97 (м, 1H) 6,85-6,91 (м, 2H) 7,15-7,20 (м, 1H) 7,56 (д, J=6,88 Гц, 1H)
368		875,8	(600 МГц): 0,94 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,04-1,08 (м, 1H) 1,09 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,13-1,18 (м, 12H) 1,19 (с, 3H) 1,21-1,24 (м, 6H) 1,25 (д, J=5,96 Гц, 3H) 1,26-1,31 (м, 1H) 1,46-1,54 (м, 1H) 1,66-1,70 (м, 1H) 1,75-1,79 (м, 1H) 1,89-1,99 (м, 4H) 2,11-2,17 (м, 1H) 2,16-2,20 (м, 1H) 2,22-2,24 (м, 6H) 2,25-2,27 (м, 1H) 2,31 (с, 6H) 2,33 (с, 3H) 2,34-2,39 (м, 2H) 2,49-2,56 (м, 2H) 2,56-2,65 (м, 2H) 2,79 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,89-2,93 (м, 1H) 3,29 (с, 3H) 3,29-3,33 (м, 1H) 3,57-3,63 (м, 2H) 3,98-4,02 (м, 1H) 4,07 (кв, J=6,42 Гц, 1H) 4,09-4,12 (м, 1H) 4,18-4,21 (м, 1H) 4,54 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,85-4,90 (м, 1H) 4,92-4,96 (м, 1H) 5,03-5,08 (м, 1H)

Приклад 367

- (1) (9R)-[N-(карбобензилокси)аміно-9-дезоксоеритроміцин А] (877 мг), отриманий описаним у літературі способом (Journal of Medicinal Chemistry, 1991, vol. 34, p. 3390), розчиняли в ізопропанолі (18 мл), до розчину додавали карбонат калію (558 мг), і перемішували отриману суміш при 60 °С протягом 16 годин і при нагріванні зі зворотним холодильником протягом 10 годин. До реакційної суміші додавали хлороформ і насичений водний гідрокарбонат натрію, розділяли шари, і екстрагували водний шар хлороформом. Органічні шари об'єднували, сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, до отриманого залишку додавали етилацетат, і збирали тверду речовину, яка випала в осад, шляхом фільтрування з одержанням карбаматної сполуки (237 мг).

- (2) Епоксисполуку (220 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 1, стадія (1), у прикладі 6, стадія (3), у прикладі 4, стадія (6), і в прикладі 1, стадія (4), шляхом використання сполуки (360 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

(3) Сполуку (36,8 мг), представлену в таблиці 14, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (90 мг), отриманої на описаній вище стадії (2), і сполуки (83 мг), отриманої в довідковому прикладі 104, як вихідних речовин.

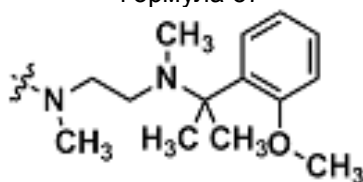
Приклад 368

- Сполуку (22,0 мг), представлену в таблиці 14, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (80 мг), отриманої в прикладі 367, стадія (2), як вихідної речовини.

Приклад 369

- Нижче представлений спосіб одержання сполуки, представленної формулою (U), у якій X¹ являє собою атом кисню, R^{4c} являє собою атом водню, і R^{1d} являє собою

Формула 57



Приклад 369

(1) Ацетильну сполуку (3,39 г) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 1, стадія (1), шляхом використання (9S)-9-дигідроеритроміцину А (3,00 г), отриманого описаним у літературі способом (The Journal of Antibiotics, 1989, vol. 42, No. 2, p. 293), як вихідної речовини.

(2) Сполуку (3,29 г), отриману на описаній вище стадії (1), розчиняли в хлороформі (30 мл), до розчину при охолодженні на льоді додавали піридин (5,47 мл) і трифосген (1,88 г), і перемішували отриману суміш протягом 1,5 годин при охолодженні на льоді. До реакційної суміші додавали лід, насичений водний гідрокарбонат натрію й хлороформ, розділяли шари, органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 95/5/0,5) з одержанням карбонатної сполуки (2,78 г).

(3) Сполуку зі знятим захистом (91,2 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 1, стадія (3), стадія (4), і в прикладі 4, стадія (6), шляхом використання сполуки (400 мг), отриманої на описаній вище стадії (2), як вихідної речовини.

(4) Сполуку (20,0 мг), отриману на описаній вище стадії (3), розчиняли в тетрагідрофурані (60 мкл), до розчину додавали сполуку (12,9 мг), отриману в довідковому прикладі 104, і перемішували отриману суміш при 80 °С протягом 8,5 годин у герметизованій пробірці. Реакційну суміш очищали методом препаративної тонкошарової хроматографії (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 95/5/0,5) з одержанням згаданої вище цільової сполуки (5,0 мг).

МС (FAB) $m/z = 1010 [M+H]^+$

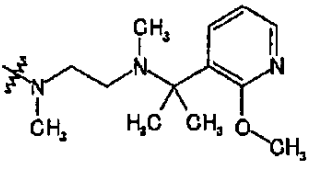
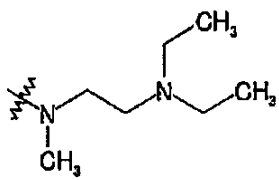
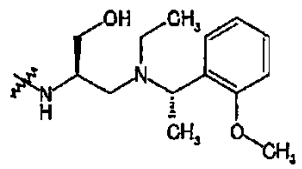
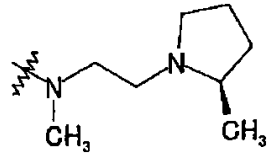
^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 0,93 (т, $J=7,3$ Гц, 3H), 1,08-1,32 (м, 32H), 1,35-1,59 (м, 8H), 1,59-1,97 (м, 9H), 1,99-2,10 (м, 2H), 2,14 (с, 2H), 2,27-2,38 (м, 12H), 2,42-2,74 (м, 4H), 2,81 (д, $J=14,6$ Гц, 1H), 3,27 (с, 3H), 3,48-3,56 (м, 1H), 3,66 (д, $J=5,6$ Гц, 1H), 3,79-3,92 (м, 4H), 4,05 (кв, $J=6,3$ Гц, 1H), 4,37 (д, $J=2,2$ Гц, 1H), 4,51 (д, $J=7,3$ Гц, 1H), 4,91 (д, $J=3,4$ Гц, 1H), 4,99 (дд, $J=9,6$, 3,3 Гц, 1H), 6,86-6,95 (м, 2H), 7,49-7,60 (м, 1H)

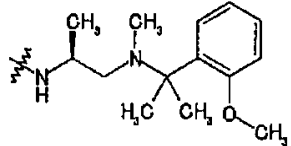
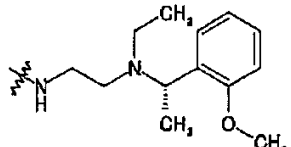
Приклади 370-376

Нижче представлені способи одержання сполук, які представлені формулою (U) і характеризуються значеннями R^{1d} , визначеними в таблиці 15, у яких X^1 являє собою атом кисню, і R^{4c} являє собою метильну групу.

Таблиця 15

Приклад	R^{1d}	ESI MS (M+H)	^1H -ЯМР, CDCl_3 , δ (м. ч.)
370		1024,8	(400 МГц): 0,86 (т, $J=7,4$ Гц, 3H) 1,05 (д, $J=6,8$ Гц, 3H) 1,10-1,14 (м, 6H) 1,17-1,34 (м, 18H) 1,41-1,46 (м, 9H) 1,47-1,69 (м, 4H) 1,76-1,93 (м, 2H) 1,97 (дд, $J=14,9$, 4,9 Гц, 1H) 2,03 (д, $J=9,8$ Гц, 1H) 2,06 (д, $J=9,8$ Гц, 1H) 2,18 (с, 3H) 2,26 (с, 3H) 2,27-2,31 (м, 8H) 2,39-2,71 (м, 5H) 2,79-2,89 (м, 2H) 3,16 (дд, $J=10,0$, 7,3 Гц, 1H) 3,25 (с, 3H) 3,27 (с, 3H) 3,39-3,48 (м, 2H) 3,72 (д, $J=7,8$ Гц, 1H) 3,79-3,83 (м, 4H) 3,89 (д, $J=6,6$ Гц, 1H) 4,13 (кв, $J=6,3$ Гц, 1H) 4,36 (д, $J=7,3$ Гц, 1H) 4,46 (д, $J=2,7$ Гц, 1H) 5,00 (д, $J=4,4$ Гц, 1H) 5,18 (дд, $J=10,7$, 2,7 Гц, 1H) 6,86-6,91 (м, 2H) 7,15-7,21 (м, 1H) 7,61-7,65 (м, 1H)

371		1025,8	(400 МГц): 0,86 (т, J=7,3 Гц, 3H) 1,05 (д, J=6,8 Гц, 3H) 1,09-1,16 (м, 22H), 1,16-1,27 (м, 2H) 1,30 (дд, J=15,0, 6,7 Гц, 1H) 1,36-1,45 (м, 3H) 1,46-1,72 (м, 7H) 1,75-2,10 (м, 5H) 2,18 (с, 3H) 2,26 (с, 4H) 2,29 (с, 7H) 2,35-2,67 (м, 5H) 2,78-2,88 (м, 2H) 3,16 (дд, J=10,1, 7,4 Гц, 1H) 3,25 (с, 3H) 3,27 (с, 3H) 3,38-3,48 (м, 2H) 3,71 (д, J=7,8 Гц, 1H) 3,81 (д, J=9,5 Гц, 1H) 3,89 (д, J=7,1 Гц, 1H) 3,93 (с, 3H) 4,14 (кв, J=6,0 Гц, 1H) 4,36 (д, J=7,1 Гц, 1H) 4,46 (д, J=2,7 Гц, 1H) 5,00 (д, J=4,6 Гц, 1H) 5,17 (дд, J=10,6, 2,6 Гц, 1H) 6,82 (дд, J=7,6, 4,9 Гц, 1H) 7,96-8,00 (м, 1H) 8,01 (дд, J=4,9, 2,0 Гц, 1H)
372		918,7	(400 МГц): 0,85 (т, J=7,4 Гц, 3H) 0,99-1,07 (м, 9H) 1,11 (д, J=7,6 Гц, 3H) 1,14-1,26 (м, 19H) 1,30 (дд, J=15,3, 7,2 Гц, 1H) 1,41 (с, 3H) 1,44-1,68 (м, 3H) 1,74-1,92 (м, 2H) 1,96 (дд, J=14,8, 5,0 Гц, 1H) 2,03 (д, J=13,9 Гц, 1H) 2,09 (д, J=14,6 Гц, 1H) 2,25 (м, 2H) 2,28 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,38-2,64 (м, 9H) 2,80-2,87 (м, 2H) 3,16 (дд, J=10,4, 7,2 Гц, 1H) 3,24 (с, 3H) 3,27 (с, 3H) 3,40-3,49 (м, 2H) 3,72 (д, J=7,6 Гц, 1H) 3,80 (д, J=9,8 Гц, 1H) 3,89 (д, J=6,8 Гц, 1H) 4,13 (кв, J=6,3 Гц, 1H) 4,36 (д, J=7,6 Гц, 1H) 4,46 (д, J=2,7 Гц, 1H) 4,99 (д, J=4,2 Гц, 1H) 5,17 (дд, J=11,0, 2,7 Гц, 1H)
373		1040,7	(400 МГц): 0,85 (т, J=7,3 Гц, 3H) 1,04 (д, J=6,8 Гц, 3H) 1,07 (д, J=7,1 Гц, 3H) 1,08-1,14 (м, 10H) 1,16-1,22 (м, 13H) 1,34 (с, 3H) 1,36 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,44-1,64 (м, 4H) 1,78-1,93 (м, 2H) 2,04 (д, J=14,9 Гц, 1H) 2,20-2,34 (м, 10H) 2,35-2,54 (м, 4H) 2,63-2,88 (м, 0H) 3,14 (дд, J=10,3, 7,3 Гц, 1H) 3,22 (с, 3H) 3,25 (с, 3H) 3,41-3,54 (м, 3H) 3,55-3,62 (м, 1H) 3,67 (д, J=8,1 Гц, 1H) 3,80 (д, J=9,5 Гц, 1H) 3,82 (с, 3H) 3,90 (д, J=6,6 Гц, 1H) 4,28 (кв, J=6,4 Гц, 1H) 4,32 (д, J=7,3 Гц, 1H) 4,42-4,48 (м, 2H) 4,95 (д, J=4,6 Гц, 1H) 5,17 (дд, J=10,6, 2,6 Гц, 1H) 6,89 (дд, J=8,3, 1,0 Гц, 1H) 6,95 (тд, J=7,5, 0,9 Гц, 1H) 7,22-7,30 (м, 5H)
374		930,6	(400 МГц): 0,85 (т, J=7,4 Гц, 3H) 1,04 (д, J=6,6 Гц, 3H) 1,08 (д, J=6,3 Гц, 3H) 1,11 (д, J=7,6 Гц, 3H) 1,14 (с, 3H) 1,16-1,26 (м, 14H) 1,31 (дд, J=14,9, 6,6 Гц, 1H) 1,41 (с, 3H) 1,45-1,71 (м, 7H) 1,72-1,92 (м, 4H) 1,96 (дд, J=14,6, 4,9 Гц, 1H) 2,03 (д, J=14,2 Гц, 1H) 2,07-2,19 (м, 3H) 2,20-2,35 (м, 10H) 2,36 (с, 3H) 2,39-2,47 (м, 1H) 2,60-2,67 (м, 2H) 2,80-2,94 (м, 3H) 3,11-3,19 (м, 2H) 3,24 (с, 3H) 3,27 (с, 3H) 3,40-3,48 (м, 2H) 3,72 (д, J=7,8 Гц, 1H) 3,79 (д, J=9,8 Гц, 1H) 3,89 (д, J=6,8 Гц, 1H) 4,13 (кв, J=6,3 Гц, 1H) 4,36 (д, J=7,1 Гц, 1H) 4,47 (д, J=2,7 Гц, 1H) 4,99

			(д, J=4,4 Гц, 1H) 5,17 (дд, J=10,7, 2,7 Гц, 1H)
375		1024,7	(400 МГц): 0,86 (т, J=7,3 Гц, 3H) 0,91 (д, J=6,1 Гц, 3H) 1,04 (д, J=6,6 Гц, 3H) 1,11 (д, J=7,6 Гц, 3H) 1,13 (с, 3H) 1,16-1,25 (м, 18H) 1,32 (дд, J=15,0, 6,5 Гц, 1H) 1,41 (с, 3H) 1,44 (с, 6H) 1,47-1,58 (м, 2H) 1,59-1,66 (м, 1H) 1,78-1,94 (м, 2H) 1,97-2,03 (м, 2H) 2,13 (с, 3H) 2,14-2,21 (м, 2H) 2,22-2,33 (м, 9H) 2,38-2,48 (м, 2H) 2,63-2,72 (м, 1H) 2,80-2,89 (м, 1H) 3,10 (д, J=13,4 Гц, 1H) 3,16 (дд, J=10,3, 7,3 Гц, 1H) 3,24 (с, 3H) 3,30 (с, 3H) 3,41-3,52 (м, 2H) 3,74 (д, J=7,1 Гц, 1H) 3,77-3,80 (м, 1H) 3,80 (с, 4H) 3,90 (д, J=6,6 Гц, 1H) 4,23 (кв, J=6,2 Гц, 1H) 4,39 (д, J=7,3 Гц, 1H) 4,47 (д, J=2,7 Гц, 1H) 5,18 (дд, J=10,6, 2,6 Гц, 1H) 6,86-6,92 (м, 2H) 7,18-7,23 (м, 1H) 7,42 (дд, J=7,8, 1,5 Гц, 1H)
376		1011	(400 МГц): 0,86 (т, J=7,4 Гц, 3H) 0,95 (т, J=7,0 Гц, 3H) 1,05 (д, J=6,6 Гц, 3H) 1,08-1,25 (м, 22H) 1,25-1,36 (м, 4H) 1,41 (с, 3H) 1,43 (с, 1H) 1,45-1,65 (м, 3H) 1,74-1,92 (м, 1H) 1,95 (дд, J=14,8, 5,0 Гц, 1H) 2,05 (д, J=14,9 Гц, 1H) 2,26 (с, 8H) 2,28-2,67 (м, 9H) 2,75-2,89 (м, 2H) 3,14 (дд, J=10,1, 7,2 Гц, 1H) 3,24 (с, 3H) 3,27 (с, 3H) 3,39-3,51 (м, 2H) 3,71 (д, J=7,8 Гц, 1H) 3,79-3,84 (м, 4H) 3,89 (д, J=6,8 Гц, 1H) 4,24 (кв, J=6,3 Гц, 1H) 4,32-4,41 (м, 2H) 4,46 (д, J=2,7 Гц, 1H) 4,98 (д, J=4,4 Гц, 1H) 5,17 (дд, J=10,6, 2,6 Гц, 1H) 6,86 (д, J=8,3 Гц, 1H) 6,93 (т, J=7,6 Гц, 1H) 7,18-7,23 (м, 1H) 7,31 (д, J=7,1 Гц, 1H)

Приклад 370

(1) (9S)-9-дигідро-6-О-метилеритроміцин А (2,00 г), отриманий описаним у літературі способом (The Journal of Antibiotics, 1990, vol. 43, No. 10, p. 1334), розчиняли в ацетоні (20 мл), до розчину додавали оцтовий ангідрид (334 мкл) і тетрагідрофуран (15 мл), і перемішували отриману суміш протягом ночі при кімнатній температурі. Реакційну суміш концентрували в умовах зниженого тиску, потім до отриманого залишку додавали етилацетат і насичений водний гідрокарбонат натрію, і розділяли шари. Органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і збирали отриману тверду речовину шляхом фільтрування з одержанням ацетильної сполуки (1,53 г).

(2) Карбонатну сполуку (1,07 г) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 369, стадія (2), шляхом використання сполуки (1,15 г), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

(3) Кетоніву сполуку (921 мг) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 1, стадія (3), шляхом використання сполуки (948 мг), отриманої на описаній вище стадії (2), як вихідної речовини.

(4) Епоксисполуку (790 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 4, стадія (6), і в прикладі 1, стадія (4), шляхом використання сполуки (1,01 г), отриманої на описаній вище стадії (3), як вихідної речовини.

(5) Сполуку (65,4 мг), представлену в таблиці 15, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 359, шляхом використання сполуки (80,0 мг), отриманої на описаній вище стадії (4), і сполуки (31,2 мг), отриманої в довідковому прикладі 104, як вихідних речовин.

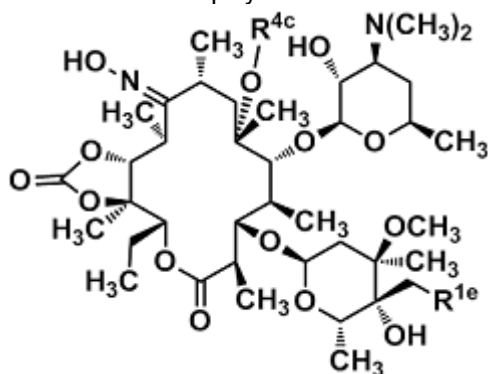
У прикладах 371-376, сполуки, представлені в таблиці 15, синтезували тим же способом, що й описаний у прикладі 359, шляхом використання сполуки, отриманої в прикладі 370, стадія (4) і відповідних амінів.

Приклади 377-381

Нижче представлені способи одержання сполук, які представлені формулою (V) і характеризуються значенням R^{1e} , визначеним у таблиці 16, у яких R^{4c} являє собою атом водню.

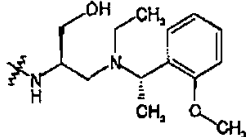
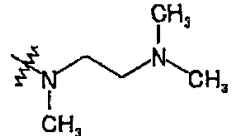
Формула (V)

Формула 58



Таблиця 16

Приклад	R^{1e}	ESI MS (M+H)	^1H -ЯМР, CDCl_3 , δ (м. ч.)
377		1023,7	(600 МГц): 0,87 (т, $J=7,34$ Гц, 3H) 1,04 (д, $J=6,88$ Гц, 3H) 1,08 (д, $J=7,34$ Гц, 3H) 1,12 (с, 3H) 1,15 (д, $J=6,42$ Гц, 3H) 1,17-1,27 (м, 10H) 1,43 (с, 6H) 1,46 (з 3H) 1,48-1,67 (м, 7H) 1,81-1,96 (м, 3H) 2,00-2,05 (м, 2H) 2,18 (с, 3H) 2,25 (с, 3H) 2,29 (с, 6H) 2,36-2,68 (м, 6H) 2,77-2,88 (м, 2H) 3,19-3,25 (м, 1H) 3,26 (с, 3H) 3,38-3,42 (м, 1H) 3,42-3,48 (м, 1H) 3,56 (д, $J=7,79$ Гц, 1H) 3,80 (с, 3H) 3,83-3,91 (м, 1H) 4,03-4,12 (м, 2H) 4,39 (д, $J=6,88$ Гц, 1H) 4,84 (с, 1H) 4,92-4,95 (м, 1H) 4,98-5,03 (м, 1H) 6,84-6,92 (м, 2H) 7,14-7,20 (м, 1H) 7,57-7,63 (м, 1H)
378		1009,7	(500 МГц): 0,88 (т, $J=7,45$ Гц, 3H) 0,94-1,01 (м, 3H) 1,01-1,06 (м, 3H) 1,07-1,33 (м, 22H) 1,46 (с, 3H) 1,49-1,66 (м, 7H) 1,81-2,04 (м, 5H) 2,25-2,36 (м, 7H) 2,41-2,68 (м, 7H) 2,80-2,89 (м, 2H) 3,19-3,27 (м, 4H) 3,45-3,54 (м, 1H) 3,56 (д, $J=7,64$ Гц, 1H) 3,81 (с, 3H) 3,83-3,91 (м, 1H) 4,07 (д, $J=8,41$ Гц, 1H) 4,17-4,24 (м, 1H) 4,38 (д, $J=7,26$ Гц, 2H) 4,86 (с, 1H) 4,92 (д, $J=4,97$ Гц, 1H) 5,00 (дд, $J=10,51$, 2,48 Гц, 1H) 6,86 (д, $J=8,03$ Гц, 1H) 6,91-6,97 (м, 1H) 7,17-7,24 (м, 1H) 7,31-7,38 (м, 1H)
379		1024,7	(500 МГц): 0,88 (т, $J=7,40$ Гц, 3H) 1,05 (д, $J=7,13$ Гц, 3H) 1,08 (д, $J=7,40$ Гц, 3H) 1,10-1,31 (м, 16H) 1,37-1,43 (м, 6H) 1,47 (с, 3H) 1,48-1,72 (м, 9H) 1,81-2,06 (м, 7H) 2,18 (с, 3H) 2,22-2,54 (м, 12H) 2,62-2,67 (м, 1H) 2,78-2,88 (м, 2H) 3,20-3,29 (м, 4H) 3,42-3,50 (м, 1H) 3,56 (д, $J=7,40$ Гц, 1H) 3,84-3,91 (м, 1H) 3,92-3,95 (м, 3H) 4,03-4,12 (м, 2H) 4,39 (д, $J=7,13$ Гц, 1H) 4,83 (с, 1H) 4,93 (д, $J=4,66$ Гц, 1H) 4,99 (дд, $J=10,28$, 2,61 Гц, 1H) 6,80-6,85 (м, 1H) 7,93-7,96 (м, 1H) 8,00-8,05 (м, 1H)

380		1039,7	(500 МГц): 0,88 (т, J=7,45 Гц, 3H) 1,02-1,28 (м, 25H) 1,33-1,37 (м, 3H) 1,44-1,65 (м, 12H) 1,81-2,04 (м, 4H) 2,29 (с, 6H) 2,38-2,54 (м, 3H) 2,60-2,88 (м, 6H) 3,18-3,26 (м, 4H) 3,42-3,61 (м, 4H) 3,80-3,89 (м, 4H) 4,05-4,10 (м, 1H) 4,23-4,28 (м, 1H) 4,35 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,42-4,47 (м, 1H) 4,83 (с, 1H) 4,87-4,90 (м, 1H) 4,97-5,01 (м, 1H) 6,86-6,96 (м, 2H) 7,22-7,30 (м, 2H)
381		889,6	(600 МГц): 0,90 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,04 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,11 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,21 (с, 3H) 1,23-1,34 (м, 13H) 1,52 (с, 3H) 1,61 (с, 3H) 1,48-1,75 (м, 4H) 1,84-1,97 (м, 3H) 1,99-2,07 (м, 2H) 2,21-2,28 (м, 1H) 2,26-2,38 (м, 15H) 2,48-2,56 (м, 2H) 2,60-2,73 (м, 2H) 2,78-2,90 (м, 2H) 2,95-3,02 (м, 1H) 3,25-3,34 (м, 4H) 3,35-3,39 (м, 1H) 3,45-3,53 (м, 1H) 3,61 (д, J=8,25 Гц, 1H) 3,90-3,96 (м, 1H) 4,10-4,19 (м, 2H) 4,41 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,99 (д, J=4,58 Гц, 1H) 5,02 (с, 1H) 5,04-5,10 (м, 1H)

Приклад 377

(1) Епоксисполуку (3,51 г) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 1, стадії (1), (2) і (3), у прикладі 4, стадія (6), і в прикладі 1, стадія (4), шляхом використання 9-[О-(2-хлорбензил)]оксиму (Е)-еритроміцину А (10 г), отриманого описаним у літературі способом (The Journal of Antibiotics, 1993, vol. 46, No. 7, p. 1163), як вихідної речовини.

(2) Сполуку (1,0 г), отриману на описаній вище стадії (1), розчиняли в метанолі (30 мл), до розчину додавали 10 % паладоване вугілля (113 мг), і перемішували отриману суміш протягом ночі при кімнатній температурі під тиском 1 атм водню. Реакційну суміш фільтрували, а потім концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску. Отриманий залишок розчиняли в метанолі (3 мл), до розчину додавали форміат амонію (303 мг) і мурашину кислоту (1,8 мл), і перемішували отриману суміш при 45 °С протягом 5 годин. Реакційну суміш фільтрували, потім фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і до розчину отриманого залишку в метанолі (50 мл) додавали дистильовану воду (150 мл). Значення рН суміші коректували приблизно до 10 додаванням 10 % водного гідроксиду натрію, і збирали тверду речовину, яка випала в осад, шляхом фільтрування. Отриману тверду речовину розчиняли в етилацетаті, розчин сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, отриманий залишок розчиняли в суміші хлороформу й гексану, і концентрували розчин в умовах зниженого тиску. Тверду речовину, яка випала в осад, суспендували в гексані й збирали шляхом фільтрування з одержанням дебензилованої сполуки (621 мг).

(3) Сполуку (62,7 мг), представлену в таблиці 16, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (71 мг), отриманої на описаній вище стадії (2), і сполуки (53 мг), отриманої в довідковому прикладі 104, як вихідних речовин.

У прикладах 378-380, сполуки, представлені в таблиці 16, синтезували тим же способом, що й описаний у прикладі 317, шляхом використання сполуки, отриманої в прикладі 377, стадія (2) і відповідних амінів.

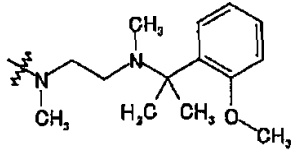
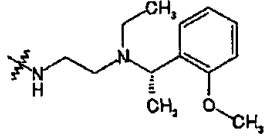
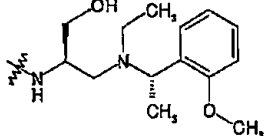
Приклад 381

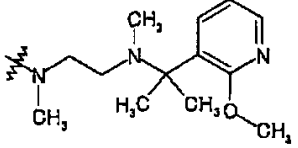
Сполуку (33,6 мг), представлену в таблиці 16, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (50 мг), отриманої в прикладі 377, стадія (2), і N,N,N'-триметилетен-1,2-діаміну (26 мг) як вихідних речовин.

Приклади 382-385

Нижче представлені способи одержання сполук, які представлені формулою (V) і характеризуються значеннями R^{1e}, визначеними в таблиці 17, у яких R^{4c} являє собою метильну групу.

Таблиця 17

Приклад	R ^{1e}	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
382		1037,7	(600 МГц): 0,87 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,98 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,06 (д, J=7,79 Гц, 3H) 1,13 (с, 3H) 1,18 (д, J=6,42 Гц, 3H) 1,21 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,22-1,27 (м, 7H) 1,37-1,44 (м, 7H) 1,47 (с, 3H) 1,49 (с, 3H) 1,52-1,67 (м, 3H) 1,81-2,06 (м, 5H) 2,18 (с, 3H) 2,26 (с, 3H) 2,29 (с, 6H) 2,40-2,64 (м, 6H) 2,77-2,87 (м, 2H) 3,07 (с, 3H) 3,16-3,22 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,37 (ушир.с, 1H) 3,41-3,48 (м, 1H) 3,60-3,66 (м, 1H) 3,75-3,84 (м, 2H) 3,80 (с, 3H) 4,10 (кв, J=6,11 Гц, 1H) 4,40 (д, J=6,88 Гц, 1H) 4,79 (с, 1H) 4,99 (д, J=5,04 Гц, 1H) 5,07 (дд, J=10,77, 2,52 Гц, 1H) 6,84-6,90 (м, 2H) 7,01 (ушир. с, 1H) 7,15-7,20 (м, 1H) 7,61 (д, J=6,88 Гц, 1H)
383		1023,7	(600 МГц): 0,85-0,89 (м, 3H) 0,94-1,00 (м, 6H) 1,04-1,30 (м, 22H) 1,36-1,42 (м, 1H) 1,46-1,51 (м, 6H) 1,52-1,66 (м, 3H) 1,81-2,11 (м, 4H) 2,26-2,28 (м, 6H) 2,28-2,31 (м, 1H) 2,40-2,63 (м, 8H) 2,81-2,87 (м, 2H) 3,05-3,08 (м, 3H) 3,16-3,22 (м, 1H) 3,27-3,30 (м, 3H) 3,45-3,52 (м, 1H) 3,63 (д J=7,34 Гц, 1H) 3,75-3,79 (м, 1H) 3,79-3,82 (м, 3H) 3,81-3,85 (м, 1H) 4,21 (кв, J=6,11 Гц, 1H) 4,34-4,48 (м, 2H) 4,79 (с, 1H) 4,94-4,98 (м, 1H) 5,05-5,09 (м, 1H) 6,86 (д, J=7,79 Гц, 1H) 6,90-6,94 (м, 1H) 7,12-7,16 (м, 1H) 7,18-7,22 (м, 1H) 7,29-7,33 (м, 1H)
384		1053,7	(600 МГц): 0,87 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,98 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,05 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,07 (т, J=7,11 Гц, 3H) 1,10-1,14 (м, 6H) 1,17 (д, J=5,96 Гц, 3H) 1,20 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,23 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,23-1,27 (м, 1H) 1,35 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,36-1,44 (м, 1H) 1,47 (с, 3H) 1,49 (с, 3H) 1,51-1,65 (м, 3H) 1,82-1,93 (м, 3H) 2,01-2,05 (м, 1H) 2,28 (с, 6H) 2,36-2,44 (м, 3H) 2,45-2,50 (м, 1H) 2,49-2,53 (м, 1H) 2,63-2,70 (м, 2H) 2,69-2,76 (м, 1H) 2,77-2,85 (м, 2H) 3,05 (с, 3H) 3,15-3,21 (м, 1H) 3,27 (с, 3H) 3,38-3,51 (м, 2H) 3,55-3,62 (м, 2H) 3,75-3,78 (м, 1H) 3,78-3,83 (м, 1H) 3,82 (с, 3H) 4,23-4,28 (м, 1H) 4,36 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,42-4,47 (м, 1H) 4,78 (с, 1H) 4,93-4,95 (м, 1H) 5,04-5,08 (м, 1H) 6,90 (д, J=0,92 Гц, 1H) 6,92-6,97 (м, 1H) 7,04-7,08 (м, 1H) 7,22-7,30 (м, 2H)

385		1038,7	(600 МГц): 0,87 (т, J=7,34 Гц, 3H) 0,98 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,06 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,14 (с, 3H) 1,19 (д, J=6,42 Гц, 3H) 1,21 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,22-1,26 (м, 7H) 1,39-1,42 (м, 1H) 1,40 (с, 3H) 1,41 (с, 3H) 1,47 (с, 3H) 1,50 (с, 3H) 1,51-1,58 (м, 1H) 1,60-1,67 (м, 2H) 1,83-1,90 (м, 2H) 1,95-2,00 (м, 1H) 2,02-2,07 (м, 2H) 2,19 (с, 3H) 2,26 (с, 3H) 2,27-2,33 (м, 2H) 2,30 (с, 6H) 2,42 (д, J=18,34 Гц, 3H) 2,49-2,53 (м, 1H) 2,79-2,87 (м, 2H) 3,07 (с, 3H) 3,18-3,24 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,35-3,40 (м, 1H) 3,41-3,47 (м, 1H) 3,63 (д, J=7,79 Гц, 1H) 3,78 (д, J=9,17 Гц, 1H) 3,79-3,86 (м, 1H) 3,92-3,93 (м, 3H) 4,11 (кв, J=6,27 Гц, 1H) 4,40 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,79 (с, 1H) 4,99 (д, J=5,04 Гц, 1H) 5,04-5,08 (м, 1H) 6,82 (дд, J=7,34, 4,58 Гц, 1H) 7,29-7,35 (м, 1H) 7,94-7,98 (м, 1H) 8,00-8,02 (м, 1H)
-----	---	--------	--

Приклад 382

- (1) 9-[O-(2-хлорбензил)]оксим (Е)-2',4''-О-бис(триметилсиліл)еритроміцину А (14,0 г), отриманий способом, описаним у міжнародній патентній публікації WO 98/18808, розчиняли в суміші тетрагідрофурану й диметилсульфоксиду (1/1, 56 мл), до розчину при охолодженні на льоді додавали йодметан (1,19 мл) і гідроксид калію (998 мг), і перемішували отриману суміш при тій же температурі протягом 2,5 годин. До реакційної суміші додавали йодметан (0,24 мл) і гідроксид калію (178 мг), і перемішували отриману суміш при тій же температурі протягом 1 години. Реакційну суміш розбавляли етилацетатом, і промивали насиченим водним хлоридом амонію й насиченим водним хлоридом натрію. Органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували, а потім концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску. Отриманий залишок розчиняли в толуолі, і концентрували розчин в умовах зниженого тиску з одержанням метильної сполуки (13,9 г).
- (2) Карбонатну сполуку (5,79 г) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 1, стадія (2), шляхом використання сполуки (5,0 г), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.
- (3) Сполуку (5,79 г), отриману на описаній вище стадії (2), розчиняли в тетрагідрофурані (50 мл), до розчину додавали 1М розчин фториду тетрабутиламонію в тетрагідрофурані (11,2 мл), і перемішували отриману суміш протягом ночі при кімнатній температурі. Реакційну суміш розбавляли етилацетатом, і промивали водним хлоридом амонію й насиченим водним хлоридом натрію. Органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували, потім фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 100/1/0,1→20/1/0,1) з одержанням сполуки зі знятим захистом (2,89 г).
- (4) Ацетильну сполуку (2,64 г) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 1, стадія (1), шляхом використання сполуки (2,89 г), отриманої на описаній вище стадії (3), як вихідної речовини.
- (5) Епоксисполуку (0,97 г) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 1, стадія (3), у прикладі 4, стадія (6), і в прикладі 1, стадія (4), шляхом використання сполуки (1,2 г), отриманої на описаній вище стадії (4), як вихідної речовини.
- (6) Сполуку (300 мг), отриману на описаній вище стадії (5), розчиняли в метанолі (3 мл), до розчину додавали мурашину кислоту (150 мкл), форміат амонію (40,9 мг) і 10 % паладоване вугілля (150 мг), і перемішували отриману суміш при 45 °С протягом 7 годин під тиском 1 атм водню. Реакційну суміш фільтрували, а потім концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску. Отриманий залишок розчиняли в метанолі (3 мл), до розчину додавали мурашину кислоту (150 мкл), форміат амонію (40,9 мг) і 10 % паладоване вугілля (150 мг), і перемішували отриману суміш при 45 °С протягом 7 годин під тиском 1 атм водню. Реакційну суміш фільтрували, а потім концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску. Отриманий залишок розчиняли в метанолі (3 мл), до розчину додавали мурашину кислоту (150 мкл), форміат амонію (40,9 мг) і 10 % паладоване вугілля (300 мг), і перемішували отриману суміш при 45 °С протягом 3 годин під тиском 1 атм водню. Реакційну суміш фільтрували, а потім концентрували фільтрат

в умовах зниженого тиску. Отриманий залишок розчиняли в етилацетаті, і додавали до розчину 10 % водний гідроксид натрію. До реакційної суміші додавали насичений водний гідрокарбонат натрію, і розділяли шари. Органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували, потім фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 40/1/0,1→10/1/0,1) з одержанням сполуки зі знятим захистом (114 мг).

(7) Сполуку (74,5 мг), представлену в таблиці 17, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (100 мг), отриманої на описаній вище стадії (6), і сполуки (88,5 мг), отриманої в довідковому прикладі 104, як вихідних речовин.

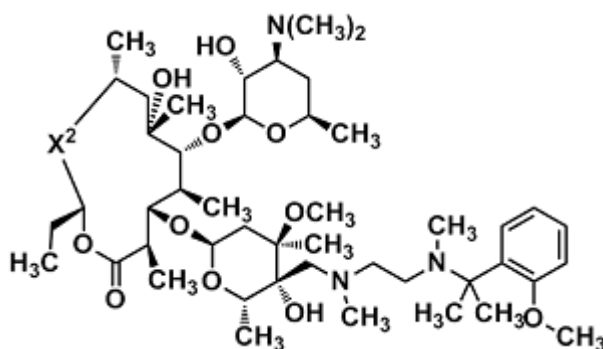
У прикладах 383-385, сполуки, представлені в таблиці 17, синтезували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки, отриманої в прикладі 382, стадія (6) і відповідних амінів.

Приклади 386-395

Нижче представлені способи одержання сполук, які представлені формулою (W) і характеризуються значеннями X^2 , визначеними в таблиці 18.

Формула (W)

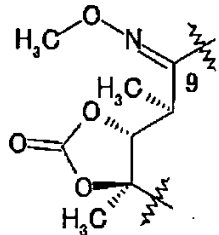
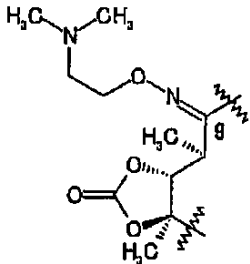
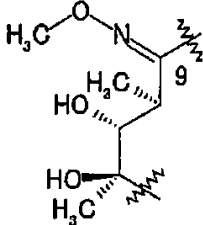
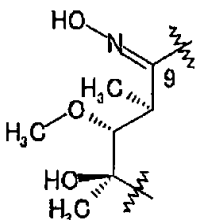
Формула 59



20

Таблиця 18-1

Приклад	X^2	ESI MS (M+H)	^1H -ЯМР, CDCl_3 , δ (м. ч.)
386		1009,7	(500 МГц): 0,88 (т, $J=7,27$ Гц, 3H) 0,98 (д, $J=6,86$ Гц, 3H) 1,10 (с, 9H) 1,14-1,23 (м, 9H) 1,23-1,26 (м, 1H) 1,28 (с, 3H) 1,36-1,41 (м, 1H) 1,42 (с, 6H) 1,45 (с, 3H) 1,47-1,60 (м, 2H) 1,64 (д, $J=10,70$ Гц, 1H) 1,77-1,86 (м, 1H) 1,87-2,08 (м, 6H) 2,16 (с, 3H) 2,24 (ушир. с, 3H) 2,28 (с, 6H) 2,35-2,67 (м, 5H) 2,73-2,84 (м, 3H) 3,20-3,28 (м, 1H) 3,26 (с, 3H) 3,41-3,51 (м, 1H) 3,60 (д, $J=7,40$ Гц, 1H) 3,79 (с, 3H) 4,06-4,13 (м, 1H) 4,23 (д, $J=7,95$ Гц, 1H) 4,43 (д, $J=7,40$ Гц, 1H) 4,89 (с, 1H) 4,93 (д, $J=4,66$ Гц, 1H) 4,98 (дд, $J=9,74$, 2,88 Гц, 1H) 6,82-6,90 (м, 2H) 7,13-7,19 (м, 1H) 7,54-7,63 (м, 1H)

387		1037,7	(600 МГц): 0,88 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,02 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,08 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,12 (с, 3H) 1,14-1,26 (м, 13H) 1,43 (с, 6H) 1,46 (с, 6H) 1,47-1,68 (м, 4H) 1,81-1,97 (м, 3H) 2,00-2,05 (м, 2H) 2,18 (с, 3H) 2,25 (с, 3H) 2,29 (с, 6H) 2,38-2,55 (м, 4H) 2,57-2,64 (м, 2H) 2,77-2,86 (м, 2H) 3,22 (дд, J=10,09, 7,34 Гц, 1H) 3,27 (с, 3H) 3,42-3,48 (м, 1H) 3,54 (д, J=7,34 Гц, 1H) 3,72-3,77 (м, 1H) 3,80 (с, 3H) 3,85 (с, 3H) 4,04-4,12 (м, 2H) 4,39 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,79 (с, 1H) 4,93 (д, J=4,58 Гц, 1H) 4,99 (дд, J=10,09, 2,75 Гц, 1H) 6,84-6,91 (м, 2H) 7,17 (с, 1H) 7,61 (д, J=6,88 Гц, 1H)
388		1094	(400 МГц): 0,85 (т, J=7,32 Гц, 3H) 0,98 (д, J=6,84 Гц, 3H) 1,06 (д, J=7,32 Гц, 6H) 1,12 (с, 3H) 1,18 (д, J=6,10 Гц, 6H) 1,22 (д, J=7,08 Гц, 3H) 1,24 (д, J=6,35 Гц, 3H) 1,44 (с, 6H) 1,48 (с, 3H) 1,50-1,74 (м, 6H) 1,78-1,97 (м, 2H) 1,98-2,08 (м, 1H) 2,17 (с, 9H) 2,26 (с, 3H) 2,29 (с, 6H) 2,37-2,50 (м, 2H) 2,50-2,67 (м, 2H) 2,69-2,78 (м, 2H) 3,23 (дд, J=10,3, 7,32 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,32-3,45 (м, 1H) 3,48 (д, J=8,30 Гц, 1H) 3,62-3,75 (м, 1H) 3,78 (с, 3H) 4,04-4,16 (м, 2H) 4,25-4,37 (м, 3H) 4,92 (д, J=4,64 Гц, 1H) 4,95 (с, 1H) 5,07 (дд, J=10,6, 1,57 Гц, 1H) 6,07 (с, 6H) 6,81-6,92 (м, 2H) 7,17 (т, J=7,20 Гц, 1H) 7,64 (т, J=7,32 Гц, 1H)
389		1011,7	(600 МГц): 0,84 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,02 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,08-1,25 (м, 22H) 1,41-1,54 (м, 11H) 1,60-1,67 (м, 2H) 1,87-2,06 (м, 5H) 2,18 (с, 3H) 2,25 (с, 3H) 2,29 (с, 6H) 2,35-2,69 (м, 6H) 2,81 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,85-2,91 (м, 1H) 3,10 (с, 1H) 3,22 (дд, J=10,09, 7,34 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,38 (ушир. с, 1H) 3,43-3,49 (м, 1H) 3,60 (д, J=7,34 Гц, 1H) 3,66-3,72 (м, 2H) 3,80 (с, 3H) 3,82 (с, 3H) 4,02 (дд, J=9,40, 1,15 Гц, 1H) 4,08 (кв, J=6,42 Гц, 1H) 4,37 (с, 1H) 4,42 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,98 (д, J=5,04 Гц, 1H) 5,11 (дд, J=10,77, 2,06 Гц, 1H) 6,85-6,92 (м, 2H) 7,17 (т, J=7,11 Гц, 1H) 7,61 (д, J=7,34 Гц, 1H)
390		1011,7	(600 МГц): 0,88 (т, J=7,57 Гц, 3H) 1,05-1,30 (м, 28H) 1,34-1,71 (м, 10H) 1,88-2,09 (м, 5H) 2,17 (с, 3H) 2,23-2,33 (м, 9H) 2,88 (с, 8H) 3,25-3,44 (м, 6H) 3,47-3,59 (м, 5H) 3,79 (с, 3H) 3,98-4,14 (м, 2H) 4,46-4,51 (м, 1H) 4,81-4,86 (м, 1H) 4,94 (д, J=5,04 Гц, 1H) 6,87 (д, J=7,79 Гц, 2H) 7,14-7,20 (м, 1H) 7,57-7,63 (м, 1H)

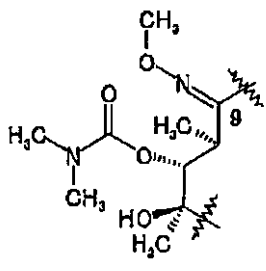
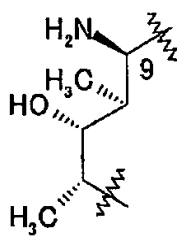
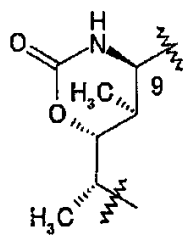
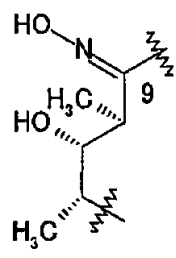
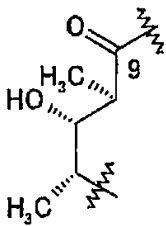
391		1083	(600 МГц): 0,87 (т, J=7,57 Гц, 3H) 1,06-1,12 (м, 9H) 1,13-1,19 (м, 6H) 1,22-1,30 (м, 13H) 1,35 (с, 3H) 1,43 (ушир. с, 6H) 1,47-1,65 (м, 3H) 1,69-1,75 (м, 1H) 1,83-1,92 (м, 3H) 2,00-2,08 (м, 3H) 2,19 (ушир. с, 3H) 2,25 (ушир. с, 3H) 2,31 (ушир. с, 6H) 2,45-2,97 (м, 8H) 2,92 (ушир. с, 3H) 3,26 (с, 3H) 3,26-3,31 (м, 1H) 3,47-3,53 (м, 1H) 3,57-3,61 (м, 1H) 3,70 (с, 3H) 3,77-3,83 (м, 3H) 4,07-4,12 (м, 1H) 4,23-4,26 (м, 1H) 4,45 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,74-4,78 (м, 1H) 4,90-4,93 (м, 1H) 5,06 (ушир. с, 1H) 6,85-6,91 (м, 2H) 7,15-7,20 (м, 1H) 7,58-7,62 (м, 1H)
-----	---	------	--

Таблица 18-2

Приклад	X ²	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
392		967,7	(600 МГц): 0,84-1,01 (м, 12H) 1,09 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,12 (с, 3H) 1,14-1,29 (м, 11H) 1,31 (с, 3H) 1,40-1,51 (м, 8H) 1,62-1,69 (м, 2H) 1,72-1,81 (м, 1H) 1,90-1,97 (м, 2H) 1,99-2,10 (м, 4H) 2,18 (с, 3H) 2,25 (с, 3H) 2,30 (с, 6H) 2,37-2,65 (м, 5H) 2,78-2,90 (м, 3H) 3,24-3,30 (м, 4H) 3,45-3,51 (м, 1H) 3,66 (д, J=7,34 Гц, 1H) 3,80 (с, 3H) 3,89-3,94 (м, 1H) 4,12 (м, 1H) 4,20 (д, J=7,79 Гц, 1H) 4,46 (д, J=7,34 Гц, 1H) 5,02 (д, J=5,04 Гц, 1H) 5,07-5,12 (м, 1H) 6,85-6,90 (м, 2H) 7,15-7,20 (м, 1H) 7,58-7,62 (м, 1H)
393		993,7	(600 МГц): 0,85-0,92 (м, 6H) 0,98-1,05 (м, 4H) 1,06 (д, J=7,34 Гц, 3H) 1,10-1,17 (м, 12H) 1,24 (т, J=2,98 Гц, 7H) 1,43 (с, 7H) 1,63-2,11 (м, 9H) 2,16 (с, 3H) 2,24 (с, 4H) 2,31 (с, 6H) 2,39-2,65 (м, 6H) 2,78 (д, J=14,21 Гц, 1H) 3,00-3,03 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,53-3,62 (м, 2H) 3,80 (с, 3H) 3,93-4,04 (м, 3H) 4,14 (д, J=9,63 Гц, 1H) 4,58 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,72-4,75 (м, 1H) 4,89-4,93 (м, 1H) 5,02-5,07 (м, 1H) 6,88 (с, 2H) 7,15-7,20 (м, 1H) 7,54-7,59 (м, 1H)
394		981,8	(600 МГц): 0,85-0,89 (м, 6H) 1,01-1,06 (м, 6H) 1,07-1,28 (м, 16H) 1,41-1,50 (м, 10H) 1,51-1,74 (м, 8H) 1,92-1,98 (м, 1H) 2,01-2,06 (м, 2H) 2,09-2,14 (м, 1H) 2,16-2,19 (м, 3H) 2,23-2,33 (м, 9H) 2,39-2,66 (м, 6H) 2,78-2,83 (м, 1H) 2,87-2,93 (м, 1H) 3,21-3,25 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,38-3,42 (м, 1H) 3,44-3,50 (м, 1H) 3,57-3,60 (м, 1H) 3,61-3,66 (м, 2H) 3,80 (с, 4H) 4,01-4,04 (м, 1H) 4,07-4,11 (м, 1H) 4,43 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,98 (д, J=5,04 Гц, 1H) 5,40-5,45 (м, 1H)

395		967,1	(500 МГц): 0,84-0,91 (м, 6H) 0,99 (д, J=6,86 Гц, 3H) 1,08-1,28 (м, 19H) 1,40-1,49 (м, 10H) 1,58-1,77 (м, 6H) 1,92-2,13 (м, 5H) 2,17 (с, 3H) 2,25 (с, 3H) 2,27-2,32 (м, 6H) 2,37-2,66 (м, 5H) 2,71-2,92 (м, 3H) 2,95-3,02 (м, 1H) 3,18-3,24 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,42-3,49 (м, 1H) 3,58 (д, J=7,40 Гц, 1H) 3,80 (с, 3H) 4,02 (д, J=9,05 Гц, 1H) 4,08-4,13 (м, 1H) 4,41 (д, J=7,40 Гц, 1H) 4,96 (д, J=4,94 Гц, 1H) 5,35 (дд, J=9,60, 4,66 Гц, 1H) 6,84-6,90 (м, 2H) 7,15-7,21 (м, 1H) 7,60 (д, J=6,58 Гц, 1H)
-----	---	-------	---

Приклад 386

(1) (9R)-9-аміно-9-дезоксеритроміцин А (5,0 г), отриманий описаним у літературі способом (Tetrahedron Letters, 1970, vol. 2, p. 157), розчиняли в хлороформі (70 мл), до розчину додавали дистильовану воду (28 мл) і гідрокарбонат натрію (2,57 г), до суміші додавали при охолодженні на льоді бензилхлороформіат (2,55 г), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 1,5 годин. До реакційної суміші додавали бензилхлороформіат (0,2 мл), і перемішували отриману суміш при тій же температурі протягом 15 хвилин. До реакційної суміші додавали дистильовану воду, і екстрагували отриману суміш хлороформом. Органічний шар сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску з одержанням захищеної сполуки (7,29 г).

(2) Епоксисполуку (197,5 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 1, стадії (2) і (3), у прикладі 4, стадія (6), у прикладі 1, стадія (4), і в прикладі 170, стадія (1), шляхом використання сполуки (7,29 г), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

(3) Сполуку (66,1 мг), представлену в таблиці 18, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (100 мг), отриманої на описаній вище стадії (2), і сполуки (76,4 мг), отриманої в довідковому прикладі 104, як вихідних речовин.

Приклад 387

(1) Гідроксид калію (14 мг) суспендували в тетрагідрофурані (2 мл), до суспензії додавали сполуки (100 мг), отриману в прикладі 377, стадія (2), і йодметан (16 мкл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 30 хвилин. До реакційної суміші додавали йодметан (8 мкл) і гідроксид калію (7 мг), і перемішували отриману суміш протягом 30 хвилин. До реакційної суміші додавали етилацетат і насичений водний розчин хлориду амонію, розділяли шари, органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 20/1/0,1) з одержанням метильної сполуки (72,5 мг).

(2) Сполуку, представлену в таблиці 18, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (70 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), і сполуки (52 мг), отриманої в довідковому прикладі 104, як вихідних речовин.

Приклад 388

(1) Сполуку (5,0 г), отриману в прикладі 352, стадія (2), розчиняли в хлороформі (60 мл), до розчину при охолодженні на льоді додавали піридин (11 мл) і розчин трифосгену (2,16 г) у хлороформі (28 мл), і перемішували отриману суміш протягом 1 години при охолодженні на льоді. До реакційної суміші додавали при охолодженні на льоді холодну воду, отриману суміш нейтралізували додаванням 5н водного гідроксиду натрію, а потім розділяли органічний шар і водний шар. Водний шар екстрагували хлороформом, органічні шари об'єднували, а потім двічі промивали дистильованою водою й насиченим водним хлоридом натрію, а потім сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували. Органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. До фільтрату додавали етилацетат і дистильовану воду, розділяли шари, органічний шар послідовно промивали дистильованою водою й насиченим водним хлоридом натрію, а потім сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і розчиняли отриманий залишок в етилацетаті. До розчину додавали гексан, і збирали тверду речовину, яка випала в осад, шляхом фільтрування з одержанням карбонатної сполуки (3,03 г). Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на

силікагелі (хлороформ \rightarrow хлороформ/метанол = 70/1 \rightarrow 30/1). Отриману тверду речовину (2,0 г) розчиняли в етилацетаті (10 мл), до розчину додавали гексан (20 мл), і збирали тверду речовину, яка випала в осад, шляхом фільтрування з одержанням карбонатної сполуки (814 мг).

5 (2) Деацетиловану сполуку (3,85 г) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 1, стадія (3), і в прикладі 4, стадія (6), шляхом використання сполуки (3,84 г), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

(3) Епоксисполуку (1,25 г) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 1, стадія (4), шляхом використання сполуки (2,05 г), отриманої на описаній вище стадії (2), як вихідної речовини.

10 (4) Сполуку (43,6 г), отриману на описаній вище стадії (3), розчиняли в метанолі (15 мл), до розчину в атмосфері аргону додавали форміат амонію (232 мг) і 5 % паладоване вугілля (2,0 г), а потім перемішували отриману суміш при 45 °С протягом 3 годин під тиском 1 атм водню. До реакційної суміші додавали насичений водний гідрокарбонат натрію, отриману суміш фільтрували через целіт, а потім концентрували фільтрат в умовах зниженого тиску. До
15 отриманого залишку додавали етилацетат (100 мл) і метанол (14 мл), розчиняли в них осад, органічний шар промивали насиченим водним гідрокарбонатом натрію, дистильованою водою й насиченим водним хлоридом натрію, а потім сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ \rightarrow хлороформ/метанол/28 %
20 водний аміак = 70/1/0,1 \rightarrow 50/1/0,1) з одержанням дебензилованої сполуки (1,07 г).

(5) Сполуку (70 мг), отриману на описаній вище стадії (4), і 2-хлор-N,N-диметилетанамін (100 мг) розчиняли в тетрагідрофурані (1 мл), до розчину додавали порошковий 85 % гідроксид калію (7 мг) і бромід тетрабутиламонію (1,5 мг), отриману суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 30 годин, а потім при 60 °С протягом 16 годин. До реакційної суміші при
25 охолодженні на льоді додавали етилацетат і 20 % водний хлорид амонію, розділяли шари, органічний шар двічі промивали насиченим водним гідрокарбонатом натрію, дистильованою водою й насиченим водним хлоридом натрію, а потім сушили над безводним сульфатом натрію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий
30 залишок методом препаративної тонкошарової хроматографії (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 10/1/0,1) з одержанням алкілоксимної сполуки (59 мг).

(6) Сполуку (33 мг), представлену в таблиці 18, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 129, стадія (3), шляхом використання сполуки (98 мг), отриманої на описаній вище стадії (5), і сполуки (54 мг), отриманої в довідковому прикладі 104, як вихідних речовин.

35 Приклад 389

Сполуку, представлену в таблиці 18, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (70 мг), отриманої в прикладі 387, стадія (1), і сполуки (52 мг), отриманої в довідковому прикладі 104, як вихідних речовин.

Приклад 390

40 (1) 9-Оксим (Е)-еритроміцину А (10 г), отриманий способом, описаним у публікації європейського патенту № 0508726, розчиняли в тетрагідрофурані (60 мл), до розчину при охолодженні на льоді додавали гідроксид калію (825 мг), бензилхлорид (1,7 мл) і бромід тетрабутиламонію (215 мг), і перемішували отриману суміш при 45 °С протягом 2 годин. До реакційної суміші додавали етилацетат, дистильовану воду й насичений водний хлорид натрію,
45 отриману суміш фільтрували, а потім розділяли шари. Органічний шар промивали насиченим водним хлоридом натрію, сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску з одержанням бензильної сполуки (10,49 г).

(2) Сполуку (10,49 г), отриману на описаній вище стадії (1), розчиняли в диметилформаміді (125 мл), до розчину при охолодженні на льоді додавали імідазол (6,41 г) і триетилсилілхлорид (4,71 г), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 3 діб. До реакційної суміші додавали імідазол (1,28 г) і триетилсилілхлорид (942 мг), і перемішували отриману суміш протягом 7 годин. До реакційної суміші додавали імідазол (2,56 г) і триетилсилілхлорид (1,88 г), і перемішували отриману суміш протягом ночі при кімнатній температурі. До реакційної суміші
50 додавали етилацетат, дистильовану воду й насичений водний хлорид амонію, і розділяли шари. Органічний шар промивали насиченим водним хлоридом амонію й насиченим водним хлоридом натрію, потім сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (гексан/ацетон/триетиламін = 40/1/0 \rightarrow 8/1/0 \rightarrow 3/1/0,2 \rightarrow 2/1/0,2) з одержанням силільної
55 сполуки (10,82 г).

(3) Сполуку (9,15 г), отриману на описаній вище стадії (2), розчиняли в диметилформаміді (83 мл), до розчину додавали борну кислоту (539 мг), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 0,5 години. До реакційної суміші додавали 0,6М розчин триметилсилілдіазометану в гексані (69,2 мл), і перемішували отриману суміш протягом ночі при кімнатній температурі. До реакційної суміші додавали насичений водний гідрокарбонат натрію й етилацетат, і розділяли шари. Органічний шар двічі промивали дистильованою водою, сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску з одержанням метильної сполуки (10,3 г).

(4) Сполуку (10,3 г), отриману на описаній вище стадії (3), розчиняли в тетрагідрофурані (30 мл), до розчину додавали комплекс 70 % фтороводню/піридину (11,8 мл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 2 годин. До реакційної суміші додавали насичений водний гідрокарбонат натрію для нейтралізації суміші, потім до суміші додавали 1н водний гідроксид натрію й етилацетат, і розділяли шари. Органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ → хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 20/1/0,1 → 10/1/0,1) з одержанням сполуки зі знятим захистом (5,7 г).

(5) Епоксисполуку (507 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 1, стадії (1) і (3), у прикладі 4, стадія (6), і в прикладі 1, стадія (4), шляхом використання сполуки (700 мг), отриманої на описаній вище стадії (4), як вихідної речовини.

(6) Сполуку (500 мг), отриману на описаній вище стадії (5), розчиняли в метанолі (15 мл), до розчину додавали форміат амонію (739,2 мг), мурашину кислоту (0,45 мл) і 5 % паладоване вугілля (150 мг), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 4 годин. Реакційну суміш фільтрували, фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, до отриманого залишку додавали хлороформ і насичений водний гідрокарбонат натрію, і розділяли шари. Органічний шар сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, до отриманого залишку додавали толуол, і концентрували отриману суміш в умовах зниженого тиску. Отриманий залишок очищали методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 20/1/0,1) з одержанням сполуки зі знятим захистом (26 мг).

(7) Сполуку (3 мг), представлену в таблиці 18, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 317, шляхом використання сполуки (26 мг), отриманої на описаній вище стадії (6), і сполуки (39,6 мг), отриманої в довідковому прикладі 104, як вихідних речовин.

Приклад 391

(1) Карбонатну сполуку (1,72 г) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 1, стадії (1) і (2), шляхом використання 9-метилоксиму (Е)-еритроміцину А (2,2 г), отриманого описаним у літературі способом (The Journal of Antibiotics, 1991, vol. 44, No. 3, p. 313), як вихідної речовини.

(2) Сполуку (500 мг), отриману на описаній вище стадії (1), розчиняли в метанолі (5 мл), до розчину додавали гідрохлорид піридину (13,9 мг) і 50 % водний диметиламін (5,0 мл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 3 доби. До реакційної суміші додавали хлороформ і насичений водний гідрокарбонат натрію, розділяли шари, і екстрагували водний шар хлороформом. Органічні шари об'єднували, фільтрували з використанням фазового сепаратора для додаткового розділення шарів, отриманий органічний шар концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 100/1/0,1 → 10/1/0,1) з одержанням амідної сполуки (327 мг).

(3) Епоксисполуку (48,2 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 1, стадія (1), у прикладі 6, стадія (3), у прикладі 4, стадія (6), і в прикладі 1, стадія (4), шляхом використання сполуки (323 мг), отриманої на описаній вище стадії (2), як вихідної речовини.

(4) Сполуку (17,3 мг), представлену в таблиці 18, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (28,0 мг), отриманої на описаній вище стадії (3), і сполуки (23,5 мг), отриманої в довідковому прикладі 104, як вихідних речовин.

Приклад 392

(1) Еритроміцин В (10 г) розчиняли в метанолі (20 мл), до розчину додавали 50 % водний гідроксиламін (6,63 г) і 80 % водну оцтову кислоту (2,87 мл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 15 хвилин і при 50 °С протягом 18 годин. Реакційну суміш залишали охолоджуватися до кімнатної температури, потім до реакційної суміші додавали етилацетат і дистильовану воду, додавали 25 % водний гідроксид натрію до одержання рН 9, і

розділяли шари. Органічний шар промивали насиченим водним хлоридом натрію, сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску з одержанням оксимної сполуки (10,85 г).

(2) Сполуку (10,5 г), отриману на описаній вище стадії (1), розчиняли в метанолі (30 мл), до розчину додавали форміат амонію (55,2 г), розчин хлориду титану(III) у соляній кислоті (21 мл), і перемішували отриману суміш при кімнатній температурі протягом 5 хвилин. До реакційної суміші додавали ціаноборгідрид натрію (4,5 г), і перемішували отриману суміш протягом ночі при кімнатній температурі. До реакційної суміші додавали етилацетат і насичений водний гідрокарбонат натрію, розділяли шари, органічний шар промивали насиченим водним гідрокарбонатом натрію й насиченим водним хлоридом натрію, сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 10/1/0,1) з одержанням аміносполуки (6,23 г).

(3) Сполуку (6,2 г), отриману на описаній вище стадії (2), розчиняли в хлороформі (15 мл), до розчину додавали насичений водний гідрокарбонат натрію (30 мл), потім до суміші по краплях додавали розчин бензилхлороформіату (2,46 мл) у хлороформі (15 мл), і перемішували отриману суміш протягом ночі при кімнатній температурі. Шари реакційної суміші розділяли, органічний шар промивали насиченим водним гідрокарбонатом натрію й насиченим водним хлоридом натрію, сушили над безводним сульфатом магнію й фільтрували. Фільтрат концентрували в умовах зниженого тиску, і очищали отриманий залишок методом колонкової хроматографії на силікагелі (хлороформ → хлороформ/метанол/28 % водний аміак = 100/1/0,1 → 20/1/0,1) з одержанням захищеної сполуки (390 мг).

(4) Епоксисполуку (115 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 1, стадія (3), у прикладі 4, стадія (6), і в прикладі 1, стадія (4), шляхом використання сполуки (390 мг), отриманої на описаній вище стадії (3), як вихідної речовини.

(5) Сполуку-аддукт (51 мг) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 317, шляхом використання сполуки (85 мг), отриманої на описаній вище стадії (4), і сполуки (70 мг), отриманої в довідковому прикладі 104, як вихідних речовин.

(6) Сполуку (10 мг), представлену в таблиці 18, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 166, стадія (2), шляхом використання сполуки (46 мг), отриманої на описаній вище стадії (5), як вихідної речовини.

Приклад 393

(1) Циклізовану сполуку (24 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 1, стадія (3), у прикладі 4, стадія (6), і в прикладі 1, стадія (4), шляхом використання сполуки (390 мг), отриманої в прикладі 392, стадія (3), як вихідної речовини.

(2) Сполуку (15 мг), представлену в таблиці 18, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 317, шляхом використання сполуки (20 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), і сполуки (18,7 мг), отриманої в довідковому прикладі 104, як вихідних речовин.

Приклад 394

(1) Діацетильну сполуку (5,16 г) одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 1, стадія (1), шляхом використання сполуки (5 г), отриманої в прикладі 392, стадія (1), як вихідної речовини.

(2) Епоксисполуку (485 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 6, стадія (3), у прикладі 1, стадія (4), і в прикладі 4, стадія (6), шляхом використання сполуки (1,45 г), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

(3) Сполуку (12 мг), представлену в таблиці 18, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (50 мг), отриманої на описаній вище стадії (2), і сполуки (47,5 мг), отриманої в довідковому прикладі 104, як вихідних речовин.

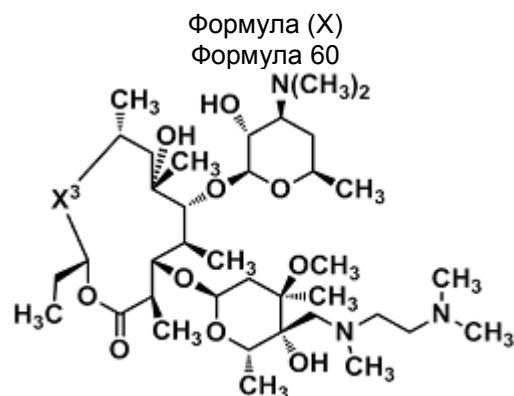
Приклад 395

(1) Епоксисполуку (295 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 1, стадія (1), у прикладі 6, стадія (3), у прикладі 4, стадія (6), і в прикладі 1, стадія (4), шляхом використання еритроміцину В (2 г) як вихідної речовини.

(2) Сполуку (23 мг), представлену в таблиці 18, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 317, шляхом використання сполуки (150 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), і сполуки (121 мг), отриманої в довідковому прикладі 104, як вихідних речовин.

Приклади 396-398

Нижче представлені способи одержання сполук, які представлені формулою (X) і характеризуються значеннями X^3 , визначеними в таблиці 19.



Таблиця 19

Приклад	X ³	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
396		948,9	(600 МГц) d м. ч. 0,87 (т, J=7,34 Гц, 3H) 1,06-1,11 (м, 6H) 1,13-1,19 (м, 9H) 1,21-1,30 (м, 10H) 1,35 (с, 3H) 1,47-1,54 (м, 1H) 1,55-1,61 (м, 1H) 1,64-1,68 (м, 1H) 1,70-1,74 (м, 1H) 1,84-1,92 (м, 3H) 2,01 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,01-2,06 (м, 1H) 2,15 (д, J=15,13 Гц, 1H) 2,24 (с, 6H) 2,31 (с, 6H) 2,33-2,37 (м, 1H) 2,34 (с, 3H) 2,37-2,43 (м, 1H) 2,48-2,56 (м, 2H) 2,60-2,66 (м, 1H) 2,70-2,75 (м, 1H) 2,82 (д, J=14,67 Гц, 1H) 2,84-2,88 (м, 1H) 2,91-3,00 (м, 6H) 3,27 (с, 3H) 3,27-3,31 (м, 1H) 3,49-3,55 (м, 1H) 3,59 (д, J=6,88 Гц, 1H) 3,71 (с, 3H) 4,09-4,13 (м, 1H) 4,24 (д, J=5,96 Гц, 1H) 4,45 (д, J=7,34 Гц, 1H) 4,73-4,77 (м, 1H) 4,92 (д, J=4,58 Гц, 1H) 5,07 (с, 1H)
397		832,7	(500 МГц) d м. ч. 0,84-0,91 (м, 6H) 0,99 (д, J=6,86 Гц, 3H) 1,10-1,28 (м, 19H) 1,42-1,51 (м, 4H) 1,57-1,76 (м, 4H) 1,91-2,17 (м, 6H) 2,21-2,26 (м, 6H) 2,26-2,56 (м, 13H) 2,58-2,66 (м, 1H) 2,70-2,90 (м, 3H) 2,95-3,02 (м, 1H) 3,22 (дд, J=10,28, 7,27 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,48 (ушир. с, 1H) 3,60 (д, J=7,13 Гц, 1H) 3,81 (д, J=10,15 Гц, 1H) 4,01-4,05 (м, 1H) 4,12 (кв, J=6,40 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,40 Гц, 1H) 4,95 (д, J=4,39 Гц, 1H) 5,34 (дд, d=9,19, 4,53 Гц, 1H)
398		847,7	(500 МГц) d м. ч. 0,83-0,89 (м, 6H) 1,00 (д, J=7,13 Гц, 6H) 1,09 (д, J=7,40 Гц, 3H) 1,11-1,14 (м, 3H) 1,17-1,30 (м, 10H) 1,39-1,54 (м, 5H) 1,57-1,71 (м, 4H) 1,98-2,14 (м, 4H) 2,22-2,37 (м, 15H) 2,41-2,92 (м, 8H) 3,21-3,29 (м, 4H) 3,43-3,51 (м, 1H) 3,61 (д, J=7,40 Гц, 1H) 3,72 (д, J=9,32 Гц, 1H) 3,79-3,85 (м, 1H) 4,04 (д, J=9,60 Гц, 1H) 4,10 (кв, J=5,94 Гц, 1H) 4,40 (д, J=7,13 Гц, 1H) 4,97 (ушир. с, 1H) 5,45 (дд, J=9,32, 4,11 Гц, 1H)

5

Приклад 396

Сполуку (6,9 мг), представлену в таблиці 19, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (18 мг), отриманої в прикладі 391, стадія (3), як вихідної речовини.

Приклад 397

Сполуку (13 мг), представлену в таблиці 19, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (50 мг), отриманої в прикладі 395, стадія (1), як вихідної речовини.

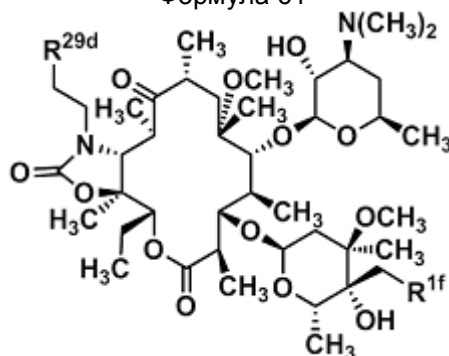
5 Приклад 398

Сполуку (19 мг), представлену в таблиці 19, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (50 мг), отриманої в прикладі 394, стадія (2), як вихідної речовини.

Приклади 399-456

- 10 Нижче представлені способи одержання сполук, які представлені формулою (Y) і характеризуються значеннями R^{1f} і R^{29d} , визначеними в таблиці 20.

Формула 61



Таблиця 20-1

Приклад	R^{29d}	R^{1f}	ESI MS (M+H)	$^1\text{H-NMR}$, CDCl_3 , δ (м. ч.)
399			1048,6	(500 МГц): 0,37-0,50 (м, 4H) 0,86 (т, J=7,45 Гц, 3H) 0,99-1,29 (м, 25H) 1,40 (с, 6H) 1,50-1,81 (м, 5H) 1,82-2,10 (м, 5H) 2,30 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,40-2,74 (м, 8H) 2,83 (д, J=14,52 Гц, 1H) 2,89-2,97 (м, 1H) 2,99 (с, 3H) 3,05 (с, 3H) 3,12 (кв, J=7,01 Гц, 1H) 3,19 (дд, J=9,94, 7,26 Гц, 1H) 3,24-3,36 (м, 1H) 3,27 (с, 3H) 3,40-3,57 (м, 2H) 3,59 (с, 1H) 3,66-3,73 (м, 2H) 3,76-3,83 (м, 1H) 3,84-3,92 (м, 1H) 4,08 (кв, J=6,37 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,92-5,01 (м, 2H) 5,55 (т, J=5,73 Гц, 1H)
400			1034,6	(499 МГц): 0,37-0,48 (м, 4H) 0,85 (т, J=7,40 Гц, 3H) 0,99-1,28 (м, 22H) 1,40 (с, 6H) 1,51-1,62 (м, 1H) 1,63-1,71 (м, 2H) 1,74 (д, J=6,58 Гц, 2H) 1,82-2,11 (м, 5H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,34 (с, 3H) 2,40-2,48 (м, 1H) 2,50-2,68 (м, 5H) 2,83 (д, J=14,53 Гц, 1H) 2,93 (дд, J=9,60, 7,13 Гц, 1H) 2,98 (с, 3H) 3,05 (с, 3H) 3,12 (кв, J=6,86 Гц, 1H) 3,18 (дд, J=10,15, 7,40 Гц, 1H) 3,27 (с, 3H) 3,24-3,36 (м, 1H) 3,40-3,50 (м, 1H) 3,50-3,62 (м, 1H) 3,58 (с, 1H) 3,69 (т, J=7,68 Гц, 2H) 3,76-3,92 (м, 2H) 4,08 (кв, J=6,12 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,13 Гц, 1H) 4,92-5,01 (м, 2H) 5,56 (т, J=5,76 Гц, 1H)

401			1062,7	(500 МГц): 0,37-0,51 (м, 4H) 0,86 (т, J=7,26 Гц, 3H) 0,99-1,27 (м, 28H) 1,40 (с, 6H) 1,51-1,62 (м, 1H) 1,63-1,69 (м, 1H) 1,74 (д, J=6,50 Гц, 2H) 1,82-2,08 (м, 6H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,40-2,70 (м, 7H) 2,82 (д, J=14,52 Гц, 1H) 2,89-3,03 (м, 1H) 2,99 (с, 3H) 3,06 (с, 3H) 3,12 (кв, J=7,14 Гц, 1H) 3,18 (дд, J=10,32, 7,26 Гц, 1H) 3,27 (с, 3H) 3,28-3,36 (м, 1H) 3,40-3,58 (м, 2H) 3,58 (с, 1H) 3,67-3,72 (м, 2H) 3,76-3,83 (м, 1H) 3,84-3,92 (м, 1H) 4,08 (кв, J=6,12 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,96 (дд, J=10,70, 1,91 Гц, 1H) 4,98 (д, J=4,59 Гц, 1H) 5,55 (т, J=5,73 Гц, 1H)
402			1060,6	(500 МГц): 0,36-0,48 (м, 8H) 0,86 (т, J=7,26 Гц, 3H) 1,02 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,07-1,28 (м, 19H) 1,40 (с, 6H) 1,51-1,69 (м, 2H) 1,74 (д, J=6,12 Гц, 2H) 1,82-2,11 (м, 7H) 2,29 (с, 6H) 2,36 (с, 3H) 2,39-2,47 (м, 1H) 2,54-2,88 (м, 6H) 2,94 (дд, J=9,94, 7,26 Гц, 1H) 2,99 (с, 3H) 3,06 (с, 3H) 3,12 (кв, J=6,88 Гц, 1H) 3,18 (дд, J=10,32, 7,26 Гц, 1H) 3,25-3,36 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,39-3,61 (м, 2H) 3,58 (с, 1H) 3,66-3,73 (м, 2H) 3,77-3,83 (м, 1H) 3,84-3,92 (м, 1H) 4,09 (кв, J=6,12 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,96 (дд, J=10,70, 1,91 Гц, 1H) 4,98 (д, J=4,97 Гц, 1H) 5,56 (т, J=5,73 Гц, 1H)
403			1062,7	(500 МГц): 0,37-0,49 (м, 4H) 0,85 (т, J=7,45 Гц, 6H) 1,02 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,07-1,29 (м, 19H) 1,40 (с, 6H) 1,48-1,81 (м, 7H) 1,82-2,09 (м, 5H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,40-2,76 (м, 8H) 2,83 (д, J=14,91 Гц, 1H) 2,89-3,00 (м, 1H) 2,99 (с, 3H) 3,06 (с, 3H) 3,12 (кв, J=6,88 Гц, 1H) 3,18 (дд, J=10,32, 7,26 Гц, 1H) 3,25-3,36 (м, 1H) 3,27 (с, 3H) 3,40-3,61 (м, 2H) 3,58 (с, 1H) 3,66-3,73 (м, 2H) 3,77-3,83 (м, 1H) 3,84-3,92 (м, 1H) 4,08 (кв, J=6,12 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,96 (дд, J=11,08, 1,91 Гц, 1H) 4,98 (д, J=4,97 Гц, 1H) 5,55 (т, J=5,92 Гц, 1H)
404			1064,7	(500 МГц): 0,85 (т, J=7,26 Гц, 3H) 0,95-1,28 (м, 34H) 1,40 (с, 6H) 1,50-1,78 (м, 4H) 1,82-2,09 (м, 5H) 2,29 (с, 6H) 2,33-2,38 (м, 3H) 2,39-2,64 (м, 6H) 2,83 (д, J=14,91 Гц, 1H) 2,90-3,03 (м, 6H) 3,05 (с, 3H) 3,09-3,21 (м, 2H) 3,25-3,36 (м, 4H) 3,40-3,55 (м, 2H) 3,58 (с, 1H) 3,66-3,73 (м, 2H) 3,76-3,93 (м, 2H) 4,05-4,13 (м, 1H) 4,41 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,92-5,02 (м, 2H) 5,52-5,59 (м, 1H)
405			1036,6	(500 МГц): 0,85 (т, J=7,26 Гц, 3H) 0,96-1,04 (м, 9H) 1,07-1,27 (м, 19H) 1,40 (с, 6H) 1,50-1,77 (м, 4H) 1,82-2,14 (м, 5H) 2,22 (с, 3H) 2,29 (с, 6H) 2,32-2,62 (м, 9H) 2,78-2,96 (м, 3H) 2,98 (с, 3H) 3,05 (с, 3H) 3,09-3,22 (м, 2H) 3,24-3,36 (м, 4H) 3,42-3,57 (м, 2H) 3,59 (с, 1H) 3,85-3,93 (м, 4H) 4,05-4,13 (м, 1H) 4,42 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,92-5,01 (м, 2H) 5,50-5,61 (м, 1H)

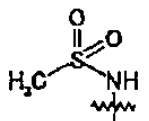
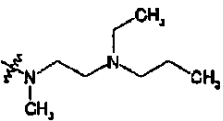
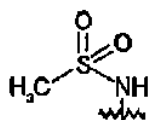
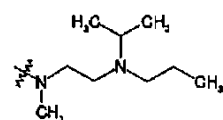
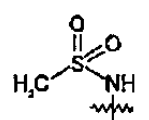
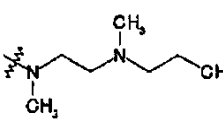
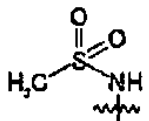
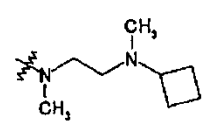
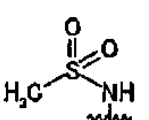
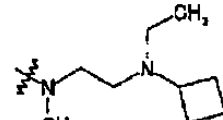
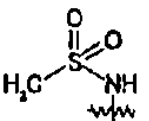
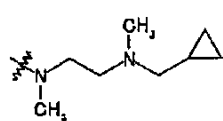
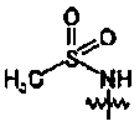
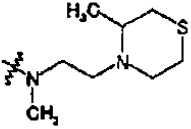
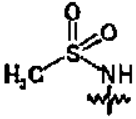
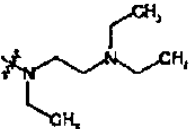
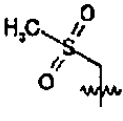
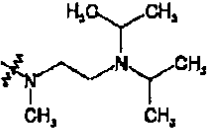
406			1050,7	(500 МГц): 0,81-0,90 (м, 6H) 0,98-1,05 (м, 6H) 1,08-1,29 (м, 19H) 1,36-1,76 (м, 11H) 1,82-2,11 (м, 5H) 2,29 (с, 6H) 2,31-2,64 (м, 13H) 2,81-2,96 (м, 2H) 2,98 (с, 3H) 3,06 (с, 3H) 3,08-3,21 (м, 2H) 3,25-3,36 (м, 4H) 3,41-3,57 (м, 3H) 3,59 (с, 1H) 3,65-3,74 (м, 2H) 3,77-3,93 (м, 2H) 4,04-4,14 (м, 1H) 4,41 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,92-5,01 (м, 2H) 5,51-5,60 (м, 1H)
407			1064,7	(500 МГц): 0,85 (т, J=7,26 Гц, 6H) 0,94-1,04 (м, 9H) 1,07-1,27 (м, 19H) 1,35-1,48 (м, 8H) 1,51-1,77 (м, 4H) 1,81-2,10 (м, 5H) 2,26-2,63 (м, 16H) 2,80-3,00 (м, 6H) 3,06 (с, 3H) 3,08-3,21 (м, 2H) 3,24-3,36 (м, 4H) 3,41-3,57 (м, 3H) 3,58 (с, 1H) 3,67-3,73 (м, 2H) 3,76-3,93 (м, 2H) 4,04-4,12 (м, 1H) 4,41 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,93-5,01 (м, 2H) 5,51-5,59 (м, 1H)
408			1036,6	(499 МГц): 0,82-0,91 (м, 6H) 1,02 (д, J=6,86 Гц, 3H) 1,08-1,28 (м, 19H) 1,40 (с, 6H) 1,43-1,77 (м, 6H) 1,82-2,14 (м, 5H) 2,16-2,66 (м, 18H) 2,81-2,96 (м, 2H) 2,98 (с, 3H) 3,05 (с, 3H) 3,09-3,22 (м, 2H) 3,25-3,35 (м, 4H) 3,43-3,60 (м, 4H) 3,66-3,74 (м, 2H) 3,77-3,92 (м, 2H) 4,07-4,13 (м, 1H) 4,41 (д, J=7,40 Гц, 1H) 4,93-5,00 (м, 2H) 5,53-5,59 (м, 1H)
409			1048,6	(499 МГц): 0,86 (т, J=7,27 Гц, 3H) 1,02 (д, J=6,86 Гц, 3H) 1,08-1,27 (м, 19H) 1,40 (ушир.с, 6H) 1,51-2,14 (м, 18H) 2,24-2,36 (м, 10H) 2,40-2,64 (м, 4H) 2,77-3,00 (м, 6H) 3,06 (с, 3H) 3,09-3,21 (м, 2H) 3,25-3,37 (м, 4H) 3,42-3,60 (м, 4H) 3,66-3,74 (м, 2H) 3,76-3,93 (м, 2H) 4,10 (кв, J=6,31 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,13 Гц, 1H) 4,92-5,02 (м, 2H) 5,52-5,59 (м, 1H)

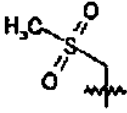
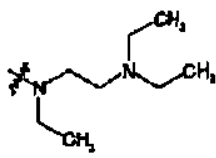
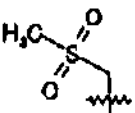
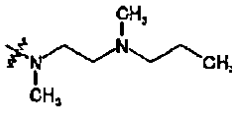
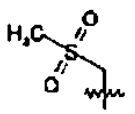
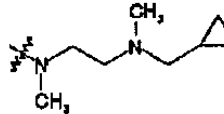
Таблица 20-2

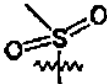
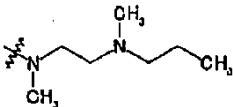
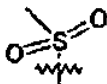
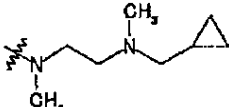
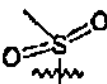
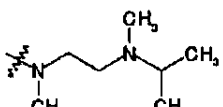
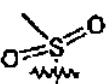
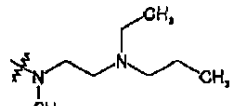
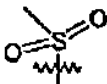
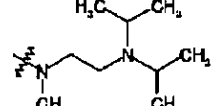
При- клад	R ^{29d}	R ^{1f}	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
410			1062,7	(499 МГц): 0,85 (т, J=7,40 Гц, 3H) 0,95-1,05 (м, 6H) 1,08-1,28 (м, 19H) 1,36-1,44 (м, 6H) 1,51-1,77 (м, 6H) 1,82-2,11 (м, 9H) 2,29 (с, 6H) 2,31-2,35 (м, 3H) 2,38-2,63 (м, 8H) 2,84 (д, J=14,53 Гц, 1H) 2,90-3,00 (м, 4H) 3,03-3,21 (м, 6H) 3,25-3,36 (м, 4H) 3,43-3,60 (м, 4H) 3,66-3,73 (м, 2H) 3,77-3,92 (м, 2H) 4,09 (кв, J=6,22 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,13 Гц, 1H) 4,92-5,03 (м, 2H) 5,53-5,60 (м, 1H)
411			1048,6	(499 МГц): 0,06-0,14 (м, 2H) 0,46-0,55 (м, 2H) 0,81-0,93 (м, 4H) 0,98-1,29 (м, 22H) 1,40 (с, 6H) 1,52-1,78 (м, 4H) 1,83-2,16 (м, 5H) 2,21-2,68 (м, 20H) 2,83 (д, J=14,81 Гц, 1H) 2,88-3,01 (м, 4H) 3,05 (с, 3H) 3,09-3,22 (м, 2H) 3,25-3,36 (м, 4H) 3,43-3,57 (м, 2H) 3,59 (с, 1H) 3,66-3,92 (м, 4H) 4,07-4,15 (м, 1H) 4,42 (д, J=7,40 Гц, 1H) 4,92-5,01 (м, 2H) 5,53-5,59 (м, 1H)

412			1080,6	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,43 Гц, 3H) 1,02 (д, J=7,02 Гц, 3H) 1,11 (д, J=7,43 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,02 Гц, 3H) 1,15-1,20 (м, 9H) 1,20-1,25 (м, 7H) 1,40 (с, 6H) 1,52-1,61 (м, 1H) 1,63-1,68 (м, 1H) 1,72-1,76 (м, 2H) 1,84-1,89 (м, 1H) 1,89-1,96 (м, 1H) 2,01 (д, 2H) 2,08 (д, J=14,86 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,33 (с, 3H) 2,38-2,77 (м, 12H) 2,80-2,85 (м, 1H) 2,89-2,95 (м, 1H) 2,96-3,02 (м, 1H) 2,99 (с, 3H) 3,05-3,07 (м, 3H) 3,12 (кв, J=6,88 Гц, 1H) 3,16-3,21 (м, 1H) 3,28 (д, J=3,72 Гц, 3H) 3,30-3,36 (м, 1H) 3,43-3,50 (м, 1H) 3,51-3,57 (м, 1H) 3,59 (с, 1H) 3,69 (д, J=11,15 Гц, 1H) 3,72 (д, J=4,54 Гц, 1H) 3,77-3,83 (м, 1H) 3,85-3,91 (м, 1H) 4,05-4,10 (м, 1H) 4,42 (д, J=7,02 Гц, 1H) 4,95-4,97 (м, 1H) 4,98-5,01 (м, 1H) 5,50-5,57 (м, 1H)
413			1050,7	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,22 Гц, 3H) 0,98-1,04 (м, 12H) 1,11 (д, J=7,43 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,02 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,17-1,22 (м, 7H) 1,23 (д, J=6,19 Гц, 3H) 1,40 (с, 6H) 1,53-1,60 (м, 1H) 1,62-1,66 (м, 1H) 1,72-1,75 (м, 2H) 1,83-1,89 (м, 1H) 1,89-1,95 (м, 1H) 1,98-2,01 (м, 2H) 2,17 (д, J=14,86 Гц, 1H) 2,29 (б, 6H) 2,40-2,63 (м, 10H) 2,66-2,76 (м, 2H) 2,87 (д, J=14,86 Гц, 1H) 2,92-2,96 (м, 1H) 2,98 (с, 3H) 3,05 (с, 3H) 3,12 (кв, J=7,02 Гц, 1H) 3,16-3,20 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,29-3,35 (м, 1H) 3,45 (ушир.с, 1H) 3,47-3,57 (м, 2H) 3,59 (с, 1H) 3,68 (д, J=9,91 Гц, 1H) 3,73 (д, J=7,43 Гц, 1H) 3,78-3,82 (м, 1H) 3,85-3,91 (м, 1H) 4,07-4,11 (м, 1H) 4,43 (д, J=7,02 Гц, 1H) 4,96 (дд, J=10,94, 1,86 Гц, 1H) 4,97-4,99 (м, 1H) 5,54 (т, J=5,78 Гц, 1H)
414			1063,6	(500 МГц): 0,84 (т, J=7,45 Гц, 3H) 0,93-1,06 (м, 15H) 1,07-1,30 (м, 19H) 1,39 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,48-1,61 (м, 1H) 1,62-1,69 (м, 1H) 1,71-1,77 (м, 2H) 1,84-2,08 (м, 6H) 2,10-2,32 (м, 2H) 2,29 (с, 6H) 2,36 (с, 3H) 2,38-2,65 (м, 6H) 2,83 (д, J=14,91 Гц, 1H) 2,87-3,06 (м, 3H) 2,83 (с, 3H) 3,03 (с, 3H) 3,06-3,21 (м, 4H) 3,28 (с, 3H) 3,40-3,49 (м, 1H) 3,81-3,77 (м, 3H) 3,63 (с, 1H) 3,86-3,95 (м, 1H) 4,09 (кв, J=6,12 Гц, 1H) 4,40 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,89 (дд, J=10,89, 2,10 Гц, 1H) 4,98 (д, J=4,59 Гц, 1H)

415			1035,6	(500 МГц): 0,84 (т, J=7,26 Гц, 3H) 0,95-1,03 (м, 9H) 1,07-1,28 (м, 19H) 1,39 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,50-1,60 (м, 1H) 1,62-1,68 (м, 1H) 1,71-1,78 (м, 2H) 1,84-2,04 (м, 4H) 2,11 (д, J=14,52 Гц, 1H) 2,13-2,31 (м, 2H) 2,22 (с, 3H) 2,29 (с, 6H) 2,31-2,64 (м, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,78-2,86 (м, 2H) 2,87-2,95 (м, 1H) 2,93 (с, 3H) 3,03 (с, 3H) 3,06-3,21 (м, 4H) 3,28 (с, 3H) 3,41-3,51 (м, 1H) 3,63 (с, 1H) 3,66-3,76 (м, 3H) 3,86-3,93 (м, 1H) 4,09 (кв, J=6,12 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,88 (дд, J=10,89, 2,10 Гц, 1H) 4,98 (д, J=3,82 Гц, 1H)
416			1049,6	(500 МГц): 0,85 (дт, J=10,13, 7,55 Гц, 6H) 0,96-1,04 (м, 6H) 1,07-1,29 (м, 19H) 1,39 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,43-1,61 (м, 3H) 1,63-1,69 (м, 1H) 1,69-1,79 (м, 2H) 1,84-2,05 (м, 4H) 2,08 (д, J=14,91 Гц, 1H) 2,11-2,32 (м, 2H) 2,29 (с, 6H) 2,32-2,65 (м, 10H) 2,34 (с, 3H) 2,83 (д, J=14,91 Гц, 1H) 2,87-2,96 (м, 1H) 2,93 (с, 3H) 3,03 (с, 3H) 3,06-3,21 (м, 4H) 3,28 (с, 3H) 3,41-3,60 (м, 1H) 3,63 (с, 1H) 3,66-3,76 (м, 3H) 3,86-3,94 (м, 1H) 4,09 (кв, J=6,12 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,89 (дд, J=10,89, 2,10 Гц, 1H) 4,98 (д, J=4,59 Гц, 1H)
417			1047,6	(600 МГц): 0,84 (т, J=7,43 Гц, 3H) 1,00 (д, J=6,61 Гц, 3H) 1,10 (д, J=7,43 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,43 Гц, 3H) 1,17 (с, 3H) 1,18-1,22 (м, 7H) 1,24 (д, J=5,78 Гц, 3H) 1,39 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,51-1,69 (м, 4H) 1,72-1,76 (м, 2H) 1,81-1,94 (м, 5H) 1,97-2,04 (м, 3H) 2,09 (с, 3H) 2,09-2,12 (м, 1H) 2,13-2,21 (м, 1H) 2,22-2,31 (м, 3H) 2,29 (с, 6H) 2,33 (с, 3H) 2,40-2,47 (м, 1H) 2,47-2,55 (м, 1H) 2,55-2,63 (м, 2H) 2,77-2,84 (м, 1H) 2,84 (д, J=14,86 Гц, 1H) 2,88-2,92 (м, 1H) 2,93-2,94 (м, 3H) 3,04 (с, 3H) 3,08-3,20 (м, 4H) 3,28 (с, 3H) 3,43-3,49 (м, 2H) 3,63 (с, 1H) 3,67-3,75 (м, 3H) 3,87-3,92 (м, 1H) 4,10 (кв, J=6,19 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,43 Гц, 1H) 4,87-4,90 (м, 1H) 4,99 (д, J=4,54 Гц, 1H)
418			1061,6	(600 МГц): 0,84 (т, J=7,22 Гц, 3H) 0,98 (т, J=7,02 Гц, 3H) 1,01 (с, 3H) 1,10 (д, J=7,43 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,02 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,18-1,20 (м, 6H) 1,21-1,26 (м, 1H) 1,24 (д, J=6,19 Гц, 3H) 1,39 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,52-1,68 (м, 4H) 1,72-1,76 (м, 2H) 1,85-1,93 (м, 4H) 1,96-2,05 (м, 4H) 2,07 (д, J=14,86 Гц, 1H) 2,13-2,20 (м, 1H) 2,23-2,28 (м, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,33 (с, 3H) 2,37-2,53 (м, 6H) 2,54-2,62 (м, 2H) 2,84 (д, J=14,86 Гц, 1H) 2,89-2,93 (м, 1H) 2,93 (с, 3H) 3,04 (с, 3H) 3,08-3,20 (м, 5H) 3,28 (с, 3H) 3,43-3,49 (м, 2H) 3,63 (с, 1H) 3,68 (д, J=7,43 Гц, 1H) 3,69-3,76 (м, 2H) 3,86-3,93 (м, 1H) 4,09 (кв, J=6,19 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,02 Гц, 1H) 4,86-4,92 (м, 1H) 4,99 (д, J=4,95 Гц, 1H)

Таблиця 20-3

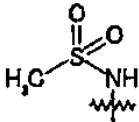
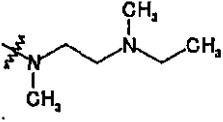
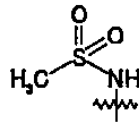
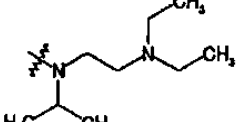
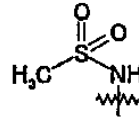
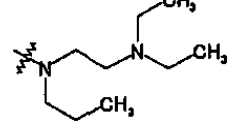
При- клад	R ^{29d}	R ^{1f}	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
419			1049,6	(600 МГц): 0,84 (т, J=7,22 Гц, 3H) 0,98-1,04 (м, 12H) 1,10 (д, J=7,43 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,02 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,18-1,24 (м, 7H) 1,23 (д, J=6,19 Гц, 3H) 1,39 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,52-1,59 (м, 1H) 1,62-1,66 (м, 1H) 1,71-1,75 (м, 2H) 1,86-1,94 (м, 2H) 1,97-2,02 (м, 2H) 2,13-2,19 (м, 2H) 2,22-2,28 (м, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,39-2,44 (м, 1H) 2,45-2,63 (м, 9H) 2,66-2,75 (м, 2H) 2,87 (д, J=14,86 Гц, 1H) 2,89-2,93 (м, 1H) 2,93 (с, 3H) 3,03 (с, 3H) 3,07-3,21 (м, 4H) 3,28 (с, 3H) 3,44 (с, 1H) 3,45-3,53 (м, 1H) 3,64 (с, 1H) 3,67-3,70 (м, 2H) 3,71-3,75 (м, 1H) 3,87-3,94 (м, 1H) 4,06-4,12 (м, 1H) 4,43 (д, J=7,43 Гц, 1H) 4,89 (дд, J=10,94, 2,27 Гц, 1H) 4,98 (д, J=4,54 Гц, 1H)
420			1035,6	(500 МГц): 0,84 (т, J=7,45 Гц, 3H) 0,88 (т, J=7,26 Гц, 3H) 1,00 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,10 (д, J=7,64 Гц, 3H) 1,13 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,15-1,27 (м, 1H) 1,17 (с, 3H) 1,18-1,20 (м, 6H) 1,24 (д, J=6,12 Гц, 3H) 1,39 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,46-1,52 (м, 2H) 1,51-1,59 (м, 1H) 1,67 (д, J=13,00 Гц, 1H) 1,72-1,76 (м, 2H) 1,84-1,96 (м, 2H) 1,98-2,05 (м, 2H) 2,11 (д, J=14,91 Гц, 1H) 2,13-2,20 (м, 1H) 2,24 (с, 3H) 2,24-2,30 (м, 1H) 2,30 (с, 6H) 2,30-2,35 (м, 2H) 2,35 (с, 3H) 2,37-2,48 (м, 3H) 2,49-2,56 (м, 1H) 2,56-2,66 (м, 2H) 2,83 (д, J=14,91 Гц, 1H) 2,87-2,93 (м, 1H) 2,93 (с, 3H) 3,03 (с, 3H) 3,07-3,21 (м, 4H) 3,28 (с, 3H) 3,43-3,50 (м, 1H) 3,63 (с, 1H) 3,67-3,76 (м, 3H) 3,86-3,94 (м, 1H) 4,10 (кв, J=6,12 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,89 (дд, J=10,89, 2,10 Гц, 1H) 4,98 (д, J=4,59 Гц, 1H)
421			1047,8	(500 МГц): 0,08-0,12 (м, 2H) 0,48-0,53 (м, 2H) 0,84 (т, J=7,45 Гц, 3H) 0,85-0,91 (м, 1H) 1,00 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,10 (д, J=7,64 Гц, 3H) 1,13 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,16-1,26 (м, 1H) 1,17 (с, 3H) 1,18-1,21 (м, 6H) 1,24 (д, J=6,12 Гц, 3H) 1,39 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,56 (д, J=11,08 Гц, 1H) 1,66 (д, J=13,76 Гц, 1H) 1,71-1,77 (м, 2H) 1,85-1,96 (м, 2H) 1,98-2,04 (м, 2H) 2,13 (д, J=14,91 Гц, 1H) 2,13-2,20 (м, 1H) 2,22-2,32 (м, 3H) 2,29 (с, 6H) 2,31 (с, 3H) 2,35 (с, 3H) 2,40-2,66 (м, 6H) 2,83 (д, J=14,52 Гц, 1H) 2,88-2,94 (м, 1H) 2,93 (с, 3H) 3,03 (с, 3H) 3,07-3,21 (м, 4H) 3,28 (с, 3H) 3,43-3,52 (м, 1H) 3,63 (с, 1H) 3,67-3,76 (м, 3H) 3,86-3,93 (м, 1H) 4,09-4,14 (м, 1H) 4,41 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,89 (дд, J=10,89, 2,10 Гц, 1H) 4,98 (д, J=4,59 Гц, 1H)

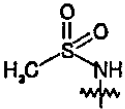
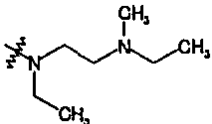
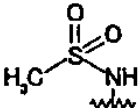
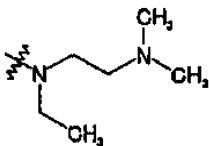
422			1021,7	(500 МГц): 0,84 (т, J=7,26 Гц, 3H) 0,88 (т, J=7,45 Гц, 3H) 1,02 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,09 (д, J=7,26 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,26 Гц, 3H) 1,15-1,26 (м, 1H) 1,17 (с, 3H) 1,18-1,22 (м, 6H) 1,23 (д, J=6,12 Гц, 3H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,44-1,57 (м, 3H) 1,66 (д, J=14,14 Гц, 1H) 1,73-1,77 (м, 2H) 1,82-1,91 (м, 2H) 1,94-2,05 (м, 2H) 2,11 (д, J=14,52 Гц, 1H) 2,23 (с, 3H) 2,29 (с, 6H) 2,29-2,33 (м, 2H) 2,34 (с, 3H) 2,37-2,48 (м, 3H) 2,49-2,55 (м, 1H) 2,56-2,65 (м, 2H) 2,83 (д, J=14,52 Гц, 1H) 2,86-2,93 (м, 1H) 3,02 (с, 3H) 3,08 (с, 3H) 3,06-3,12 (м, 1H) 3,18 (дд, J=10,32, 7,26 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,41-3,50 (м, 2H) 3,51-3,59 (м, 1H) 3,63 (с, 1H) 3,69-3,73 (м, 2H) 4,00-4,18 (м, 3H) 4,42 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,94-5,00 (м, 2H)
423			1033,7	(500 МГц): 0,10 (кв, J=4,97 Гц, 2H) 0,48-0,53 (м, 2H) 0,84 (т, J=7,45 Гц, 3H) 0,83-0,93 (м, 1H) 1,02 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,09 (д, J=7,26 Гц, 3H) 1,13 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,16-1,27 (м, 1H) 1,17 (с, 3H) 1,18-1,21 (м, 6H) 1,23 (д, J=5,73 Гц, 3H) 1,39 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,49-1,58 (м, 1H) 1,66 (д, J=12,61 Гц, 1H) 1,73-1,76 (м, 2H) 1,81-1,91 (м, 2H) 1,94-2,06 (м, 2H) 2,13 (д, J=14,52 Гц, 1H) 2,25-2,30 (м, 2H) 2,29 (с, 6H) 2,31 (с, 3H) 2,35 (с, 3H) 2,40-2,67 (м, 6H) 2,83 (д, J=14,52 Гц, 1H) 2,86-2,93 (м, 1H) 3,02 (с, 3H) 3,06-3,11 (м, 1H) 3,07 (с, 3H) 3,18 (дд, J=10,32, 7,26 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,40-3,50 (м, 2H) 3,51-3,59 (м, 1H) 3,63 (с, 1H) 3,68-3,74 (м, 2H) 4,00-4,18 (м, 3H) 4,42 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,93-5,01 (м, 2H)
424			1021,8	(499 МГц): 0,84 (т, J=7,27 Гц, 3H) 0,96-1,27 (м, 28H) 1,39 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,47-2,14 (м, 9H) 2,22 (с, 3H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,36-2,64 (м, 6H) 2,79-2,94 (м, 3H) 3,00-3,13 (м, 7H) 3,15-3,21 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,40-3,59 (м, 3H) 3,63 (с, 1H) 3,68-3,74 (м, 2H) 3,98-4,20 (м, 3H) 4,42 (д, J=7,40 Гц, 1H) 4,92-5,02 (м, 2H)
425			1035,8	(499 МГц): 0,80-0,90 (м, 6H) 0,98-1,28 (м, 25H) 1,36-1,59 (м, 9H) 1,62-1,78 (м, 3H) 1,81-2,12 (м, 5H) 2,29 (с, 6H) 2,32-2,65 (м, 13H) 2,80-2,94 (м, 2H) 3,02 (с, 3H) 3,05-3,12 (м, 4H) 3,15-3,21 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,39-3,59 (м, 3H) 3,63 (с, 1H) 3,67-3,74 (м, 2H) 4,00-4,19 (м, 3H) 4,41 (д, J=7,40 Гц, 1H) 4,93-5,02 (м, 2H)
426			1049,8	(499 МГц): 0,84 (т, J=7,27 Гц, 3H) 0,98-1,27 (м, 34H) 1,39 (с, 3H) 1,41 (с, 3H) 1,48-1,77 (м, 4H) 1,80-2,07 (м, 6H) 2,29 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,39-2,66 (м, 6H) 2,81-2,95 (м, 2H) 2,96-3,21 (м, 10H) 3,28 (с, 3H) 3,39-3,59 (м, 3H) 3,63 (с, 1H) 3,67-3,75 (м, 2H) 4,00-4,18 (м, 3H) 4,41 (д, J=7,40 Гц, 1H) 4,93-5,02 (м, 2H)

427			1035,7	(600 МГц): 0,84 (т, J=7,43 Гц, 3H) 0,99-1,04 (м, 12H) 1,10 (д, J=7,43 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,43 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,18-1,27 (м, 7H) 1,23 (д, J=6,19 Гц, 3H) 1,39 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,49-1,58 (м, 1H) 1,61-1,67 (м, 1H) 1,72-1,76 (м, 2H) 1,82-1,92 (м, 2H) 1,97-2,01 (м, 2H) 2,17 (д, J=14,86 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,40-2,64 (м, 10H) 2,65-2,76 (м, 2H) 2,86 (д, J=14,86 Гц, 1H) 2,88-2,93 (м, 1H) 3,02 (с, 3H) 3,07 (с, 3H) 3,07-3,11 (м, 1H) 3,16-3,21 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,41-3,47 (м, 2H) 3,48-3,52 (м, 1H) 3,52-3,58 (м, 1H) 3,63 (с, 1H) 3,69-3,73 (м, 2H) 4,00-4,17 (м, 3H) 4,43 (д, J=7,02 Гц, 1H) 4,94-5,00 (м, 2H)
-----	--	--	--------	--

Таблица 20-4

При-клад	R ^{29d}	R ^{1f}	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
428			1033,7	(600 МГц): 0,84 (т, J=7,43 Гц, 3H) 1,03 (д, J=6,61 Гц, 3H) 1,10 (д, J=7,43 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,02 Гц, 3H) 1,17 (с, 3H) 1,19-1,22 (м, 6H) 1,19-1,25 (м, 1H) 1,24 (д, J=5,78 Гц, 3H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,48-1,56 (м, 1H) 1,56-1,70 (м, 3H) 1,73-1,77 (м, 2H) 1,82-1,92 (м, 4H) 1,96-2,05 (м, 4H) 2,07-2,13 (м, 1H) 2,09 (с, 3H) 2,23-2,32 (м, 2H) 2,29 (с, 6H) 2,33 (с, 3H) 2,41-2,46 (м, 1H) 2,48-2,54 (м, 1H) 2,54-2,63 (м, 2H) 2,77-2,83 (м, 1H) 2,84 (д, J=14,45 Гц, 1H) 2,87-2,92 (м, 1H) 3,02 (с, 3H) 3,06-3,11 (м, 1H) 3,07 (с, 3H) 3,18 (дд, J=10,32, 7,43 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,41-3,49 (м, 3H) 3,51-3,59 (м, 1H) 3,63 (с, 1H) 3,69-3,74 (м, 2H) 4,01-4,17 (м, 3H) 4,42 (д, J=7,43 Гц, 1H) 4,96 (дд, J=10,73, 2,06 Гц, 1H) 4,98-5,01 (м, 1H)
429			1047,7	(600 МГц): 0,84 (т, J=7,43 Гц, 3H) 0,98 (т, J=7,02 Гц, 3H) 1,03 (д, J=6,61 Гц, 3H) 1,10 (д, J=7,43 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,02 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,18-1,21 (м, 6H) 1,18-1,27 (м, 1H) 1,24 (д, J=5,78 Гц, 3H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,48-1,68 (м, 4H) 1,73-1,77 (м, 2H) 1,83-1,93 (м, 4H) 1,95-2,04 (м, 4H) 2,07 (д, J=14,86 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,33 (с, 3H) 2,38-2,63 (м, 8H) 2,84 (д, J=14,86 Гц, 1H) 2,88-2,92 (м, 1H) 3,02 (с, 3H) 3,05-3,14 (м, 2H) 3,07 (с, 3H) 3,18 (дд, J=10,11, 7,22 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,41-3,49 (м, 3H) 3,51-3,58 (м, 1H) 3,63 (с, 1H) 3,70 (д, J=7,02 Гц, 1H) 3,72 (д, J=9,91 Гц, 1H) 4,02-4,17 (м, 3H) 4,41 (д, J=7,02 Гц, 1H) 4,96 (дд, J=10,94, 1,86 Гц, 1H) 5,00 (д, J=4,13 Гц, 1H)

430			1022,6	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,26 Гц, 3H) 1,00-1,07 (м, 6H) 1,11 (д, J=7,26 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,26 Гц, 3H) 1,17 (с, 3H) 1,19-1,22 (м, 6H) 1,20-1,26 (м, 1H) 1,23 (д, J=6,12 Гц, 3H) 1,40 (с, 6H) 1,52-1,61 (м, 1H) 1,65 (д, J=11,80 Гц, 1H) 1,71-1,77 (м, 2H) 1,84-1,98 (м, 2H) 1,97-2,02 (м, 2H) 2,13 (д, J=14,91 Гц, 1H) 2,23 (с, 3H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,36-2,48 (м, 5H) 2,49-2,56 (м, 1H) 2,56-2,66 (м, 2H) 2,83 (д, J=14,52 Гц, 1H) 2,89-2,96 (м, 1H) 2,98 (с, 3H) 3,05 (с, 3H) 3,09-3,14 (м, 1H) 3,18 (дд, J=10,32, 7,26 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,29-3,37 (м, 1H) 3,42-3,50 (м, 2H) 3,51-3,56 (м, 1H) 3,59 (с, 1H) 3,69 (д, J=9,94 Гц, 1H) 3,72 (д, J=7,26 Гц, 1H) 3,76-3,84 (м, 1H) 3,84-3,92 (м, 1H) 4,10 (кв, J=6,50 Гц, 1H) 4,42 (д, J=6,88 Гц, 1H) 4,93-5,00 (м, 2H) 5,54 (т, J=5,73 Гц, 1H)
431			1064,7	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,43 Гц, 3H) 0,99-1,04 (м, 15H) 1,10 (д, J=7,43 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,43 Гц, 3H) 1,19-1,26 (м, 13H) 1,39 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,53-1,60 (м, 1H) 1,61-1,65 (м, 1H) 1,73 (д, J=6,61 Гц, 2H) 1,83-1,89 (м, 1H) 1,90-1,95 (м, 1H) 1,96-1,99 (м, 2H) 2,25-2,29 (м, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,41-2,63 (м, 10H) 2,88-2,96 (м, 3H) 2,98 (с, 3H) 3,04 (с, 3H) 3,11 (кв, J=6,74 Гц, 1H) 3,16-3,21 (м, 1H) 3,27 (с, 3H) 3,30-3,35 (м, 1H) 3,41-3,48 (м, 1H) 3,51-3,57 (м, 2H) 3,60 (с, 1H) 3,63-3,66 (м, 1H) 3,75 (д, J=6,61 Гц, 1H) 3,77-3,82 (м, 1H) 3,84-3,91 (м, 1H) 4,10 (кв, J=6,19 Гц, 1H) 4,46 (д, J=7,43 Гц, 1H) 4,94-4,98 (м, 2H) 5,55 (т, J=5,78 Гц, 1H)
432			1064,7	(600 МГц): 0,83-0,87 (м, 3H) 0,92 (т, J=7,43 Гц, 3H) 0,99-1,04 (м, 9H) 1,10 (д, J=7,43 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,43 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,17-1,25 (м, 1H) 1,18-1,22 (м, 6H) 1,23 (д, J=6,19 Гц, 3H) 1,40 (с, 6H) 1,48-1,65 (м, 4H) 1,73 (д, J=6,61 Гц, 2H) 1,83-1,90 (м, 1H) 1,90-1,97 (м, 1H) 1,97-2,03 (м, 2H) 2,19 (д, J=14,86 Гц, 1H) 2,28 (с, 6H) 2,40-2,46 (м, 1H) 2,46-2,61 (м, 9H) 2,62-2,64 (м, 1H) 2,65-2,69 (м, 1H) 2,88-2,95 (м, 2H) 2,98 (с, 3H) 3,05 (с, 3H) 3,09-3,14 (м, 1H) 3,15-3,21 (м, 1H) 3,27 (с, 3H) 3,28-3,34 (м, 1H) 3,45 (с, 1H) 3,47-3,57 (м, 2H) 3,59 (с, 1H) 3,67 (д, J=9,91 Гц, 1H) 3,72 (д, J=7,02 Гц, 1H) 3,77-3,83 (м, 1H) 3,85-3,91 (м, 1H) 4,06-4,11 (м, 1H) 4,43 (д, J=7,43 Гц, 1H) 4,93-4,99 (м, 2H)

433			1036,7	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,22 Гц, 3H) 0,98-1,07 (м, 9H) 1,11 (д, J=7,43 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,02 Гц, 3H) 1,15-1,25 (м, 1H) 1,18 (с, 3H) 1,19-1,22 (м, 6H) 1,23 (д, J=6,19 Гц, 3H) 1,40 (с, 6H) 1,53-1,60 (м, 1H) 1,63-1,66 (м, 1H) 1,74 (д, J=6,61 Гц, 2H) 1,84-1,90 (м, 1H) 1,90-1,96 (м, 1H) 1,98-2,00 (м, 2H) 2,19-2,22 (м, 1H) 2,22 (с, 3H) 2,29 (с, 6H) 2,34-2,47 (м, 5H) 2,57-2,65 (м, 3H) 2,66-2,73 (м, 2H) 2,86 (д, J=14,86 Гц, 1H) 2,91-2,95 (м, 1H) 2,98 (с, 3H) 3,05 (с, 3H) 3,12 (кв, J=6,88 Гц, 1H) 3,16-3,21 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,29-3,34 (м, 1H) 3,45 (ушир. с, 1H) 3,47-3,57 (м, 2H) 3,59 (с, 1H) 3,67 (д, J=9,91 Гц, 1H) 3,73 (д, J=7,02 Гц, 1H) 3,78-3,82 (м, 1H) 3,85-3,91 (м, 1H) 4,10 (кв, J=6,19 Гц, 1H) 4,44 (д, J=7,43 Гц, 1H) 4,94-4,99 (м, 2H) 5,53-5,56 (м, 1H)
434			1022,6	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,43 Гц, 3H) 0,98-1,03 (м, 6H) 1,11 (д, J=7,43 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,02 Гц, 3H) 1,15-1,25 (м, 1H) 1,18 (с, 3H) 1,19-1,22 (м, 6H) 1,23 (д, J=6,19 Гц, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,40-1,40 (м, 3H) 1,54-1,59 (м, 1H) 1,64 (д, J=12,39 Гц, 1H) 1,73 (д, J=6,61 Гц, 2H) 1,84-1,88 (м, 1H) 1,90-1,97 (м, 1H) 1,97-2,00 (м, 2H) 2,20-2,26 (м, 1H) 2,22 (с, 6H) 2,29 (с, 6H) 2,32-2,41 (м, 2H) 2,42-2,48 (м, 1H) 2,55-2,64 (м, 3H) 2,65-2,72 (м, 2H) 2,85 (д, J=14,86 Гц, 1H) 2,90-2,96 (м, 1H) 2,98 (с, 3H) 3,05 (с, 3H) 3,12 (кв, J=7,02 Гц, 1H) 3,17-3,21 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,29-3,35 (м, 1H) 3,42-3,46 (м, 1H) 3,48-3,57 (м, 2H) 3,59 (с, 1H) 3,67 (д, J=9,91 Гц, 1H) 3,74 (д, J=7,02 Гц, 1H) 3,77-3,83 (м, 1H) 3,84-3,91 (м, 1H) 4,11 (кв, J=6,19 Гц, 1H) 4,44 (д, J=7,43 Гц, 1H) 4,93-4,98 (м, 2H) 5,54 (т, J=5,78 Гц, 1H)

Таблиця 20-5

При- клад	R ^{29d}	R ^{1f}	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
435			1050,7	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,43 Гц, 3H) 0,97-1,01 (м, 9H) 1,02 (д, J=6,61 Гц, 3H) 1,11 (д, J=7,43 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,02 Гц, 3H) 1,15-1,25 (м, 1H) 1,18 (с, 3H) 1,19-1,22 (м, 6H) 1,23 (д, J=5,78 Гц, 3H) 1,40 (с, 6H) 1,54-1,60 (м, 1H) 1,61-1,66 (м, 1H) 1,73 (д, J=6,61 Гц, 2H) 1,83-1,88 (м, 1H) 1,89-1,96 (м, 1H) 1,97-2,01 (м, 2H) 2,17-2,19 (м, 1H) 2,18-2,20 (м, 3H) 2,29 (с, 6H) 2,34-2,47 (м, 3H) 2,56-2,62 (м, 3H) 2,65-2,74 (м, 2H) 2,80-2,86 (м, 1H) 2,87 (д, J=14,45 Гц, 1H) 2,91-2,95 (м, 1H) 2,98 (с, 3H) 3,05 (с, 3H) 3,12 (кв, J=6,74 Гц, 1H) 3,16-3,21 (м, 1H) 3,26-3,29 (м, 3H) 3,28-3,36 (м, 1H) 3,44 (с, 1H) 3,48-3,57 (м, 2H) 3,59 (с, 1H) 3,67 (д, J=9,50 Гц, 1H) 3,73 (д, J=7,43 Гц, 1H) 3,77-3,82 (м, 1H) 3,84-3,90 (м, 1H) 4,09 (кв, J=6,19 Гц, 1H) 4,44 (д, J=7,02 Гц, 1H) 4,96 (дд, J=10,94, 1,86 Гц, 1H) 4,97-5,00 (м, 1H) 5,54 (т, J=5,78 Гц, 1H)
436			1062,7	(600 МГц): 0,10 (д, J=4,13 Гц, 2H) 0,50 (д, J=7,84 Гц, 2H) 0,86 (т, J=7,22 Гц, 3H) 0,86-0,91 (м, 1H) 0,99-1,03 (м, 6H) 1,11 (д, J=7,84 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,02 Гц, 3H) 1,15-1,24 (м, 1H) 1,18 (с, 3H) 1,19-1,22 (м, 6H) 1,23 (д, J=6,19 Гц, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,52-1,60 (м, 1H) 1,62-1,66 (м, 1H) 1,73 (д, J=6,61 Гц, 2H) 1,82-1,90 (м, 1H) 1,90-1,97 (м, 1H) 1,97-2,00 (м, 2H) 2,21 (д, J=14,86 Гц, 1H) 2,26-2,30 (м, 2H) 2,29 (с, 6H) 2,30 (ушир. с, 3H) 2,41-2,52 (м, 3H) 2,56-2,61 (м, 1H) 2,63-2,75 (м, 4H) 2,87 (д, J=14,86 Гц, 1H) 2,91-2,95 (м, 1H) 2,98 (с, 3H) 3,05 (с, 3H) 3,12 (кв, J=6,88 Гц, 1H) 3,16-3,22 (м, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,29-3,36 (м, 1H) 3,42-3,47 (м, 1H) 3,48-3,57 (м, 2H) 3,59 (с, 1H) 3,67 (д, J=9,91 Гц, 1H) 3,74 (д, J=7,02 Гц, 1H) 3,77-3,82 (м, 1H) 3,84-3,91 (м, 1H) 4,10 (кв, J=6,19 Гц, 1H) 4,44 (д, J=7,43 Гц, 1H) 4,94-4,99 (м, 2H) 5,54 (т, J=5,78 Гц, 1H)

437			1050,7 (600 МГц): 0,84-0,89 (м, 6H) 1,00 (т, J=7,02 Гц, 3H) 1,02 (д, J=6,61 Гц, 3H) 1,11 (д, J=7,43 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,43 Гц, 3H) 1,15-1,26 (м, 1H) 1,17 (с, 3H) 1,18-1,22 (м, 6H) 1,23 (д, J=6,19 Гц, 3H) 1,40 (с, 6H) 1,46-1,51 (м, 2H) 1,53-1,60 (м, 1H) 1,62-1,67 (м, 1H) 1,73 (д, J=6,61 Гц, 2H) 1,84-1,90 (м, 1H) 1,90-1,97 (м, 1H) 1,98-2,00 (м, 2H) 2,19 (д, J=15,28 Гц, 1H) 2,22 (с, 3H) 2,29 (с, 6H) 2,29-2,33 (м, 2H) 2,34-2,48 (м, 3H) 2,56-2,65 (м, 3H) 2,66-2,73 (м, 2H) 2,86 (д, J=14,86 Гц, 1H) 2,89-2,96 (м, 1H) 2,98 (с, 3H) 3,05 (с, 3H) 3,12 (кв, J=6,88 Гц, 1H) 3,16-3,22 (м, 1H) 3,25-3,29 (м, 3H) 3,29-3,37 (м, 1H) 3,44 (с, 1H) 3,48-3,56 (м, 2H) 3,59 (с, 1H) 3,67 (д, J=9,91 Гц, 1H) 3,73 (с, 1H) 3,77-3,83 (м, 1H) 3,85-3,91 (м, 1H) 4,10 (кв, J=6,19 Гц, 1H) 4,43 (д, J=7,02 Гц, 1H) 4,93-5,00 (м, 2H) 5,64 (т, J=5,78 Гц, 1H)
438			1064,7 (499 МГц): 0,83-0,89 (м, 6H) 0,99-1,03 (м, 9H) 1,08-1,25 (м, 1H) 1,11 (д, J=7,40 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,13 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,19 (д, J=6,31 Гц, 3H) 1,21 (д, J=7,13 Гц, 3H) 1,23 (д, J=6,03 Гц, 3H) 1,40 (с, 6H) 1,42-1,51 (м, 2H) 1,53-1,60 (м, 1H) 1,64 (д, J=12,34 Гц, 1H) 1,74 (д, J=6,58 Гц, 2H) 1,84-1,98 (м, 2H) 1,98-2,05 (м, 2H) 2,16 (д, J=14,81 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,35-2,55 (м, 7H) 2,56-2,64 (м, 3H) 2,66-2,76 (м, 2H) 2,87 (д, J=14,81 Гц, 1H) 2,91-2,98 (м, 1H) 2,98 (с, 3H) 3,05 (с, 3H) 3,12 (кв, J=6,86 Гц, 1H) 3,18 (дд, J=10,28, 7,27 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,27-3,37 (м, 1H) 3,42-3,56 (м, 3H) 3,59 (с, 1H) 3,68 (д, J=9,87 Гц, 1H) 3,72 (д, J=7,13 Гц, 1H) 3,76-3,83 (м, 1H) 3,84-3,94 (м, 1H) 4,10 (кв, J=6,22 Гц, 1H) 4,43 (д, J=7,40 Гц, 1H) 4,92-5,01 (м, 2H) 5,55 (т, J=5,48 Гц, 1H)
439			1078,7 (600 МГц): 0,86 (т, J=7,22 Гц, 3H) 0,98-1,03 (м, 18H) 1,09-1,14 (м, 9H) 1,17 (д, J=6,19 Гц, 3H) 1,17-1,24 (м, 1H) 1,21 (д, J=7,02 Гц, 3H) 1,23 (д, J=6,19 Гц, 3H) 1,40 (с, 6H) 1,53-1,61 (м, 1H) 1,62-1,66 (м, 1H) 1,74 (д, J=5,78 Гц, 2H) 1,84-1,89 (м, 1H) 1,90-1,95 (м, 1H) 1,96-2,06 (м, 2H) 2,10 (д, J=14,86 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,41-2,50 (м, 3H) 2,57 (т, J=7,02 Гц, 3H) 2,69-2,79 (м, 2H) 2,87 (д, J=14,86 Гц, 1H) 2,91-3,02 (м, 3H) 2,98 (с, 3H) 3,05 (с, 3H) 3,12 (кв, J=6,74 Гц, 1H) 3,16-3,20 (м, 1H) 3,27-3,29 (м, 3H) 3,28-3,36 (м, 1H) 3,44-3,49 (м, 2H) 3,50-3,57 (м, 1H) 3,59 (5,1H) 3,68-3,72 (м, 2H) 3,78-3,82 (м, 1H) 3,84-3,91 (м, 1H) 4,09 (кв, J=6,19 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,43 Гц, 1H) 4,96 (дд, J=11,15, 2,06 Гц, 1H) 4,99 (д, J=4,95 Гц, 1H) 5,54 (т, J=5,78 Гц, 1H)

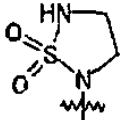
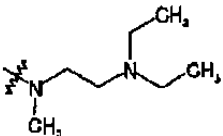
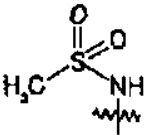
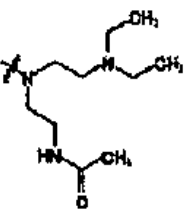
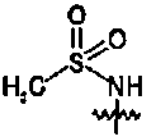
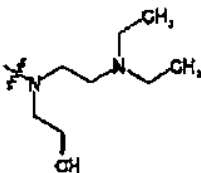
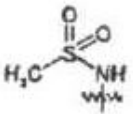
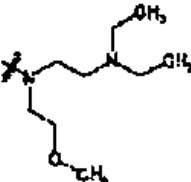
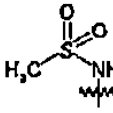
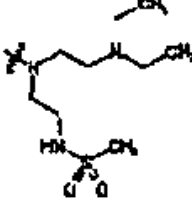
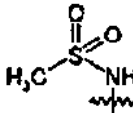
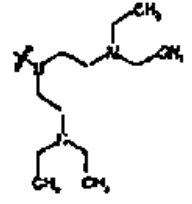
440			1063,7	(600 МГц): 0,84 (т, J=7,43 Гц, 3H) 0,99-1,04 (м, 9H) 1,10 (д, J=7,43 Гц, 3H) 1,14 (д, J=7,02 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,17-1,26 (м, 1H) 1,18-1,21 (м, 6H) 1,23 (д, J=5,78 Гц, 3H) 1,39 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,47-1,55 (м, 1H) 1,63-1,68 (м, 1H) 1,70-1,81 (м, 2H) 1,86-1,94 (м, 2H) 1,96-2,05 (м, 2H) 2,09 (д, J=14,86 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,40-2,61 (м, 10H) 2,84 (д, J=14,86 Гц, 1H) 2,88-2,95 (м, 1H) 3,04 (с, 3H) 3,07-3,12 (м, 1H) 3,13-3,22 (м, 2H) 3,28 (с, 3H) 3,37-3,41 (м, 1H) 3,42-3,51 (м, 4H) 3,52-3,58 (м, 1H) 3,62 (с, 1H) 3,64-3,71 (м, 4H) 3,88-3,96 (м, 1H) 4,06-4,13 (м, 1H) 4,41 (д, J=7,43 Гц, 1H) 4,64-4,74 (м, 1H) 4,98 (д, J=4,54 Гц, 1H) 5,29 (дд, J=10,94, 2,27 Гц, 1H)
441			1107,7	(499 МГц): 0,86 (т, J=7,27 Гц, 3H) 1,00-1,05 (м, 9H) 1,10 (д, J=7,40 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,13 Гц, 3H) 1,16-1,26 (м, 13H) 1,40 (с, 6H) 1,53-1,61 (м, 1H) 1,66-1,70 (м, 1H) 1,72-1,76 (м, 2H) 1,84-1,88 (м, 1H) 1,89-1,95 (м, 1H) 1,95-2,03 (м, 2H) 1,96 (с, 3H) 2,25-2,31 (м, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,39-2,61 (м, 8H) 2,67-2,73 (м, 2H) 2,73-2,79 (м, 2H) 2,90-2,95 (м, 1H) 2,97-3,02 (м, 1H) 2,97-3,00 (м, 3H) 3,04 (с, 3H) 3,12 (кв, J=6,86 Гц, 1H) 3,19 (дд, J=10,28, 7,27 Гц, 1H) 3,27 (с, 3H) 3,29-3,49 (м, 5H) 3,50-3,57 (м, 1H) 3,59 (с, 1H) 3,67 (д, J=9,87 Гц, 1H) 3,71 (д, J=7,13 Гц, 1H) 3,75-3,83 (м, 1H) 3,83-3,92 (м, 1H) 4,08-4,14 (м, 1H) 4,39 (д, J=7,13 Гц, 1H) 4,93-4,98 (м, 2H) 5,52-5,57 (м, 1H) 6,18-6,24 (м, 1H)

Таблица 20-6

При-клад	R ^{29d}	R ^{1f}	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
442			1066,7	(499 МГц): 0,86 (т, J=7,40 Гц, 3H) 1,01-1,06 (м, 9H) 1,11 (д, J=7,68 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,13 Гц, 3H) 1,17-1,26 (м, 1H) 1,18-1,22 (м, 9H) 1,23 (д, J=6,03 Гц, 3H) 1,40 (с, 6H) 1,53-1,61 (м, 1H) 1,66 (д, J=11,79 Гц, 1H) 1,74 (д, J=6,31 Гц, 2H) 1,83-1,90 (м, 1H) 1,90-1,97 (м, 1H) 1,99-2,05 (м, 2H) 2,29 (с, 6H) 2,29-2,35 (м, 1H) 2,40-2,47 (м, 1H) 2,48-2,64 (м, 7H) 2,74-2,86 (м, 4H) 2,91-2,96 (м, 1H) 2,98 (с, 3H) 3,05 (с, 3H) 3,05-3,09 (м, 1H) 3,12 (кв, J=6,86 Гц, 1H) 3,18 (дд, J=10,28, 7,27 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,28-3,36 (м, 1H) 3,40-3,49 (м, 2H) 3,50-3,58 (м, 1H) 3,59 (с, 1H) 3,65-3,72 (м, 4H) 3,75-3,83 (м, 1H) 3,83-3,91 (м, 1H) 4,12 (кв, J=6,31 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,40 Гц, 1H) 4,93-4,99 (м, 2H) 5,50-5,57 (м, 1H)

443			1080,7	(499 МГц): 0,86 (т, J=7,27 Гц, 3H) 0,99-1,05 (м, 9H) 1,10 (д, J=7,40 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,13 Гц, 3H) 1,18 (с, 3H) 1,19-1,27 (м, 1H) 1,19-1,22 (м, 6H) 1,23 (д, J=6,31 Гц, 3H) 1,40 (с, 6H) 1,53-1,61 (м, 1H) 1,61-1,67 (м, 1H) 1,74 (д, J=6,58 Гц, 2H) 1,83-1,88 (м, 1H) 1,89-1,96 (м, 1H) 1,98-2,01 (м, 2H) 2,27-2,32 (м, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,40-2,61 (м, 8H) 2,70 (т, J=6,03 Гц, 2H) 2,84 (кв, J=5,48 Гц, 2H) 2,91-2,95 (м, 1H) 2,97-3,02 (м, 1H) 2,98 (с, 3H) 3,05 (с, 3H) 3,09-3,14 (м, 1H) 3,16-3,20 (м, 1H) 3,27 (с, 3H) 3,30-3,36 (м, 1H) 3,33 (с, 3H) 3,42-3,57 (м, 5H) 3,59 (с, 1H) 3,67 (д, J=9,87 Гц, 1H) 3,73 (д, J=7,13 Гц, 1H) 3,76-3,83 (м, 1H) 3,84-3,91 (м, 1H) 4,08 (кв, J=6,12 Гц, 1H) 4,43 (д, J=7,40 Гц, 1H) 4,93-5,00 (м, 2H) 5,55 (т, J=5,76 Гц, 1H)
444			1143,7	(500 МГц): 0,86 (т, J=7,26 Гц, 3H) 1,00-1,06 (м, 9H) 1,10 (д, J=7,64 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,26 Гц, 3H) 1,16-1,28 (м, 1H) 1,19-1,22 (м, 9H) 1,24 (д, J=6,12 Гц, 3H) 1,40 (с, 6H) 1,52-1,61 (м, 1H) 1,67-1,71 (м, 1H) 1,72-1,79 (м, 2H) 1,84-1,89 (м, 1H) 1,89-1,95 (м, 1H) 1,96-2,05 (м, 2H) 2,27-2,30 (м, 6H) 2,33 (д, J=14,91 Гц, 1H) 2,39-2,63 (м, 8H) 2,71-2,77 (м, 2H) 2,81-2,87 (м, 2H) 2,90-2,95 (м, 1H) 2,93 (с, 3H) 2,96-3,02 (м, 1H) 2,99 (с, 3H) 3,04 (с, 3H) 3,11 (кв, J=6,88 Гц, 1H) 3,16-3,25 (м, 3H) 3,28-3,30 (м, 3H) 3,29-3,38 (м, 1H) 3,40-3,48 (м, 2H) 3,50-3,57 (м, 1H) 3,58 (с, 1H) 3,65-3,72 (м, 2H) 3,75-3,90 (м, 2H) 4,13 (кв, J=6,37 Гц, 1H) 4,39 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,94-4,97 (м, 2H) 5,51-5,56 (м, 1H)
445			1121,7	(500 МГц): 0,85 (т, J=7,45 Гц, 3H) 0,99-1,04 (м, 15H) 1,10 (д, J=7,64 Гц, 3H) 1,13 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,16-1,28 (м, 1H) 1,18-1,22 (м, 9H) 1,23 (д, J=6,12 Гц, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,52-1,61 (м, 1H) 1,64 (д, J=11,47 Гц, 1H) 1,73 (д, J=6,12 Гц, 2H) 1,83-1,88 (м, 1H) 1,89-1,96 (м, 1H) 1,97-2,02 (м, 2H) 2,23 (д, J=14,91 Гц, 1H) 2,28 (с, 6H) 2,40-2,46 (м, 1H) 2,46-2,57 (м, 12H) 2,57-2,62 (м, 1H) 2,63-2,74 (м, 4H) 2,88-3,02 (м, 2H) 2,98 (с, 3H) 3,05 (с, 3H) 3,09-3,14 (м, 1H) 3,18 (дд, J=10,32, 7,26 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,30-3,36 (м, 1H) 3,44 (с, 1H) 3,46-3,56 (м, 2H) 3,59 (с, 1H) 3,67 (д, J=9,94 Гц, 1H) 3,73 (д, J=6,88 Гц, 1H) 3,76-3,84 (м, 1H) 3,84-3,92 (м, 1H) 4,07 (кв, J=5,73 Гц, 1H) 4,43 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,94-4,99 (м, 2H) 5,52-5,58 (м, 1H)

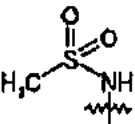
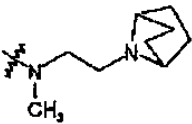
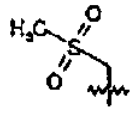
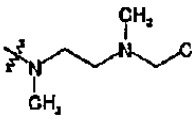
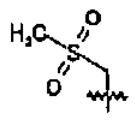
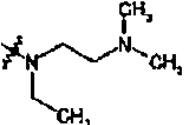
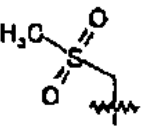

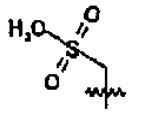

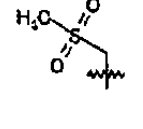
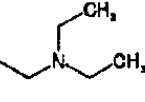
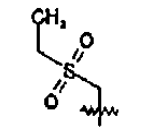
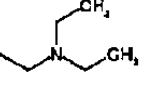
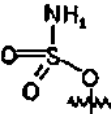
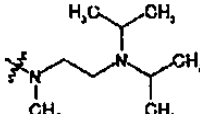
446			1060,6	(500 МГц): 0,85 (т, J=7,45 Гц, 3H) 1,02 (д, J=6,88 Гц, 3H) 1,10 (д, J=7,26 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,26 Гц, 3H) 1,16-1,26 (м, 1H) 1,18 (с, 3H) 1,19-1,22 (м, 6H) 1,23 (д, J=6,12 Гц, 3H) 1,28 (д, J=7,26 Гц, 4H) 1,40 (с, 6H) 1,53-1,61 (м, 1H) 1,66 (д, J=12,23 Гц, 1H) 1,69-1,75 (м, 6H) 1,84-1,89 (м, 1H) 1,89-1,96 (м, 1H) 1,98-2,01 (м, 2H) 2,13 (д, J=14,52 Гц, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,33 (с, 3H) 2,40-2,49 (м, 3H) 2,53-2,67 (м, 3H) 2,84 (д, J=14,52 Гц, 1H) 2,90-2,95 (м, 1H) 2,98 (с, 3H) 3,05 (с, 3H) 3,09-3,14 (м, 1H) 3,16-3,21 (м, 1H) 3,23 (ушир. с, 2H) 3,27 (с, 3H) 3,29-3,37 (м, 1H) 3,42-3,50 (м, 2H) 3,51-3,57 (м, 1H) 3,59 (с, 1H) 3,68 (д, J=9,56 Гц, 1H) 3,73 (д, J=6,88 Гц, 1H) 3,77-3,83 (м, 1H) 3,84-3,92 (м, 1H) 4,10 (кв, J=6,12 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,26 Гц, 1H) 4,93-5,00 (м, 2H) 5,55 (т, J=5,73 Гц, 1H)
447			1021,6	(499 МГц): 0,84 (т, J=7,40 Гц, 3H) 1,00 (д, J=6,86 Гц, 3H) 1,05 (т, J=7,13 Гц, 3H) 1,10 (д, J=7,68 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,13 Гц, 3H) 1,16-1,26 (м, 1H) 1,17 (с, 3H) 1,18-1,20 (м, 6H) 1,24 (д, J=6,31 Гц, 3H) 1,39 (с, 3H) 1,40-1,41 (м, 3H) 1,51-1,59 (м, 1H) 1,63-1,68 (м, 1H) 1,72-1,77 (м, 2H) 1,85-1,95 (м, 2H) 1,98-2,03 (м, 2H) 2,12 (д, J=14,81 Гц, 1H) 2,15-2,19 (м, 1H) 2,21-2,29 (м, 1H) 2,23 (с, 3H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,36-2,40 (м, 1H) 2,41-2,47 (м, 4H) 2,48-2,55 (м, 1H) 2,55-2,66 (м, 2H) 2,83 (д, J=14,81 Гц, 1H) 2,87-2,93 (м, 1H) 2,92-2,95 (м, 3H) 3,03 (с, 3H) 3,07-3,21 (м, 4H) 3,28 (с, 3H) 3,44 (с, 1H) 3,44-3,51 (м, 1H) 3,63 (с, 1H) 3,67-3,71 (м, 2H) 3,71-3,76 (м, 1H) 3,85-3,93 (м, 1H) 4,10 (кв, J=6,22 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,13 Гц, 1H) 4,89 (дд, J=11,11, 2,06 Гц, 1H) 4,97 (д, J=4,11 Гц, 1H)
448			1021,6	(499 МГц): 0,84 (т, J=7,40 Гц, 3H) 0,98-1,03 (м, 6H) 1,10 (д, J=7,40 Гц, 3H) 1,13 (д, J=6,86 Гц, 3H) 1,16-1,26 (м, 1H) 1,17-1,20 (м, 9H) 1,23 (д, J=6,03 Гц, 3H) 1,40 (с, 6H) 1,51-1,58 (м, 1H) 1,64 (д, J=12,62 Гц, 1H) 1,69-1,77 (м, 2H) 1,85-1,95 (м, 2H) 1,96-2,03 (м, 2H) 2,11-2,26 (м, 3H) 2,24 (с, 6H) 2,29 (с, 6H) 2,31-2,40 (м, 2H) 2,41-2,48 (м, 1H) 2,56-2,65 (м, 3H) 2,66-2,72 (м, 2H) 2,86 (д, J=14,81 Гц, 1H) 2,88-2,95 (м, 1H) 2,91 (с, 3H) 3,03 (с, 3H) 3,07-3,22 (м, 4H) 3,28 (с, 3H) 3,43 (с, 1H) 3,47-3,55 (м, 1H) 3,64 (с, 1H) 3,66-3,75 (м, 3H) 3,85-3,93 (м, 1H) 4,11 (кв, J=6,31 Гц, 1H) 4,43 (д, J=7,13 Гц, 1H) 4,89 (дд, J=10,97, 1,92 Гц, 1H) 4,96 (д, J=3,02 Гц, 1H)

Таблица 20-7

При- клад	R ^{29d}	R ^{1f}	ESI MS (M+H)	¹ H-ЯМР, CDCl ₃ , δ (м. ч.)
449			1091,7	(600 МГц): 0,82-0,86 (м, 3H) 0,98-1,03 (м, 15H) 1,09-1,11 (м, 3H) 1,13-1,15 (м, 6H) 1,14-1,26 (м, 1H) 1,17 (д, J=6,61 Гц, 3H) 1,20 (д, J=7,02 Гц, 3H) 1,23 (д, J=6,19 Гц, 3H) 1,39 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,48-1,55 (м, 1H) 1,64-1,68 (м, 1H) 1,70-1,81 (м, 2H) 1,87-1,94 (м, 2H) 1,96-2,09 (м, 3H) 2,29 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,39-2,64 (м, 6H) 2,81-2,85 (м, 1H) 2,88-2,95 (м, 1H) 2,95-3,01 (м, 2H) 3,04 (с, 3H) 3,06-3,11 (м, 1H) 3,14-3,22 (м, 2H) 3,28 (с, 3H) 3,37-3,40 (м, 1H) 3,41-3,49 (м, 4H) 3,53-3,58 (м, 1H) 3,62 (с, 1H) 3,63-3,71 (м, 4H) 3,91 (д, J=5,37 Гц, 1H) 4,10 (кв, J=6,19 Гц, 1H) 4,40 (д, J=7,02 Гц, 1H) 4,66-4,72 (м, 1H) 4,98 (д, J=4,95 Гц, 1H) 5,29 (дд, J=11,15, 2,48 Гц, 1H)
450			1059,7	(499 МГц): 0,84 (т, J=7,40 Гц, 3H) 1,00 (д, J=6,86 Гц, 3H) 1,10 (д, J=7,40 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,13 Гц, 3H) 1,16-1,25 (м, 1H) 1,17 (с, 3H) 1,18-1,21 (м, 6H) 1,23 (д, J=6,03 Гц, 3H) 1,28 (д, J=7,40 Гц, 4H) 1,39 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,50-1,59 (м, 1H) 1,65 (д, J=12,34 Гц, 1H) 1,69-1,77 (м, 6H) 1,86-1,95 (м, 2H) 1,98-2,02 (м, 2H) 2,12 (д, J=14,53 Гц, 1H) 2,13-2,20 (м, 1H) 2,21-2,29 (м, 1H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,40-2,49 (м, 3H) 2,54-2,67 (м, 3H) 2,84 (д, J=14,81 Гц, 1H) 2,88-2,93 (м, 1H) 2,92-2,95 (м, 3H) 3,03 (с, 3H) 3,07-3,13 (м, 2H) 3,14-3,21 (м, 2H) 3,23 (ушир. с, 2H) 3,28 (с, 3H) 3,40-3,49 (м, 2H) 3,64 (с, 1H) 3,67-3,75 (м, 3H) 3,85-3,93 (м, 1H) 4,10 (кв, J=6,03 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,40 Гц, 1H) 4,87-4,91 (м, 1H) 4,97 (д, J=3,29 Гц, 1H)
451			1064,7	(499 МГц): 0,85 (т, J=7,38 Гц, 3H) 0,95-1,05 (м, 15H) 1,09 (д, J=7,55 Гц, 3H) 1,11-1,28 (м, 16H) 1,38 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,46-1,57 (м, 1H) 1,63-1,69 (м, 1H) 1,71-1,78 (м, 2H) 1,82-1,93 (м, 2H) 1,95-2,08 (м, 3H) 2,29 (с, 6H) 2,35 (с, 3H) 2,39-2,64 (м, 6H) 2,80-2,86 (м, 4H) 2,88-2,93 (м, 1H) 2,99 (дт, J=12,78, 6,48 Гц, 2H) 3,05 (с, 3H) 3,09 (кв, J=6,86 Гц, 1H) 3,18 (дд, J=10,29, 7,20 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,35-3,55 (м, 3H) 3,66 (с, 1H) 3,68 (д, J=7,55 Гц, 1H) 3,73 (д, J=9,61 Гц, 1H) 3,97-4,23 (м, 3H) 4,41 (д, J=7,20 Гц, 1H) 4,98-5,06 (м, 2H) 5,20 (дд, J=10,98, 2,06 Гц, 1H)

452			922,5	(499 МГц): 0,85 (т, J=7,38 Гц, 3H) 1,00 (д, J=6,86 Гц, 3H) 1,07-1,27 (м, 19H) 1,40 (с, 3H) 1,41 (с, 3H) 1,50-1,78 (м, 4H) 1,84-1,96 (м, 2H) 1,98 (д, J=5,15 Гц, 2H) 2,10-2,33 (м, 2H) 2,28 (с, 6H) 2,39-2,46 (м, 1H) 2,50 (д, J=13,72 Гц, 1H) 2,55-2,64 (м, 1H) 2,87-2,97 (м, 1H) 2,93 (с, 3H) 3,01 (д, J=13,72 Гц, 1H) 3,03 (с, 3H) 3,06-3,21 (м, 4H) 3,29 (с, 3H) 3,47-3,54 (м, 1H) 3,63 (с, 1H) 3,65-3,76 (м, 3H) 3,86-3,93 (м, 1H) 4,28 (кв, J=6,17 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,20 Гц, 1H) 4,89 (д, J=10,98 Гц, 1H) 4,97 (д, J=4,80 Гц, 1H)
453			936,5	(499 МГц): 0,85 (т, J=7,38 Гц, 3H) 1,00 (д, J=6,86 Гц, 3H) 1,07-1,27 (м, 19H) 1,40 (с, 3H) 1,42 (с, 3H) 1,50-1,61 (м, 1H) 1,62-1,68 (м, 1H) 1,68-1,80 (м, 2H) 1,84-1,96 (м, 3H) 2,05 (д, J=15,09 Гц, 1H) 2,11-2,33 (м, 2H) 2,28 (с, 6H) 2,40 (с, 3H) 2,39-2,46 (м, 1H) 2,49 (д, J=13,38 Гц, 1H) 2,56-2,64 (м, 1H) 2,75 (д, J=13,04 Гц, 1H) 2,86-2,93 (м, 1H) 2,93 (с, 3H) 3,03 (с, 3H) 3,06-3,20 (м, 4H) 3,28 (с, 3H) 3,61-3,76 (м, 5H) 3,85-3,93 (м, 1H) 4,37 (кв, J=6,40 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,20 Гц, 1H) 4,89 (дд, J=10,81, 1,89 Гц, 1H) 4,94 (д, J=4,80 Гц, 1H)
454			1021,6	(499 МГц): 0,84 (т, J=7,38 Гц, 3H) 0,98-1,04 (м, 9H) 1,08-1,28 (м, 19H) 1,40 (с, 3H) 1,40 (с, 3H) 1,50-1,61 (м, 1H) 1,62-1,68 (м, 1H) 1,69-1,79 (м, 2H) 1,85-2,07 (м, 4H) 2,11-2,32 (м, 2H) 2,29 (с, 6H) 2,35 (д, J=13,72 Гц, 1H) 2,40-2,70 (м, 10H) 2,87-2,97 (м, 2H) 2,83 (с, 3H) 3,03 (с, 3H) 3,06-3,21 (м, 4H) 3,29 (с, 3H) 3,48-3,55 (м, 1H) 3,63 (с, 1H) 3,66-3,76 (м, 3H) 3,86-3,93 (м, 1H) 4,23 (кв, J=6,52 Гц, 1H) 4,42 (д, J=7,20 Гц, 1H) 4,89 (дд, J=10,98, 2,06 Гц, 1H) 4,97 (д, J=4,80 Гц, 1H)
455			1049	(400 МГц): 0,84 (т, J=7,32 Гц, 3H) 1,01 (т, J=7,57 Гц, 6H) 1,04 (д, J=7,08 Гц, 3H) 1,09 (д, J=7,57 Гц, 3H) 1,13 (д, J=7,08 Гц, 3H) 1,16 (с, 3H) 1,18-1,20 (м, 6H) 1,24 (д, J=6,10 Гц, 3H) 1,25-1,27 (м, 1H) 1,37-1,42 (м, 9H) 1,51-1,59 (м, 1H) 1,64-1,88 (м, 2H) 1,72-1,75 (м, 2H) 1,84-1,93 (м, 2H) 1,99-2,03 (м, 2H) 2,09 (д, J=14,7 Гц, 1H) 2,13-2,18 (м, 1H) 2,20-2,26 (м, 2H) 2,29 (с, 6H) 2,34 (с, 3H) 2,40-2,64 (м, 10H) 2,83 (д, J=14,7 Гц, 1H) 2,88-2,92 (м, 1H) 3,00-3,04 (м, 5H) 3,06-3,12 (м, 3H) 3,19 (дд, J=9,77, 7,08 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,42-3,50 (м, 1H) 3,63 (с, 1H) 3,67-3,75 (м, 3H) 3,86 (ддд, 14,0, 7,45, 5,62 Гц, 1H) 4,09 (кв, J=6,18 Гц, 1H) 4,41 (д, J=7,08 Гц, 1H) 4,89 (дд, J=11,0, 2,20 Гц, 1H) 4,98 (д, J=3,66 Гц, 1H)

456			1066,7	(600 МГц): 0,86 (т, J=7,22 Гц, 3H) 0,94-1,06 (м, 12H) 1,09 (д, J=7,43 Гц, 3H) 1,11-1,28 (м, 19H) 1,39 (с, 3H) 1,42 (с, 3H) 1,46-1,55 (м, 1H) 1,63-1,78 (м, 3H) 1,86-2,07 (м, 5H) 2,29 (с, 6H) 2,36 (с, 3H) 2,38-2,64 (м, 6H) 2,80-2,93 (м, 2H) 2,95-3,05 (м, 2H) 3,02 (с, 3H) 3,09-3,13 (м, 1H) 3,18 (дд, J=10,11, 7,64 Гц, 1H) 3,28 (с, 3H) 3,43 (ушир. с, 1H) 3,62-3,68 (м, 2H) 3,66 (с, 1H) 3,89-3,95 (м, 1H) 4,03-4,13 (м, 2H) 4,20-4,25 (м, 1H) 4,40 (д, J=7,02 Гц, 1H) 4,62 (ддд, J=10,53, 7,64, 3,30 Гц, 1H) 4,95 (д, J=4,95 Гц, 1H) 5,20 (дд, J=10,32, 2,06 Гц, 1H) 5,46 (ушир. с, 2H)
-----	---	---	--------	--

Приклад 399

Сполуку (129,0 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (300,0 мг), отриманої в прикладі 86, стадія (1), і N-циклопропіл-N-етил-N'-метилетан-1,2-діаміну (142,2 мг) як вихідних речовин.

Приклад 400

Сполуку (206,0 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (300,0 мг), отриманої в прикладі 86, стадія (1), і N,N'-диметил-N-циклопропілетан-1,2-діаміну (128,2 мг) як вихідних речовин.

Приклад 401

Сполуку (256,0 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (300,0 мг), отриманої в прикладі 86, стадія (1), і N-циклопропіл-N-ізопропіл-N'-метилетан-1,2-діаміну (156,3 мг) як вихідних речовин.

Приклад 402

Сполуку (184,0 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (300,0 мг), отриманої в прикладі 86, стадія (1), і N,N-дициклопропіл-N'-метилетан-1,2-діаміну (154,3 мг) як вихідних речовин.

Приклад 403

Сполуку (183,0 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (300,0 мг), отриманої в прикладі 86, стадія (1), і N-циклопропіл-N'-метил-N-пропілетан-1,2-діаміну (156,3 мг) як вихідних речовин.

Приклад 404

Сполуку (145,0 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (200,0 мг), отриманої в прикладі 86, стадія (1), і N,N-діізопропіл-N'-метилетан-1,2-діаміну (104,8 мг) як вихідних речовин.

До сполуки (1,07 г), отриманої способом, описаним у прикладі 404, додавали метанол (3,2 мл), і повністю розчиняли сполуку при нагріванні реакційної суміші на водяній бані при 65 °С. До розчину при тій же температурі по краплях додавали воду (2,0 мл), потім суміш охолоджували до кімнатної температури й перемішували протягом ночі. Отримані кристалічні речовини збирали шляхом фільтрування, і промивали метанолом/водою (1/2) з одержанням сполуки з наступними ідентифікованими фізико-хімічними даними (725 мг).

Точка плавлення: 118-126 °С

DSC (пік): 124,9 °С

XRD пік 2θ (°): 7,0, 10,1, 14,1, 15,9, 17,7, 20,2

Приклад 405

Сполуку (155,0 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (200,0 мг), отриманої в прикладі 86, стадія (1), і N,N'-диметил-N-ізопропілетан-1,2-діаміну (86,2 мг) як вихідних речовин.

Приклад 406

Сполуку (191,0 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (200,0 мг), отриманої в прикладі 86, стадія (1), і N-етил-N'-метил-N-пропілетан-1,2-діаміну (95,5 мг) як вихідних речовин.

Приклад 407

- 5 Сполуку (145,0 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (200,0 мг), отриманої в прикладі 86, стадія (1), і N-ізопропіл-N'-метил-N-пропілетан-1,2-діаміну (104,8 мг) як вихідних речовин.

Приклад 408

- 10 Сполуку (69,0 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (200,0 мг), отриманої в прикладі 86, стадія (1), і N,N'-диметил-N-пропілетан-1,2-діаміну (86,2 мг) як вихідних речовин.

Приклад 409

- 15 Сполуку (118,0 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (200,0 мг), отриманої в прикладі 86, стадія (1), і N-циклопропіл-N,N'-диметилетан-1,2-діаміну (94,2 мг) як вихідних речовин.

Приклад 410

- 20 Сполуку (193,0 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (200,0 мг), отриманої в прикладі 86, стадія (1), і сполуки (103,5 мг), отриманої в довідковому прикладі 112, як вихідних речовин.

Приклад 411

- 25 Сполуку (149,0 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (200,0 мг), отриманої в прикладі 86, стадія (1), і N-(циклопропілметил)-N,N'-диметилетан-1,2-діаміну (94,1 мг) як вихідних речовин.

Приклад 412

- 30 Сполуку (73,2 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (86,0 мг), отриманої в прикладі 86, стадія (1), і сполуки (49,6 мг), отриманої в довідковому прикладі 113, як вихідних речовин.

Приклад 413

- 35 Сполуку (64,8 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (100 мг), отриманої в прикладі 86, стадія (1), і N,N,N'-триетилетан-1,2-діаміну (59,7 мкл) як вихідних речовин.

Приклад 414

- 40 Сполуку (277,0 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (300,0 мг), отриманої в прикладі 35, стадія (1), і N,N-діізопропіл-N'-метилетан-1,2-діаміну (158,3 мг) як вихідних речовин.

Приклад 415

- 45 Сполуку (284,0 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (300,0 мг), отриманої в прикладі 35, стадія (1), і N-ізопропіл-N,N'-диметилетан-1,2-діаміну (130,2 мг) як вихідних речовин.

Приклад 416

- 50 Сполуку (331,0 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (300,0 мг), отриманої в прикладі 35, стадія (1), і N-етил-N'-метил-N-пропілетан-1,2-діаміну (144,3 мг) як вихідних речовин.

Приклад 417

- 55 Сполуку (312 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (300 мг), отриманої в прикладі 35, стадія (1), і N-циклобутил-N,N'-диметилетан-1,2-діаміну (141 мг) як вихідних речовин.

Приклад 418

- Сполуку (290 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (300 мг), отриманої в прикладі 35, стадія (1), і сполуки (155 мг), отриманої в довідковому прикладі 112, як вихідних речовин.

Приклад 419

Сполуку (262,5 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (300 мг), отриманої в прикладі 35, стадія (1), і N,N,N'-триетилтан-1,2-діаміну (239 мкл) як вихідних речовини.

Приклад 420

5 Сполуку (256 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (300 мг), отриманої в прикладі 35, стадія (1), і N,N'-диметил-N-пропілетан-1,2-діаміну (129 мг) як вихідних речовин.

Приклад 421

10 Сполуку (274 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (300 мг), отриманої в прикладі 35, стадія (1), і N-(циклопропілметил)-N,N'-диметилетан-1,2-діаміну (141 мг) як вихідних речовин.

Приклад 422

15 Сполуку (295 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (300 мг), отриманої в прикладі 31, стадія (1), і N,N'-диметил-N-пропілетан-1,2-діаміну (263 мг) як вихідних речовин.

Приклад 423

Сполуку (296 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (300 мг), отриманої в прикладі 31, стадія (1), і N-(циклопропілметил)-N,N'-диметилетан-1,2-діаміну (287 мг) як вихідних речовин.

Приклад 424

Сполуку (260 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (300 мг), отриманої в прикладі 31, стадія (1), і N-ізопропіл-N,N'-диметилетан-1,2-діаміну (131,5 мг) як вихідних речовин.

Приклад 425

25 Сполуку (286 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (300 мг), отриманої в прикладі 31, стадія (1), і N-етил-N'-метил-N-пропілетан-1,2-діаміну (145,7 мг) як вихідних речовин.

Приклад 426

30 Сполуку (217 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (300 мг), отриманої в прикладі 31, стадія (1), і N,N-діізопропіл-N'-метилетан-1,2-діаміну (159.9 мг) як вихідних речовин.

Приклад 427

35 Сполуку (258 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (300 мг), отриманої в прикладі 31, стадія (1), і N,N,N'-триетилетан-1,2-діаміну (182 мкл) як вихідних речовин.

Приклад 428

Сполуку (303 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (300 мг), отриманої в прикладі 31, стадія (1), і N-циклобутил-N,N'-диметилетан-1,2-діаміну (144 мг) як вихідних речовин.

Приклад 429

Сполуку (302 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (300 мг), отриманої в прикладі 31, стадія (1), і сполуки (158 мг), отриманої в довідковому прикладі 112, як вихідних речовин.

Приклад 430

45 Сполуку (46,6 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (50 мг), отриманої в прикладі 86, стадія (1), і N-етил-N,N'-диметилетан-1,2-діаміну (19 мг) як вихідних речовин.

Приклад 431

50 Сполуку (6,5 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (25 мг), отриманої в прикладі 86, стадія (1), і N,N-діетил-N'-ізопропілетан-1,2-діаміну (13 мг) як вихідних речовин.

Приклад 432

Сполуку (91,7 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (100 мг), отриманої в прикладі 86, стадія (1), і N,N-діетил-N'-пропілетан-1,2-діаміну (52 мг) як вихідних речовин.

Приклад 433

Сполуку (99,2 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (100 мг), отриманої в прикладі 86, стадія (1), і N,N'-діетил-N-метилетан-1,2-діаміну (57 мг) як вихідних речовин.

Приклад 434

Сполуку (91,7 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (100 мг), отриманої в прикладі 86, стадія (1), і N-етил-N',N'-диметилетан-1,2-діаміну (70 мкл) як вихідних речовин.

Приклад 435

5 Сполуку (100,6 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (100 мг), отриманої в прикладі 86, стадія (1), і N-етил-N'-ізопропіл-N'-метилетан-1,2-діаміну (48 мг) як вихідних речовин.

Приклад 436

10 Сполуку (56,7 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (100 мг), отриманої в прикладі 86, стадія (1), і N-(циклопропілметил)-N'-етил-N-метилетан-1,2-діаміну (52 мг) як вихідних речовин.

Приклад 437

15 Сполуку (72,3 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (100 мг), отриманої в прикладі 86, стадія (1), і N-етил-N'-метил-N'-пропілетан-1,2-діаміну (48 мг) як вихідних речовин.

Приклад 438

Сполуку (86,4 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (100 мг), отриманої в прикладі 86, стадія (1), і N,N'-етил-N-пропілетан-1,2-діаміну (52 мг) як вихідних речовин.

20 Приклад 439

Сполуку (83,9 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (100 мг), отриманої в прикладі 86, стадія (1), і N-етил-N',N'-діізопропілетан-1,2-діаміну (57 мг) як вихідних речовин.

Приклад 440

25 (1) Деацетиловану сполуку (121 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 15, стадія (1), і в прикладі 2, стадія (2), шляхом використання сполуки (2,4 г), представленої формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і сполуки (1,4 г), отриманої в довідковому прикладі 114, як вихідних речовин.

30 (2) Сполуку (7,8 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 15, стадія (2), шляхом використання сполуки (40,0 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 441

35 Сполуку (54,4 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (100 мг), отриманої в прикладі 86, стадія (1), і N-(2-{{2-(діетиламіно)етил}аміно}етил)ацетаміду (67 мг) як вихідних речовин.

Приклад 442

Сполуку (73,0 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (100 мг), отриманої в прикладі 86, стадія (1), і 2-(2-діетиламіноетиламіно)етанолу (53 мг) як вихідних речовин.

40 Приклад 443

Сполуку (47,8 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (100 мг), отриманої в прикладі 86, стадія (1), і N,N'-діетил-N'-(2-метоксіетил)етан-1,2-діаміну (58 мг) як вихідних речовин.

Приклад 444

45 Сполуку (32,4 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (60 мг), отриманої в прикладі 86, стадія (1), і N-(2-{{2-(діетиламіно)етил}аміно}етил)-метансульфонамід (47 мг) як вихідних речовин.

Приклад 445

50 Сполуку (94,8 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (100 мг), отриманої в прикладі 86, стадія (1), і N,N,N',N'-тетраетилдіетилентриаміну (88 мкл) як вихідних речовин.

Приклад 446

55 Сполуку (45,7 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (50 мг), отриманої в прикладі 86, стадія (1), і сполуки (26 мг), отриманої в довідковому прикладі 115, як вихідних речовин.

Приклад 447

Сполуку (106 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (100 мг), отриманої в прикладі 35, стадія (1), і N-етил-N',N'-диметилетан-1,2-діаміну (51 мг) як вихідних речовин.

60 Приклад 448

Сполуку (90,1 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (100 мг), отриманої в прикладі 35, стадія (1), і N-етил-N',N'-диметилетан-1,2-діаміну (70 мкл) як вихідних речовин.

Приклад 449

5 Сполуку (8,4 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (40,0 мг), отриманої в прикладі 440, стадія (1), і N,N-діізопропіл-N'-метилетан-1,2-діаміну (20,4 мг) як вихідних речовин.

Приклад 450

10 Сполуку (44,8 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 2, стадія (5), шляхом використання сполуки (100 мг), отриманої в прикладі 35, стадія (1), і сполуки (20 мг), отриманої в довідковому прикладі 115, як вихідних речовин.

Приклад 451

15 Сполуку (158 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (227,0 мг), отриманої в прикладі 48, стадія (1), і N,N-діізопропіл-N'-метилетан-1,2-діаміну (119 мг) як вихідних речовин.

Приклад 452

Сполуку (37,4 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (50,0 мг), отриманої в прикладі 35, стадія (1), і 28 % водного аміаку (135 мкл) як вихідних речовин.

20 Приклад 453

Сполуку (43,9 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (50,0 мг), отриманої в прикладі 35, стадія (1), і 40 % водного метиламіну (43 мкл) як вихідних речовин.

Приклад 454

25 Сполуку (38,1 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 4, стадія (8), шляхом використання сполуки (50,0 мг), отриманої в прикладі 35, стадія (1), і N,N-діізопропілетилендіаміну (64 мг) як вихідних речовин.

Приклад 455

30 (1) Деацетиловану сполуку (292 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 15, стадія (1), і в прикладі 2, стадія (2), шляхом використання сполуки (300 мг), представленої формулою (A) і отриманої в прикладі 1, стадія (5), і сполуки (192 мг), отриманої в довідковому прикладі 116, як вихідних речовин.

(2) Сполуку (46 мг), представлену в таблиці 20, одержували тим же способом, що й описаний у прикладі 129, стадія (3), шляхом використання сполуки (80 мг), отриманої на описаній вище стадії (1), як вихідної речовини.

Приклад 456

40 Сполуку (112 мг), представлену в таблиці 20, одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 4, стадія (8), у прикладі 1, стадія (1), у прикладі 81, стадія (3), і в прикладі 4, стадія (6), шляхом використання сполуки (450 мг), отриманої в прикладі 1, стадія (7), і N,N-діізопропіл-N'-метилетан-1,2-діаміну (256 мг) як вихідних речовин.

Приклад 457: Синтез сполуки формули (H), у якій R^{2b} являє собою діетиламіногрупу, і R^{29c} являє собою 3-метилбут-2-ениламінокарбонільну групу

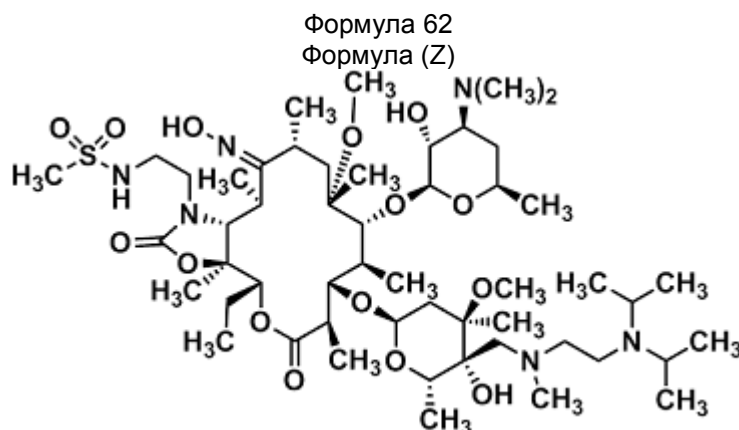
45 Вказану в заголовку сполуку (32 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 196, стадія (2), у прикладі 2, стадія (2), і в прикладі 11, шляхом використання сполуки (300 мг), отриманої в прикладі 196, стадія (1), і сполуки (72 мг), отриманої в довідковому прикладі 117, як вихідних речовин.

МС (ESI) m/z=1041 [M+H]⁺

50 ¹H-ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ (м. ч.): 0,88 (т, J=7,32 Гц, 3H), 1,03 (т, J=7,08 Гц, 6H), 1,08 (д, J=6,35 Гц, 3H), 1,08 (д, J=6,84 Гц, 3H), 1,14 (д, J=6,84 Гц, 3H), 1,16 (с, 3H), 1,17 (д, J=6,18 Гц, 3H), 1,21 (д, J=7,57 Гц, 1H), 1,23 (д, J=6,10 Гц, 1H), 1,24-1,26 (м, 1H), 1,36 (с, 3H), 1,43 (с, 3H), 1,52-2,11 (м, 9H), 1,65 (с, 3H), 1,68 (с, 3H), 2,29 (с, 6H), 2,34 (с, 3H), 2,41-2,67 (м, 10H), 2,81-2,89 (м, 2H), 2,92 (с, 3H), 3,07 (кв, J=6,84 Гц, 1H), 3,17 (дд, J=10,1, 7,20 Гц, 1H), 3,27 (с, 3H), 3,40-3,51 (м, 1H), 3,67 (д, J=7,08 Гц, 1H), 3,73 (д, J=9,28 Гц, 1H), 3,76 (с, 1H), 3,76-3,88 (м, 2H), 4,07 (кв, J=6,18 Гц, 1H), 4,42 (д, J=7,20 Гц, 1H), 4,98 (д, J=4,15 Гц, 1H), 5,24 (т, J=7,08 Гц, 1H), 5,33 (д, J=9,77 Гц, 1H), 7,67 (с, 1H)

Приклад 458

Нижче представлений спосіб одержання сполуки, представленої формулою (Z).



Приклад 458

Згадану вище цільову сполуку (37,2 мг) одержували тими ж способами, що й описані в прикладі 4, стадія (8), у прикладі 334, стадія (1), і в прикладі 162, шляхом використання сполуки (80 мг), отриманої в прикладі 333, стадія (2), і N,N-діізопропіл-N'-метилетан-1,2-діаміну (46,9 мг) як вихідних речовин.

MC (ESI) $m/z=1079,7$ $[M+H]^+$

^1H -ЯМР (500 МГц, CDCl_3) δ (м. ч.): 0,84 (т, $J=7,45$ Гц, 3H), 0,96-1,04 (м, 15H), 1,07 (д, $J=7,64$ Гц, 3H), 1,09 (д, $J=6,88$ Гц, 3H), 1,13 (с, 3H), 1,16-1,27 (м, 1H), 1,18 (д, $J=6,50$ Гц, 3H), 1,20 (д, $J=7,26$ Гц, 3H), 1,24 (д, $J=6,12$ Гц, 3H), 1,38-1,44 (м, 1H), 1,39 (с, 3H), 1,49 (с, 3H), 1,51-1,57 (м, 1H), 1,60 (д, $J=13,76$ Гц, 1H), 1,65 (д, $J=12,61$ Гц, 1H), 1,84-1,92 (м, 2H), 1,94-2,07 (м, 3H), 2,29 (с, 6H), 2,36 (с, 3H), 2,39-2,63 (м, 6H), 2,84 (д, $J=14,52$ Гц, 1H), 2,88-2,93 (м, 1H), 2,94-3,01 (м, 2H), 2,98 (с, 3H), 3,12 (с, 3H), 3,20 (дд, $J=9,94, 7,26$ Гц, 1H), 3,27 (с, 3H), 3,39-3,48 (м, 2H), 3,51-3,67 (м, 3H), 3,68-3,74 (м, 2H), 3,77-3,88 (м, 3H), 4,11 (кв, $J=6,12$ Гц, 1H), 4,40 (д, $J=7,26$ Гц, 1H), 4,88 (д, $J=9,17$ Гц, 1H), 4,99 (д, $J=4,97$ Гц, 1H), 5,90 (ушир. с, 1H), 8,02 (ушир. с, 1H)

Тестовий приклад 1 (антибактеріальна активність *in vitro*)

Антибактеріальну активність сполук згідно із даним винаходом *in vitro* відносно різних тестових бактерій вимірювали відповідно до способу мікророзведень у бульйоні (спосіб CLSI). Використовувані тестові бактерії представлено в таблиці 21. Серед них бактерії С, D і E являють собою резистентні до еритроміцину бактерії. Значення MIC (мінімальна інгібуюча концентрація, мкг/мл) відносно тестових бактерій А і В наведено в таблиці 22. Діапазони значень MIC, які демонструються сполуками, наведеними в таблиці 22, відносно тестових бактерій С і D представлені нижче.

Значення MIC (мінімальна інгібуюча концентрація, мкг/мл), які демонструються сполуками прикладів 62, 94, 183, 263, 329, 332, 367, 390, 391 і 393 відносно тестової бактерії С, становили не менше 0,5 і не більше 2; значення MIC (мінімальна інгібуюча концентрація, мкг/мл), які демонструються сполуками прикладів 1, 4, 15, 16, 24, 28, 30, 38, 48, 50, 53, 63, 70, 72, 76, 83, 87, 92, 103, 131, 141, 154, 170, 172, 191, 192, 193, 198, 208, 210, 233, 264, 299, 334, 338, 340, 341, 342, 348, 363, 366, 377, 395, 404, 413, 418, 440, 443, 445, 446, 451, 456, 457 і 458 відносно тестової бактерії С, становили не менше 0,12 і не більше 0,25; і значення MIC (мінімальна інгібуюча концентрація, мкг/мл), які демонструються сполуками прикладів 3, 26, 73, 113, 114, 142, 231, 353, 354, 364 і 370 відносно тестової бактерії С, становили не більше 0,06.

Значення MIC (мінімальна інгібуюча концентрація, мкг/мл), які демонструються сполуками прикладів 1, 4, 30, 72, 94, 183, 192, 193, 233, 263, 264, 299, 329, 332, 366, 367, 390, 391, 393 і 395 відносно тестової бактерії D, становили не менше 16; значення MIC (мінімальна інгібуюча концентрація, мкг/мл), які демонструються сполуками прикладів 15, 16, 28, 38, 48, 50, 53, 62, 63, 70, 73, 76, 83, 87, 92, 103, 131, 141, 154, 170, 191, 208, 210, 334, 348, 413, 440, 443, 445, 446, 451, 457 і 458 відносно тестової бактерії D, становили не менше 4 і не більше 8; і значення MIC (мінімальна інгібуюча концентрація, мкг/мл), які демонструються сполуками прикладів 3, 24, 26, 113, 114, 142, 172, 198, 231, 338, 340, 341, 342, 353, 354, 363, 364, 370, 377, 404, 418 і 456 відносно тестової бактерії D, становили не більше 2.

Діапазони значень MIC, які демонструються сполуками прикладів 3, 15, 16, 26, 38, 62, 63, 70, 87, 92, 131, 142, 172, 198, 299, 334, 338, 340, 341, 342, 353, 354, 363, 364, 370, 377, 390, 395 і 404 відносно тестової бактерії E, представлені нижче. Значення MIC (мінімальна інгібуюча концентрація, мкг/мл), які демонструються сполуками прикладів 3, 62, 63, 299 і 395 відносно тестової бактерії E, становили не менше 0,5 і не більше 1; і значення MIC (мінімальна інгібуюча концентрація, мкг/мл), які демонструються сполуками прикладів 15, 16, 26, 38, 70, 87, 92, 131,

142, 172, 198, 334, 338, 340, 341 342, 353, 354, 363, 364, 370, 377, 390 і 404 відносно тестової бактерії E, становили не більше 0,25.

Таблиця 21

Тестова бактерія	Позначення бактерій
<i>Haemophilus influenzae</i> ATCC43095	A
<i>Streptococcus pneumoniae</i> ATCC49619	B
<i>Streptococcus pneumoniae</i> ATCC700904	C
<i>Streptococcus pyogenes</i> M808	D
<i>Mycoplasma pneumoniae</i> MSC04933	E

Таблиця 22

Сполуки	A	B	Сполуки	A	B
Агент порівняння 1	4	0,03	Сполука прикладу 208	2	0,03
Сполука прикладу 1	4	0,03	Сполука прикладу 210	8	0,12
Сполука прикладу 3	8	0,03	Сполука прикладу 231	4	0,03
Сполука прикладу 4	8	0,06	Сполука прикладу 233	8	0,03
Сполука прикладу 15	4	0,03	Сполука прикладу 299	4	0,03
Сполука прикладу 16	4	0,03	Сполука прикладу 263	8	0,06
Сполука прикладу 24	8	0,06	Сполука прикладу 264	8	0,06
Сполука прикладу 50	8	0,12	Сполука прикладу 329	8	0,03
Сполука прикладу 26	4	0,06	Сполука прикладу 332	4	0,06
Сполука прикладу 28	8	0,06	Сполука прикладу 334	4	0,06
Сполука прикладу 30	8	0,06	Сполука прикладу 338	8	0,06
Сполука прикладу 38	4	0,06	Сполука прикладу 340	4	0,06
Сполука прикладу 48	4	0,03	Сполука прикладу 341	4	0,06
Сполука прикладу 53	8	0,03	Сполука прикладу 342	4	0,06
Сполука прикладу 62	4	0,016	Сполука прикладу 348	16	0,03
Сполука прикладу 63	4	0,03	Сполука прикладу 353	4	0,06
Сполука прикладу 70	4	0,06	Сполука прикладу 354	2	0,03
Сполука прикладу 72	8	0,06	Сполука прикладу 363	8	0,06
Сполука прикладу 73	4	0,03	Сполука прикладу 364	8	0,03
Сполука прикладу 76	8	0,06	Сполука прикладу 366	8	0,03
Сполука прикладу 83	4	0,06	Сполука прикладу 367	8	0,25
Сполука прикладу 87	4	0,06	Сполука прикладу 370	4	0,03
Сполука прикладу 92	4	0,06	Сполука прикладу 377	2	0,03
Сполука прикладу 94	8	0,06	Сполука прикладу 390	4	0,03
Сполука прикладу 103	4	0,03	Сполука прикладу 391	16	0,12
Сполука прикладу 113	4	0,03	Сполука прикладу 393	4	0,06
Сполука прикладу 114	4	0,03	Сполука прикладу 395	4	0,03
Сполука прикладу 131	4	0,06	Сполука прикладу 404	4	0,03
Сполука прикладу 141	16	0,06	Сполука прикладу 413	4	0,03
Сполука прикладу 142	4	0,03	Сполука прикладу 418	4	0,03
Сполука прикладу 154	4	0,06	Сполука прикладу 440	4	0,03
Сполука прикладу 172	2	0,03	Сполука прикладу 443	4	0,03
Сполука прикладу 183	8	0,016	Сполука прикладу 445	8	0,12
Сполука прикладу 170	4	0,03	Сполука прикладу 446	4	0,03
Сполука прикладу 191	4	0,016	Сполука прикладу 451	4	0,03
Сполука прикладу 192	4	0,016	Сполука прикладу 456	2	0,03
Сполука прикладу 193	4	0,03	Сполука прикладу 457	2	0,06
Сполука прикладу 198	2	0,03	Сполука прикладу 458	4	0,06

5

Промислова застосовність

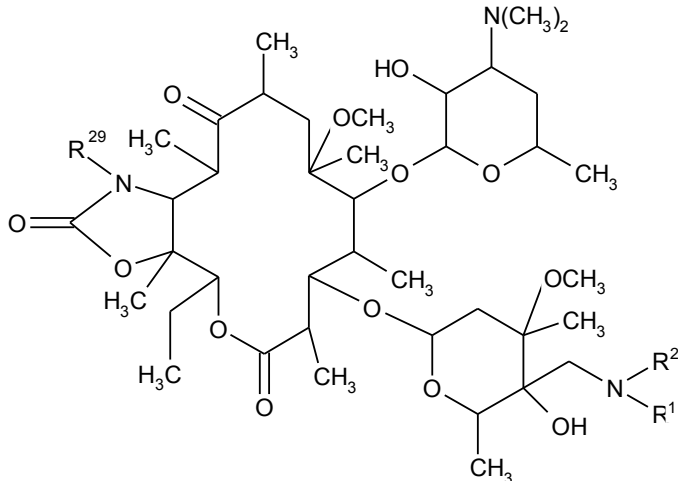
Сполуки згідно із даним винаходом мають потужну антибактеріальну активність відносно різних мікроорганізмів, і навіть відносно резистентних до еритроміцину бактерій (наприклад, резистентні пневмококи, стрептококи й мікоплазми) і т. п., відносно яких не може бути досягнута

значима антибактеріальна активність із використанням традиційних макролідних антибіотиків, а тому вони можуть бути використані як лікарські засоби для профілактичного і/або терапевтичного лікування різних мікробіальних інфекційних захворювань.

5

ФОРМУЛА ВИНАХОДУ

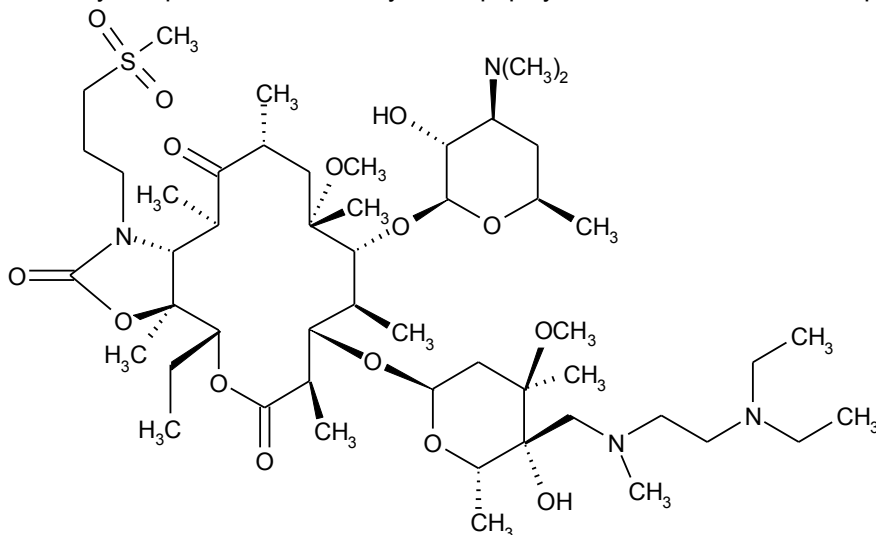
1. Сполука, представлена наступною формулою, або її сіль, або її гідрат, або сольват,



де

- 10 R^1 являє собою C_{1-6} алкільну групу;
 R^2 являє собою C_{1-6} алкільну групу, яка заміщена
 i) гідроксильною групою,
 ii) групою, представленою формулою $-NR^{17}R^{18}$, де R^{17} і R^{18} можуть бути однаковими або різними і являти собою атом водню або C_{1-6} алкільну групу, яка може бути заміщена C_{3-6} циклоалкільною
 15 групою,
 R^{29} являє собою C_{1-6} алкільну групу, яка заміщена
 i) C_{1-6} алкілсульфанільною групою,
 ii) C_{1-6} алкілсульфінільною групою,
 iii) C_{1-6} алкілсульфонільною групою,
 20 iv) групою, яка представлена формулою $-CONR^{59}R^{60}$, де R^{59} і R^{60} можуть бути однаковими або різними і являти собою атом водню або C_{1-6} алкільну групу.

2. Сполука, представлена наступною формулою, або її сіль, або її гідрат, або сольват,



25

3. Лікарський засіб, який містить як активний інгредієнт речовину, вибрану з групи, яка складається із сполуки за п. 1 або 2, її солі, її гідрату і сольвату.

4. Лікарський засіб за п. 3, який використовують для профілактичного і/або терапевтичного лікування інфекційного захворювання.

Комп'ютерна верстка Л. Литвиненко

Державна служба інтелектуальної власності України, вул. Василя Липківського, 45, м. Київ, МСП, 03680, Україна

ДП "Український інститут інтелектуальної власності", вул. Глазунова, 1, м. Київ – 42, 01601