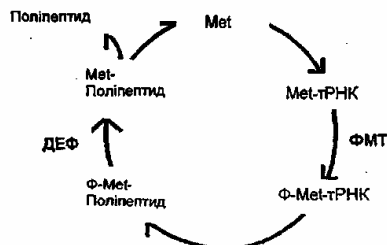


Даний винахід відноситься до нових антибактеріальних сполук і до фармацевтичних композицій, що містять зазначені сполуки як інгібітори пептидної деформілази.

Бактеріальний ініціатор тРНК метіонілу модифікується метіонілом тРНК формілтрансферазою (ФМТ) з одержанням тРНК формілметіонілу. Потім формілметіонін (Ф-мет) міститься по N-кінцях знову синтезованих поліпептидів. Після цього поліпептидна деформілаза (ПДФ або Деф) деформілює первинні продукти трансляції з утворенням N-метіонілполіпептидів. Велика частина внутрішньоклітинних білків піддається подальшому впливу метіонінамінопептидази (МАП) з одержанням зрілого пептиду і вільного метіоніну, що повертається в цикл. Як ПДФ, так і МАП мають велике значення для бактеріального росту, при цьому ПДФ необхідна для активності МАП. Подібну серію взаємодій називають циклом метіоніну (Фіг.1).



Фіг.1. Цикл метіоніну

До цього часу гомологічні гени поліпептидної деформілази були виявлені в бактеріях, у рослинах, що містять хлоропласт, у мишей і людей. Білки рослин закодовані нуклеїнами, але, очевидно, несуть сигнал локалізації хлоропласта. Це відповідає спостереженню, що процеси синтезу РНК хлоропласта і білка дуже схожі на процеси, що відбуваються в еубактеріях.

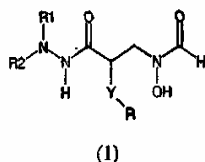
Оскільки інформація про експресію білків гомологів генів ПДФ ссавців [Bayer Aktiengesellschaft, Pat. W02001/42431] обмежена, до цього часу не була встановлена функціональна роль таких білків [Meinell, T., Parasitology Today 16(4), 165-168, 2000].

Поліпептидна деформілаза виявлена у всіх еубактеріях, для яких у великому об'ємі доступна інформація про геномні послідовності. Різноманітність послідовностей серед гомологів ПДФ висока, при цьому ідентичність між віддалено зв'язаними послідовностями складає усього лише 20%. Однак рівень консервативності навколо активного сайту дуже високий, з декількома цілком збереженими залишками, включаючи один цистеїн і два гістидина, необхідні для координації металу активного сайту [Meinell, T. et al., J. Mol. Biol. 267, 749-761, 1997].

Було встановлено, що ПДФ є привабливою антибактеріальною мішенню, оскільки було встановлено, що даний фермент має велике значення для бактеріального росту *in vitro* [Mazel, D. et al., EMBO J. 13(4), 914-923, 1994]; передбачається також, що він не приймає участі в синтезі еукаріотного білка [Rajagopalan et al., J. Am. Chem. Soc. 119, 12418-12419, 1997] і повсюдно є присутнім у прокаріотах [Kozak, M., Microbiol. Rev. 47, 1-45, 1983]. Тому інгібітори ПДФ потенційно являють собою широкий спектр антибактеріальних агентів.

Даний винахід стосується нових антибактеріальних сполук, представлених наведеною нижче формулою (I), і їхнього застосування як інгібіторів ПДФ.

Один з аспектів даного винаходу стосується сполуки формули (I):



де:

R обраний із групи, що містить:

C₂₋₆-алкіл (необов'язково заміщений алкокси, галогеном або C₁₋₃-алкілсульфанілом); C₂₋₆-алкеніл (необов'язково заміщений алкокси, галогеном або C₁₋₃-алкілсульфанілом); C₂₋₆-алкініл (необов'язково заміщений алкокси, галогеном або C₁₋₃-алкілсульфанілом); (CH₂)_n-C₃₋₆-карбоцикл (необов'язково заміщений алкокси, галогеном або C₁₋₃-алкілсульфанілом); і (CH₂)_n-R₄, де R₄ обраний із групи, що містить фенол, фуран, бензофуран, тіофен, бензотіофен, тетрагідрофуран, тетрагідропіран, діоксан, 1,4-бензодіоксан або бензо[1,3]діоксол; R₄ необов'язково заміщений одним або декількома замісниками, обраними з Cl, Br, I, C₁₋₃-алкілу (необов'язково заміщені одним-трьома атомами F) і C₁₋₂-алкокси (необов'язково заміщені одним-трьома атомами F);

R₁ і R₂ незалежно обрані з групи, що містить:

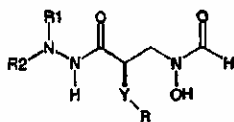
водень, C₁₋₃-заміщений алкіл, C₂₋₃-заміщений алкеніл, C₂₋₃-заміщений алкініл, (CH₂)_n-C₃₋₆-заміщений карбоцикл, арил, гетероарил і гетероцикл;

Y являє собою O, CH₂ або ковалентний зв'язок; а

n дорівнює цілому числу від 0 до 2;

або його сіль, сольват або фізіологічно функціональне похідне.

У даному винаході найбільш переважною R₂-групою є водень. Найбільш переважна абсолютна конфігурація сполук формули (I) відповідно до даного винаходу приведена нижче:



У даному описі термін «алкіл» відноситься до насиченого вуглеводневого радикалу з прямим або розгалуженим ланцюгом. Приклади «алкілу», який тут використовують включають, але не обмежуються ними, метил, етил, н-пропіл, ізопропіл, н-бутил, ізобутил, трет-бутил, н-пентил, ізопентил, гексил і т.п.

У даному описі термін «заміщений алкіл» відноситься до насиченого вуглеводневого радикалу з прямим або розгалуженим ланцюгом, необов'язково заміщеного замісниками, обраними з групи, що містить С₁₋₃-алкіл (необов'язково заміщений одним-трьома атомами фтору), С₂₋₃-алкеніл, С₂₋₃-алкініл, С₁₋₂-алкокси (необов'язково заміщений одним-трьома атомами фтору), сульфаніл, сульфініл, сульфоніл, оксо, гідрокси, меркапто, аміно, гуанідино, карбокси, амінокарбоніл, арил, арилокси, гетероарил, гетероарилокси, гетероцикл, аminosульфоніл, сульфоніламіно, карбоксамід, уреїдо, нітро, ціано і галоген, при цьому допустимо заміщення декількома групами.

У даному описі термін «алкеніл» відноситься до вуглеводневого радикала з прямим або розгалуженим ланцюгом, що має, щонайменше, один подвійний вуглець-вуглецевий зв'язок. Приклади «алкенілу», що тут використовують включають, але не обмежуються ними, етеніл і пропеніл.

У даному описі термін «заміщений алкеніл» відноситься до вуглеводневого радикала з прямим або розгалуженим ланцюгом, що має, щонайменше, один подвійний вуглець-вуглецевий зв'язок, необов'язково заміщеного замісниками, обраними з групи, що містить С₁₋₃-алкіл (необов'язково заміщений одним-трьома атомами F), аміно, арил, ціано і галоген, при цьому допустимо заміщення декількома групами.

У даному описі термін «алкініл» відноситься до вуглеводневого радикала з прямим або розгалуженим ланцюгом, що має, щонайменше, один потрійний вуглець-вуглецевий зв'язок. Приклади «алкінілу», що тут використовують включають, але не обмежуються ними, ацетиленіл і 1-пропініл.

У даному описі термін «заміщений алкініл» відноситься до вуглеводневого радикала з прямим або розгалуженим ланцюгом, що має, щонайменше, один потрійний вуглець-вуглецевий зв'язок, необов'язково заміщеного замісниками, обраними з групи, що містить С₁₋₃-алкіл (необов'язково заміщений одним-трьома атомами F), аміно, арил і галоген, при цьому допустимо заміщення декількома групами.

У даному описі термін «галоген» відноситься до фтору (F), хлору (Cl), броду (Br) або йоду (I), а «галоген» відноситься до радикалів галогенів фтору, хлору, броду і йоду.

У даному описі термін «карбоцикл» означає неароматичний циклічний вуглеводневий радикал, що містить від трьох до семи атомів вуглецю.

Карбоцикли, що містять п'яти-семичлені кільця, можуть мати подвійний зв'язок у кільці. Ілюстративні групи карбоциклів включають, але не обмежуються ними, циклопропіл, циклобутил, циклопентил, циклопентеніл, циклогексил і циклогептил.

У даному описі термін «заміщений карбоцикл» означає неароматичний циклічний вуглеводневий радикал, що містить від трьох до семи атомів вуглецю і необов'язково заміщений замісниками, обраними з групи, що містить С₁₋₃-алкіл (необов'язково заміщений одним-трьома атомами фтору), С₂₋₃-алкеніл, С₂₋₃-алкініл, С₁₋₂-алкокси (необов'язково заміщений одним-трьома атомами фтору), сульфаніл, сульфініл, сульфоніл, оксо, гідрокси, меркапто, аміно, гуанідино, карбокси, амінокарбоніл, арил, арилокси, гетероарил, гетероцикл, аminosульфоніл, сульфоніламіно, карбоксамід, нітро, уреїдо, ціано і галоген, при цьому допустимо заміщення декількома групами. Карбоцикли, що містять п'яти-семичлені кільця, можуть мати подвійний зв'язок у кільці.

У даному описі термін «арил» означає необов'язково заміщене бензольне кільце або необов'язково заміщене бензольне кільце, конденсоване з одним або декількома необов'язково заміщеними бензольними кільцями, утворюючи кільцеву систему. Ілюстративні необов'язкові замісники включають С₁₋₃-заміщений алкіл, С₂₋₃-заміщений алкеніл, С₂₋₃-заміщений алкініл, гетероарил, гетероцикл, арил, С₁₋₃-алкокси (необов'язково заміщений одним-трьома атомами F), арилокси, аралкокси, ацил, ароїл, гетероароїл, ацилокси, ароїлокси, гетероароїлокси, сульфаніл, сульфініл, сульфоніл, аminosульфоніл, сульфоніламіно, карбоксамід, амінокарбоніл, карбокси, оксо, гідрокси, меркапто, аміно, нітро, ціано, галоген або уреїдо, при цьому припустимо заміщення декількома групами. Таке кільце або кільцева система може бути необов'язково конденсована з одним або декількома необов'язково заміщеними арильними кільцями (включаючи бензольні кільця), карбоциклічними кільцями або гетероциклічними кільцями. Приклади «арильних» груп включають, але не обмежуються ними, феніл, нафтил, тетрагідронафтил, біфеніл, інданіл, антрацил або фенантрин, а також їхні заміщені похідні.

У даному описі термін «гетероарил» означає необов'язково заміщене моноциклічне п'яти-шестичленне ароматичне кільце, що містить один або трохи гетероатомних замісників, обраних з S, SO, SO₂, O, N або N-оксид, або таке ароматичне кільце, конденсоване з одним або декількома необов'язково заміщеними кільцями, такими як гетероарильні кільця, арильні кільця, гетероциклічні кільця або карбоциклічні кільця (наприклад, біциклічна або трициклічна кільцева система). Приклади необов'язкових замісників обрані з групи, що містить С₁₋₃-заміщений алкіл, С₂₋₃-заміщений алкеніл, С₂₋₃-заміщений алкініл, гетероарил, гетероцикл, арил, С₁₋₃-алкокси (необов'язково заміщений одним-трьома атомами F), арилокси, аралкокси, ацил, ароїл, гетероароїл, ацилокси, ароїлокси, гетероароїлокси, сульфаніл, сульфініл, сульфоніл, аminosульфоніл, сульфоніламіно, карбоксамід, амінокарбоніл, карбокси, оксо, гідрокси, меркапто, аміно, нітро, ціано, галоген або уреїдо, при цьому допустимо заміщення декількома групами. Приклади «гетероарильних» груп, що тут застосовують включають, але не обмежуються ними, бензоімідазоліл, бензотіазоліл, бензоізоізазоліл, бензотіофеніл, бензопіразиніл, бензотриазоліл, бензотриазиніл, бензо[1,4]діоксаніл, бензофураніл, 9H-α-карболініл, циннолініл, 2,3-дигідро[1,4]діоксина[2,3-b]піридиніл, фураніл, фуро[2,3-b]піридиніл, імідазоліл,

імідазолідиніл, імідазопіридиніл, ізоксазоліл, ізотіазоліл, ізохінолініл, індоліл, індазоліл, індолізиніл, нафтиридиніл, оксазоліл, оксотіадіазоліл, оксадіазоліл, фталазиніл, піридил, піроліл, пуриніл, птеридиніл, феназиніл, піразоліл, піридил, піразолопіримідиніл, піразолопіридиніл, піролізиніл, піридазил, піразиніл, піриміділ, 4-оксо-1,2-дигідро-4H-піроло[3,2,1-ij]хінолін-4-іл, хіноксалініл, хіназолініл, хінолініл, хінолізиніл, тіофеніл, триазоліл, триазиніл, тетразолопіримідиніл, тетразоліл, тіазоліл, тіазолідиніл, а також їхні заміщені варіанти.

У даному описі термін «гетероцикл (гетероциклічний)» означає три-семичлене кільце, що містить один або трохи гетероатомних залишків, обраних з S, SO, SO₂, O, N або N-оксид, необов'язково заміщених замісниками, обраними з групи, що містить C₁₋₃-заміщений алкіл, C₂₋₃-заміщений алкеніл, C₂₋₃-заміщений алкініл, гетероарил, гетероцикл, арил, C₁₋₃-алкокси (необов'язково заміщений одним-трьома атомами F), арилокси, аралкокси, ацил, ароїл, гетероароїл, ацилокси, ароїлокси, гетероароїлокси, сульфаніл, сульфініл, сульфоніл, аміносульфоніл, сульфоніламіно, карбоксиамід, амінокарбоніл, карбокси, оксо, гідрокси, меркапто, аміно, нітро, ціано, галоген або уреїдо, при цьому допустимо заміщення декількома групами. Таке кільце може бути насиченим або мати одну або кілька ступенів ненасиченості. Таке кільце може бути необов'язково конденсоване з одним або декількома іншими необов'язково заміщеними «гетероциклічними» кільцями, арильними кільцями, гетероарильними кільцями або карбоциклічними кільцями. Приклади «гетероциклічних» залишків включають, але не обмежуються ними, 1,4-діоксаніл, 1,3-діоксаніл, піролідиніл, піролідин-2-оніл, піперидиніл, імідазолідин-2,4-діоніпіридиніл, піперазиніл, піперазин-2,5-діоніл, морфолініл, дигідропіраніл, дигідроцінолініл, 2,3-дигідробензо[1,4]діоксиніл, 3,4-дигідро-2H-бензо[b][1,4]діоксепиніл, тетрагідропіраніл, 2,3-дигідрофураніл, 2,3-дигідробензофураніл, дигідроізоксазоліл, тетрагідробензодіазепиніл, тетрагідрохінолініл, тетрагідрофураніл, тетрагідронафтиридиніл, тетрагідропуриніл, тетрагідротіопіраніл, тетрагідротіофеніл, дигідрохіноксалініл, тетрагідрохіноксалініл, тетрагідропіридиніл, тетрагідрокарболініл, 4H-бензо[1,3]діоксиніл, бензо[1,3]діоксоніл, 2,2-дифторбензо[1,3]діоксоніл, 2,3-дигідрофталазин-1,4-діоніл, ізоіндол-1,3-діоніл і т.п.

У даному описі термін «алкокси» означає групу -OR_a, де R_a являє собою алкіл, що має вищевказане значення. Ілюстративні алкоксигрупи, що можуть бути використані в дійсному винаході, включають, але не обмежуються ними, метокси, диформетокси, триформетокси, етокси, n-пропокси, ізопропокси, n-бутокси і трет-бутокси.

У даному описі термін «аралкокси» означає групу -OR_aR_b, де R_a являє собою алкіл, а R_b являє собою арил, що мають вищевказані значення.

У даному описі термін «арилокси» означає групу -OR_a, де R_a являє собою арил, що має вищевказане значення.

У даному описі термін «меркапто» означає групу -SH.

У даному описі термін «сульфаніл» означає групу -SR_a, де R_a являє собою заміщений алкіл, заміщений карбоцикл, арил, гетероарил або гетероцикл, що мають вищевказані значення.

У даному описі термін «сульфініл» означає групу -S(O)R_a, де R_a являє собою заміщений алкіл, заміщений карбоцикл, арил, гетероарил або гетероцикл, що мають вищевказані значення.

У даному описі термін «сульфоніл» означає групу -S(O)₂R_a де R_a являє собою заміщений алкіл, заміщений карбоцикл, арил, гетероарил або гетероцикл, що мають вищевказані значення.

У даному описі "оксо" означає групу =O.

У даному описі термін «гідрокси» означає групу -OH.

У даному описі термін «аміно» означає групу -NH₂. Аміногрупа необов'язково заміщена заміщеним алкілом, заміщеним карбоциклом, арилом, гетероарилом або гетероциклом, що мають вищевказані значення.

У даному описі термін «ціано» означає групу -CN.

У даному описі термін «аміносульфоніл» означає групу -S(O)₂NH₂. Аміносульфонілгрупа необов'язково заміщена заміщеним алкілом, заміщеним карбоциклом, арилом, гетероарилом або гетероциклом, що мають вищевказані значення.

У даному описі термін «сульфоніламіно» означає групу -NHS(O)₂R_a, де R_a являє собою заміщений алкіл, заміщений карбоцикл, арил, гетероарил або гетероцикл, що мають вищевказані значення.

У даному описі термін «карбоксиамід» означає групу -NHC(O)R_a, де R_a являє собою заміщений алкіл, заміщений карбоцикл, арил, гетероарил або гетероцикл, що мають вищевказані значення.

У даному описі термін «карбокси» означає групу -C(O)OH. Карбоксигрупа необов'язково заміщена заміщеним алкілом, заміщеним карбоциклом, арилом, гетероарилом або гетероциклом, що мають вищевказані значення.

У даному описі термін «амінокарбоніл» означає групу -C(O)NH₂. Амінокарбонілгрупа необов'язково заміщена заміщеним алкілом, заміщеним карбоциклом, арилом, гетероарилом або гетероциклом, що мають вищевказані значення.

У даному описі термін «уреїдо» означає групу -NHC(O)NHR_a, де R_a являє собою водень, алкіл, карбоцикл або арил, що мають вищевказане значення.

У даному описі термін «гуанідино» означає групу -NHC(=NH)NH₂.

У даному описі термін «ацил» означає групу -C(O)R_a, де R_a являє собою алкіл, карбоцикл або гетероцикл, що мають вищевказані значення.

У даному описі термін «ароїл» означає групу -C(O)R_a, де R_a являє собою арил, що має вищевказані значення.

У даному описі термін «гетероароїл» означає групу -C(O)R_a, де R_a являє собою гетероарил, що має вищевказані значення.

У даному описі термін «ацилокси» означає групу -OC(O)R_a, де R_a являє собою алкіл, карбоцикл або гетероцикл, що мають вищевказані значення.

У даному описі термін «ароїлокси» означає групу -OC(O)R_a, де R_a являє собою арил, що має вищевказані значення.

У даному описі термін «гетероарілокси» означає групу $-OC(O)R_a$, де R_a являє собою гетероаріол, що має вищевказані значення.

В обсяг даного винаходу також входять фармацевтично прийнятні солі і комплекси, такі як солі хлористоводневої, бромистоводневої і трифтороцтової кислоти, а також солі натрію, калію і магнію. Сполуки відповідно до даного винаходу можуть містити один або кілька асиметричних атомів вуглецю і можуть існувати у вигляді рацемічних і оптично активних форм. Усі зазначені сполуки і їх діастереомери входять в обсяг даного винаходу.

Переважні сполуки, корисні в даному винаході, вибирають із групи, що містить:

N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-піридин-2-ілгіdraзинокарбоніл)гептил]формамід
N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-(3-метоксифеніл)гіdraзинокарбоніл)гептил]формамід,
N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-(4-трифторметилпіримідин-2-іл)гіdraзинокарбоніл)гептил]формамід,
N-[(R)-2-(N'-(4-ціановфеніл)гіdraзинокарбоніл)гептил]-N-гідроксиформамід,
N-[(R)-2-(N'-(2,6-диметилпіримідин-4-іл)гіdraзинокарбоніл)гептил]-N-гідроксиформамід,
N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-хіноксалін-2-іл)гіdraзинокарбоніл)гептил]формамід,
N-гідрокси-N-[(2R)-2-(N'-(3,4-дигідрохіноксалін-2-іл)гіdraзинокарбоніл)гептил]формамід,
N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-(1,3,4-триметил-1H-піразоло[3,4-b]піридин-6-іл)гіdraзинокарбоніл)гептил]формамід,
4-(N'-[(R)-2-[(формілгідроксіаміно)метил]гептаноїл]гіdraзино)бензолсульфонамід,
N-гідрокси-N-[(2R)-2-(циклогексилметил)-3-оксо-3-{N'-[4-(трифторметил)піримідин-2-іл]гіdraзино}пропіл]формамід,
N-гідрокси-N-[(2R)-2-(циклопентилметил)-3-оксо-3-{N'-[4-(трифторметил)піримідин-2-іл]гіdraзино}пропіл]формамід,
N-[(R)-2-(N'-(диметилтрифторметилпіримідин-4-іл)гіdraзинокарбоніл)гептил]-N-гідроксиформамід,
N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-(6-трифторметилпіридазин-3-іл)гіdraзинокарбоніл)гептил]формамід,
N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-(6-трифторметилпіримідин-4-іл)гіdraзинокарбоніл)гептил]формамід,
N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-(5-метил[1,2,4]триазоло[1,5-a]піримідин-7-іл)гіdraзинокарбоніл)гептил]формамід,
N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-(9H-пурин-6-іл)гіdraзинокарбоніл)гептил]формамід,
N-[(R)-2-(N'-(5-ціанопіримідин-2-іл)гіdraзинокарбоніл)гептил]-N-гідроксиформамід,
N-гідрокси-N-[(2R)-2-[(N'-(піримідин-2-іл)гіdraзино)карбоніл]гептил]формамід,
N-гідрокси-N-[(2R)-2-(циклобутилметил)-3-оксо-3-{N'-[4-(трифторметил)піримідин-2-іл]гіdraзино}пропіл]формамід,
N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-(6-імідазол-1-ілпіримідин-4-іл)гіdraзинокарбоніл)гептил]формамід,
N-[(R)-2-(N'-бензо[1,2,4]триазин-3-іл)гіdraзинокарбоніл)гептил]-N-гідроксиформамід,
N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-(7-метоксибензо[1,2,4]триазин-3-іл)гіdraзинокарбоніл)гептил]формамід,
N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-(1-метил-1H-піразоло[3,4-d]піримідин-6-іл)гіdraзинокарбоніл)гептил]формамід,
N-[(R)-2-{N'-[6-(5-хлорпіридин-3-ілокси)піридазин-3-іл]гіdraзинокарбоніл)гептил]-N-гідроксиформамід,
N-гідрокси-N-[(2R)-2-[(N'-[6-(1H-пірол-1-іл)-3-піридазиніл]гіdraзино)карбоніл)гептил]формамід,
N-гідрокси-N-[(2R)-2-[(N'-(9-метил-9H-пурин-6-іл)гіdraзино)карбоніл]гептил]формамід,
N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-[6-морфолін-4-іл]-9H-пурин-2-іл)гіdraзинокарбоніл)гептил]формамід,
N-[(R)-2-(N'-(6-фторпіридин-2-іл)гіdraзинокарбоніл)гептил]-N-гідроксиформамід,
N-гідрокси-N-[(2R)-2-[(N'-(1-метил-1H-піразоло[3,4-d]піримідин-4-іл)гіdraзино)карбоніл]гептил]формамід,
N-[(R)-2-(N'-(4-аміно-6-ізопропіл[1,3,5]триазин-2-іл)гіdraзинокарбоніл)гептил]-N-гідроксиформамід,
N-[(R)-2-(N'-(2,5-диметил-4-нітро-2H-піразол-3-іл)гіdraзинокарбоніл)гептил]-N-гідроксиформамід,
N-[(R)-2-(N'-(3-хлор-1-метил-1H-піразоло[3,4-d]піримідин-6-іл)гіdraзинокарбоніл)гептил]-N-гідроксиформамід,
N-[(R)-2-(N'-(6-диметиламіно-9H-пурин-2-іл)гіdraзинокарбоніл)гептил]-N-гідроксиформамід,
N-гідрокси-N-[(2R)-4-циклопропіл-2-[(N'-[4-трифторметилпіримідин-2-іл]гіdraзино)карбоніл]бутил]формамід,
N-гідрокси-N-[(2R)-2-(циклопропілметил)-3-оксо-3-{N'-[4-трифторметил]піримідин-2-іл]гіdraзино}пропіл]формамід,
N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-метил-N'-(4-трифторметилпіримідин-2-іл)гіdraзинокарбоніл)гептил]формамід, складний метиловий ефір 2-(N'-[(R)-2-[(формілгідроксіаміно)метил]гептаноїл]гіdraзино)-4-трифторметилпіримідин-5-карбонової кислоти,
2-(N-[(R)-2-[(формілгідроксіаміно)метил]гептаноїл]гіdraзино)-4-трифторметилпіримідин-5-карбонова кислота,
N-[(R)-2-(N'-(5-фтор-4-метокситримідин-2-іл)гіdraзинокарбоніл)гептил]-N-гідроксиформамід,
N-[(R)-2-(N'-(4-диметиламінопіримідин-2-іл)гіdraзинокарбоніл)гептил]-N-гідроксиформамід,
N-гідрокси-N-[(2R)-2-[(N'-[6-[(2-гідроксиетил)аміно]-1,3-дигідро-2H-пурин-2-іліден]гіdraзино)карбоніл]гептил]формамід,
N-[(R)-2-(N'-(5-фтор-4-морфолін-4-ілпіримідин-2-іл)гіdraзинокарбоніл)гептил]-N-гідроксиформамід,
N-[(R)-2-(N'-(5-фтор-4-метиламінопіримідин-2-іл)гіdraзинокарбоніл)гептил]-N-гідроксиформамід, диметиламід 2-(N'-[(R)-2-[(формілгідроксіаміно)метил]гептаноїл]гіdraзино)-4-трифторметилпіримідин-5-карбонової кислоти,
N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-3-оксо-3,4-дигідрохіноксалін-2-іл)гіdraзинокарбоніл]гептил]формамід,
N-[(R)-2-бутоксі-2-(N'-(4-трифторметилпіримідин-2-іл)гіdraзинокарбоніл)етил]-N-гідроксиформамід, (2-фторфеніл)амід 2-(N'-[(R)-2-[(формілгідроксіаміно)метил]гептаноїл]гіdraзино)-4-трифторметилпіримідин-5-карбонової кислоти,
трет-бутиламід 2-(N'-[(R)-2-[(формілгідроксіаміно)метил]гептаноїл]гіdraзино)-4-трифторметилпіримідин-5-карбонової кислоти,
N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-[(1-піперидин-1-ілметаноїл)трифторметилпіримідин-2-іл]гіdraзинокарбоніл)гептил]формамід,

N-((R)-2-[N'-(5-ціано-4-трифторметилпіримідин-2-іл)гідразинокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-гідрокси-N-((2R)-2-({N'-[9-(4,4,4-трифторбутил)-1,9-дигідро-2H-пурин-2-ілден]гідразино}карбоніл)гептил)формамід,
 N-гідрокси-N-((R)-2-({N'-[(1-морфолін-4-ілметаноїл)трифторметилпіримідин-2-іл]гідразинокарбоніл}гептил)формамід,
 бензиламід 2-(N'-((R)-2-[(формілгідроксіаміно)метил]гептаноїл)гідразино)-4-трифторметилпіримідин-5-карбонової кислоти,
 N-гідрокси-N-((2R)-3-[N'-(1,2,4-бензотриазин-3-іл)гідразино]-2-(циклогексилметил)-3-оксопропіл)формамід,
 N-гідрокси-N-((2R)-2-(циклогексилметил)-3-[N'-[7-(метилокси)-1,2,4-бензотриазин-3-іл]гідразино]-3-оксопропіл)формамід,
 2-[2-((2R)-2-[(форміл(гідрокси)аміно)метил]гептаноїл)гідразино]-N-метил-N-2-піридиніл-4-(трифторметил)-5-піримідинкарбоксамід,
 2-[2-((2R)-2-[(форміл(гідрокси)аміно)метил]гептаноїл)гідразино]-N-метил-N-феніл-4-(трифторметил)-5-піримідинкарбоксамід,
 морфолін-4-іламід 2-(N'-((R)-2-[(формілгідроксіаміно)метил]гептаноїл)гідразино)-4-трифторметилпіримідин-5-карбонової кислоти,
 N-гідрокси-N-((R)-2-({N'-[(N'-фенілгідразинокарбоніл)трифторметилпіримідин-2-іл]гідразинокарбоніл}гептил)формамід,
 піперидин-1-іламід 2-(N'-((R)-2-[(формілгідроксіаміно)метил]гептаноїл)гідразино)-4-трифторметилпіримідин-5-карбонової кислоти,
 пірол-1-іламід 2-(N'-((R)-2-[(формілгідроксіаміно)метил]гептаноїл)гідразино)-4-трифторметилпіримідин-5-карбонової кислоти,
 N-((R)-2-[N'-(диметиламінофторпіримідин-2-іл)гідразинокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-((R)-2-({N'-[(етилметиламіно)фторпіримідин-2-іл]гідразинокарбоніл}гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-гідрокси-N-((2R)-2-(циклопентилметил)-3-{N'-[7-(метилокси)-1,2,4-бензотриазин-3-іл]гідразино}-3-оксопропіл)формамід,
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(1-метил-1H-бензоімідазол-2-іл)гідразинокарбоніл]гептил)формамід,
 N-((R)-2-[N'-(4-азетидин-1-іл-5-фторпіримідин-2-іл)гідразинокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-((R)-2-[N'-(4-циклопропіламіно-5-фторпіримідин-2-іл)гідразинокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-((R)-2-(N-бензо[1,2,4]триазин-3-ілгідразинокарбоніл)-3-циклопентилпропіл)-N-гідроксиформамід,
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(морфолін-4-ілтрифторметилпіримідин-2-іл)гідразинокарбоніл]гептил)формамід,
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-[(2-гідроксиетил)метиламіно]трифторметилпіримідин-2-іл]гідразинокарбоніл)гептил)формамід,
 N-гідрокси-N-((R)-2-({N'-[(4-метилпіперазин-1-іл)трифторметилпіримідин-2-іл]гідразинокарбоніл}гептил)формамід,
 N-гідрокси-N-((2R)-2-(циклогексилметил)-3-{N'-[4-циклопропіламіно]-5-фторпіримідин-2-іл]гідразино)-3-оксопропіл)формамід,
 N-гідрокси-N-((2R)-2-(циклопентилметил)-3-{N'-[4-(циклопропіламіно)-5-фторпіримідин-2-іл]гідразино}-3-оксопропіл)формамід,
 N-гідрокси-N-((2R)-3-{N'-[4-(азетидин-1-іл)-5-фторпіримідин-2-іл]гідразино}-2-(циклопентилметил)-3-оксопропіл)формамід,
 N-гідрокси-N-((2R)-5-метил-2-({N'-[4-(трифторметил)піримідин-2-іл]гідразино}карбоніл)гексил)формамід,
 N-((R)-2-(N'-бензо[1,2,4]триазин-3-ілгідразинокарбоніл)-5-метилгексил)-N-гідроксиформамід,
 N-гідрокси-N-((2R)-5-метил-2-({N'-[7-(метилокси)-1,2,4-бензотриазин-3-іл]гідразино}карбоніл)гексил)формамід,
 N-((R)-2-[N'-(7-хлорбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразинокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-гідрокси-N-((2R)-2-(циклопентилметил)-3-{N'-[4-(морфолін-4-іл)-6-(трифторметил)піримідин-2-іл]гідразино}-3-оксопропіл)формамід,
 N-гідрокси-N-((2R)-2-(циклопентилметил)-3-{N'-[4-[(2-гідроксиетил)(метил)аміно]-6-(трифторметил)піримідин-2-іл]гідразино}-3-оксопропіл)формамід,
 N-гідрокси-N-((2R)-6-метил-2-({N'-[4-(трифторметил)піримідин-2-іл]гідразино}карбоніл)гептил)формамід,
 N-гідрокси-N-((2R)-2-({N'-[(1,2,4-бензотриазин-3-іл)гідразино]карбоніл}-6-метилгептил)формамід,
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(5-метилбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразинокарбоніл]гептил)формамід,
 N-((R)-2-({N'-[(4-етилпіперазин-1-іл)трифторметилпіримідин-2-іл]гідразинокарбоніл}гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(піперазин-1-ілтрифторметилпіримідин-2-іл)гідразинокарбоніл]гептил)формамід,
 N-((R)-2-[N'-(7-фторбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразинокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-гідрокси-N-((2R)-2-({N'-[4-(4-етил-1-піперазиніл)-6-(трифторметил)піримідин-2-іл]гідразино}карбоніл)-6-метилгептил)формамід,
 N-гідрокси-N-((2R)-6-метил-2-({N'-[4-(піперазин-1-іл)-6-(трифторметил)піримідин-2-іл]гідразино}карбоніл)гептил)формамід,
 N-гідрокси-N-((2R)-6-метил-2-({N'-[4-(4-метилпіперазин-1-іл)-6-(трифторметил)піримідин-2-іл]гідразино}карбоніл)гептил)формамід,
 N-гідрокси-N-((2R)-2-({N'-[(7-хлор-1,2,4-бензотриазин-3-іл)гідразино]карбоніл}-6-метилгептил)формамід,
 N-гідрокси-N-((2R)-6-метил-2-({N'-[(5-метил-1,2,4-бензотриазин-3-іл)гідразино]карбоніл}гептил)формамід,
 N-гідрокси-N-((2R)-2-({N'-[(7-фтор-1,2,4-бензотриазин-3-іл)гідразино]карбоніл}-6-метилгептил)формамід,
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-[(2-метоксиетиламіно)трифторметилпіримідин-2-іл]гідразинокарбоніл]гептил)формамід,
 N-гідрокси-N-((2R)-6-метил-2-({N'-[7-(метилокси)-1,2,4-бензотриазин-3-іл]гідразино}карбоніл)гептил)формамід,

N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-[4-(2-гідроксиетил)піперазин-1-іл]трифторметилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил}формамід,
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(4-піримідин-2-іл)піперазин-1-іл]трифторметилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил}формамід,
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(2-гідроксиетиламіно)трифторметилпіримідин-2-іл]гідразінокарбоніл]гептил}формамід,
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(7-трифторметилбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразінокарбоніл]гептил}формамід,
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(6-метилбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразінокарбоніл]гептил}формамід,
 N-гідрокси-N-((2R)-2-(циклопентилметил)-3-[N'-(5-метил-1,2,4-бензотриазин-3-іл)гідразіно]-3-оксопропіл}формамід,
 N-гідрокси-N-[(2R)-2-((N'-[4-(трифторметил)піримідин-2-іл]гідразіно)карбоніл)октил}формамід,
 N-гідрокси-N-((2R)-2-[N'-(1,2,4-бензотриазин-3-іл)гідразіно]карбоніл)октил}формамід,
 N-гідрокси-N-[(2R)-2-(N'-[7-(метилокси)-1,2,4-бензотриазин-3-іл]гідразіно)карбоніл)октил}формамід,
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(7-метилбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразінокарбоніл]гептил}формамід,
 N-((R)-2-[N'-(6-хлорбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(5-метоксибензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразінокарбоніл]гептил}формамід,
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(1-метил-2-оксо-1,2-дигідропіридин-4-іл)гідразінокарбоніл]гептил}формамід,
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(N'-піридин-2-іл)гідразіно]трифторметилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил}формамід,
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(4-метил-6-морфолін-4-іл)піримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил}формамід,
 N-((R)-2-[N'-(4-етилпіперазин-1-іл)-6-метилпіримідин-2-іл]гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-((R)-2-[N'-(4,6-диметилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(4-трифторметилпіридин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил}формамід,
 N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-ізохінолін-1-іл)гідразінокарбоніл]гептил}формамід,
 N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-хінолін-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил}формамід,
 N-((R)-2-[N'-(1-бензил-2-оксо-1,2-дигідропіридин-4-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(4-оксо-4H-піридо[1,2-a][1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил}формамід,
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(4-метилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил}формамід,
 N-((R)-2-[N'-(1-бутил-2-оксо-1,2-дигідропіридин-4-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(9-метил-4-оксо-4H-піридо[1,2-a][1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил}формамід,
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(6-оксо-4-трифторметил-1,6-дигідропіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил}формамід,
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(метилтрифторметилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил}формамід,
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(5-трифторметилпіридин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил}формамід,
 N-((R)-2-[N'-(6-етоксипіридин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-піридо[2,3-e][1,2,4]триазин-3-іл)гідразінокарбоніл]гептил}формамід,
 N-((R)-2-[N'-(1-етилпропіл)-2-оксо-1,2-дигідропіридин-4-іл]гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(2-оксо-1-(3-трифторметилбензил)-1,2-дигідропіридин-4-іл)гідразінокарбоніл]гептил}формамід,
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(4-метилпіридин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил}формамід,
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(6-метоксипіридин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил}формамід,
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(2-оксо-1-хінолін-8-іл)метил-1,2-дигідропіридин-4-іл)гідразінокарбоніл]гептил}формамід,
 N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-[2-оксо-1-[2-(5,6,7,8-тетрагідро[1,8]нафтиридин-2-іл)етил]дигідропіридин-4-іл)гідразінокарбоніл]гептил}формамід,
 N-((R)-2-[N'-(4,6-бісетиламіно[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-((R)-2-[N'-(бісдиметиламіно[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-((R)-2-[N'-(4,6-диморфолін-4-іл[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(4-метилпіперазин-1-іл)-6-пропіламіно[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил}формамід,
 N-((R)-2-[N'-(диметиламіноморфолін-4-іл[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(6-метилпіридин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил}формамід,
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(5-(5-феніл[1,3,4]оксадіазол-2-іл)піридин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил}формамід,
 N-((R)-2-[N'-(7-третбутил-1,4-діоксо-1,2,3,4-тетрагідропіридо[3,4-d]піридазин-5-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-((R)-2-[N'-(4-етиламіно-6-(4-метил[1,4]діазепан-1-іл)[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-((R)-2-[N'-(4-етиламіно-6-(4-етилпіперазин-1-іл)[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(6-трифторметилпіридин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил}формамід,
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(4-метил-6-морфолін-4-іл)метилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил}формамід,
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(4-метил-6-морфолін-4-іл[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил}формамід,
 N-гідрокси-N-((2R)-2-(циклопентилметил)-3-[N'-(4,6-диметил-2-піримідинил)гідразіно]-3-оксопропіл}формамід,
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(4-метил-6-піролидин-1-іл)метилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил}формамід,
 N-((R)-2-[N'-(4-диметиламінометил-6-метилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(4-метил-6-(4-метилпіперазин-1-іл)метил)піримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил}формамід,

N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(5-метилпіридин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)формамід,
 N-((R)-2-[N'-(диметиламіно(4-метил[1,4]діазепан-1-іл)[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(4-метил-6-піролідін-1-іл)[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)формамід,
 N-гідрокси-N-((R)-2-метил-6-піролідін-1-ілпіперидин-1-іл)[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)формамід,
 N-((R)-2-[N'-(етилметиламіно)метил[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-((R)-2-[N'-(4-(4-етилпіперазин-1-іл)-6-метил[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-гідрокси-N-[(2R)-7,7,7-трифтор-2-((N'-(4-(трифторметил)піримідин-2-іл)гідразіно)карбоніл)гептил]формамід,
 N-гідрокси-N-((2R)-7,7,7-трифтор-2-[N'-(5-метил-1,2,4-бензотриазин-3-іл)гідразіно]карбоніл]гептил)формамід,
 N-гідрокси-N-((2K)-7,7,7-трифтор-2-[N'-(7-метил-1,2,4-бензотриазин-3-іл)гідразіно]карбоніл]гептил)формамід,
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(4-метиламіно-6-морфолін-4-іл)[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)формамід,
 N-((R)-2-[N'-(4-етилпіперзин-1-іл)-6-метиламіно[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-((R)-2-[N'-(4-етиламіно-6-морфолін-4-іл)[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(4,6,7-триметил-7,8-дигідропротеридин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)формамід,
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(4,6,7-триметилптеридин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)формамід,
 N-гідрокси-N-((R)-[N'-(метоксиметоксиметилтрифторметилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)формамід,
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(4-метил-6-(1-піперидин-1-ілметаноїл)піримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)формамід,
 циклопропіламід 2-(N'-((R)-2-[(формілгідроксіаміно)метил]гептаноїл)гідразіно)-6-метилпіримідин-4-карбоновой кислоти,
 діізопропіламід 2-(N'-((R)-2-[(формілгідроксіаміно)метил]гептаноїл)гідразіно)-6-метилпіримідин-4-карбоновой кислоти,
 N-((R)-2-[N'-(5-ціанопіридин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-((R)-2-[N'-(4,6-діетил[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-((R)-4-циклопентил-2-[N'-(4-трифторметилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]бутил)-N-гідроксиформамід,
 N-((R)-4-циклопентил-2-[N'-(7-метилбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразінокарбоніл]бутил)-N-гідроксиформамід,
 N-((R)-4-циклопентил-2-[N'-(5-метилбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразінокарбоніл]бутил)-N-гідроксиформамід,
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(6-(4-метилпіперазин-1-ілметил)піридин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)формамід,
 N-((R)-2-[N'-(5-(4,6-диметоксипіримідин-2-іл)піридин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-((R)-2-[N'-(діетиламінометил[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-[(2-метіоксиетил)метиламіно]метил[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)формамід,
 N-((R)-1-[N'-(4-(2,6-диметилморфолін-4-іл)-6-метил[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-((R)-2-[N'-(5-фтор-4-метил-6-морфолін-4-ілпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-((R)-2-[N'-(4-етил-6-морфолін-4-іл)[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-((R)-2-[N'-(етилметиламіно)[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-((R)-2-[N'-(4-етил-6-(4-етилпіперазин-1-іл)[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-((R)-2-[N'-(5-фтор-4-метил-6-(4-метилпіперазин-1-іл)піримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-((R)-2-[N'-(диметиламіноетил[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-((R)-2-[N'-(5-фтор-4-метил-6-(4-метил[1,4]діазепан-1-іл)піримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-((R)-4-циклопентил-2-[N'-(морфолін-4-ілтрифторметилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]бутил)-N-гідроксиформамід,
 N-((R)-2-[N'-(етил[(2-метоксіетил)метиламіно][1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-((R)-2-[N'-(диметиламінометилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-((R)-2-[N'-(4-циклопропіламіно-6-метилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-((R)-2-циклогексил-2-[N'-(4-трифторметилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]етил)-N-гідроксиформамід,
 N-((R)-2-циклогексил-2-[N'-(7-метоксибензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразінокарбоніл]етил)-N-гідроксиформамід,
 N-((R)-2-циклогексил-2-[N'-(5-метилбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразінокарбоніл]етил)-N-гідроксиформамід,
 N-((R)-4,4-диметил-2-[N'-(4-трифторметилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]пентил)-N-гідроксиформамід,
 N-((R)-4,4-диметил-2-[N'-(7-метилбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразінокарбоніл]пентил)-N-гідроксиформамід,
 N-((R)-4,4-диметил-2-[N'-(5-метилбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразінокарбоніл]пентил)-N-гідроксиформамід,
 N-((R)-4,4-диметил-2-[N'-(морфолін-4-ілтрифторметилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]пентил)-N-гідроксиформамід,

[illegible]

оксопропіл)формамід,
N-((R)-2-{N'-[4-етил-6-(4-ізопропілпіперазин-1-іл)][1,3,5]триазин-2-іл}гідразінокарбоніл)гептил)-N-гідроксиформамід,
N-гідрокси-N-[(2R)-3-[N'-(6-хлор-1,2,4-бензотриазин-3-іл)гідразіно]-2-(циклопентилметил)-3-оксопропіл]формамід,
N-((R)-4,4-диметил-2-[N'-(4-трифторметилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гексил)-N-гідроксиформамід,
N-((R)-4,4-диметил-2-[N'-(7-метилбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразінокарбоніл]гексил)-N-гідроксиформамід,
N-((R)-4,4-диметил-2-[N'-(5-метилбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразінокарбоніл]гексил)-N-гідроксиформамід,
N-((R)-4,4-диметил-2-[N'-(морфолін-4-ілтрифторметилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гексил)-N-гідроксиформамід,
N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(5-феніл[1,2,4]триазин-3-іл)гідразінокарбоніл]гептил)формамід,
N-((R)-2-[N'-(4-етил-6-морфолін-4-ілпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
N-((R)-2-{N'-[4-етил-6-(4-метилпіперазин-1-іл)піримідин-2-іл]гідразінокарбоніл}гептил)-N-гідроксиформамід,
N-((R)-2-[N'-(5-етил-4-метилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
N-((R)-2-{N'-[4-етил-6-(4-пропілпіперазин-1-іл)][1,3,5]триазин-2-іл}гідразінокарбоніл)гептил)-N-гідроксиформамід,
N-гідрокси-N-((R)-2-{N'-[6-(4-піримідин-2-ілпіперазин-1-ілметил)піридин-2-іл]гідразінокарбоніл}гептил)формамід,
N-гідрокси-N-((R)-2-{N'-[6-(3-[1,2,4]триазол-1-ілметил[1,2,4]триазол-1-іл)піридин-2-іл]гідразінокарбоніл}гептил)формамід,
N-((R)-3-біцикло[2.2.1]гепт-7-ил-2-[N'-(4-трифторметилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]пропіл)-N-гідроксиформамід,
N-((R)-3-біцикло[2.2.1]гепт-7-ил-2-[N'-(морфолін-4-ілтрифторметилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]пропіл)-N-гідроксиформамід,
N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-піридин-3-іл)гідразінокарбоніл]гептил)формамід,
Іодид 4-{4-етил-6-[2-((2R)-2-{[форміл(гідрокси)аміно]метил}гептаноїл)гідразіно]-1,3,5-триазин-2-іл]-1-метил-1-пропілпіперазин-1-іл},
N-((R)-3-біцикло[2.2.1]гепт-7-ил-2-[N'-(5-метилбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразінокарбоніл]пропіл)-N-гідроксиформамід,
N-((R)-2-[N'-(4-азетидин-1-іл-6-етил[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
N-((R)-2-циклопентил-2-[N'-(4-трифторметилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]етил)-N-гідроксиформамід,
N-((R)-2-циклопентил-2-[N'-(морфолін-4-іл-4-трифторметилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]етил)-N-гідроксиформамід,
N-((R)-2-циклопентил-2-[N'-(4-метилпіридин-2-іл)гідразінокарбоніл]етил)-N-гідроксиформамід,
N-((R)-2-циклопентил-2-[N'-(диметиламіноетил[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]етил)-N-гідроксиформамід,
N-((R)-2-циклопентил-2-[N'-(7-метилбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразінокарбоніл]етил)-N-гідроксиформамід,
N-((R)-2-циклопентил-2-[N'-(5-метилбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразінокарбоніл]етил)-N-гідроксиформамід,
N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(5-метилбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразінокарбоніл]-2-(4-метилциклогексил)етил)формамід,
N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(7-метилбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразінокарбоніл]-2-(4-метилциклогексил)етил)формамід,
N-гідрокси-N-((R)-2-(4-метилциклогексил)-2-[N'-(4-трифторметилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]етил)формамід,
N-гідрокси-N-((R)-2-(4-метилциклогексил)-2-[N'-(морфолін-4-ілтрифторметилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]етил)формамід,
N-гідрокси-N-((R)-2-(4-метилциклогексил)-2-[N'-(4-метилпіридин-2-іл)гідразінокарбоніл]етил)формамід,
N-((R)-2-[N'-(диметиламіноетил[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]-2-(4-метилциклогексил)етил)-N-гідроксиформамід,
N-((R)-2-[N'-(6,7-дигідро-5H-циклопентапіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
N-((R)-2-[N'-(4-етил-6-((S)-2-гідроксиметилпіролідин-1-іл)][1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
N-((R)-2-[N'-(диметиламінопіридин-3-ілпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
N-((R)-2-[N'-(диметиламінопіридин-4-ілпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
N-гідрокси-N-((R)-2-N'-(5,6,7,8-тетрагідробензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразінокарбоніл]гептил)формамід,
N-((R)-2-[N'-(5,6-диетил[1,2,4]триазин-3-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(5-(4-гідроксифеніл)[1,2,4]триазин-3-іл)гідразінокарбоніл]гептил)формамід,
N-((R)-2-(N'-[(2-диметиламіноетил)метиламіно]етил[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл)гептил)-N-гідроксиформамід,
N-((R)-2-[N'-(2-диметиламінохіназолін-4-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(3-метансульфоніл-4,6-диметилпіридин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)формамід,
N-((R)-2-{N'-[4-етил-6-(3-гідроксипіридин-1-іл)][1,3,5]триазин-2-іл}гідразінокарбоніл)гептил)-N-гідроксиформамід,
N-((R)-2-(N'-[4,5]біпіримідиніл-2-іл)гідразінокарбоніл)гептил)-N-гідроксиформамід,
N-((R)-2-{N'-[(циклопропілметиламіно)етил[1,3,5]триазин-2-іл]гідразінокарбоніл}гептил)-N-гідроксиформамід,
N-((R)-2-{N'-[4-етил-6-((R)-3-гідроксипіролідин-1-іл)][1,3,5]триазин-2-іл}гідразінокарбоніл)гептил)-N-гідроксиформамід,
N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-[3,3']біпіридинил-5-іл)гідразінокарбоніл]гептил)формамід,

N-гідрокси-N-[(R-2-[N'-(5-морфолін-4-ілпіридин-3-іл)гідразинокарбоніл]гептил]формамід,
 N-гідрокси-N-[(R)-2-[N'-(4-піридин-3-ілпіридин-2-іл)гідразинокарбоніл]гептил]формамід,
 N-гідрокси-N-[(R)-2-[N'-(5,6,7,8-тетрагідрокіназолін-2-іл)гідразинокарбоніл]гептил]формамід,
 N-[(R)-2-(N'-[циклопропіл-1-(1-метилпіперидин-4-іл)аміно]етил[1,3,5]триазин-2-іл)гідразинокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід,
 N-((R)-2-{N'-[4-((R)-3-диметиламінопіролідін-1-іл)-6-етил[1,3,5]триазин-2-іл]гідразинокарбоніл}гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-[5-(1H-пірол-2-іл)піридин-3-іл]гідразинокарбоніл]гептил]формамід,
 N-гідрокси-N-[(R)-2-[N'-(4-метилпіперазин-1-іл)трифторметилпіримідин-4-іл]гідразинокарбоніл]гептил]формамід,
 N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-[5-(5-фуран-3-ілпіридин-3-іл)гідразинокарбоніл]гептил]формамід,
 N-[(R)-5,5-диметил-2-[N'-(4-трифторметилпіримідин-2-іл)гідразинокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід,
 N-[(R)-5,5-диметил-2-[N'-(7-метилбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразинокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід,
 N-[(R)-5,5-диметил-2-(4-метилпіридин-2-іл)гідразинокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід,
 N-[(R)-2-циклогептил-2-[N'-(4-трифторметилпіримідин-2-іл)гідразинокарбоніл]етил]-N-гідроксиформамід,
 N-[(R)-2-циклогептил-2-[N'-(4-метилпіридин-2-іл)гідразинокарбоніл]етил]-N-гідроксиформамід,
 N-[(R)-2-циклогептил-2-[N'-(диметиламіноетил[1,3,5]триазин-2-іл)гідразинокарбоніл]етил]-N-гідроксиформамід,
 N-[(R)-2-циклогептил-2-[N'-(7-метилбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразинокарбоніл]етил]-N-гідроксиформамід,
 N-((R)-[N'-[4-етил-6-(4-гідроксипіперидин-1-іл)[1,3,5]триазин-2-іл]гідразинокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-[(R)-5,5-диметил-2-[N'-(5-метилбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразинокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід,
 N-[(R)-2-[N'-(4-диметиламінохіназолін-2-іл)гідразинокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід,
 N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-(4-піридин-4-ілпіримідин-2-іл)гідразинокарбоніл]гептил]формамід,
 N-гідрокси-N-[(R)-2-[N'-(4-(3-гідроксиметилфеніл)піримідин-2-іл)гідразинокарбоніл]гептил]формамід,
 N-гідрокси-N-[(R)-2-[N'-(4-(4-гідроксиметилфеніл)піримідин-2-іл)гідразинокарбоніл]гептил]формамід,
 N-((R)-2-{N'-[4-етил-6-(3-метоксипіперидин-1-іл)[1,3,5]триазин-2-іл]гідразинокарбоніл}гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-гідрокси-N-[(R)-2-[N'-(7-метилбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразинокарбоніл]-2-(4-метилциклогексил)етил]формамід,
 N-[(R)-2-{N'-[етил(етилметиламіно)[1,3,5]триазин-2-іл]гідразинокарбоніл}-2-(4-метилциклогексил)етил]-N-гідроксиформамід,
 N-[(R)-2-{N'-[етил(етилметиламіно)[1,3,5]триазин-2-іл]гідразинокарбоніл}-2-(4-метилциклогексил)етил]-N-гідроксиформамід,
 N-гідрокси-N-[(R)-2-[N'-(7-метилбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразинокарбоніл]-2-(4-метилциклогексил)етил]формамід,
 N-((R)-2-{N'-[4-(2,6-диметоксифеніл)піримідин-2-іл]гідразинокарбоніл}гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-((R)-2-{N'-[4-етил-6-((R)-3-метоксипіролідін-1-іл)[1,3,5]триазин-2-іл]гідразинокарбоніл}гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-((R)-2-{N'-[4-етил-6-(4-метоксипіперидин-1-іл)[1,3,5]триазин-2-іл]гідразинокарбоніл}гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-(6-піролідін-1-ілпіримідин-4-іл)гідразинокарбоніл]гептил]формамід,
 N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-(6-(4-метилпіперазин-1-іл)піримідин-4-іл)гідразинокарбоніл]гептил]формамід,
 N-[(R)-2-[N'-(6-диметиламінопіримідин-4-іл)гідразинокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід,
 N-[(R)-2-[N'-(піридин-4-ілтрифторметилпіримідин-4-іл)гідразинокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід,
 N-[(R)-2-[N'-(піридин-3-ілтрифторметилпіримідин-4-іл)гідразинокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід,
 N-[(R)-2-[N'-(2-етиламіно-6-трифторметилпіримідин-4-іл)гідразинокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід,
 N-гідрокси-N-[(R)-2-[N'-(5-(4-метоксифеніл)[1,2,4]триазин-3-іл)гідразинокарбоніл]гептил]формамід,
 N-гідрокси-N-[(R)-2-[N'-(4-(2,3,4-триметоксифеніл)піримідин-2-іл)гідразинокарбоніл]гептил]формамід,
 N-[(R)-4,4-диметил-2-[N'-(4-трифторметилпіримідин-2-іл)гідразинокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід,
 N-[(R)-4,4-диметил-2-[N'-(7-метилбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразинокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід,
 N-[(R)-4,4-диметил-2-[N'-(5-метилбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразинокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід,
 N-[(R)-4,4-диметил-2-[N'-(4-метилпіридин-2-іл)гідразинокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід,
 N-гідрокси-N-[(R)-2-[N'-(6-морфолін-4-ілпіримідин-4-іл)гідразинокарбоніл]гептил]формамід,
 N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-[5-(4-(2-гідроксиетокси)феніл)[1,2,4]триазин-3-іл]гідразинокарбоніл]гептил]формамід,
 N-[(R)-2-[N'-(4-фуран-2-ілпіримідин-2-іл)гідразинокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід,
 N-((R)-2-[N'-(4-(3,5-диметилізоксазол-4-іл)піримідин-2-іл)гідразинокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-гідрокси-N-[(R)-2-[N'-(4-метил-1-оксипіридин-2-іл)гідразинокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід,
 2-(N'-[(R)-2-[(формілгідроксіаміно)метил]гептаноіл]гідразино)-6-метилнікотінова кислота,
 N-гідрокси-N-[(R)-2-[N'-(3-метоксипіридин-2-іл)гідразинокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід,
 N-гідрокси-N-[(2R)-2-[(N'-[4-(4-(метилсульфоніл)феніл)піримідин-2-іл]гідразино)карбоніл]гептил]формамід,
 N-гідрокси-N-[(2R)-2-[(N'-[4-(фуран-3-іл)піримідин-2-іл]гідразино)карбоніл]гептил]формамід,
 N-[(2R)-2-[(N'-[4-(2-амінофеніл)піримідин-2-іл]гідразино)карбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід,
 N-гідрокси-N-[(2R)-2-[(N'-[5-(5-метил-1,3,4-оксадіазол-2-іл)-4-(трифторметил)піримідин-2-іл]гідразино)карбоніл]гептил]формамід,
 N-гідрокси-N-[(2R)-2-(циклопентилметил)-3-{N'-[5-(5-метил-1,3,4-оксадіазол-2-іл)-4-(трифторметил)піримідин-2-іл]гідразино}-3-оксопропіл]формамід,
 N-[(2R)-2-[(N'-[6-(диметиламіно)-2-метилпіримідин-4-іл]гідразино)карбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід,
 N-[(2R)-2-[(N'-[2-циклопропіл-6-(диметиламіно)піримідин-4-іл]гідразино)карбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід,

гідроксиформамід,
 N-гідрокси-N-[(2R)-4-(2-тієніл)-2-({N'-[4-(трифторметил)піримідин-2-іл]гідразино}карбоніл)бутил]формамід,
 N-гідрокси-N-[(2R)-2-({N'-[4-метилпіримідин-2-іл]гідразино}карбоніл)-4-(2-тієніл)бутил]формамід,
 N-[(2R)-2-({N'-[4-етил-6-[етил(метил)аміно]-1,3,5-триазин-2-іл]гідразино}карбоніл)-4-(2-тієніл)бутил]-N-гідроксиформамід,
 N-гідрокси-N-((2R)-3-оксо-2-(2-тієнілметил)-3-{N'-[4-(трифторметил)піримідин-2-іл]гідразино}пропіл)формамід,
 N-гідрокси-N-[(2R)-3-{N'-[4-метилпіримідин-2-іл]гідразино}-3-оксо-2-(2-тієнілметил)пропіл]формамід,
 N-[(2R)-3-{N'-[4-етил-6-[етил(метил)аміно]-1,3,5-триазин-2-іл]гідразино}-3-оксо-2-(2-тієнілметил)пропіл]-N-гідроксиформамід,
 N-гідрокси-N-[(2R)-2-({N'-[2-метил-6-(піридин-2-іл)піримідин-4-іл]гідразино}карбоніл)гептил]формамід,
 N-гідрокси-N-[(2R)-2-({N'-[6-(піридин-2-ілметил)піридазин-3-іл]гідразино}карбоніл)гептил]формамід,
 N-гідрокси-N-[(2R)-2-({N'-[2-метил-6-(морфолін-4-іл)піримідин-4-іл]гідразино}карбоніл)гептил]формамід,
 N-гідрокси-N-[(2R)-2-({N'-[6-(морфолін-4-іл)-2-(трифторметил)піримідин-4-іл]гідразино}карбоніл)гептил]формамід,
 N-гідрокси-N-[(2R)-2-({N'-[4-метил(піридин-2-іл)аміно]піримідин-2-іл]гідразино}карбоніл)гептил]формамід,
 N-гідрокси-N-((2R)-2-(циклопентилметил)-3-{N'-[4-циклопропіл-6-(диметиламіно)-1,3,5-триазин-2-іл]гідразино}-3-оксопропіл)формамід, складний трет-бутиловий ефір N-бензо[1,3]діоксол-5-ілметилгідразинкарбоновой кислоти,
 N-[(R)-2-(N'-бензо[1,3]діоксол-5-ілметилгідразинокарбоніл)гептил]-N-гідроксиформамід,
 N-[(R)-2-{N'-(2,3-дигідро[1,4]діоксина[2,3-б]піридин-7-ілметил)гідразинокарбоніл}гептил]-N-гідроксиформамід,
 диметиламінобензилгідразинокарбонілгептил]-N-гідроксиформамід,
 N-гідрокси-N-((R)-2-{N'-[2-(5,6,7,8-тетрагідро[1,8]нафтиридин-2-іл)етил]гідразинокарбоніл}гептил)-N-гідроксиформамід,
 N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-хінолін-2-ілметилгідразинокарбоніл)гептил]формамід,
 N-гідрокси-N-[(R)-2-{N'-(1,2,3,4-тетрагідрохінолін-2-ілметил)гідразинокарбоніл}гептил]формамід,
 N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-хінолін-6-ілметилгідразинокарбоніл)гептил]формамід,
 N-[(R)-2-(N'-бензофуран-2-ілметилгідразинокарбоніл)гептил]-N-гідроксиформамід,
 N-[(R)-2-(N'-циклопропілметилгідразинокарбоніл)гептил]-N-гідроксиформамід,
 N-[(R)-2-{N'-(6-фтор-4H-бензо[1,3]діоксин-8-ілметил)гідразинокарбоніл}гептил]-N-гідроксиформамід,
 N-гідрокси-N-[(R)-2-{N'-(4-метоксибензил)гідразинокарбоніл}гептил]гідроксиформамід,
 N-гідрокси-N-[(R)-2-{N'-(2-метоксибензил)гідразинокарбоніл}гептил]формамід,
 N-гідрокси-N-[(R)-2-{N'-(тетрагідрофуран-3-ілметил)гідразинокарбоніл}гептил]формамід,
 N-[(R)-2-(N'-фуран-3-ілметилгідразинокарбоніл)гептил]-N-гідроксиформамід,
 N-[(R)-2-{N'-(2,3-дигідробензо[1,4]діоксин-6-ілметил)гідразинокарбоніл}гептил]-N-гідроксиформамід,
 N-[(R)-2-{N'-(2,3-дигідробензо[1,4]діоксин-2-ілметил)гідразинокарбоніл}гептил]-N-гідроксиформамід,
 N-гідрокси-N-[(R)-2-{N'-(2-феноксіетил)гідразинокарбоніл}гептил]формамід,
 N-[(R)-2-{N'-(S)-2,3-дигідроксипропіл}гідразинокарбоніл}гептил]-N-гідроксиформамід,
 N-гідрокси-N-[(R)-2-{N'-(5-метилізоксазол-3-ілметил)гідразинокарбоніл}гептил]формамід,
 N-[(R)-2-{N'-[1-(1-бензо[1,3]діоксол-5-ілметаноїл)піперидин-4-іл]гідразинокарбоніл}гептил]-N-гідроксиформамід,
 N-[(R)-2-{N'-[1-(1-бензофуран-2-ілметаноїл)піперидин-4-іл]гідразинокарбоніл}гептил]-N-гідроксиформамід,
 N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-[1-(7-метоксибензофуран-2-іл)метаноїл]піперидин-4-іл]гідразинокарбоніл}гептил]формамід,
 N-[(R)-2-{N'-[1-бензилпіперидин-4-іл]гідразинокарбоніл}гептил]-N-гідроксиформамід,
 N-[(R)-2-(N'-[1-(3,4-дихлорфеніл)метаноїл]піперидин-4-іл]гідразинокарбоніл}гептил]-N-гідроксиформамін,
 N-[(R)-2-(N'-[1-(1-(2,3-дихлорфеніл)метаноїл)піперидин-4-іл]гідразинокарбоніл}гептил]-N-гідроксиформамід,
 N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-[1-(4-метилпіперазин-1-іл)метаноїл]пентил}гідразинокарбоніл)гептил]формамід,
 N-[(R)-2-(N'-бензилгідразинокарбоніл)гептил]-N-гідроксиформамід.

Загальна послідовність синтезу

Сполуки і способи відповідно до даного винаходу стануть більш зрозумілими при розгляді наступних схем синтезу, які усього лише ілюструють способи, якими можуть бути отримані сполуки відповідно до даного винаходу, при цьому вони не повинні розглядатися як обмеження обсягу даного винаходу, що заявлений у прикладеній формулі винаходу.

Даний винахід стосується сполук формули (1), які можуть бути отримані з загальної рацемічної проміжної сполуки (8) або загальних хіральних проміжних сполук (17) і (25).

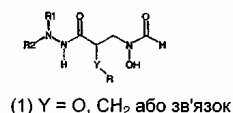
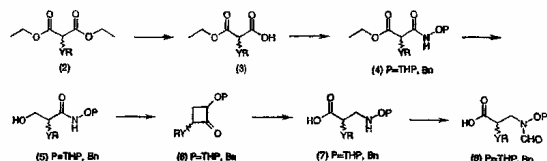


Схема 1



Як показано на схемі 1, проміжну сполуку (8) може бути отримано взаємодією монозаміщеного діалкілмалонату (2) з основою, такою як гідроксид калію, у відповідному розчиннику, такому як етанол/вода, з одержанням монокислоти (3). У результаті взаємодії сполуки (3) з О-бензилгідроксиламіном або О-(тетрагідро-2Н-піран-2-іл)гідроксиламіном у присутності реагенту сполучення, такого як гідрохлорид 1-[3-(диметиламіно)пропіл]-3-етилкарбодіїміду (EDCI), і основи, такої як 4-диметиламінопіридин (DMAP), у відповідному розчиннику, такому як дихлорметан, одержують амід (4), у якому Р являє собою бензил або тетрагідро-2Н-піран-2-іл. У результаті відновлення складноєфірної функціональної групи сполуки (4) агентом, що відновлює, таким як боргідрид літію, у відповідному розчиннику, такому як тетрагідрофуран, при кімнатній температурі одержують спирт (5). Оброблення спирту (5) в умовах реакції Міцунобу дозволяє одержати лактам (6). Подібна трансформація може бути досягнута в результаті оброблення сполуки (5) трифенілфосфіном, тетрахлоридом вуглецю і основою, такою як триетиламін, з одержанням сполуки (6). Гідроліз лактаму (6) із застосуванням, наприклад, гідроксиду літію у відповідній суміші розчинників, такою як ТГФ-Н₂О-МеОН, дозволяє одержати кислоту (7). Формілування аміногрупи сполуки (7) здійснюють, застосовуючи мурашину кислоту й оцтовий ангідрид у розчиннику, такому як дихлорметан, одержуючи формільовану сполуку (8).

Будь-які рацемати можуть бути розділені під час синтезу на рівні будь-якої проміжної сполуки за допомогою, наприклад, способу хіральної хроматографії, з одержанням сполуки (8) у кожній із двох енантіомерних форм.

Альтернативно, енантіомер проміжної сполуки (8), такої як сполука (18) на схемі 2 або (27) на схемі 3, може бути отриманий взаємодією відповідного хлорангідриду кислоти (9) з хіральним агентом, таким як хіральний оксазолідинон Еванса, у присутності основи, такої як *n*-бутиллітій, з одержанням хіральної проміжної сполуки (10), зазначеної на схемі 2, або (19) на схемі 3. Оброблення сполуки (10) або (19) основою, такою як діізопропілетиламін, у присутності хелатуючого агента, такого як тетрахлорид титану, у розчиннику, такому як тетрагідрофуран, з наступним додаванням електрофілу, такого як бензилоксиметилхлорид, дозволяє одержати кожну з двох хіральних сполук (11) або (20), у залежності від вибору хірального допоміжного засобу. Перетворення сполуки (11) або (20) у відповідну оксикислоту (14) або (23) може бути здійснено за допомогою послідовності, що включає окислювальне розщеплення хірального оксазолідинону з застосуванням, наприклад, Н₂О₂ і гідроксиду літію, до відповідних проміжних сполук (12) або (21) з наступним гідрогенолізом для одержання проміжних сполук (13) або (21), відповідно. Сполуки (10) або (19) також можуть бути перетворені в проміжні сполуки (14) або (23), відповідно, у результаті двоступінчастої процедури. Для здійснення такого перетворення сполуки (10) або (19) можуть бути оброблені основою, такою як діізопропілетиламін, у присутності хелатуючого агента, такого як тетрахлорид титану, у розчиннику, такому як тетрагідрофуран, з наступним додаванням триоксану або будь-якого іншого еквівалента формальдегіду для одержання сполук (13) або (22), що потім піддають окислювальному розщепленню хірального оксазолідинону з застосуванням, наприклад, Н₂О₂ і гідроксиду літію, до відповідних кислот (14) або (23), відповідно.

Взаємодія кислоти (14) або (23) з бензилоксиаміном або О-(тетрагідро-2Н-піран-2-іл)гідроксиламіном у присутності агентів сполучення, таких як EDCI-DMAP, дозволяє одержати аміди (15) або (24), відповідно. Вони можуть бути циклізовані до азетидин-2-онів (16) або (25) із застосуванням умов реакції Міцунобу або комбінації трифенілфосфін-тетрахлоридвуглеця-триетиламін. У результаті гідролізу азетидин-2-она (16) або (25) із застосуванням, наприклад, гідроксиду літію, у відповідному розчиннику одержують відповідну кислоту (17) або (26), відповідно. Перетворення сполуки (17) або (26) у карбонову кислоту (18) або (27) може бути здійснене з застосуванням відповідного формілюючого агента, такого як мурашина кислота/оцтовий ангідрид або метилформіат, у чистих реагентах або у відповідному розчиннику, такому як дихлорметан.

Схема 2

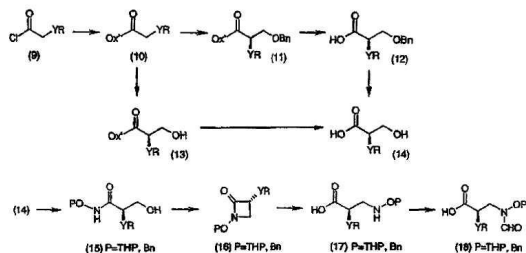
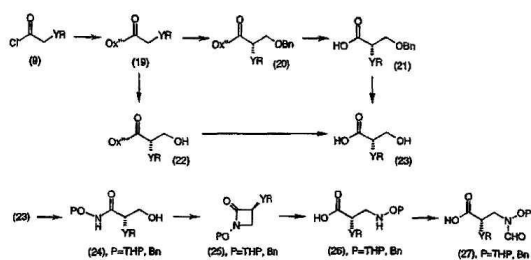
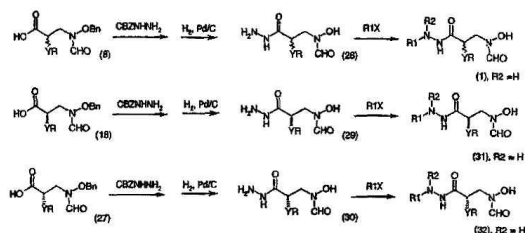


Схема 3



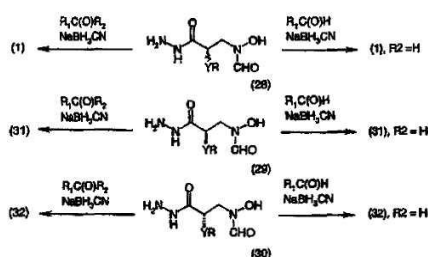
Як показано на схемі 4, сполуку (8) піддають взаємодії з CBZHNH₂ із застосуванням DMAP-EDCI або EDCI-HOAt-NMM, а потім дебензилуванню для одержання сполуки (28). Взаємодія сполуки (28) з галоїдом або трифторметилом R₁X приводить до одержання сполуки (1), у якій R₂ являє собою H. Так само, сполуки (18) і (27) піддають такій же процедурі для одержання, відповідно, сполук (31), у якій R₂ являє собою H, і (32), у якій R₂ також являє собою H.

Схема 4



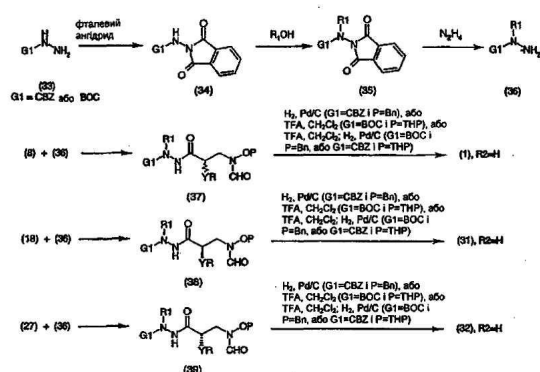
Альтернативно, як показано на схемі 5, сполуку (28) піддають відновлювальному алкілюванню кетоном R₁C(O)R₂, застосовуючи як відновник, наприклад, ціаноборгідрид натрію, для одержання сполуки (1). При використанні для відновлювального алкілювання альдегіду R₁C(O)H одержують сполуки (1), у якій R₂ являє собою H. Так само, сполуку (29) піддають відновлювальному алкілюванню кетоном R₁C(O)R₂ для одержання сполуки (31), або альдегідом R₁C(O)H для одержання сполуки (31), у якій R₂ являє собою H. Так само, сполуки (30) піддають відновлювальному алкілюванню кетоном R₁C(O)R₂ для одержання сполуки (32), або альдегідом R₁C(O)H для одержання сполуки (32), у якій R₂ являє собою H.

Схема 5



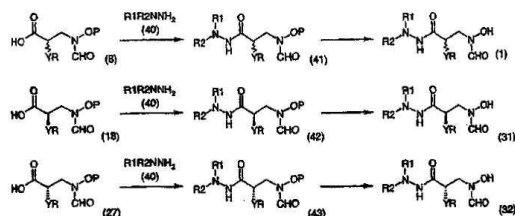
Альтернативно, як показано на схемі 6, монозахищений гідрозин G₁NHNH₂ (33), у якому G₁ являє собою бензилоксикарбоніл або трет-бутоксикарбоніл, піддають взаємодії з фталевим ангідридом для одержання проміжної сполуки (34). Сполуку (34) піддають взаємодії зі спиртом R₁OH в умовах реакції Міцунобу для одержання сполуки (35), з якої після гідразінолізу одержують гідрозин (36). Взаємодія сполуки (36) з кислотою (8) із застосуванням DMAP/EDCI або EDCI/HOAt/NMM дозволяє одержати сполуку (37). Із сполуки (37) можуть бути цілком вилучені захисні групи за одну стадію з застосуванням гідрогенлізу в тому випадку, коли G₁ являє собою бензилоксикарбоніл, а Р являє собою бензил, за одну стадію з застосуванням кислотних умов у тому випадку, коли G₁ являє собою трет-бутоксикарбоніл, а Р являє собою О-(тетрагідро-2Н-піран-2-іл), або за двох стадій (у результаті кислотного оброблення і гідрогенлізу) у тому випадку, коли G₁ являє собою бензилоксикарбоніл, а Р являє собою О-(тетрагідро-2Н-піран-2-іл), або G₁ являє собою трет-бутоксикарбоніл, а Р являє собою бензил. В усіх трьох випадках одержують сполуки (1), у якій R₂ являє собою H. Так само, сполуки (18) і (27) можуть бути піддані такій же процедурі для одержання, відповідно, сполуки (31), у якій R₂ являє собою H, або (32), у якій R₂ також являє собою H.

Схема 6



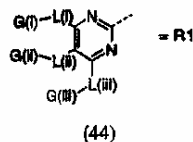
Як показано на схемі 7, взаємодія кислоти (8) з гідразином $R_1R_2NNH_2$ (40) із застосуванням DMAP-EDCI або EDCI-HOAt-NMM дозволяє одержати гідразид (41). У результаті остаточного зняття захисної групи (гідрогеноліз із застосуванням каталізатора, такого як 10% Pd/C, у відповідному розчиннику, такому як етанол, у тому випадку, коли Р являє собою Вп; оброблення 80% оцтовою кислотою-водою при кімнатній температурі або 40°C у тому випадку, коли Р являє собою ТНР) одержують бажану сполуку (1). Так само, взаємодія хіральної кислоти (18) або (27) з гідразином (40) дозволяє одержати відповідний гідразид (42) або (43). У результаті остаточного зняття захисної групи одержують бажані сполуки (31) або (32).

Схема 7



Гідразини загальної структури $R_1R_2NNH_2$ (40) можуть бути придбані з доступних комерційних джерел або отримані фахівцями в даній області відповідно до описаних в літературі способами. Приклади, що приводяться нижче, конкретних структур гідразина (40) та способів синтезу, застосовуваних для їхнього одержання, є чисто ілюстративними і не повинні розглядатися як обмежуючий обсяг даного винаходу.

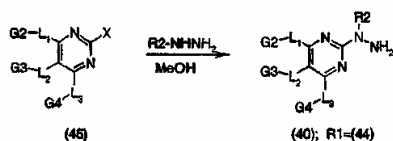
Гідразини (40), у яких R_2 являє собою алкіл або водень, а R_1 має загальну структуру (44), можуть бути отримані з відповідних вихідних сполук, представлених на схемах 8, 9 і 10.



Як показано на схемі 8, гідразин (40), у якому R_1 являє собою групу (44), може бути отриманий з вихідної сполуки (45) у результаті оброблення відповідним гідразиним, таким як моногідрат гідразину, у відповідному розчиннику, такому як метанол. Альтернативно, як показано на схемі 9, гідразин (40), у якому R_1 являє собою групу (44), може бути отриманий з вихідної сполуки (46) шляхом окислювання до сульфону в результаті оброблення відповідним окислювачем, таким як мета-хлорпербензойна кислота (м-CPBA) у відповідному розчиннику, такому як метиленхлорид.

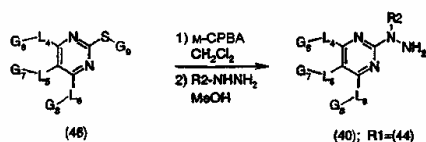
Подальше оброблення відповідним гідразиним, таким як моногідрат гідразину, у відповідному розчиннику, такому як метанол, дозволяє одержати бажаний продукт (40), у якому R_1 являє собою групу (44). Альтернативно, як показано на схемі 10, гідразин (40), у якому R_1 = група (44), може бути отриманий із сполуки (47) у результаті оброблення нітратом натрію у відповідному розчиннику, такому як водна сірчана кислота, для одержання сполуки (48). Потім сполуку (48) обробляють при нагріванні зі зворотним холодильником відповідним галогенуючим реагентом, таким як оксихлорид фосфору, з наступним обробленням відповідним гідразиним, таким як моногідрат гідразину, у відповідному розчиннику, такому як метанол, одержуючи проміжну сполуку (40), у якій R_1 являє собою групу (44). Сполуки (45), (46), (47) і (48) можуть бути придбані з комерційних джерел або отримані фахівцями в даній області відповідно до описаних в літературі способів [Pyrimidines. Brown, D.J. In "The Chemistry of Heterocyclic Compounds", vol.52, Taylor, E.G., ed.; Wiley: New York, 1994].

Схема 8



X = галоген; L_1 , L_2 , L_3 = зв'язок, N-G5, O, S; G_2 , G_3 , G_4 , G_5 = H, алкіл, ацил, гетероцикл, арил, гетероарил.

Схема 9

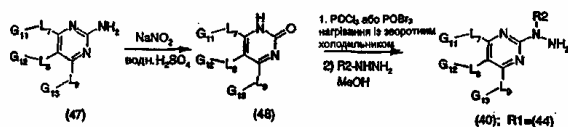


L4, L5, L6 = зв'язок, N-G10, O;

G6, G7, G8, G10 = H, алкіл, ацил, гетероцикл, арил, гетероарил;

G9 = алкіл, арил.

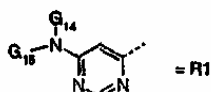
Схема 10



L7, L8, L9 = зв'язок, O, S;

G11, G12, G13 = H, алкіл, ацил, гетероцикл, арил, гетероарил.

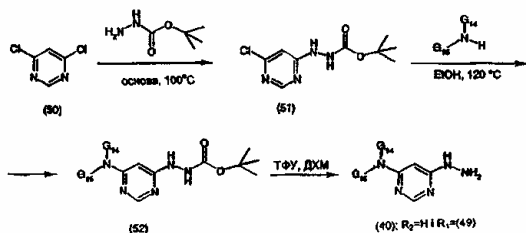
Гідразини (40), у яких R2 являє собою водень, а R1 має загальну структуру (49), можуть бути отримані з відповідних вихідних сполук, представлених на схемах 11 і 12.



(49) G14, G15 = H, алкіл, арил, гетероарил, гетероцикл

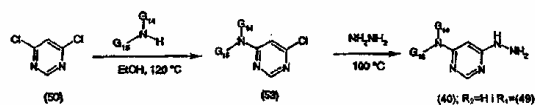
Як показано на схемі 11, 4,6-дихлорпіримідин (50) піддають взаємодії з трет-бутилкарбазатом у присутності основи, такої як діізопропілетиламін, при 100°C у відповідному розчиннику, такому як етанол, з одержанням сполуки (51). Амін G14G15NH піддають взаємодії із сполукою (51) для одержання сполуки (52), з якої може бути знята захисна група, наприклад, трифтороцтовою кислотою в дихлорметані, з одержанням сполуки (40), у якій R2 являє собою водень, а R1 являє собою сполуку (49).

Схема 11

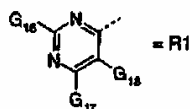


Альтернативно, як показано на схемі 12, 4,6-дихлорпіримідини (50) піддають взаємодії з одним еквівалентом аміну G14G15NH у присутності основи, такої як триетиламін або діізопропілетиламін, для одержання сполуки (53), що може бути оброблена надлишковою кількістю гідразину для одержання сполуки (40), у якій R2 являє собою водень, а R1 являє собою групу (49).

Схема 12

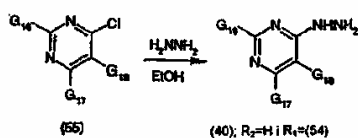


Гідразини (40), у яких R2 являє собою водень, а R1 має загальну структуру (54), можуть бути отримані з відповідної вихідної сполуки (55) обробленням безводним гідрaziном у відповідному розчиннику, такому як етанол, як показано на схемі 13.

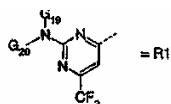


(54) G16, G17, G18=H, алкіл, арил

Схема 13



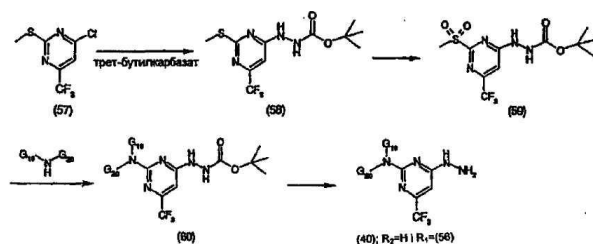
Гідразини (40), у яких R2 являє собою водень, а R1 має загальну структуру (56), можуть бути отримані з відповідної вихідної сполуки, представленої на схемі 14.



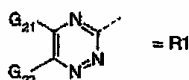
(56) G19, G20=H, алкіл, арил

Як показано на схемі 14, 4-хлор-2-метилсульфаніл-6-трифторметилпіримідин (57) може бути оброблений трет-бутилкарбазатом при 100°C в відповідному розчиннику, такому як етанол, з одержанням проміжної сполуки (58). У результаті оброблення сполуки (58) окислювачем, таким як мета-хлорпербензойна кислота, одержують сполуки (59), які при обробленні аміном G19G20NH у підходящому розчиннику, такому як метанол або етанол, дозволяють одержати сполуки (60). Зняття захисту в кислотних умовах, таких як трифтороцтова кислота або дихлорметан, дозволяє одержати сполуки (40), у якій R2 являє собою водень, а R1 являє собою групу (56).

Схема 14



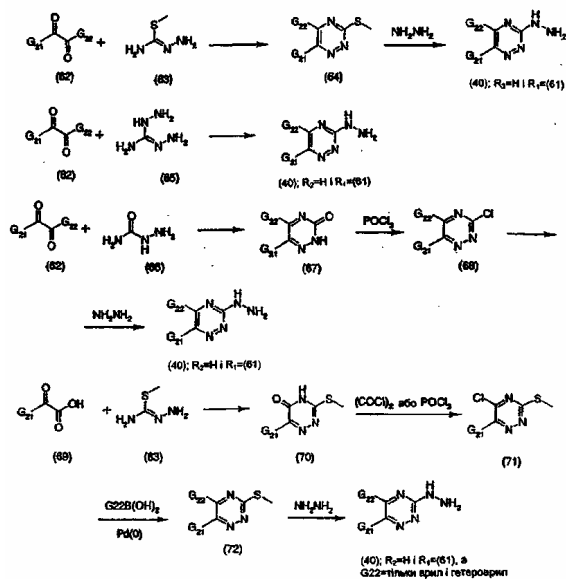
Гідразини (40), у яких R2 являє собою водень, а R1 має загальну структуру (61), можуть бути отримані у відповідності з наступною методикою, представленої на схемі 15 [Pauldler, W. et al., J. Het. Chem. 767-771, 1970; Lieber, E. et al., J. Org. Chem. 17, 518-522; Chem. Abstr. 87, 68431, 1977; Taylor, E.G., J. Org. Chem. 52, 4287-4292, 1987].



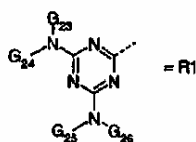
(61) G21, G22=H, алкіл, арил, гетероарил

Як показано на схемі 15, сполуки (62) піддають взаємодії із сполукою (63) у присутності слабкої основи, такої як водний бікарбонат натрію, для одержання сполуки (64). Оброблення сполуки (64) гідразином в умовах мікрохвильової печі дозволяє одержати сполуки (40), у якій R2 являє собою H, а R1 являє собою групу (61). Альтернативно, сполуки (62) піддають взаємодії з сполукою (65) для одержання сполуки (40), у якій R2 являє собою H, а R1 являє собою групу (61). Альтернативно, сполука (62) може бути сконденсована із сполукою (66) для одержання сполуки (67), що при обробленні оксихлоридом фосфору утворить сполуку (68). Оброблення сполуки (68) гідразином дозволяє одержати сполуки (40), у якій R2 являє собою H, а R1 являє собою групу (61). Альтернативно, оксо-кислота (69) може бути сконденсована з сполукою (63) для одержання сполуки (70), що може бути перетворена в сполуку (71) взаємодією з оксалілхлоридом або оксихлоридом фосфору. Взаємодія сполуки (71) з бороноювою кислотою G22B(OH)₂ у стандартних умовах реакції Сузуки дозволяє одержати сполуку (72), що піддають взаємодії з гідразином для одержання сполуки (40), у якій R2 являє собою H, R1 являє собою групу (61), а G22 являє собою тільки алкіл і гетероарил.

Схема 15



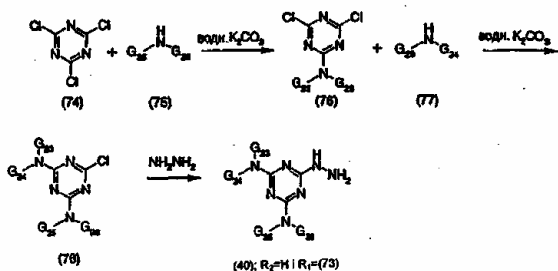
Гідразини (40), у яких R2 являє собою водень, а R1 має загальну структуру (73), можуть бути отримані відповідно до методики, представленої на схемі 16.



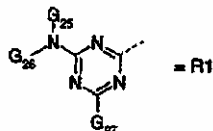
(73) G23, G24, G25, G26=H, алкіл, арил, гетероарил, гетероцикл

Як показано на схемі 16, хлорангідрид ціанурової кислоти (74) може бути оброблений одним еквівалентом аміну (75) у м'яких умовах, таких як 0°C в ацетоні, у присутності водного карбонату калію, з одержанням сполуки (76). У результаті оброблення сполуки (76) аміном (77) при 25°C в ацетоні в присутності карбонату калію одержують сполуку (78). Заміщення хлориду, що залишився, у сполуці (78) гіdraзином дозволяє одержати сполуку (40), у якій R2 являє собою H, а R1 являє собою сполуку (73).

Схема 16



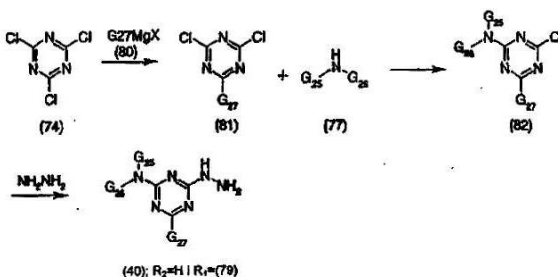
Гідразини (40), у яких R2 являє собою водень, а R1 має загальну структуру (79), можуть бути отримані відповідно до методики, представленої на схемі 17 [Menicagli, R. et al., Tetrahedron, 56, 9705-9711, 2000].



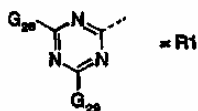
(79) G25, G26=H, алкіл, арил, гетероарил, гетероцикл; G27=алкіл, гетероцикл

Як показано на схемі 17, хлорангідрид ціанурової кислоти (74) піддають взаємодії з сполукою Грин'єра (80) для одержання сполуки (81), що після оброблення аміном (77) дозволяє одержати монохлорид (82). У результаті гідразінолізу сполуки (82) одержують сполуку (40), у якій R2 являє собою H, а R1 представляє собою групу (79).

Схема 17



Гідразини (40), у яких R2 являє собою водень, а R1 має загальну структуру (83), можуть бути отримані відповідно до методики, представленої на схемі 18 [Kobe, J. et al., Monatsh. Chem. 101, 724-735, 1970; Janietz, D. and Bauer, M., Synthesis 33-34, 1993].

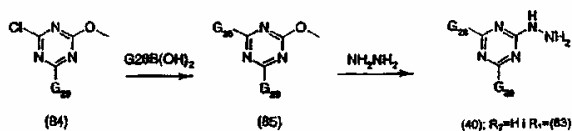


(83) G28 = арил, гетероарил; G29 = алкіл, арил, гетероарил, гетероцикл, NG30G31;

G30, G31 = арил, алкіл, гетероарил, гетероцикл

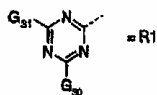
Як показано на схемі 18, сполуку (84) піддають реакції взаємодії з бороновою кислотою G28B(OH)₂ або еквівалентною сполукою відповідно до протоколів сполучення Сузуки для одержання сполуки (85), у результаті гідразінолізу якої одержують сполуки (40), у якій R2 являє собою H, а R1 являє собою групу (83).

Схема 18



Гідразини (40), у яких R2 являє собою водень, а R1 має загальну структуру (86), можуть бути отримані

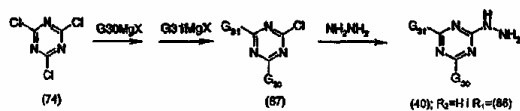
відповідно до методики, представленої на схемі 19.



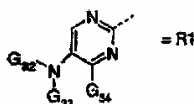
(86) G30, G31 = алкіл, гетероцикл

Як показано на схемі 19, послідовна взаємодія хлорангідриду ціанурової кислоти (74) із сполуками Гриньяра G30MgX і G31MgX у розчиннику, такому як бензол, дозволяє одержати монохлорид (87), що може бути оброблений гідразидом для одержання сполуки (40), у якій R2 = H, а R1 = (86).

Схема 19



Гідразини (40), у яких R2 являє собою водень, а R1 має загальну структуру (88), можуть бути отримані відповідно до методики, представленої на схемі 20.



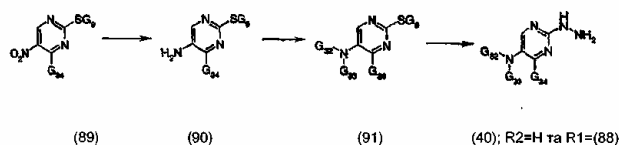
(88) G32 = алкіл, арил, гетероарил, гетероцикл;

G33 = водень, алкіл, арил, гетероарил, гетероцикл;

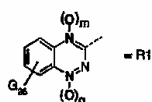
G34 = алкіл

Як показано на схемі 20, сполука (89) може бути відновлена до сполуки (90) із застосуванням відновників, таких як залізо й оцтова кислота. Наступне оброблення сполуки (90) алкілувальними агентами G32X і G33X (у якій X являє собою галогід або трифторметилсульфонат) дозволяє одержати сполуку (91). Альтернативно, оброблення сполуки (90) одним еквівалентом G32X дозволяє одержати сполуку (91), у якій G33 являє собою H. Окислювання сполуки (91) до відповідного сульфоксиду або сульфону з застосуванням окислювача, такого як мета-хлорпербензойна кислота, і наступне оброблення гідразидом дозволяє одержати сполуку (40), у якій R2 являє собою H, а R1 являє собою групу (88).

Схема 20



Гідразини (40), у яких R2 являє собою водень, а R1 має загальну структуру (92), можуть бути отримані відповідно до методики, представленої на схемі 21 [Wolf, F.J. et al., J. Am. Chem. Soc. 76, 3551-3553, 1954; Hay, M. et al., J. Med. Chem. 46, 169-182, 2003] і схемі 22 [Ley, K. et al., Angew. Chem. Int. Ed. 11, 1009-1010, 1972].

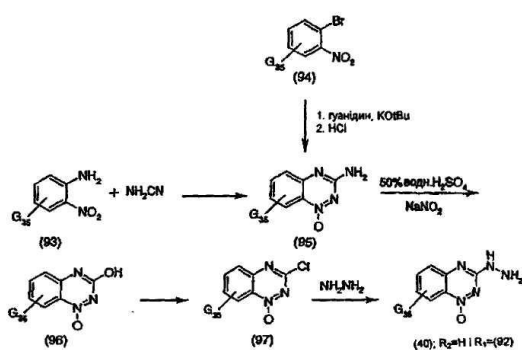


(92) G35 = алкіл, арил, гетероарил, гетероцикл, алкокси,

галоген, аміно; m, q = 0, 1

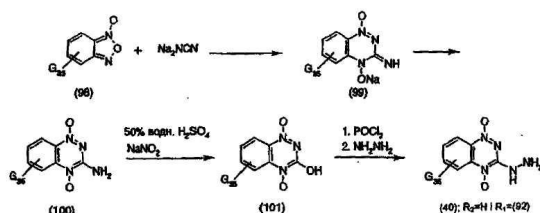
Як показано на схемі 21, сполуку (93) піддають взаємодії з ціанамідом у присутності основи, такої як водний гідроксид натрію для одержання сполуки (95). Альтернативно, оброблення сполуки (94) гуанідином і основою, такою як трет-бутоксид калію, з наступним підкисленням також дозволяє одержати сполуку (95). У результаті взаємодії сполуки (95) з нітритом натрію в кислому розчині одержують сполуку (96). Перетворення сполуки (96) у відповідний хлорид (97) може бути, наприклад, здійснено за допомогою оксихлориду фосфору. Гідразіноліз сполуки (97) дозволяє одержати сполуку (40), у якій R2 являє собою H, R1 являє собою групу (92), m = 0, а q = 1; N-оксид у даній молекулі може бути відновлений гідрогенолізом у присутності Pd на вуглєці, а потім отриманий гідразин піддають взаємодії з кислотою (8), (18) або (27). Альтернативно, гідразин I-N-оксиду бензотриазину піддають взаємодії з кислотами (8), (18) або (27), а отримані сполуки потім піддають гідрогенолізу в присутності Pd на вуглєці з метою відновлення N-оксидної групи.

Схема 21



Альтернативно, як показано на схемі 22, сполуку (98) піддають взаємодії з динатрійціанамідом у розчиннику, такому як суміш метанолу і води, для одержання сполуки (99), що піддається таутомеризації у сполуку (100) в присутності кислоти. У результаті оброблення сполуки (100) нітритом натрію в кислому середовищі одержують сполуку (101). Взаємодія сполуки (101) з оксихлоридом фосфору з наступним гідразинолізом дозволяє одержати сполуки (40), у якій R₂ являє собою H, R₁ являє собою групу (92), m = q = 1; N-оксидні групи в даній молекулі можуть бути відновлені гідрогенізацією у присутності Pd на вуглеці, а потім отриманий гідразин піддають взаємодії з кислотою (8), (18) або (27). Альтернативно, гідразин 1,4-біс-N-оксиду бензотриазини піддають взаємодії з кислотою (8), (18) або (27), а отримані сполуки потім піддають гідрогенізації в присутності Pd на вуглеці.

Схема 22



Приклади синтезу

Далі даний винахід описаний з посиланням на приведені нижче приклади, що є чисто ілюстративними і не повинні розглядатися як ті, що обмежують обсяг даного винаходу.

Символи й умовні позначення, використовувані при описі різних способів, схем і прикладів, відповідають символам, використовуваним у сучасній науковій літературі, наприклад, Journal of the American Chemical Society або Journal of Biological Chemistry. Стандартні одне- або трибуквені скорочення, як правило, використовують для позначення залишків амінокислот, що, приблизно, мають L-конфігурацію, якщо не обговорено особливо. При відсутності інших вказівок усі вихідні матеріали одержують через комерційних постачальників і застосовують без додаткового очищення.

Гц - Герц;

T_r - час утримання;

MeOH - метанол;

EtOH - етанол;

ТФУ - трифтороцтова кислота;

ДМСО - диметилсульфоксид;

ДХМ - дихлорметан;

CDI - 1,1-карбонілдіімідазол;

HOSu - N-гідроксисукцинімід;

НОВТ - 1-гідроксibenзотриазол;

m-CPBA - мета-хлорпербензойна кислота;

DCC - дициклогексилкарбодіімід;

NMM - N-метилморфолін;

DMAP - 4-диметиламінопіридин;

TBAF - фторид тетра-н-бутиламонія;

ВЕРХ - вискоєфективна рідинна хроматографія;

ВОР - біс(2-оксо-3-оксазолідиніл)фосфінхлорид;

EDCI - гідрохлорид 1-етил-3-[3-диметиламінопропіл]карбодіімиду;

НВТУ - гексафторфосфат О-бензотриазол-1-іл-N,N',N'-тетраметилуронію;

ТШХ - тонкошарова хроматографія;

ЗФ - звернена фаза;

ізо-PrOH - ізопропанол;

TEA - триетиламін;

ТГФ - тетрагідрофуран;

AcOEt або EtOAc - етилацетат;

ДМФ - N,N-диметилформамід;

HOAc - оцтова кислота;

Ac - ацетил;

BOC - трет-бутилоксикарбоніл;
FMOC - 9-флуоренілметоксикарбоніл;
CBZ - бензилоксикарбоніл;
HOAt - 1-гідрокси-7-азабензотриазол;
Bn - бензил;
THP - тетрагідро-2H-піран-2-іл.

Усі згадування про простий ефір відносяться до діетилового ефіру; «насичений сольовий розчин» означає насичений водний розчин NaCl. Якщо не обговорено окремо, усі температури виражені в °C (градуси по Цельсію). Якщо не зазначено інакше, усі взаємодії здійснюються в інертній атмосфері при кімнатній температурі і всі розчинники мають найвищу можливу чистоту.

Сpektри ¹H-ЯМР (надалі також «ЯМР») записують на приладі Varian VXR-300, Varian Unity-300, Varian Unity-400, Bruker AVANCE-400, General Electric QE-300 або спектрометрі Bruker AM 400. Хімічні зсуви виражені в мільйонних частках (м.ч., одиниці δ). Константи взаємодії виражені в герцах (Гц). Зразки розщеплення представляють очевидні мультиплетності і позначені як с (синглет), д (дублет), т (триплет), кв (квартет), квінт (квінтет), м (мультиплет), шир. (широкий).

Дані по мас-спектру одержують на системі LC-MS з відкритим доступом із застосуванням електророзсіюваною іонізацією. Умови LC: від 4,5 до 90% CH₃CN (0,02% ТФУ) за 3,2 хвилини з 0,4-хвилинною витримкою і 1,4-хвилинним повторним зрівноважуванням; детектування з застосуванням MS, УФ при 214нм, і детектора розсіювання світла (ELS). Столпчик 1x40мм Aquasil (C18).

Для препаративної ВЕРХ; са 50мг готових продуктів вводять у 500мкл ДМСО в колонку YMC CombiPrep ODS-A, що має внутрішній діаметр 50x20мм, зі швидкістю 20мол/хв, з 10-хвилинним градієнтом від 10% CH₃CN (0,1% ТФУ) до 90% CH₃CN (0,1% ТФУ) у H₂O (0,1% ТФУ) і 2-хвилинним утриманням. Флеш-хроматографію здійснюють на силікагелі Merck Silica gel 60 (230-400 меш).

Інфрачервоні (ИК) спектри одержують на спектрометрі Nicolet 510 FT-IR, застосовуючи 1-мм елемент із NaCl. Велику частину реакцій контролюють за допомогою тонкошарової хроматографії на 0,25-мм пластинках із силікагелю E. Merck (60F-254), візуалізуючих УФ світлом, 5% етанольною фосфорно-молібденовою кислотою або розчином п-анісового альдегіду.

Наступні схеми синтезу усього лише ілюструють способи, якими можуть бути отримані сполуки відповідно до даного винаходу і не передбачають обмеження обсягу даного винаходу, обумовленого прикладеною формулою винаходу.

Сполуки, описані в прикладах 2-353, одержують відповідно до загальної методики, описаної в прикладі 1. Сполуки, описані в прикладах 355-379, одержують відповідно до загальної методики, описаної в прикладі 354.

Одержання 1

(4S)-бензил-3-гептанойлоксазолідин-2-он

До розчину (S) - (-) -4-бензил-2-оксазолідинону (3,3г, 18,6ммоль) у ТГФ (50мл) при -78°C по краплях додають n-BuLi (7,4мл, 2,5М розчин у гексані, 18,6ммоль). Після перемішування протягом 30 хвилин при зазначеній температурі реакційну суміш обробляють гептанойлхлоридом (2,76г, 18,6ммоль). Реакційну суміш перемішують і дають можливість нагрітись до 10°C протягом 5 годин, а потім гасять насиченим водним розчином NH₄Cl (100мл). Водний шар екстрагують EtOAc (100мл x2). Об'єднані органічні шари промивають насиченим сольовим розчином і сушать над MgSO₄. Після видалення розчинника при зниженому тиску одержують 4,63г (86%) зазначеної в заголовку сполуки. ¹H-ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ 7,37-7,22 (м, 5H), 4,69 (м, 1H), 4,1,9 (м, 2H), 3,31 (дд, J=13,4, 3,3 Гц, 1H), 2,95 (м, 2H), 2,79 (дд, J=13,4, 9,7 Гц, 1H), 1,71 (м, 2H), 1,42-1,32 (м, 6H), 0,92 (т, J=6, 8 Гц, 3H), MN+290.

Одержання 2

(4S)-бензил-3-(2R)-бензилоксиметилгептанойл]-оксазолідин-2-он

До розчину (S)-4-бензил-3-гептанойлоксазолідин-2-она (4,63г, 16,02ммоль) і хлориди титану (IV) (1,9мл, 16,82ммоль) у дихлорметані (55мл) при 0°C по краплях додають діізопропілетиламін (3,1мл, 16,62ммоль). Після перемішування при 0°C протягом 1 години отриманий енолат титану піддають взаємодії з бензилхлорметилловим простим ефіром (TCI-America, 4,9мол, 32,04ммоль) при 0°C протягом 6 годин. Потім реакційну суміш гасять водою (100мл). Водний шар екстрагують дихлорметаном (100мл x2). Органічні екстракти промивають насиченим сольовим розчином і сушать над MgSO₄. Після видалення розчинника при зниженому тиску й очищення колоночною флеш-хроматографією із застосуванням елюючої системи з гексана/EtOAc (5:1) одержують 4,39г (67%) зазначеної в заголовку сполуки. ¹H-ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ 7,38-7,21 (м, 10H), 4,74 (м, 1H), 4,57 (м, 2H), 4,28-4,13 (м, 3H), 3,82 (т, J=8,7 Гц, 1H), 3,68 (дд, J=9,0, 4,9 Гц, 1H), 3,25 (дд, J=13,5, 3,1 Гц, 1H), 2,71 (дд, J=13,5, 9,3 Гц, 1H), 1,74 (м, 1H), 1,54 (м, 1H), 1,31-1,28 (м, 6H), 0,89 (т, J=6,7 Гц, 3H), MN+410.

Одержання 3

(3R)-бензилокси-2-пентилпропіонова кислота

0,05М розчин (S)-4-бензил-3-[(R)-2-бензилоксиметилгептанойл]оксазолідин-2-ону (2,0г, 4,89ммоль) у 3:1 суміші ТГФ і H₂O обробляють 30% H₂O₂ (4,5мл, 39,12ммоль), а потім LiOH (0,48г, 9,78ммоль) при 0°C. Отриману суміш перемішують і дають можливість нагрітись до кімнатної температури протягом ночі. Потім ТГФ видаляють у вакуумі. Залишок промивають дихлорметаном (50мол x2) з метою видалення (S)-4-бензилоксазолідин-2-ону. Бажаний продукт виділяють, екстрагуючи підкислену (pH 1~2) водну фазу EtOAc. Подальшого очищення не потрібно. Після витримування в глибокому вакуумі одержують 1,16г (95%) зазначеної в заголовку сполуки. ¹H-ЯМР (400 МГц, CHCl₃) δ 11,1 (шир.с, 1H), 7,36 (м, 5H), 4,57 (с, 2H), 3,69 (м, 1H), 3,58 (дд, J=9,2, 5,2 Гц, 1H), 2,74 (м, 1H), 1,66 (м, 1H), 1,54 (м, 1H), 1,34-1,30 (м, 6H), 0,90 (т, J=6,7 Гц, 3H), MN+ 251.

Одержання 4

3-гідрокси-(2R)-пентилпропіонова кислота

До розчину (R)-3-бензилокси-2-пентилпропіонової кислоти (1,54г, 6,16ммоль) у EtOH (100мл) додають 10%

Pd/C (310мг). Реакційну суміш піддають гідрогенізації протягом ночі при кімнатній температурі. По закінченні взаємодії реакційну суміш фільтрують через шар целіту і промивають EtOH (50мл х3). Після видалення розчинника одержують зазначену в заголовку сполуку (0,92г, 93%). Подальшого очищення не потрібно. ¹H-ЯМР (400 МГц, CHCl₃) δ 6,30 (шир.с, 1H), 3,81 (д, J=5,4 Гц, 2H), 2,64 (м, 1H), 1,69 (м, 1H), 1,56 (м, 1H), 1,41-1,27 (м, 6H), 0,91 (т, J=7,7 Гц, 3H), MH+161.

Одержання 5

N-бензилокси-3-гідрокси-(2R)-пентилпропіонамід

До суміші (R)-3-гідрокси-2-пентилпропіонової кислоти (0,92г, 5,75ммоль), гідрохлориду O-бензилгідроксиламіну (0,92г, 5,75ммоль) і 4-(диметиламіно)піридину (1,41г, 11,50ммоль) у дихлорметані (25мл) при 0°C додають гідрохлорид 1-[3-(диметиламіно)пропіл]-3-етилкарбодііміду (1,11г, 5,75ммоль). Після перемішування при кімнатній температурі протягом ночі реакційну суміш гасять 1 н. водним розчином HCl (25мл) і екстрагують за допомогою дихлорметану (25мл х2). Органічні екстракти промивають водою, насиченим сольовим розчином і сушать над MgSO₄. Після видалення розчинника при зниженому тиску одержують зазначену в заголовку сполуку (1,43м, 94%). ¹H-ЯМР (400МГц, CHCl₃) δ 9,22 (шир.с, 1H), 7,41-7,28 (м, 5H), 4,89 (кв., J=10,6 Гц, 2H), 3,70-3,37 (м, 3H), 2,17 (м, 1H), 1,54 (шир.с, 1H), 1,27 (м, 6H), 0,88 (т, J=6,9 Гц, 3H), MH+266.

Одержання 6

1-бензилокси-(3R)-пентилазетидин-2-он

До суміші (R)-N-бензилокси-3-гідрокси-2-пентилпропіонаміду (1,41г, 5,32ммоль) і трифенілфосфіну (1,68г, 6,39ммоль) у ТГФ (53мл) при 0°C по краплях додають діетилазодикарбоксилат (1,1мл, 6,39ммоль). Реакційну суміш перемішують і дають можливість нагрітися до кімнатної температури протягом, ночі. Потім реакційну суміш гасять водою (50мл). Водний шар екстрагують EtOAc (50мл х2). Об'єднані органічні шари промивають насиченим сольовим розчином і сушать над MgSO₄. Після видалення розчинника у вакуумі залишок очищають колоночною флеш-хроматографією (гексан:EtOAc 5:1), одержуючи зазначену в заголовку сполуку (1,17г, 89%). ¹H-ЯМР (400 МГц, CHCl₃) δ 7,35-7,25 (м, 5H), 4,87 (с, 2H), 3,28 (т, J=4,85 Гц, 1H), 2,84 (кв., J=2,35 Гц, 1H), 2,77 (м, 1H), 1,62 (м, 1H), 1,36 (м, 1H), 1,25-1,16 (м, 6H), 0,88 (т, J=6,9 Гц, 3H), MH+ 248.

Одержання 7

3-бензилоксиаміно-(2R)-пентилпропіонова кислота

До розчину (R)-1-бензилокси-3-пентилазетидин-2-ону (0,96г, 3,89ммоль) у суміші ТГФ-H₂O-MeOH (50мл, 3:1:1 об./об.) додають моногідрат гідроксиду літію (1,91г, 38,9ммоль). Після перемішування при кімнатній температурі протягом ночі до суміші додають воду (25мл). Розчин підкисляють до pH 5~6 3 н. водним розчином HCl. Його екстрагують EtOAc (50мл х2). Об'єднані органічні шари промивають насиченим сольовим розчином і сушать над MgSO₄. Після видалення розчинника у вакуумі одержують зазначену в заголовку сполуку (0,98г, 95%). ¹H-ЯМР (400 МГц, CHCl₃) δ 9,80 (шир.с, 1H), 7,37 (м, 5H), 4,75 (м, 2H), 3,14 (м, 2H), 2,74 (м, 1H), 1,70 (м, 1H), 1,53 (м, 1H), 1,38-1,25 (м, 6H), 0,91 (т, J=6,8 Гц, 3H), MH+ 266.

Одержання 8

(2R)-[(бензилоксиформіламіно)метил]гептанова кислота

До холодного розчину (R)-3-бензилоксиаміно-2-пентилпропіонової кислоти (1,03г, 3,89ммоль) у HCO₂H (19мл) і дихлорметані (19мл) при 0°C додають оцтовий ангідрид (3,9мл, 41,2ммоль). Суміш перемішують при 0°C протягом 3 годин. Летучі речовини видаляють випарюванням у вакуумі. Додають дихлорметан (50мл). Органічний розчин промивають насиченим сольовим розчином (50мл х2) і сушать над MgSO₄. Після фільтрації і випарюванні у вакуумі одержують зазначену в заголовку сполуку (1,08г, 95%). ¹H-ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ 8,07 (шир.с, 1H), 7,29 (м, 5H), 4,91-4,71 (м, 2H), 3,76 (м, 2H), 2,67 (м, 1H), 1,54 (м, 1H), 1,41 (м, 1H), 1,20 (м, 6H), 0,80 (т, J=7,0 Гц, 3H), MH+ 294.

Приклад 1

N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-піридин-2-ілгідазинокарбоніл)гептил]формахід

(2R)-[(бензилоксиформіламіно)метил]гептанову кислоту (1,2ммоль), HOAt (1,3ммоль), N'-піридин-2-ілгідазин (1,2ммоль) і NMM (5ммоль) розчиняють у ДМФ і обробляють EDCI (1,3ммоль) при кімнатній температурі протягом 12 годин. Продукт взаємодії N-бензилокси-N-[(R)-2-(N'-піридин-2-ілгідазинокарбоніл)гептил]формахід виділяють за допомогою препаративної ВЕРХ неопрацьованої реакційної суміші. Отриману сполуку піддають гідрогенізації при атмосферному тиску над Pd/C у метанолі протягом 1 години, одержуючи зазначену в заголовку сполуку. MH+ 295.

Одержання 9

2-гідазино-5-етилпіримідин

До розчину 2-хлор-5-етилпіримідину (0,31г, 2,2ммоль) у MeOH (5мл) додають моногідрат гідазину (1,0мл, 20,6ммоль). Після перемішування протягом 16 годин при 50°C розчин охолоджують до кімнатної температури й очищають за допомогою ВЕРХ зі зверненою фазою, одержуючи 0,24г (80%) зазначеної в заголовку сполуки у вигляді білої твердої речовини. MH+ 139.

Одержання 10

2-гідазино-4-метилпіримідин

До тонкодиспергованої суспензії 2-хлорпіримідину (8,01г, 69,9ммоль) у 10:1 суміші Et₂O-ТГФ (500мл) при -30°C по краплях додають MeLi (46мл, 1,6 М в Et₂O, 73,6ммоль). Реакційну суміш перемішують при -30°C протягом 30 хвилин, а потім нагрівають до 0°C і перемішують протягом ще 30 хвилин. Після цього до реакційної суміші додають 1:1:20 суміш H₂O-HOAc-ТГФ (100мл) і суміш перемішують при 0°C протягом 10 хвилин. Потім до отриманої суміші додають розчин DDQ (16,7г, 73,6ммоль) у ТГФ (100мл) і суміш перемішують і нагрівають до кімнатної температури протягом 30 хвилин. Після цього суміш розбавляють Et₂O (300мл) і промивають 1 н. водн. NaOH (3х100мл), а потім насиченим сольовим розчином (300мл). Після цього органічну фазу сушать над безводним MgSO₄, фільтрують, концентрують у вакуумі й очищають флеш-хроматографією із застосуванням EtOAc-гексану (1:2) як елюента, одержуючи 6,06г 2-хлор-4-метилпіримідину (67%) у вигляді білих кристалічних пластинок.

До розчину 2-хлор-4-метилпіримідину (6,06г, 47,1ммоль) у MeOH (40мл) додають моногідрат гідазину (10мл, 206ммоль). Розчин перемішують протягом 16 годин при кімнатній температурі, а потім очищають за допомогою ВЕРХ зі зверненою фазою, одержуючи 4,43г зазначеної в заголовку сполуки (76%) у вигляді білої твердої речовини. МН+ 125.

Одержання 11

2-гідазино-4-морфоліно-6-метилпіримідин

До розчину 2,4-дихлор-6-метилпіримідину (0,41г, 2,50ммоль) у MeOH (5мл) додають морфолін (0,5мл, 5,73ммоль). Розчин перемішують протягом 30 хвилин при кімнатній температурі, а потім додають моногідрат гідазину (1,0мл, 20,6ммоль). Після цього розчин нагрівають до 60°C і перемішують протягом 16 годин. Потім розчин охолоджують до кімнатної температури й очищають за допомогою ВЕРХ зі зверненою фазою, одержуючи 0,31г зазначеної в заголовку сполуки (59%) у вигляді воскоподібної білої твердої речовини. МН+210.

Одержання 12

2-гідазино-4-(2,3,4-триметоксифеніл)піримідин

До розчину 2-тіометил-4-хлорпіримідину (0,3410г, 2,12ммоль) у 1,4-діоксані (21мл) додають 2,3,4-триметоксифенілборонову кислоту (0,4950г, 2,33ммоль) і водн. Na₂CO₃ (2,3мл, 2,0М в воді, 4,60ммоль). Суміш барботують сухим газоподібним азотом протягом 5 хвилин, а потім додають Pd(Ph₃P)₄ (123мг, 0,106ммоль). Суміш захищають від світла і нагрівають при 110°C протягом 16 годин. Потім суміш охолоджують до кімнатної температури, фільтрують, концентрують у вакуумі й очищають флеш-хроматографією із застосуванням EtOAc-гексану (1:4) як елюента, одержуючи 0,5920г 2-тіометил-4-(2,3,4-триметоксифеніл)піримідину (95%) у вигляді жовтої твердої речовини.

До розчину 2-тіометил-4-(2,3,4-триметоксифеніл)піримідину (0,5920г, 2,02ммоль) у CH₂Cl₂ (10мл) додають м-хлорпербензойну кислоту (1,05г, 6,08ммоль) і розчин перемішують протягом 3 годин, після чого він перетворюється в білу суспензію. Отриману суспензію концентрують у вакуумі і додають MeOH (10мл), а потім моногідрат гідазину (2мл, 41,2ммоль). Отриманий розчин перемішують протягом 16 годин, а потім концентрують у вакуумі приблизно до половини обсягу. Суміші дають можливість відстоятися протягом 1 години, отриману тверду фракцію збирають вакуумною фільтрацією і промивають водою. Після сушіння у вакуумі одержують 0,3330г зазначеної в заголовку сполуки (60%) у вигляді ясно-коричневої твердої речовини. МН+277.

Одержання 13

2-гідазино-4-морфоліно-6-трифторметилпіримідин

До розчину 2-тіометил-4-хлор-6-трифторметилпіримідину (1,9996г, 8,75ммоль) у MeOH (50мл) додають морфолін (1,5мл, 17,2ммоль). Розчин перемішують протягом ночі, концентрують у вакуумі й отриману білу тверду фракцію збирають вакуумною фільтрацією і промивають водою. До розчину твердої фракції в CH₂Cl₂ (50мл) додають м-хлорпербензойну кислоту (4,53г, 26,3ммоль) і отриманий розчин перемішують протягом 2 годин, після чого він перетворюється в білу суспензію. Розчинник видаляють у вакуумі, після чого додають MeOH (50мл), а потім моногідрат гідазину (3,0мл, 61,8ммоль). Розчин перемішують протягом 16 годин, а потім концентрують у вакуумі приблизно до половини обсягу. Після цього до отриманої суспензії додають воду (100мл) і білу тверду фракцію, що утворилася, збирають вакуумною фільтрацією. Потім зазначену фракцію промивають водою і сушать у вакуумі, одержуючи 1,7193г зазначеної в заголовку сполуки (75%) у вигляді білої твердої речовини. МН+264.

Одержання 14

2-гідазино-5,6,7,8-тетрагідрокіназолін

До суміші етил 2-циклогексанонкарбоксилату (3,00г, 17,6ммоль) і сульфату 2-метил-2-тіопсевдомочевини (3,68г, 13,2ммоль) додають розчин карбонату калію (7,31г, 52,9ммоль) у воді (60мл). Реакційний розчин перемішують при кімнатній температурі протягом 16 годин, після чого він перетворюється в суспензію. Білу тверду фракцію збирають вакуумною фільтрацією, промивають водою і сушать у вакуумі. Суміш твердої фракції в оксихлориді фосфору (20мл) нагрівають при 110°C в закритій пробірці, після чого вона перетворюється в розчин. Отриманий розчин охолоджують до кімнатної температури, а потім виливають у колотий лід і воду (300мл). Суміш енергійно перемішують при 0°C протягом 1 години, а отриманий осад збирають вакуумною фільтрацією, промивають водою і сушать у вакуумі, одержуючи 1,61г 2-тіометил-4-хлор-5,6,7,8-тетрагідрокіназоліну (43%) у вигляді не зовсім білої твердої речовини.

К розчину 2-тіометил-4-хлор-5,6,7,8-тетрагідрокіназоліну (0,5121г, 2,39ммоль) у 10:1 суміші MeOH-НОAc (30мл) додають порошок активованого цинку (500мг, 7,65ммоль). Суміш нагрівають при 70°C протягом 1 години, а потім охолоджують до кімнатної температури і фільтрують. Отриманий розчин концентрують у вакуумі і сушать азеотропним способом толуолом (50мл). Залишок розподіляють між EtOAc (150мл) і 1н. води. HCl (50мл), а потім органічну фазу промивають насиченим води. NaHCO₃ і насиченим сольовим розчином. Після цього органічну фазу сушать над безводним MgSO₄ і концентрують у вакуумі, одержуючи 0,1461г 2-тіометил-5,6,7,8-тетрагідрокіназоліну (34%) у вигляді фіолетової олії.

До розчину 2-тіометил-5,6,7,8-тетрагідрокіназоліну (0,1461г, 0,81ммоль) у CH₂Cl₂ (5мл) додають м-хлорпербензойну кислоту (0,462г, 2,68ммоль). Отриманий розчин перемішують при кімнатній температурі протягом 3 годин, після чого він перетворюється в суспензію. Після цього розчинник видаляють у вакуумі, до суспензії додають MeOH (5мл), а потім моногідрат гідазину (1мл, 20,6ммоль). Після цього розчин нагрівають при 50°C і перемішують протягом 16 годин. Розчин охолоджують до кімнатної температури й очищають за допомогою ВЕРХ зі зверненою фазою, одержуючи 0,1126г зазначеної в заголовку сполуки (85%) у вигляді безбарвної олії. МН+ 165.

Одержання 15

2-гідазино-4-(2-піридил)піримідин

До розчину 2-аміно-4-(2-піридил)піримідину (10,10г, 58,66ммоль) у 5% водній сірчаній кислоті (200мл) по порціях протягом 10 хвилин додають нітрат натрію (20,24г, 293,3ммоль). Розчин перемішують при кімнатній

температурі протягом 2 годин, а потім його рН доводять до 10, додаючи 6н. води. NaOH. Після цього отриманий розчин екстрагують 30% ізо-PrOH у CHCl_3 (10х300мл), об'єднану органічну фазу сушать над безводним MgSO_4 і концентрують у вакуумі. Залишок розтирають з гексаном і збирають вакуумною фільтрацією, одержуючи 6,89г 4-(2-піридил)піримід-2-ону (68%) у вигляді твердої речовини бежевого кольору.

Суміш 4-(2-піридил)піримід-2-она (6,89г, 39,8ммоль) в оксихлориді фосфору (30мл) нагрівають при 110°C протягом 90 хвилин у закритій пробірці. Потім темно-коричневий розчин охолоджують до кімнатної температури і виливають у колотий лід і воду (500мл). Суміш енергійно перемішують при 0°C протягом 1 години, а потім рН доводять до 14, додаючи 6н. води. NaOH. Суміш екстрагують CH_2Cl_2 (2х300мл), об'єднану органічну фазу сушать над безводним MgSO_4 і концентрують у вакуумі. До розчину залишку в CH_2Cl_2 (10мл) і MeCP (30мл) додають моногідрат гідазину (7,0мл, 144,2ммоль) і розчин перемішують протягом 16 годин, після чого з'являється білий осад. Отриману тверду фракцію збирають вакуумною фільтрацією, промивають водою і сушать у вакуумі, одержуючи 2,20г зазначеної в заголовку сполуки (30%) у вигляді не зовсім білої твердої речовини. МН+ 188.

Одержання 16

(6-морфолін-4-іл)піримідин-4-іл)гідазин

Розчин 4,6-дихлорпіримідину (300мг, 2ммоль), трет-бутилкарбазату (280мг, 2,1ммоль) і основи Ханіга (453мкл, 2,6ммоль) у етанолі (3мл) перемішують при 120°C протягом 1 години в умовах мікрохвильової печі. Після додавання морфоліну (700мкл, 8ммоль) суміш знову поміщають у такі ж умови мікрохвильової печі ще на 1 годину. У результаті випарювання розчинника у вакуумі одержують білу тверду фракцію, що обробляють ТФУ (3мл) у ДХМ (3мл) протягом 20 хвилин. Після випарювання розчинника залишок знову розчиняють у метанолі. Обробленням NaHCO_3 видаляють сліди ТФУ, що можливо залишилися. Після фільтрації з наступним випарюванням одержують залишок, що піддають очищенню за допомогою ВЕРХ зі зверненою фазою для одержання (6-морфолін-4-іл)піримідин-4-іл)гідазину (200мг, 1ммоль, 50%, за 3 стадії) у вигляді білої твердої речовини. МН+ 196.

Альтернативно, дану сполуку може бути отримано перемішуванням розчину 4,6-дихлорпіримідину (300мг, 2ммоль), морфоліну (280мг, 2,1ммоль) і діізопропілетиламіну (453мкл, 2,6ммоль) у етанолі (3мл) протягом 1 години. Після додавання гідазину (370мкл, 6ммоль) суміш перемішують при 120°C протягом 1 години в умовах мікрохвильової печі. Після випарювання розчинника отриману сполуку розчиняють у ДМСО, а потім піддають очищенню за допомогою препаративної ВЕРХ, одержуючи в результаті (6-морфолін-4-іл)піримідин-4-іл)гідазин. МН+ 196.

Одержання 17

(2-етиламін-6-трифторметилпіримідин-4-іл)гідазин

Розчин (4-хлор-6-трифторметилпіримідин-2-іл)етиламіну (100мг, 0,38ммоль), гідазину (87мкл, 3,8ммоль) у етанолі нагрівають при 70°C протягом ночі. Після випарювання розчинника у вакуумі одержують залишок, що піддають очищенню за допомогою препаративної ВЕРХ, одержуючи (2-етиламін-6-трифторметилпіримідин-4-іл)гідазин (74мг, 75%). МН+ 256.

Одержання 18

[(4-метилпіперазин-1-іл) трифторметил піримідин-4-іл]гідазин

Суміш 4-хлор-2-метилтіол-6-(трифторметил)піримідину (228мг, 1ммоль), трет-бутилкарбазаті (159мг, 6,12ммоль) у етанолі нагрівають до 100°C протягом 1 години в мікрохвильовому реакторі протягом 20 хвилин. Після випарювання розчинника одержують білу тверду фракцію. Отриману фракцію обробляють м-СРВА в ДХМ при кімнатній температурі протягом ночі. У результаті випарювання розчинника одержують білу тверду фракцію, що обробляють 1-метилпіперазином при 140°C протягом 20 хвилин в етанолі в умовах мікрохвильової печі. Після випарювання розчинників одержують тверду фракцію, що обробляють ТФУ (3мл) у ДХМ (3мл) протягом 20 хвилин. По закінченні взаємодії велику частину ТФУ і ДХМ видаляють у вакуумі. Залишок знову розчиняють у метанолі й обробляють твердим NaHCO_3 з метою видалення залишку ТФУ доти, поки не припиниться виділення газу. Після фільтрації і вакуумного упарювання фільтрату одержують залишок, який піддають очищенню за допомогою препаративної ВЕРХ для одержання [(4-метилпіперазин-1-іл) трифторметилпіримідин-4-іл]гідазину (100мг, 36%). МН+277.

Приклад 2

N-гідрокси-N-[(R)-2-[N'-(3-метоксифеніл)гідазинокарбоніл]гептил]формамід

МН+ = 324.

Приклад 3

N-гідрокси-N-[(R)-2-[N'-(4-трифторметилпіримідин-2-іл)гідазинокарбоніл]гептил]формамід

МН+ = 364.

Приклад 4

N-[(R)-2-[N'-(4-ціанофеніл)гідазинокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід

МН+ = 319.

Приклад 5

N-[(R)-2-[N'-(2,6-диметилпіримідин-4-іл)гідазинокарбоніл]гептил]-гідроксиформамід

МН+ = 324.

Приклад 6

N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-хіноксалін-2-іл)гідазинокарбоніл]гептил]формамід

МН+ = 346.

Приклад 7

N-гідрокси-N-[(2R)-2-[N'-(3,4-дигідрохіноксалін-2-іл)гідазинокарбоніл]гептил]формамід

МН+ = 348.

Приклад 8

N-гідрокси-N-[(R)-2-[N'-(1,3,4-триметил-1Н-піразоло[3,4-b]піридин-6-іл)гідазинокарбоніл]гептил]формамід

МН+ = 377.

Приклад 9
4-(N'-{(R)-2-[(формілгідроксіаміно)метил]гептанойл}гідразіно)бензолсульфонамід
МН+ = 373.

Приклад 10
N-гідрокси-N-[(2R)-2-(циклогексилметил)-3-оксо-3-{N'-[4-(трифторметил)піримідин-2-іл]гідразіно}пропіл]формахід
МН+ = 390.

Приклад 11
N-гідрокси-N-[(2R)-2-(циклопентилметил)-3-оксо-3-{N'-[4-(трифторметил)піримідин-2-іл]гідразіно}пропіл]формахід
МН+ = 376.

Приклад 12
N-{(R)-2-[N'-(диметилтрифторметилпіримідин-4-іл)гідразінокарбоніл]гептил}-N-гідроксиформахід
МН+ = 392.

Приклад 13
N-гідрокси-N-{(R)-2-[N'-(6-трифторметилпіридазин-3-іл)гідразінокарбоніл]гептил}формахід
МН+ = 364.

Приклад 14
N-гідрокси-N-{(R)-2-[N'-(6-трифторметилпіримідин-4-іл)гідразінокарбоніл]гептил}формахід
МН+ = 364.

Приклад 15
N-гідрокси-N-{(R)-2-[N'-(5-метил[1,2,4]тріазоло[1,5-а]піримідин-7-іл)гідразінокарбоніл]гептил}формахід
МН+ = 350.

Приклад 16
N-гідрокси-N-{(R)-2-[N'-(9H-пурин-6-іл)гідразінокарбоніл]гептил}формахід
МН+ = 336.

Приклад 17
N-{(R)-2-[N'-(5-ціанопіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил}-N-гідроксиформахід
МН+ = 321.

Приклад 18
N-гідрокси-N-((2R)-2-[[N'-(піридин-2-іл)гідразіно]карбоніл]гептил)формахід
МН+ = 296.

Приклад 19
N-гідрокси-N-((2R)-2-(циклобутилметил)-3-оксо-3-{N'-[4-(трифторметил)піримідин-2-іл]гідразіно}пропіл)формахід
МН+ = 362.

Приклад 20
N-гідрокси-N-{(R)-2-[N'-(6-імідазол-1-ілпіридин-4-іл)гідразінокарбоніл]гептил}формахід
МН+ = 362.

Приклад 21
N-[(R)-2-(N'-бензо[1,2,4]тріазин-3-іл)гідразінокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформахід
МН+ = 347.

Приклад 22
N-гідрокси-N-{(R)-2-[N'-(7-метоксибензо[1,2,4]тріазин-3-іл)гідразінокарбоніл]гептил}формахід
МН+ = 377.

Приклад 23
N-гідрокси-N-{(R)-2-[N'-(1-метил-1H-піразоло[3,4-d]піримідин-6-іл)гідразінокарбоніл]гептил}формахід
МН+ = 350.

Приклад 24
N-((R)-2-{N'-[6-(5-хлорпіридин-3-ілокси)піридазин-3-іл]гідразінокарбоніл]гептил}-N-гідроксиформахід
МН+ = 423.

Приклад 25
N-гідрокси-N-[(2R)-2-({N'-[6-(1H-піррол-1-іл)-3-піридазиніл]гідразіно}карбоніл)гептил]формахід
МН+ = 361.

Приклад 26
N-гідрокси-N-((2R)-2-[[N'-(9-метил-9H-пурин-6-іл)гідразіно]карбоніл]гептил)формахід
МН+ = 350.

Приклад 27
N-гідрокси-N-{(R)-2-[N-((6-морфолін-4-іл)-9H-пурин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил}формахід
МН+ = 421.

Приклад 28
N-{(R)-2-[N'-(6-фторпіридин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил}-N-гідроксиформахід
МН+ = 313.

Приклад 29
N-гідрокси-N-((2R)-2-[[N'-(1-метил-1H-піразоло[3,4-d]піримідин-4-іл)гідразіно]карбоніл]гептил)формахід
МН+ = 350.

Приклад 30
N-{(R)-2-[N'-(4-аміно-6-ізопропіл[1,3,5]тріазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил}-N-гідроксиформахід
МН+ = 354.

Приклад 31

N-((R)-2-[N'-(2,5-диметил-4-нітро-2H-піразол-3-іл)гідрازیнокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід
МН+ = 357.
Приклад 32
N-((R)-2-[N'-(3-хлор-1-метил-1H-піразоло[3,4-d]піримідин-6-іл)гідрازیнокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід
МН+ = 384.
Приклад 33
N-((R)-2-[N'-(6-диметиламіно-9H-пурин-2-іл)гідрازیнокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід
МН+ = 379.
Приклад 34
N-гідрокси-N-((2R)-4-циклопропіл-2-((N'-[4-трифторметилпіримідин-2-іл]гідразино)карбоніл)бутил)формамід
МН+ = 362.
Приклад 35
N-гідрокси-N-((2R)-2-(циклопропілметил)-3-оксо-3-(N'-[4-(трифторметил)піримідин-2-іл]гідразино)пропіл)формамід
МН+ = 348.
Приклад 36
N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-метил-N'-4-(трифторметилпіримідин-2-іл)гідрازیнокарбоніл]гептил)формамід
МН+ = 378.
Приклад 37
Складний метиловий ефір 2-(N'-((R)-2-((формілгідроксіаміно)метил)гептаноїл)гідразино)-4-трифторметилпіримідин-5-карбонової кислоти
МН+ = 422.
Приклад 38
2-(N'-((R)-2-((формілгідроксіаміно)метил)гептаноїл)гідразино)-4-трифторметилпіримідин-5-карбоновая кислота
МН+ = 408.
Приклад 39
N-((R)-2-[N'-(5-фтор-4-метоксипіримідин-2-іл)гідрازیнокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід
МН+ = 344.
Приклад 40
N-((R)-2-[N'-(4-диметиламінопіримідин-2-іл)гідрازیнокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід
МН+ = 339.
Приклад 41
N-гідрокси-N-((2R)-2-((N'-{6-[(2-гідроксиетил)аміно]-1,3-дигідро-2H-пурин-2-іліден}гідразино)карбоніл]гептил)формамід
МН+ = 395.
Приклад 42
N-((R)-2-[N'-(5-фтор-4-морфолін-4-ілпіримідин-2-іл)гідрازیнокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід
МН+ = 399.
Приклад 43
N-((R)-2-[N'-(5-фтор-4-метиламінопіримідин-2-іл)гідрازیнокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід
МН+ = 343.
Приклад 44
Диметиламід 2-(N-((R)-2-((формілгідроксіаміно)метил)гептаноїл)гідразино)-4-трифторметил піримідин-5-карбонової кислоти
МН+ = 435.
Приклад 45
N-гідрокси-N-((R)-2-((N'-(3-оксо-3,4-дигідрокіноксалін-2-іл)гідрازیнокарбоніл]гептил)формамід
МН+ = 362.
Приклад 46
N-((R)-2-бутоксид-2-[N'-(4-трифторметилпіримідин-2-іл)гідрازیнокарбоніл]етил)-N-гідроксиформамід
МН+ = 366.
Приклад 47
(2-фторфеніл)амід 2-(N'-((R)-2-((формілгідроксіаміно)метил)гептаноїл)гідразино)-4-трифторметилпіримідин-5-карбонової кислоти
МН+ = 501.
Приклад 48
Трет-бутиламід 2-(N'-((R)-2-((формілгідроксіаміно)метил)гептаноїл)гідразино)-4-трифторметилпіримідин-5-карбонової кислоти
МН+ = 463.
Приклад 49
N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-[(1-піперидин-1-ілметаноїл)трифторметилпіримідин-2-іл]гідрازیнокарбоніл]гептил)формамід
МН+ = 475.
Приклад 50
N-((R)-2-[N'-(5-ціано-4-трифторметилпіримідин-2-іл)гідрازیнокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід
МН+ = 389.
Приклад 51

N-гідрокси-N-[(2R)-2-({N'-[9-(4,4,4-трифторбутил)-1,9-дигідро-2H-пурин-2-іліден]гіdraзино}карбоніл)гептил]формамід
 МН+ = 446.
 Приклад 52
 N-гідрокси-N-[(R)-2-({N'-[(1-морфолін-4-ілметаноїл)трифторметилпіримідин-2-іл]гіdraзинокарбоніл}гептил)формамід
 МН+ = 477.
 Приклад 53
 Бензиламід 2-(N'-{(R)-2-[(формілгідроксіаміно)метил]гептаноїл}гіdraзино)-4-трифторметилпіримідин-5-карбонової кислоти
 МН+ = 497.
 Приклад 54
 N-гідрокси-N-[(2R)-3-[N'-(1,2,4-бензотриазин-3-іл)гіdraзино]-2-(циклогексилметил)-3-оксопропіл]формамід
 МН+ = 373.
 Приклад 55
 N-гідрокси-N-[(2R)-2-(циклогексилметил)-3-({N'-[7-(метилокси)-(1,2,4-бензотриазин-3-іл)гіdraзино]-3-оксопропіл}формамід
 МН+ = 403.
 Приклад 56
 2-[2-((2R)-2-[(форміл(гідрокси)аміно)метил]гептаноїл)гіdraзино]-N-піридиніл-4-(трифторметил)-5-піримідинкарбоксамід
 МН+ = 498.
 Приклад 57
 2-[2-((2R)-2-[(форміл(гідрокси)аміно)метил]гептаноїл)гіdraзино]-N-метил-N-2-феніл-4-(трифторметил)-5-піримідинкарбоксамід
 МН+ = 497.
 Приклад 58
 Морфолін-4-іламід 2-(N'-{(R)-2-[(формілгідроксіаміно)метил]гептаноїл}гіdraзино)-4-трифторметилпіримідин-5-карбонової кислоти
 МН+ = 492.
 Приклад 59
 N-гідрокси-N-((R)-{N'-[(N'-фенілгіdraзинокарбоніл)трифторметилпіримідин-2-іл]гіdraзинокарбоніл}гептил)формамід
 МН+ = 498.
 Приклад 60
 Піперидин-1-іламід 2-(N'-{(R)-2-[(формілгідроксіаміно)метил]гептаноїл}гіdraзино)-4-трифторметилпіримідин-5-карбонової кислоти
 МН+ = 490.
 Приклад 61
 Пірол-1-іламід 2-(N'-{(R)-2-[(формілгідроксіаміно)метил]гептаноїл}гіdraзино)-4-трифторметилпіримідин-5-карбонової кислоти
 МН+ = 472.
 Приклад 62
 N-((R)-2-[N'-(диметиламінофторпіримідин-2-іл)гіdraзинокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід
 МН+ = 357.
 Приклад 63
 N-(R)-2-[N'-(етилметиламіно)фторпіримідин-2-іл]гіdraзинокарбоніл}гептил)-N-гідроксиформамід
 МН+ = 371.
 Приклад 64
 N-гідрокси-N-((2R)-2-(циклопентилметил)-3-({N'-[7-(метилокси)-1,2,4-бензотриазин-3-іл]гіdraзино)-3-оксопропіл}формамід
 МН+ = 389.
 Приклад 65
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(1-метил-1H-бензоімідазол-2-іл)гіdraзинокарбоніл]гептил)формамід
 МН+ = 348.
 Приклад 66
 N-((R)-2-[N'-(4-азетидин-1-іл-5-фторпіримідин-2-іл)гіdraзинокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід
 МН+ = 369.
 Приклад 67
 N-((R)-2-[N'-(4-циклопропіламіно-5-фторпіримідин-2-іл)гіdraзинокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід
 МН+ = 369.
 Приклад 68
 N-((R)-2-(N-бензо[1,2,4]триазин-3-ілгіdraзинокарбоніл)-3-циклопентилпропіл)-N-гідроксиформамід
 МН+ = 359.
 Приклад 69
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(морфолін-4-ілтрифторметилпіримідин-2-іл)гіdraзинокарбоніл]гептил)формамід
 МН+ = 449.
 Приклад 70
 N-гідрокси-N-((R)-2-(N'-[(2-гідроксіетил)метиламіно]трифторметилпіримідин-2-іл)гіdraзинокарбоніл)гептил]формамід

МН+ = 437.
 Приклад 71
 N-гідрокси-N-((R)-2-{N'-[(4-метилпіперазин-1-іл)трифторметилпіримідин-2-іл]гідразінокарбоніл}гептил)формамід
 МН+ = 462.
 Приклад 72
 N-гідрокси-N-((2R)-2-(циклогексилметил)-3-{N'-[4-(циклопропіламіно)-5-фторпіримідин-2-іл]гідразіно}-3-оксопропіл)формамід
 МН+ = 395.
 Приклад 73
 N-гідрокси-N-((2R)-2-(циклопентилметил)-3-{N'-[4-(циклопропіламіно)-5-фторпіримідин-2-іл]гідразіно}-3-оксопропіл)формамід
 МН+ = 381.
 Приклад 74
 N-гідрокси-N-[(2R)-3-{N'-[4-(азетидин-1-іл)-5-фторпіридин-2-іл]гідразіно}-2-(циклопентилметил)-3-оксопропіл]формамід
 МН+ = 381.
 Приклад 75
 N-гідрокси-N-[(2R)-5-метил-2-{N'-[4-(трифторметил)піримідин-2-іл]гідразіно}карбоніл)гексил]формамід
 МН+ = 364.
 Приклад 76
 N-[(R)-2-(N'-бензо[1,2,4]триазин-3-ілгідразінокарбоніл)-5-метилгексил]-N-гідроксиформамід
 МН+ = 347.
 Приклад 77
 N-гідрокси-N[(2R)-5-метил-2-{N'-[7-метилокси]-1,2,4-бензотриазин-3-іл]гідразіно}карбоніл)гексил]формамід
 МН+ = 377.
 Приклад 78
 N-[(R)-2-[N'-(7-хлорбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразінокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід
 МН+ = 381.
 Приклад 79
 N-гідрокси-N-((2R)-2-(циклопентилметил)-3-{N'-[4-(морфолін-4-іл)-6-(трифторметил)піримідин-2-іл]гідразіно}-3-оксопропіл)формамід
 МН+ = 461.
 Приклад 80
 N-гідрокси-N-((2R)-2-(циклопентилметил)-3-{N'-[4-[(2-гідроксіетил)(метил)аміно]-6-(трифторметил)піримідин-2-іл]гідразіно}-3-оксопропіл)формамід
 МН+ = 449.
 Приклад 81
 N-гідрокси-N-[(2R)-6-метил-2-{N'-[4-(трифторметил)піримідин-2-іл]гідразіно}карбоніл)гептил]формамід
 МН+ = 378.
 Приклад 82
 N-гідрокси-N-((2R)-2-[[N'-(1,2,4-бензотриазин-3-іл)гідразіно]карбоніл]-6-метилгептил)формамід
 МН+ = 361.
 Приклад 83
 N-гідрокси-N-[(R)-2-[N'-(5-метилбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразінокарбоніл]гептил]формамід
 МН+ = 361.
 Приклад 84
 N-((R)-2-{N'-[(4-етилпіперазин-1-іл)трифторметилпіримідин-2-іл]гідразінокарбоніл}гептил)-N-гідроксиформамід
 МН+ = 476.
 Приклад 85
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(піперазин-1-іл)трифторметилпіримідин-2-іл]гідразінокарбоніл]гептил)формамід
 МН+ = 448.
 Приклад 86
 N-(((R)-2-[N'-(7-фторбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід
 МН+ = 365.
 Приклад 87
 N-гідрокси-N-[(2R)-2-{N'-[4-(4-етил-1-піперазиніл)-6-(трифторметил)піримідин-2-іл]гідразіно}карбоніл)-6-метилгептил]формамід
 МН+ = 490.
 Приклад 88
 N-гідрокси-N-[(2R)-6-метил-2-{N'-[4-(піперазин-1-іл)-6-(трифторметил)піримідин-2-іл]гідразіно}карбоніл)гептил]формамід
 МН+ = 462.
 Приклад 89
 N-гідрокси-N-[(2R)-6-метил-2-{N'-[4-(4-метилпіперазин-1-іл)-6-(трифторметил)піримідин-2-іл]гідразіно}карбоніл)гептил]формамід
 МН+ = 476.
 Приклад 90

N-гідрокси-N-((2R)-2-[[N'-(7-хлор-1,2,4-бензотриазин-3-іл)гіdraзино]карбоніл]-6-метилгептил)формамід
 МН+ = 395.
 Приклад 91
 N-гідрокси-N-((2R)-6-метил-2-[[N'-(5-метил-1,2,4-бензотриазин-3-іл)гіdraзино]карбоніл]гептил) формамід
 МН+ = 375.
 Приклад 92
 N-гідрокси-N-((2R)-2-[[N'-(7-фтор-1,2,4-бензотриазин-3-іл)гіdraзино]карбоніл]-6-метилгептил) формамід
 МН+ = 379.
 Приклад 93
 N-гідрокси-N-((R)-2-{N'-[(2-метоксиетиламіно)трифторметилпіримідин-2-іл]гіdraзинокарбоніл}гептил)
 формамід
 МН+ = 437.
 Приклад 94
 N-гідрокси-N-[(2R)-6-метил-2-({N'-[7-(метилокси)-1,2,4-бензоотриазин-3-іл]гіdraзино}карбоніл)
 гептил]формамід
 МН+ = 391.
 Приклад 95
 N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-{[4-(2-гідроксиетил)піперазин-1-іл]трифторметил піримідин-2-іл}гіdraзинокарбоніл)
 гептил]формамід
 МН+ = 492.
 Приклад 96
 N-гідрокси-N-((R)-2-{N'-[(4-піримідин-2-ілпіперазин-1-іл)трифторметилпіримідин-2-
 іл]гіdraзинокарбоніл}гептил) формамід
 МН+ = 526.
 Приклад 97
 N-гідрокси-N-((R)-2-{N'-[(2-гідроксиетиламіно)трифторметилпіримідин-2-іл]гіdraзинокарбоніл}гептил)
 формамід
 МН+ = 423.
 Приклад 98
 N-гідрокси-N-[(R)-2-[N'-(7-трифторметилбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гіdraзинокарбоніл]гептил]формамід
 МН+ = 415.
 Приклад 99
 N-гідрокси-N-[(R)-2-[N'-(6-метилбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гіdraзинокарбоніл]гептил]формамід
 МН+ = 361.
 Приклад 100
 N-гідрокси-N-((2R)-2-(циклопентилметил)-3-[N'-(5-метил-1,2,4-бензотриазин-3-іл)гіdraзино]-3-
 оксопропіл]формамід
 МН+ = 373.
 Приклад 101
 N-гідрокси-N-[(2R)-2-({N'-[4-(трифторметил)піримідин-2-іл]гіdraзино}карбоніл)октил]формамід
 МН+ = 378.
 Приклад 102
 N-гідрокси-N-((2R)-2-[[N'-(1,2,4-бензотриазин-3-іл)гіdraзино]карбоніл]октил)формамід
 МН+ = 361.
 Приклад 103
 N-гідрокси-N-[(R)-2-({N'-[7-(метилокси)-1,2,4-бензотриазин-3-іл]гіdraзино}карбоніл)октил]формамід
 МН+ = 391.
 Приклад 104
 N-гідрокси-N-[(R)-2-[N'-(7-метилбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гіdraзинокарбоніл]гептил]формамід
 МН+ = 361.
 Приклад 105
 N-[(R)-2-[N'-(6-хлорбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гіdraзинокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід
 МН+ = 381.
 Приклад 106
 N-гідрокси-N-[(R)-2-[N'-(5-метоксибензо[триазин-3-іл]гіdraзинокарбоніл]гептил]формамід
 МН+ = 377.
 Приклад 107
 N-гідрокси-N-[(R)-2-[N'-(1-метил-2-оксо-1,2-дигідропіридин-4-іл)гіdraзинокарбоніл]гептил]формамід
 МН+ = 325.
 Приклад 108
 N-гідрокси-N-((R)-2-{N'-[(N'-піридин-2-іл)гіdraзино]трифторпіримідин-2-іл]гіdraзинокарбоніл}гептил)
 формамід
 МН+ = 471.
 Приклад 109
 N-гідрокси-N-[(R)-2-[N'-(4-метил-6-морфолін-4-ілпіримідин-2-іл)гіdraзинокарбоніл]гептил]формамід
 МН+ = 395.
 Приклад 110
 N-[(R)-2-{N'-[4-(4-етилпіперазин-1-іл)-6-метилпіримідин-2-іл]гіdraзинокарбоніл}гептил]-N-гідроксиформамід
 МН+ = 422.
 Приклад 111

N-((R)-2-[N'-(4,6-диметилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід
 МН+ = 324.
 Приклад 112
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(4-трифторметилпіридин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)формамід
 МН+ = 363.
 Приклад 113
 N-гідрокси-N-((R)-2-(N'-ізохінолін-1-ілгідразінокарбоніл)гептил)формамід
 МН+ = 345.
 Приклад 114
 N-гідрокси-N-((R)-2-(N'-хінолін-2-ілгідразінокарбоніл)гептил)формамід
 МН+ = 345.
 Приклад 115
 N-((R)-2-[N'-(1-бензил-2-оксо-1,2-дигідропіридин-4-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід
 МН+ = 401.
 Приклад 116
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(4-оксо-4Н-піrido[1,2-а][1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)формамід
 МН+ = 363.
 Приклад 117
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(4-метилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)формамід
 МН+ = 310.
 Приклад 118
 N-((R)-2-[N'-(1-бутил-2-оксо-1,2-дигідропіридин-4-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід
 МН+ = 367.
 Приклад 119
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(9-метил-4-оксо-4Н-піrido[1,2-а][1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)формамід
 МН+ = 377.
 Приклад 120
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(6-оксо-4-трифторметил-1,6-дигідропіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)формамід
 МН+ = 380.
 Приклад 121
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(метилтрифторметилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)формамід
 МН+ = 378.
 Приклад 122
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(5-трифторметилпіридин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)формамід
 МН+ = 363.
 Приклад 123
 N-((R)-2-[N'-(6-етоксипіридин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід
 МН+ = 339.
 Приклад 124
 N-гідрокси-N-((R)-2-(N'-піrido[2,3-е][1,2,4]триазин-3-ілгідразінокарбоніл)гептил)формамід
 МН+ = 348.
 Приклад 125
 N-((R)-2-[N'-(1-етилпропіл)-2-оксо-1,2-дигідропіридин-4-іл]гідразінокарбоніл)гептил)-N-гідроксиформамід
 МН+ = 381.
 Приклад 126
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(2-оксо-1-(3-трифторметилбензил)-1,2-дигідропіридин-4-іл)гідразінокарбоніл]гептил)формамід
 МН+ = 469.
 Приклад 127
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(4-метилпіридин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)формамід
 МН+ = 309.
 Приклад 128
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(6-метоксипіридин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)формамід
 МН+ = 325.
 Приклад 129
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(2-оксо-1-хінолін-8-ілметил-1,2-дигідропіридин-4-іл)гідразінокарбоніл]гептил)формамід
 МН+ = 452.
 Приклад 130
 N-гідрокси-N-((R)-2-(N'-(2-оксо-1-[2-(5,6,7,8-тетрагідро[1,8]нафтиридин-2-іл)етил]дигідропіридин-4-іл)гідразінокарбоніл)гептил)формамід
 МН+ = 471.
 Приклад 131
 N-((R)-2-[N'-(4,6-бісетиламіно[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід
 МН+ = 383.
 Приклад 132
 N-((R)-2-[N'-(бісдиметиламіно[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід

МН+ = 383.
 Приклад 133
 N-((R)-2-[N'-(4,6-[іморфолін-4-іл[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід
 МН+ = 467.
 Приклад 134
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(4-(4-метилпіперазин-1-іл)-6-пропіламіно[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)формамід
 МН+ = 452.
 Приклад 135
 N-((R)-2-[N'-(диметиламіноморфолін-4-іл[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід
 МН+ = 425.
 Приклад 136
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(6-метилпіридин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)формамід
 МН+ = 309.
 Приклад 137
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(5-(5-феніл[1,3,4]оксадіазол-2-іл)піридин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)формамід
 МН+ = 439.
 Приклад 138
 N-((R)-2-[N'-(7-трет-бутил-1,4-діоксо-1,2,3,4-тетрагідропіридо[3,4-d]піридазин-5-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід
 МН+ = 435.
 Приклад 139
 N-((R)-2-[N'-(4-етиламіно-6-(4-метил[1,4]діазепан-1-іл)[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід
 МН+ = 452.
 Приклад 140
 N-((R)-2-[N'-(4-етиламіно-6-(4-етилпіперазин-1-іл)[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід
 МН+ = 452.
 Приклад 141
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(6-трифторметилпіридин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)формамід
 МН+ = 363.
 Приклад 142
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(4-метил-6-морфолін-4-ілметилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)формамід
 МН+ = 409.
 Приклад 143
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(4-метил-6-морфолін-4-іл[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)формамід
 МН+ = 396.
 Приклад 144
 N-гідрокси-N-((2R)-2-(циклопентилметил)-3-[N'-(4,6-диметил-2-піримідиніл)гідразіно]-3-оксопропіл)формамід
 МН+ = 336.
 Приклад 145
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(4-метил-6-піролідін-1-ілметилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)формамід
 МН+ = 393.
 Приклад 146
 N-((R)-2-[N'-(4-диметиламінометил-6-метилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід
 МН+ = 367.
 Приклад 147
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(4-метилпіперазин-1-ілметил)піримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)формамід
 МН+ = 422.
 Приклад 148
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(5-метилпіридин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)формамід
 МН+ = 309.
 Приклад 149
 N-((R)-2-[N'-(диметиламіно(4-метил[1,4]дизепан-1-іл)[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід
 МН+ = 452.
 Приклад 150
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(4-метил-6-піролідін-1-іл[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)формамід
 МН+ = 380.
 Приклад 151
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(4-метил-6)4-піролідін-1-ілпіперидин-1-іл)[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)формамід
 МН+ = 463.
 Приклад 152
 N-((R)-2-[N'-(етилметиламіно)метил[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід
 МН+ = 368.
 Приклад 153
 N-((R)-2-[N'-(4-(4-етилпіперазин-1-іл)-6-метил[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-

гідроксиформамід
 МН+ = 423.
 Приклад 154
 N-гідрокси-N-((2R)-7,7,7-трифтор-2-([N'-(4-(трифторметил)піримідин-2-іл)гіdraзино]карбоніл)гептил)формамід
 МН+ = 418.
 Приклад 155
 N-гідрокси-N-((2R)-7,7,7-трифтор-2-([N'-(5-метил-1,2,4-бензотриазин-3-іл)гіdraзино]карбоніл)гептил)формамід
 МН+ = 415.
 Приклад 156
 N-гідрокси-N-((2R)-7,7,7-трифтор-2-([N'-(7-метил-1,2,4-бензотриазин-3-іл)гіdraзино]карбоніл)гептил)формамід
 МН+ = 415.
 Приклад 157
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(4-метиламіно-6-морфолін-4-іл[1,3,5]-2-іл)гіdraзинокарбоніл]гептил)формамід
 МН+ = 411.
 Приклад 158
 N-((R)-2-[N'-(4-(4-етилпіперазин-1-іл)-6-метиламіно[1,3,5]триазин-2-іл)гіdraзинокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід
 МН+ = 438.
 Приклад 159
 N-((R)-2-[N'-(4-етиламіно-6-морфолін-4-іл[1,3,5]триазин-2-іл)гіdraзинокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід
 МН+ = 425.
 Приклад 160
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(4,6,7-триметил-7,8-дигідроптерин-2-іл)гіdraзинокарбоніл]гептил)формамід
 МН+ = 392.
 Приклад 161
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(4,6,7-триметилптеридин-2-іл)гіdraзинокарбоніл]гептил)формамід
 МН+ = 390.
 Приклад 162
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(метоксиметоксиметилтрифторметилпіримідин-2-іл)гіdraзинокарбоніл]гептил)формамід
 МН+ = 438.
 Приклад 163
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(4-метил-6-(1-піперидин-1-ілметаноїл)піримідин-2-іл)гіdraзинокарбоніл]гептил)формамід
 МН+ = 421.
 Приклад 164
 Циклопропіламід-2-(N'-((R)-2-[(формілгідроксіаміно)метил]гептаноїл)гіdraзино)-6-метилпіримідин-4-карбонової кислоти
 МН+ = 393.
 Приклад 165
 Діізопропіламід-2-(N'-((R)-2-[(формілгідроксіаміно)метил]гептаноїл)гіdraзино)-6-метилпіримідин-4-карбонової кислоти
 МН+ = 437.
 Приклад 166
 N-((R)-2-[N'-(5-ціанопіридин-2-іл)гіdraзинокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід
 МН+ = 320.
 Приклад 167
 N-((R)-2-[N'-(4,6-діетил[1,3,5]триазин-2-іл)гіdraзинокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід
 МН+ = 353.
 Приклад 168
 N-((R)-4-циклопентил-2-[N'-(4-трифторметилпіримідин-2-іл)гіdraзинокарбоніл]бутил)-N-гідроксиформамід
 МН+ = 390.
 Приклад 169
 N-((R)-4-циклопентил-2-[N'-(7-метилбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гіdraзинокарбоніл]бутил)-N-гідроксиформамід
 МН+ = 387.
 Приклад 170
 N-((R)-4-циклопентил-2-[N'-(5-метилбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гіdraзинокарбоніл]бутил)-N-гідроксиформамід
 МН+ = 387.
 Приклад 171
 N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(6-(4-метилпіперазин-1-ілметил)піридин-2-іл)гіdraзинокарбоніл]гептил)формамід
 МН+ = 407.
 Приклад 172
 N-((R)-2-[N'-(5-(4,6-диметоксипіримідин-2-іл)піридин-2-іл)гіdraзинокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід
 МН+ = 433.
 Приклад 173
 N-((R)-2-[N'-(діетиламінометил[1,3,5]триазин-2-іл)гіdraзинокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід
 МН+ = 382.

Приклад 174
N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-[(2-метіоксиетил)метиламіно]метил[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл)гептил]формамід
МН+ = 397.

Приклад 175
N-((R)-1-{N'-[4-(2,6-диметилморфолін-4-іл)-6-метил[1,3,5]триазин-2-іл]гідразінокарбоніл}гептил)-N-гідроксиформамід
МН+ = 424.

Приклад 176
N-((R)-2-[N'-(5-фтор-4-метил-6-морфолін-4-ілпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил}-N-гідроксиформамід
МН+ = 413.

Приклад 177
N-((R)-2-[N'-(4-етил-6-морфолін-4-іл[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил}-N-гідроксиформамід
МН+ = 410.

Приклад 178
N-((R)-2-[N'-(етилметиламіно)[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил}-N-гідроксиформамід
МН+ = 382.

Приклад 179
N-((R)-2-{N'-[4-етил-6-(4-етилпіперазин-1-іл)][1,3,5]триазин-2-іл]гідразінокарбоніл}гептил)-N-гідроксиформамід
МН+ = 437.

Приклад 180
N-((R)-2-{N'-[5-фтор-4-метил-6(4-метилпіперазин-1-іл)піримідин-2-іл]гідразінокарбоніл}гептил)-N-гідроксиформамід
МН+ = 426.

Приклад 181
N-((R)-2-[N'-(диметиламіноетил[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід
МН+ = 368.

Приклад 182
N-((R)-2-{N'-[5-фтор-4-метил-6-(4-метил[1,4]діазепан-1-іл)піримідин-2-іл]гідразінокарбоніл}гептил)-N-гідроксиформамід
МН+ = 440.

Приклад 183
N-((R)-4-циклопентил-2-[N'-(морфолін-4-ілтрифторметилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]бутил)-N-гідроксиформамід
МН+ = 475.

Приклад 184
N-[(R)-2-(N'-{етил-[(2-метоксіетил)метиламіно][1,3,5]триазин-2-іл}гідразінокарбоніл)гептил]-N-гідроксиформамід
МН+ = 412.

Приклад 185
N-((R)-2-[N'-(диметиламінометилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід
МН+ = 353.

Приклад 186
N-((R)-2-[N'-(4-циклопропіламіно-6-метилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід
МН+ = 365.

Приклад 187
N-((R)-2-циклогексил-2-[N'-(4-трифторметилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]етил)-N-гідроксиформамід
МН+ = 376.

Приклад 188
N-((R)-2-циклогексил-2-[N'-(7-метоксибензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразінокарбоніл]етил)-N-гідроксиформамід
МН+ = 389.

Приклад 189
N-((R)-2-циклогексил-2-[N'-(5-метилбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразінокарбоніл]етил)-N-гідроксиформамід
МН+ = 373.

Приклад 190
N-((R)-4,4-диметил-2-[N'-(4-трифторметилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід
МН+ = 364.

Приклад 191
N-((R)-4,4-диметил-2-[N'-(7-метилбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразінокарбоніл]пентил)-N-гідроксиформамід
МН+ = 361.

Приклад 192
N-((R)-4,4-дметил-2-[N-(5-метилбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразінокарбоніл]пентил)-N-гідроксиформамід
МН+ = 361.

Приклад 193
N-((R)-4,4-диметил-2-[N'-(морфолін-4-ілтрифторметилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]пентил)-N-гідроксиформамід
МН+ = 449.

Приклад 194
N-((R)-2-{N'-[етил(метилпіридин-2-іламіно)][1,3,5]триазин-2-іл]гідразінокарбоніл}гептил)-N-

гідроксиформамід

MH+ = 431.

Приклад 195

N-((R)-2-[N'-(4-циклопропіламіно-6-етил[1,3,5]тріазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід

MH+ = 380.

Приклад 196

N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(5-метилбензо[1,2,4]тріазин-3-іл)гідразінокарбоніл]-3-(1-метилциклопентил)пропіл]формамід

MH+ = 387.

Приклад 197

-N-((R)-2-[N'-(7-метоксибензо[1,2,4]тріазин-3-іл)гідразінокарбонілі-3-(1-метилциклопентил)пропіл]формамід

MH+ = 403.

Приклад 198

N-гідрокси-N-((R)-3-(1-метилциклопентил)-2-[N'-(4-трифторметилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]пропіл]формамід

MH+ = 390.

Приклад 199

N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(4-ізопропіл-6-морфолін-4-іл[1,3,5]тріазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил]формамід

MH+ = 424.

Приклад 200

N-гідрокси-N-((2R)-2-(циклопентилметил)-3-[N'-(4-метил-2-піримідиніл)гідразіно]-3-оксопропіл]формамід

MH+ = 322.

Приклад 201

N-гідрокси-N-((2R)-6,6,6-трифтор-2-((N'-(4-(трифторметил)піримідин-2-іл)гідразіно)карбоніл)гексил]формамід

MH+ = 404.

Приклад 202

N-((R)-2-[N'-(5,7-диметилбензо[1,2,4]тріазин-3-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід

MH+ = 375.

Приклад 203

N-((R)-2-[N'-(3,6-диметилпіразин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід

MH+ = 324.

Приклад 204

N-((R)-2-{N'-(4-(4-етилпіперазин-1-іл)-6-ізопропіл[1,3,5]тріазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід

MH+ = 451.

Приклад 205

N-((R)-2-[N'-(4-диметиламіно-6-ізопропіл[1,3,5]тріазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід

MH+ = 382.

Приклад 206

N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(метилтрифторметилпіридин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил]формамід

MH+ = 377.

Приклад 207

2-N'((R)-2-[(формілгідроксіаміно)метил]гептанойл)гідразіно-6,N,N-триметилізонікотинамід

MH+ = 380.

Приклад 208

N-гідрокси-N-((2R)-2-((N'-(3-аміно-6-(трифторметил)піридин-2-іл)гідразіно)карбоніл)гептил]формамід

MH+ = 378.

Приклад 209

N-гідрокси-N-((R)-2-(N'-(4-ізопропіл-6-[(2-метоксіетил)метиламіні][1,3,5]тріазин-2-іл)гідразінокарбоніл)гептил]формамід

MH+ = 426.

Приклад 210

N-((R)-3-циклопентил-2-[N'-(4-етил-6-морфолін-4-іл[1,3,5]тріазин-2-іл)гідразінокарбоніл]пропіл)-N-гідроксиформамід

MH+ = 422.

Приклад 211

N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(4-морфолін-4-іл-6-пропіл[1,3,5]тріазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил]формамід

MH+ = 424.

Приклад 212

N-((R)-2-{N'-(4-(4-етилпіперазин-1-іл)-6-пропіл[1,3,5]тріазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід

MH+ = 451.

Приклад 213

N-((R)-5,5-диметил-2-[N'-(4-трифторметилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гексил)-N-гідроксиформамід

MH+ = 378.

Приклад 214

N-((R)-5,5-диметил-2-[N'-(7-метилбензо[1,2,4]тріазин-3-іл)гідразінокарбоніл]гексил)-N-гідроксиформамід

MH+ = 375.

Приклад 215
N-((R)-5,5-диметил-2-[N'-(5-метилбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразінокарбоніл]гексил)-N-гідроксиформамід
МН+ = 375.

Приклад 216
N-((R)-5,5-диметил-2-[N'-(морфолін-4-ілтрифторметилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гексил)-N-гідроксиформамід
МН+ = 463.

Приклад 217
N-((R)-4-етил-2-[N'-(4-трифторметилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гексил)-N-гідроксиформамід
МН+ = 378.

Приклад 218
N-((R)-4-етил-2-[N'-(7-метилбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразінокарбоніл]гексил)-N-гідроксиформамід
МН+ = 375.

Приклад 219
N-((R)-4-етил-2-[N'-(морфолін-4-ілтрифторметилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гексил)-N-гідроксиформамід
МН+ = 463.

Приклад 220
N-((R)-3-циклопентил-2-[N'-(4-етил-6-(4-етилпіперазин-1-іл)[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]пропіл)-N-гідроксиформамід
МН+ = 449.

Приклад 221
N-((R)-3-циклопентил-2-[N'-(4-циклопропіламіно-6-етил[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]пропіл)-N-гідроксиформамід
МН+ = 392.

Приклад 222
N-((R)-4-етил-2-[N'-(5-метилбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразінокарбоніл]гексил)-N-гідроксиформамід
МН+ = 375.

Приклад 223
N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-{(2-метоксиетил)метиламіно}пропіл[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептилформамід
МН+ = 426.

Приклад 224
N-((R)-2-[N'-(диметиламінопрол[1,3,5]триазин-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід
МН+ = 382.

Приклад 225
N-((R)-2-[N'-(4-етилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід
МН+ = 324.

Приклад 226
N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(4-ізопропілпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)формамід
МН+ = 338.

Приклад 227
N-((R)-2-[N'-(4-циклопропіл-6-морфолін-4-іл[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід
МН+ = 422.

Приклад 228
N-гідрокси-N-[(2R)-2-({N'-(4-(піридин-2-іл)піримідин-2-іл)гідразіно}карбоніл)гептил]формамід
МН+ = 373.

Приклад 229
N-((R)-2-[N'-(4-циклопропіл-6-(4-етилпіперазин-1-іл)[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід
МН+ = 449.

Приклад 230
N-((R)-2-[N'-(циклопропілдиметиламіно[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід
МН+ = 380.

Приклад 231
N-((R)-2-[N'-(циклопропіл(етилметиламіно)[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід
МН+ = 394.

Приклад 232
N-((R)-2-[N'-(4-циклопропіл-6-піролідин-1-іл[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід
МН+ = 406.

Приклад 233
N-((R)-2-[N'-(4,6-дициклопропіл[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід
МН+ = 377.

Приклад 234
N-гідрокси-N-[(R)-2-[N'-(5-метилбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразінокарбоніл]-3-(2-метилциклопентил)пропіл]формамід
МН+ = 387.

Приклад 235
N-[(R)-2-[N'-(диметиламіноетил[1,3,5]триазин-2-іл)гідразинокарбоніл]-3-(2-метилциклопентил)пропіл]-N-гідроксиформамід
МН+ = 394.

Приклад 236
N-гідрокси-N-[(R)-2-[N'-(4-трифторметилпіримідин-2-іл)гідразинокарбоніл]-3-(2-метилциклопентил)пропіл]формамід
МН+ = 390.

Приклад 237
N-[(R)-2-[N'-(5-етилпіримідин-2-іл)гідразинокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід
МН+ = 324.

Приклад 238
N-гідрокси-N-[(2R)-2-(циклопентилметил)-3-[N'-(7-метил-1,2,4-бензотриазин-3-іл)гідразино]-3-оксопропіл]формамід
МН+ = 373.

Приклад 239
N-гідрокси-N-[(2R)-2-(циклопентилметил)-3-[N'-(4-етил-6-[етил(метил)аміно]-1,3,5-триазин-2-іл)гідразино]-3-оксопропіл]формамід
МН+ = 394.

Приклад 240
N-гідрокси-N-[(2R)-2-(циклопентилметил)-3-[N'-(4-(диметиламіно)-6-етил-1,3,5-триазин-2-іл)гідразино]-3-оксопропіл]формамід
МН+ = 380.

Приклад 241
N-((R)-2-[N'-(4-етил-6-(4-ізопропілпіперазин-1-іл)[1,3,5]триазин-2-іл)гідразинокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід
МН+ = 451.

Приклад 242
N-гідрокси-N-[(2R)-3-[N'-(6-хлор-1,2,4-бензотриазин-3-іл)гідразино]-2-(циклопентилметил)-3-оксопропіл]формамід
МН+ = 393.

Приклад 243
N-[(R)-4,4-диметил-2-[N'-(4-трифторметилпіримідин-2-іл)гідразинокарбоніл]гексил]-N-гідроксиформамід
МН+ = 378.

Приклад 244
N-[(R)-4,4-диметил-2-[N'-(7-метилбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразинокарбоніл]гексил]-N-гідроксиформамід
МН+ = 375.

Приклад 245
N-[(R)-4,4-диметил-2-[N'-(5-метилбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразинокарбоніл]гексил]-N-гідроксиформамід
МН+ = 375.

Приклад 246
N-[(R)-4,4-диметил-2-[N'-(морфолін-4-ілтрифторметилпіримідин-2-іл)гідразинокарбоніл]гексил]-N-гідроксиформамід
МН+=463.

Приклад 247
N-гідрокси-N-[(R)-2-[N'-(5-феніл[1,2,4]триазин-3-іл)гідразинокарбоніл]гептил]формамід
МН+ = 373.

Приклад 248
N-[(R)-2-[N'-(4-етил-6-морфолін-4-ілпіримідин-2-іл)гідразинокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід
МН+ = 409.

Приклад 249
N-((R)-2-[N'-(4-етил-6-(4-метилпіперазин-1-іл)піримідин-2-іл)гідразинокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід
МН+ = 422.

Приклад 250
N-[(R)-2-[N'-(5-етил-4-метилпіримідин-2-іл)гідразинокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід
МН+ = 338.

Приклад 251
N-((R)-2-[N'-(4-етил-6-(4-пропілпіперазин-1-іл)[1,3,5]триазин-2-іл)гідразинокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід
МН+ = 451.

Приклад 252
N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(6-(4-піримідин-2-ілпіперазин-1-ілметил)піридин-2-іл)гідразинокарбоніл]гептил]формамід
МН+ = 471.

Приклад 253
N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(6-(3-[1,2,4]триазол-1-ілметил[1,2,4]триазол-1-іл)піридин-2-іл)гідразинокарбоніл]гептил]формамід
МН+ = 443.

Приклад 254
N-[(R)-3-біцикло[2.2.1]гепт-7-ил-2-[N'-(4-трифторметилпіримідин-2-іл)гідразинокарбоніл]пропіл]-N-

гідроксиформамід

MH+ = 402.

Приклад 255

N-((R)-3-біцикло[2.2.1]гепт-7-ил-2-[N'-(морфолін-4-ілтрифторметилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]пропіл)-N-гідроксиформамід

MH+ = 487.

Приклад 256

N-гідрокси-N-((R)-2-(N'-піридин-3-ілгідразінокарбоніл)гептил]формамід

MH+ = 295.

Приклад 257

Йодид 4-{4-етил-6-[2-((2R)-2-[[форміл(гідрокси)аміно]метил]гептаноїл)гідразіно]-1,3,5-триазин-2-іл}-1-метил-1-пропілпіперазин-1-іл

MH+ = 465.

Приклад 258

N-((R)-3-біцикло[2.2.1]гепт-7-ил-2-[N'-(5-метилбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразінокарбоніл]пропіл)-N-гідроксиформамід

MH+ = 399.

Приклад 259

N-((R)-2-[N'-(4-азетидин-1-іл-6-етил[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід

MH+ = 380.

Приклад 260

N-((R)-2-циклопентил-2-[N'-(4-трифторметилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]етил)-N-гідроксиформамід

MH+ = 362.

Приклад 261

N-((R)-2-циклопентил-2-[N'-(морфолін-4-іл-4-трифторметилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]етил)-N-гідроксиформамід

MH+ = 447.

Приклад 262

N-((R)-2-циклопентил-2-[N'-(4-метилпіридин-2-іл)гідразінокарбоніл]етил)-N-гідроксиформамід

MH+ = 307.

Приклад 263

N-((R)-2-циклопентил-2-[N'-(диметиламіноетил[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]етил)-N-гідроксиформамід

MH+ = 366.

Приклад 264

N-((R)-2-циклопентил-2-[N'-(7-метилбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразінокарбоніл]етил)-N-гідроксиформамід

MH+ = 359.

Приклад 265

N-((R)-2-циклопентил-2-[N'-(5-метилбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразінокарбоніл]етил)-N-гідроксиформамід

MH+ = 359.

Приклад 266

N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(5-метилбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразінокарбоніл]-2-(4-метилциклогексил)етил)формамід

MH+ = 387.

Приклад 267

N-гідрокси-N-((R)-2-[N'-(7-метилбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гідразінокарбоніл]-2-(4-метилциклогексил)етил)формамід

MH+ = 387.

Приклад 268

N-гідрокси-N-((R)-2-(4-метилциклогексил)-2-[N'-(4-трифторметилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]етил)формамід

MH+ = 390.

Приклад 269

N-гідрокси-N-((R)-2-(4-метилциклогексил)-2-[N'-(морфолін-4-ілтрифторметилпіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]етил)формамід

MH+ = 475.

Приклад 270

N-гідрокси-N-((R)-2-(4-метилциклогексил)-2-[N'-(4-метилпіридин-2-іл)гідразінокарбоніл]етил)формамід

MH+ = 335.

Приклад 271

N-((R)-2-[N'-(диметиламіноетил[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]-2-(4-метилциклогексил)етил)-N-гідроксиформамід

MH+ = 394.

Приклад 272

N-((R)-2-[N'-(6,7-дигідро-5H-циклопентапіримідин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід

MH+ = 336.

Приклад 273

N-((R)-2-[N'-(4-етил-6-((S)-2-гідроксиметилпіролідин-1-іл)[1,3,5]триазин-2-іл)гідразінокарбоніл]гептил)-N-гідроксиформамід

MH+ = 424.

Приклад 274
 $N-((R)-2-[N'-(\text{диметиламінопіридин-3-ілпіримідин-2-іл})\text{гідразінокарбоніл}]\text{гептил})-N\text{-гідроксиформамід}$
 $MH^+ = 416$.

Приклад 275
 $N-((R)-2-[N'-(\text{диметиламінопіридин-4-ілпіримідин-2-іл})\text{гідразінокарбоніл}]\text{гептил})-N\text{-гідроксиформамід}$
 $MH^+ = 416$.

Приклад 276
 $N\text{-гідрокси-}N-((R)-2-N'-(5,6,7,8\text{-тетрагідробензо}[1,2,4]\text{триазин-3-іл})\text{гідразінокарбоніл}]\text{гептил})\text{формамід}$
 $MH^+ = 351$.

Приклад 277
 $N-((R)-2-[N'-(5,6\text{-діетил}[1,2,4]\text{триазин-3-іл})\text{гідразінокарбоніл}]\text{гептил})-N\text{-гідроксиформамід}$
 $MH^+ = 353$.

Приклад 278
 $N\text{-гідрокси-}N-((R)-2-[N'-(5-(4\text{-гідроксифеніл})[1,2,4]\text{триазин-3-іл})\text{гідразінокарбоніл}]\text{гептил})\text{формамід}$
 $MH^+ = 389$.

Приклад 279
 $N-((R)-2-(N'-((2\text{-диметиламіноетил})\text{метиламіно})\text{етил}[1,3,5]\text{триазин-2-іл})\text{гідразінокарбоніл}]\text{гептил})-N\text{-гідроксиформамід}$
 $MH^+ = 425$.

Приклад 280
 $N-((R)-2-[N'-(2\text{-диметиламінохіназолін-4-іл})\text{гідразінокарбоніл}]\text{гептил})-N\text{-гідроксиформамід}$
 $MH^+ = 389$.

Приклад 281
 $N\text{-гідрокси-}N-((R)-2-[N'-(3\text{-метансульфоніл-4,6-диметилпіридин-2-іл})\text{гідразінокарбоніл}]\text{гептил})\text{формамід}$
 $MH^+ = 401$.

Приклад 282
 $N-((R)-2-[N'-(4\text{-етил-6-(3-гідроксипіперидин-1-іл})[1,3,5]\text{триазин-2-іл})\text{гідразінокарбоніл}]\text{гептил})-N\text{-гідроксиформамід}$
 $MH^+ = 424$.

Приклад 283
 $N-((R)-2-(N'-[4,5]\text{біпіримідиніл-2-іл})\text{гідразінокарбоніл}]\text{гептил})-N\text{-гідроксиформамід}$
 $MH^+ = 374$.

Приклад 284
 $N-((R)-2-[N'-(\text{циклопропілметиламіно})\text{етил}[1,3,5]\text{триазин-2-іл})\text{гідразінокарбоніл}]\text{гептил})-N\text{-гідроксиформамід}$
 $MH^+ = 394$.

Приклад 285
 $N-((R)-2-[N'-(4\text{-етил-6-}((R)\text{-3-гідроксипіролідін-1-іл})[1,3,5]\text{триазин-2-іл})\text{гідразінокарбоніл}]\text{гептил})-N\text{-гідроксиформамід}$
 $MH^+ = 410$.

Приклад 286
 $N\text{-гідрокси-}N-((R)-2-(N'-[3,3']\text{біпіридиніл-5-іл})\text{гідразінокарбоніл}]\text{гептил})\text{формамід}$
 $MH^+ = 372$.

Приклад 287
 $N\text{-гідрокси-}N-((R)-2-(N'-(5\text{-морфолін-4-ілпіридин-3-іл})\text{гідразінокарбоніл}]\text{гептил})\text{формамід}$
 $MH^+ = 380$.

Приклад 288
 $N\text{-гідрокси-}N-((R)-2-[N'-(4\text{-піридин-3-ілпіридин-2-іл})\text{гідразінокарбоніл}]\text{гептил})\text{формамід}$
 $MH^+ = 373$.

Приклад 289
 $N\text{-гідрокси-}N-((R)-2-[N'-(5,6,7,8\text{-тетрагідрохіназолін-2-іл})\text{гідразінокарбоніл}]\text{гептил})\text{формамід}$
 $MH^+ = 350$.

Приклад 290
 $N-((R)-2-(N'-((\text{циклопропіл-1-(1-метилпіперидин-4-іл)аміно})\text{етил}[1,3,5]\text{триазин-2-іл})\text{гідразінокарбоніл}]\text{гептил})-N\text{-гідроксиформамід}$
 $MH^+ = 477$.

Приклад 291
 $N-((R)-2-[N'-(4-((R)\text{-3-диметиламінопіролідін-1-іл})-6\text{-етил}[1,3,5]\text{триазин-2-іл})\text{гідразінокарбоніл}]\text{гептил})-N\text{-гідроксиформамід}$
 $MH^+ = 437$.

Приклад 292
 $N-((R)-2-(N'-[5-(1H\text{-пірол-2-іл})\text{піридин-3-іл})\text{гідразінокарбоніл}]\text{гептил})\text{формамід}$
 $MH^+ = 360$.

Приклад 293
 $N\text{-гідрокси-}N-((R)-2-(N'-[4\text{-метилпіперазин-1-іл})\text{трифторметилпіримідин-4-іл})\text{гідразінокарбоніл}]\text{гептил})\text{формамід}$
 $MH^+ = 462$.

Приклад 294
 $N\text{-гідрокси-}N-((R)-2-(N'-(\text{фуран-3-іл})\text{гідразінокарбоніл}]\text{гептил})\text{формамід}$
 $MH^+ = 361$.

Приклад 295
 $N-((R)-5,5\text{-диметил-2-[N'-(4\text{-трифторметилпіримидин-2-іл})гідразинокарбоніл}]гептил)-N\text{-гідроксиформамід}$
 МН+ = 392.

Приклад 296
 $N-((R)-5,5\text{-диметил-2-[N'-(7\text{-метилбензо}[1,2,4]\text{триазин-3-іл})гідразинокарбоніл}]гептил)-N\text{-гідроксиформамід}$
 МН+ = 389.

Приклад 297
 $N-((R)-5,5\text{-диметил-2-(4\text{-метилпіридин-2-іл})гідразинокарбоніл}]гептил)-N\text{-гідроксиформамід}$
 МН+ = 337.

Приклад 298
 $N-((R)-2\text{-циклогептил-2-[N'-(4\text{-трифторметилпіримидин-2-іл})гідразинокарбоніл}]етил)-N\text{-гідроксиформамід}$
 МН+ = 390.

Приклад 299
 $N-((R)-2\text{-циклогептил-2-[N'-(4\text{-метилпіридин-2-іл})гідразинокарбоніл}]етил)-N\text{-гідроксиформамід}$
 МН+ = 335.

Приклад 300
 $N-((R)-2\text{-циклогептил-2-[N'-(диметиламіноетил}[1,3,5]\text{триазин-2-іл})гідразинокарбоніл}]етил)-N\text{-гідроксиформамід}$
 МН+ = 394.

Приклад 301
 $N-((R)-2\text{-циклогептил-2-[N'-(7\text{-метилбензо}[1,2,4]\text{триазин-3-іл})гідразинокарбоніл}]етил)-N\text{-гідроксиформамід}$
 МН+ = 387.

Приклад 302
 $N-((R)-[N'-(4\text{-етил-6-(4\text{-гідроксипіперидин-1-іл})[1,3,5]\text{триазин-2-іл})гідразинокарбоніл}]гептил)-N\text{-гідроксиформамід}$
 МН+ = 424.

Приклад 303
 $N-((R)-5,5\text{-диметил-2-[N'-(5\text{-метилбензо}[1,2,4]\text{триазин-3-іл})гідразинокарбоніл}]гептил)-N\text{-гідроксиформамід}$
 МН+ = 389.

Приклад 304
 $N-((R)-2-[N'-(4\text{-диметиламінохіназолін-2-іл})гідразинокарбоніл}]гептил)-N\text{-гідроксиформамід}$
 МН+ = 389.

Приклад 305
 $N\text{-гідрокси-}N-((R)-2-[N'-(4\text{-піридин-4-ілпіримидин-2-іл})гідразинокарбоніл}]гептил)\text{формамід}$
 МН+ = 373.

Приклад 306
 $N\text{-гідрокси-}N-((R)-2-[N'-(4\text{-3\text{-гідроксиметилфеніл}}\text{)піримидин-2-іл})гідразинокарбоніл}]гептил)\text{формамід}$
 МН+ = 402.

Приклад 307
 $N\text{-гідрокси-}N-((R)-2-[N'-(4\text{-4\text{-гідроксиметилфеніл}}\text{)піримидин-2-іл})гідразинокарбоніл}]гептил)\text{формамід}$
 МН+ = 402.

Приклад 308
 $N-((R)-2-[N'-(4\text{-етил-6-(3\text{-метоксипіперидин-1-іл})[1,3,5]\text{триазин-2-іл})гідразинокарбоніл}]гептил)-N\text{-гідроксиформамід}$
 МН+ = 438.

Приклад 309
 $N\text{-гідрокси-}N-((R)-2-[N'-(7\text{-метилбензо}[1,2,4]\text{триазин-3-іл})гідразинокарбоніл}]2\text{-(4\text{-метилциклогексил})етил})\text{формамід}$
 МН+ = 387.

Приклад 310
 $N-((R)-2-[N'-(етил(етилметиламіно)[1,3,5]\text{триазин-2-іл})гідразинокарбоніл}]2\text{-(4\text{-метилциклогексил})етил})-N\text{-гідроксиформамід}$
 МН+ = 408.

Приклад 311
 $N-((R)-2-[N'-(етил(етилметиламіно)[1,3,5]\text{триазин-2-іл})гідразинокарбоніл}]2\text{-(4\text{-метилциклогексил})етил})-N\text{-гідроксиформамід}$
 МН+ = 408.

Приклад 312
 $N\text{-гідрокси-}N-((R)-2-[N'-(7\text{-метилбензо}[1,2,4]\text{триазин-3-іл})гідразинокарбоніл}]2\text{-(4\text{-метилциклогексил})етил})\text{формамід}$
 МН+ = 387.

Приклад 313
 $N-((R)-2-[N'-(4\text{-2,6\text{-диметоксифеніл}}\text{)піримидин-2-іл})гідразинокарбоніл}]гептил)-N\text{-гідроксиформамід}$
 МН+ = 432.

Приклад 314
 $N-((R)-2-[N'-(4\text{-етил-6-((R)\text{-метоксипіролідин-1-іл})[1,3,5]\text{триазин-2-іл})гідразинокарбоніл}]гептил)-N\text{-гідроксиформамід}$
 МН+ = 424.

Приклад 315
 $N-((R)-2-[N'-(4\text{-етил-6-(4\text{-метоксипіперидин-1-іл})[1,3,5]\text{триазин-2-іл})гідразинокарбоніл}]гептил)-N\text{-гідроксиформамід}$

гідроксиформамід

МН+ = 438.

Приклад 316

N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-(6-піролідін-1-іл)піримідин-4-іл)гіdraзинокарбоніл]гептил]формамід

МН+ = 365.

Приклад 317

N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-(6-(4-метилпіперазин-1-іл)піримідин-4-іл)гіdraзинокарбоніл]гептил]формамід

МН+ = 394.

Приклад 318

N-[(R)-2-[N'-(6-диметиламінопіримідин-4-іл)гіdraзинокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід

МН+ = 339.

Приклад 319

N-[(R)-2-[N'-(піридин-4-ілтрифторметилпіримідин-4-іл)гіdraзинокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід

МН+ = 441.

Приклад 320

N-[(R)-2-[N'-(піридин-3-ілтрифторметилпіримідин-4-іл)гіdraзинокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід

МН+ = 441.

Приклад 321

N-[(R)-2-[N'-(2-етиламіно-6-трифторметилпіримідин-4-іл)гіdraзинокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід

МН+ = 407.

Приклад 322

N-гідрокси-N-[(R)-2-[N'-(5-(4-метоксифеніл)[1,2,4]триазин-3-іл)гіdraзинокарбоніл]гептил]формамід

МН+ = 403.

Приклад 323

N-гідрокси-N-[(R)-2-[N'-(4-(2,3,4-триметоксифеніл)піримідин-2-іл)гіdraзинокарбоніл]гептил]формамід

МН+ = 462

Приклад 324

N-[(R)-4,4-диметил-2-[N'-(4-трифторметилпіримідин-2-іл)гіdraзинокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід

МН+ = 392.

Приклад 325

N-[(R)-4,4-диметил-2-[N'-(7-метилбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гіdraзинокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід

МН+ = 389.

Приклад 326

N-[(R)-4,4-диметил-2-[N'-(5-метилбензо[1,2,4]триазин-3-іл)гіdraзинокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід

МН+ = 389.

Приклад 327

N-[(R)-4,4-диметил-2-[N'-(4-метилпіридин-2-іл)гіdraзинокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід

МН+ = 337.

Приклад 328

N-гідрокси-N-[(R)-2-[N'-(6-морфолін-4-іл)піримідин-4-іл)гіdraзинокарбоніл]гептил]формамід

МН+ = 381.

Приклад 329

N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-(5-[4-(2-гідроксиетокси)феніл][1,2,4]триазин-3-іл)гіdraзинокарбоніл]гептил]формамід

МН+ = 433.

Приклад 330

N-[(R)-2-[N'-(4-фуран-2-іл)піримідин-2-іл)гіdraзинокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід

МН+ = 362.

Приклад 331

N-[(R)-2-[N'-(4-(3,5-диметилізоксазол-4-іл)піримідин-2-іл)гіdraзинокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід

МН+ = 391.

Приклад 332

N-гідрокси-N-[(R)-2-[N'-(4-метил-1-оксипіридин-2-іл)гіdraзинокарбоніл]гептил]формамід

МН+ = 325.

Приклад 333

2-(N'-[(R)-2-[(формілгідроксіаміно)метил]гептаноїл]гіdraзино)-6-метилнікотинава кислота

МН+ = 353.

Приклад 334

N-гідрокси-N-[(R)-2-[N'-(3-метоксипіридин-2-іл)гіdraзинокарбоніл]гептил]формамід

МН+ = 325.

Приклад 335

N-гідрокси-N-[(2R)-2-[(N'-(4-[4-(метилсульфоніл)феніл]піримідин-2-іл)гіdraзино)карбоніл]гептил]формамід

МН+ = 450.

Приклад 336

N-гідрокси-N-[(2R)-2-[(N'-(4-фуран-3-іл)піримідин-2-іл)гіdraзино)карбоніл]гептил]формамід

МН+ = 362.

Приклад 337

N-[(2R)-2-[(N'-(4-(2-амінофеніл)піримідин-2-іл)гіdraзино)карбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід

МН+ = 387.

Приклад 338

N-гідрокси-N-[(2R)-2-({N'-[5-(5-метил-1,3,4-оксадіазол-2-іл)-4-(трифторметил)іл]гідразино}карбоніл)гептил]формамід піримідин-2-
 МН+ = 446.
 Приклад 339
 N-гідрокси-N-((2R)-2-(циклопентилметил)-3-{N'-[5-(5-метил-1,3,4-оксадіазол-2-іл)-4-(трифторметил)піримідин-2-іл]гідразино}-3-оксопропіл)формамід
 МН+ = 458.
 Приклад 340
 N-[(2R)-2-({N'-[6-(диметиламіно)-2-метилпіримідин-4-іл]гідразино}карбоніл)гептил]-N-гідроксиформамід
 МН+ = 353.
 Приклад 341
 N-[(2R)-2-({N'-[2-циклопропіл-6-(диметиламіно)піримідин-4-іл]гідразино}карбоніл)гептил]-N-гідроксиформамід
 МН+ = 379.
 Приклад 342
 N-гідрокси-N-[(2R)-4-(2-тієніл)-2-({N'-[4-(трифторметил)піримідин-2-іл]гідразино}карбоніл)бутил]формамід
 МН+ = 404.
 Приклад 343
 N-гідрокси-N-[(2R)-2-({N'-[4-метилпіримідин-2-іл]гідразино}карбоніл)-4-(2-тієніл)бутил]формамід
 МН+ = 350.
 Приклад 344
 N-[(2R)-2-({N'-[4-етил-6-[етил(метил)аміно]-1,3,5-триазин-2-іл]гідразино}карбоніл)-4-(2-тієніл)бутил]-N-гідроксиформамід
 МН+ = 422.
 Приклад 345
 N-гідрокси-N-((2R)-3-оксо-2-(2-тієнілметил)-3-{N'-[4-(трифторметил)піримідин-2-іл]гідразино}пропіл)формамід
 МН+ = 390.
 Приклад 346
 N-гідрокси-N-[(2R)-3-{N'-[4-метилпіримідин-2-іл]гідразино}-3-оксо-2-(2-тієнілметил)пропіл]формамід
 МН+ = 336.
 Приклад 347
 N-[(2R)-3-{N'-[4-етил-6-[етил(метил)аміно]-1,3,5-триазин-2-іл]гідразино}-3-оксо-2-(2-тієнілметил)пропіл]-N-гідроксиформамід
 МН+ = 408.
 Приклад 348
 N-гідрокси-N-[(2R)-2-({N'-[2-метил-6-(піридин-2-іл)піримідин-4-іл]гідразино}карбоніл)гептил]формамід
 МН+ = 387.
 Приклад 349
 N-гідрокси-N-[(2R)-2-({N'-[6-(піридин-2-ілметил)піридазин-3-іл]гідразино}карбоніл)гептил]формамід
 МН+ = 387.
 Приклад 350
 N-гідрокси-N-[(2R)-2-({N'-[2-метил-6-(морфолін-4-іл)піримідин-4-іл]гідразино}карбоніл)гептил]формамід
 МН+ = 395.
 Приклад 351
 N-гідрокси-N-[(2R)-2-({N'-[6-(морфолін-4-іл)-2-(трифторметил)піримідин-4-іл]гідразино}карбоніл)гептил]формамід
 МН+ = 449.
 Приклад 352
 N-гідрокси-N-[(2R)-2-({N'-[4-[метил(піридин-2-іл)аміно]піримідин-2-іл]гідразино}карбоніл)гептил]формамід
 МН+ = 402.
 Приклад 353
 N-гідрокси-N-((2R)-2-(циклопентилметил)-3-{N'-[4-циклопропіл-6-(диметиламіно)-1,3,5-триазин-2-іл]гідразино}-3-оксопропіл)формамід
 МН+ = 392.
 Одержання 19
 Складний трет-бутиловий ефір (1,3-діоксо-1,3-дигідроізоіндол-2-іл)карбамінової кислоти
 До суміші трет-бутилкарбазату (5,15г, 38,97ммоль) і фталевого ангідриду (5,77г, 38,97ммоль) додають SnCl_4 (70мол). Реакційну суміш нагрівають при кипінні зі зворотним холодильником протягом 18 годин. Після видалення розчинника при зниженому тиску одержують 8,20г (80%) зазначеної в заголовку сполуки у виді білої твердої речовини. МН+ 263.
 Одержання 20
 Складний диметилетиловий ефір бензо[1,3]діоксол-5-ілметил(1,3-діоксо-1,3-дигідроізоіндол-2-іл)карбамінової кислоти
 До розчину складного трет-бутилового ефіру (1,3-діоксо-1,3-дигідроізоіндол-2-іл) карбамінової кислоти (0,31г, 1,18ммоль), піперонілового спирту (0,18г, 1,18ммоль) і трифенілфосфіну (0,40г, 1,54ммоль) у ТГФ (12мл) при 0°C по краплях додають діізопропіл азодикарбоксилат (0,30мл, 1,54ммоль). Реакційну суміш перемішують і дають можливість нагрітися до кімнатної температури протягом ночі. Після видалення розчинника при зниженому тиску з наступним очищенням за допомогою ВЭЖХ одержують 0,28г (60%) зазначеної в заголовку сполуки. МН+ 397.

Одержання 21

Складний трет-бутиловий ефір N-бензо[1,3]діоксол-5-ілметилгідразинкарбонової кислоти

До складного диметилетилового ефіру N-бензо[1,3]діоксол-5-ілметил (1,3-диоксо-1, 3-дигідроізоіндол-2-іл) карбамінової кислоти (0,28г, 0,71ммоль) у EtOH (3,6мл) однією порцією при кімнатній температурі додають моногідрат гідрозину (0,14мл, 2,84ммоль). Реакційну суміш, перемішують протягом 21 години. До суміші додають толуол (5мл) і білу тверду фракцію збирають фільтрацією. Фільтрат упарюють у вакуумі. Після витримування в глибокому вакуумі одержують 0,17г (89%) зазначеної в заголовку сполуки. МН+ 267.

Одержання 22

Складний трет-бутиловий ефір N-бензо[1,3]діоксол-4-ілметил-[(бензилоксиформіламіно)метил]гептаноїлгідразинкарбонової кислоти

До суміші складного трет-бутилового ефіру N-бензо[1,3]діоксол-5-ілметилгідразинкарбонової кислоти (168мг, 0,632ммоль), (R)-2-[(бензилоксиформіламіно)метил]гептаноїлгідразинкарбонової кислоти (185мг, 0,632ммоль), 4-диметиламінопіридину (100мг, 0,822ммоль) у метиленхлориді (7мл) при кімнатній температурі додають гідрохлорид 1-(3-диметиламінопропіл)-3-етилкарбодііміду (158мг, 0,822ммоль). Реакційну суміш перемішують протягом 19 годин при кімнатній температурі, а потім обробляють водним 1н. розчином HCl. У результаті відділення органічного шару, сушіння над безводним MgSO₄ і видалення розчинника одержують зазначене в заголовку сполуку. Подальшого очищення не потрібно. МН+ 542.

Одержання 23

N-[(R)-2-(N'-бензо[1,3]діоксол-5-ілметилгідразинокарбоніл)гептил]-N-бензил оксиформамід

До неочищеного складного трет-бутилового ефіру N-бензо[1,3]діоксол-4-ілметил-N'-[(R)-2-[(бензилоксиформіламіно)метил]гептаноїлгідразинкарбонової кислоти, отриманого відповідно до опису в розділі "Одержання 12", при кімнатній температурі додають 5% ТФУ у метилендихлориді (20мл). Отриманий розчин перемішують протягом 6 годин, а потім промивають насиченим водним розчином NaHCO₃ (20мл x 3). Органічний шар відокремлюють і сушать (MgSO₄). У результаті фільтрації і розпарювання одержують зазначену в заголовку сполуку (0,221г, 79%, за дві стадії). Подальшого очищення не потрібно. МН+ 442.

Приклад 354

N-[(R)-2-(N'-бензо[1,3]діоксол-5-ілметилгідразинокарбоніл)гептил]-N-гідроксиформамід

До розчину N-[(R)-2-(N'-бензо[1,3]діоксол-5-ілметилгідразинокарбоніл)гептил]-N-бензилоксиформаміду (0,221г, 0,501ммоль) у EtOH (10мл) додають 10% Pd/C (50мг). Суміш піддають гідрогенізації протягом 5 годин при кімнатній температурі. Отриману суміш фільтрують через целіт. Фільтрат упарюють і очищають за допомогою ВЕЖХ, одержуючи зазначену в заголовку сполуку (0,10г, 57%) у виді білої твердої речовини. МН+ = 352.

Приклад 355

N-[(R)-2-[N'-2,3-дигідро[1,4]діоксина[2,3-b]піридин-7-ілметил]гідразинокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід

МН+ = 366

Приклад 356

N-[(R)-2-[N'-(4-диметиламінобензил)гідразинокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід

МН+ = 351.

Приклад 357

N-гідрокси-N-[(R)-2-[N'-(2-(5,6,7,8-тетрагідро[1,8]нафтиридин-2-іл)етил)гідразинокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід

МН+ = 378.

Приклад 358

N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-хінолін-2-ілметилгідразинокарбоніл)гептил]формамід

МН+ = 359.

Приклад 359

N-гідрокси-N-[(R)-2-[N'-(1,2,3,4-тетрагідрохінолін-2-ілметил)гідразинокарбоніл]гептил]формамід

МН+ = 363.

Приклад 360

N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-хінолін-6-ілметилгідразинокарбоніл)гептил]формамід

МН+ = 359.

Приклад 361

N-[(R)-2-(N'-бензофуран-2-ілметилгідразинокарбоніл)гептил]-N-гідроксиформамід

МН+ = 348.

Приклад 362

N-[(R)-2-(N'-циклопропілметилгідразинокарбоніл)гептил]-N-гідроксиформамід

МН+ = 272.

Приклад 363

N-[(R)-2-[N'-(6-фтор-4Н-бензо[1,3]діоксин-8-ілметил)гідразинокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід

МН+ = 384.

Приклад 364

N-гідрокси-N-[(R)-2-[N'-(4-метоксибензил)гідразинокарбоніл]гептил]формамід

МН+ = 338.

Приклад 365

N-гідрокси-N-[(R)-2-[N'-(2-метоксибензил)гідразинокарбоніл]гептил]формамід

МН+ = 338.

Приклад 366

N-гідрокси-N-[(R)-2-[N'-(тетрагідрофуран-3-ілметил)гідразинокарбоніл]гептил]формамід

МН+ = 302.

Приклад 367

N-[(R)-2-(N'-фуран-3-ілметилгіdraзинокарбоніл)гептил]-N-гідроксиформамід

MH+ = 298.

Приклад 368

N-[(R)-2-[N'-(2,3-дигідробензо[1,4]діоксин-6-ілметил)гіdraзинокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід

MH+ = 366.

Приклад 369

N-[(R)-2-[N'-(2,3-дигідробензо[1,4]діоксин-2-ілметил)гіdraзинокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід

MH+ = 366.

Приклад 370

N-гідрокси-N-[(R)-2-[N'-(2-феноксіетил)гіdraзинокарбоніл]гептил]формамід

MH+ = 338.

Приклад 371

N-[(R)-2-[N'-((S)-дигідроксипропіл)гіdraзинокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід

MH+ = 292.

Приклад 372

N-гідрокси-N-[(R)-2-[N'-(5-метилізоксазол-3-ілметил)гіdraзинокарбоніл]гептил]формамід

MH+ = 313.

Приклад 373

N-[(R)-2-{N'-[1-(1-бензо[1,3]діоксол-5-ілметаноїл)піперидин-4-іл]гіdraзинокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід

MH+ = 449.

Приклад 374

N-[(R)-2-{N'-[1-(1-бензофуран-2-ілметаноїл)піперидин-4-іл]гіdraзинокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід

MH+ = 445.

Приклад 375

N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-{1-[1-(7-метоксибензофуран-2-іл)метаноїл]піперидин-4-іл]гіdraзинокарбоніл]гептил]формамід

MH+ = 475.

Приклад 376

N-[(R)-2-[N'-(1-бензилпіперидин-4-іл)гіdraзинокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід

MH+ = 391.

Приклад 377

N-[(R)-2-(N'-{1-[1-(3,4-дихлорфеніл)метаноїл]піперидин-4-іл]гіdraзинокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід

MH+ = 474.

Приклад 378

N-[(R)-2-(N'-{1-[1-(2,3-дихлорфеніл)метаноїл]піперидин-4-іл]гіdraзинокарбоніл]гептил]-N-гідроксиформамід

MH+ = 474.

Приклад 379

N-гідрокси-N-[(R)-2-(N'-{1-[1-(4-метилпіперазин-1-іл)метаноїл]пентил]гіdraзинокарбоніл]гептил]формамід

MH+ = 414.

Одержання 24

N-[(R)-2-(гіdraзинокарбоніл)гептил]-N-гідроксиформамід

До розчину складного бензилового ефіру N'-[(R)-2-[(бензилоксиформіламіно)метил]гептаноїл]гіdraзинкарбонової кислоти (1ммоль) у EtOH (10мл) додають 10% Pd/C (50мг). Суміш піддають гідрогенізації протягом 5 годин при кімнатній температурі, а потім фільтрують через целіт. Фільтрат упарюють і очищають за допомогою ВЕЖХ, одержуючи N-[(R)-2-(гіdraзинокарбоніл)гептил]-N-гідроксиформамід у виді скла. MH+ 218.

Приклад 380

N-[(R)-2-(N'-бензилгіdraзинокарбоніл)гептил]-N-гідроксиформамід

N-[(R)-2-(гіdraзинокарбоніл)гептил]-N-гідроксиформамід (50мг, 0,23ммоль) і бензальдегід (24мг, 0,23ммоль) розчиняють у метанолі (2мл) в атмосфері аргону в присутності 4А молекулярних сит (50мг), перемішують протягом 1 години і прохолоджують до 0°C. До суміші додають один кристал метилового жовтогогарячого індикатора і достатню кількість метанольного HCl для підтримки кислотності розчину (червоний колір). Додають ціаноборгідрид натрію (17мг, 0,28ммоль) разом з достатньою кількістю метанольного HCl для підтримки кислотності розчину (червоний індикатор). Систему нагрівають до кімнатної температури, перемішують протягом двох днів, нейтралізують розчином бікарбонату натрію й екстрагують етилацетатом (3х). Органічний шар сушать над безводним сульфатом натрію, концентрують досуха й очищають за допомогою препаративної ВЕЖХ, одержуючи зазначену в заголовку сполуку. MH+ 308.

Композиції, способи введення і біологічні проби

Сполуки формули (1) і їх фармацевтично прийнятні солі можуть бути введені звичайним для антибіотиків способом, наприклад, перорально, парентерально, сублінгвально, дермально, трансдермально, ректально, шляхом інгаляції або трансбукально.

Композиції формули (1) і їх фармацевтично прийнятні солі, що активні при пероральному введенні, можуть бути приготовані у виді сиропів, таблеток, капсул, кремів і коржів. Сироп зазвичай являє собою суспензію або розчин сполуки або її солі в рідкому носії, наприклад, етанолі, арахісовій олії, маслиновій олії, гліцерині або воді, зі смаковим або барвним агентом. Якщо композиція має вигляд таблетки, може бути використаний будь-який фармацевтичний носій, зазвичай використовуваний для одержання твердих композицій. Приклади таких носіїв включають стеарат магнію, сульфат кальцію, тальк, желатину, акацію, стеаринову кислоту, крохмаль, лактозу і сахарозу. Якщо композиція має вид капсули, може бути використаний

будь-який звичайний спосіб капсулювання, наприклад, вищезгадані носії можуть бути введені в капсулу з твердою желатиною оболонкою. При введенні композиції в капсулу з м'якою желатиною оболонкою, може бути використаний будь-який фармацевтичний носій, зазвичай застосовуваний для одержання дисперсій або суспензій, наприклад, водні смоли, целюлози, силікати або олії, що вміщують в капсулу з м'якою желатиною оболонкою.

Типові композиції для парентерального введення являють собою розчин або суспензію сполуки або солі в стерильному водному або безводному носії, що необов'язково містить парентерально прийнятну олію, наприклад, поліетиленгліколь, полівінілпіролідон, лецитин, арахісова олія або кунжутна олія.

Типові композиції для інгаляції являють собою розчин, суспензію або емульсію, що може бути введена у виді сухого порошку або аерозолі з застосуванням звичайного газу-витискувача, такого як дихлордифторметан або трихлорфторметан.

Типова композиція супозиторію включає сполуку формули (1) або його фармацевтично прийнятну сіль, що зберігає активність при введенні таким способом, зі сполучним агентом і/або лубрікантом, наприклад, полімерними гліколями, желатинами, олією какао або іншими низькоплавкими рослинними вісками або жирами, або їх синтетичними аналогами.

Типові дермальні та трансдермальні композиції включають загальноприйнятий водний або безводний наповнювач, наприклад, крем, мазь, лосьон або пасту, або мають вигляд лікувального пластиру, накладки чи мембрани.

Композиція переважно представлена у виді одиничної дозованої форми, наприклад, таблетки, капсули або відміряної аерозольної дози, таким чином, щоб пацієнтові могла бути введена разова доза.

Кожна дозована одиниця для перорального введення містить, відповідно, від 0,1 до 500мг/кг, переважно - від 1 до 100мг/кг, а кожна дозована одиниця для парентерального введення містить, відповідно, від 0,1 до 100мг/кг сполуки формули (1) або її фармацевтично прийнятної солі в розрахунку на вільну кислоту. Кожна дозована одиниця для назального введення містить, відповідно, 1-400мг, переважно - від 10 до 200мг на пацієнта. Композиція для місцевого застосування містить, відповідно, від 0,01 до 5,0% сполуки формули (1).

Добова схема прийому при пероральному введенні складає, відповідно, приблизно від 0,01 до 40мг/кг сполуки формули (1) або її фармацевтично прийнятної солі, в розрахунку на вільну кислоту. Добова схема прийому при парентеральному введенні складає, відповідно, приблизно від 0,001 до 40мг/кг сполуки формули (1) або її фармацевтично прийнятної солі в розрахунку на вільну кислоту. Добова схема прийому при назальному введенні і пероральній інгаляції складає, відповідно, приблизно від 10 до 500мг на пацієнта. Активний інгредієнт може вводитися від 1 до 6 раз у добу, що цілком забезпечує бажану активність.

При введенні сполук відповідно до даного винаходу згідно із даним винаходом не очікується ніякої неприйнятної токсикологічної дії.

Біологічна активність сполук формули (1) підтверджується наступними тестами:

Біологічний аналіз

Активність ПДФ *S. aureus* або *E. coli* вимірюють при 25°C за допомогою безперервного аналізу з ферментною міткою, розробленою Lazennec & Meinell ["Formate dehydrogenase-coupled spectrophotometric assay of peptide deformylase", Anal. Biochem. 1997, 244, pp. 180-182], з невеликими змінами. 50мкл реакційної суміші містять 50мМ фосфатно-калієвого буфера (рН 7,6), 15мМ NAD, 0,25Ег форміату дегідрогенази. Пептид субстрату, f-Met-Ala-Ser, утримується в концентрації К_m. Реакцію починають, додаючи 10нМ ферменту Defl, при цьому поглинання контролюють протягом 20 хвилин при 340нм.

Аналіз на антимікробну активність

Антимікробну активність у відношенні всіх кліток визначають шляхом мікророзведення бульйону відповідно до методики, рекомендованої Національним комітетом клінічних лабораторних стандартів (National Committee for Clinical Laboratory Standards, NCCLS), документ M7-A4, "Methods for Dilution Susceptibility Tests for Bacteria that Grow Aerobically" (приведений тут як посилання). Сполуку піддають аналізу після серійних двократних розведень від 0,06 до 64мкг/мл. Для аналізу використовують планшет з 12 штатами. Такий планшет має наступні лабораторні штами: *Staphylococcus aureus* Oxford, *Staphylococcus aureus* WCUIH29, *Enterococcus faecalis* I, *Enterococcus faecalis* 7, *Haemophilus influenzae* QI, *Haemophilus influenzae* NEMC1, *Moraxella catarrhalis* 1502, *Streptococcus pneumoniae* 1629, *Streptococcus pneumoniae* N1387, *Streptococcus pneumoniae* N1387, *E. coli* 7623 (AcrABEFD+) і *E. coli* 120 (AcrAB-). Мінімальну інгібуючу концентрацію (MIC) визначають як найнижчу концентрацію сполуки, яка інгібує видимий ріст. Для визначення кінцевої крапки MIC використовують дзеркальний апарат для читання планшетів.

Усі публікації, включаючи, але не обмежуючи ними, патенти і патентні заявки, процитовані в даному описі, приведені тут за допомогою посилання таким чином, як яби кожна окрема публікація була конкретно й окремо приведена тут за допомогою посилання в повному обсязі.

Вищевикладений опис цілком розкриває даний винахід, включаючи кращі варіанти його здійснення. Модифікації і поліпшення конкретно описаних тут варіантів входять в обсяг прикладеної формули винаходу. Без подальших пояснень автори думають, що фахівець у даній області техніки зможе за допомогою вищевикладеного опису здійснити даний винахід у найбільш повному його обсязі. Тому приведені тут приклади повинні розглядатися тільки як ілюстративні і ніяким чином не обмежують обсяг даного винаходу. Варіанти здійснення даного винаходу, у яких заявлені його відмінні риси і переваги, визначені далі.