



УКРАЇНА

(19) **UA** (11) **76982** (13) **C2**(51) **МПК****A61K 31/522** (2006.01)**A61K 31/55** (2006.01)**A61K 31/551** (2006.01)**A61P 3/04** (2006.01)**A61P 3/10** (2006.01)**A61P 5/00** (2006.01)**A61P 19/02** (2006.01)**A61P 19/10** (2006.01)**A61P 37/02** (2006.01)**C07D 473/04** (2006.01)**C07D 473/06** (2006.01)**C07D 473/08** (2006.01)**C07D 473/10** (2006.01)**C07D 473/12** (2006.01)МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ  
І НАУКИ УКРАЇНИДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ  
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ  
ВЛАСНОСТІ

## ОПИС

### ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД

**(54) ПОХІДНІ КСАНТИНУ, ФАРМАЦЕВТИЧНА КОМПОЗИЦІЯ, ЩО ІНГІБУЄ АКТИВНІСТЬ ЕНЗИМУ ДПП-IV**

1

2

**(21)** 2003098680**(22)** 21.02.2002**(24)** 16.10.2006**(86)** PCT/EP02/01820, 21.02.2002**(31)** 101 09 021.8**(32)** 24.02.2001**(33)** DE**(31)** 101 17 803.4**(32)** 10.04.2001**(33)** DE**(31)** 101 40 345.3**(32)** 17.08.2001**(33)** DE**(31)** 102 03 486.9**(32)** 30.01.2002**(33)** DE**(46)** 16.10.2006, Бюл. № 10, 2006 р.**(72)** Хіммельсбах Франк, DE, Марк Міхаель, DE, Еккхардт Маттіас, DE, Лангкопф Ельке, DE, Маіер Роланд, DE, Лотц Ральф, DE**(73)** БЬОРИНГЕР ІНГЕЛЬХАЙМ ФАРМА ГМБХ & КО. КГ, DE**(56)** UA 42554, 15.10.2001

UA 2002064822, 16.09.2002

US 5525607, 11.06.1996

EP 0501379, 02.09.1992

EP 0415456, 06.03.1991

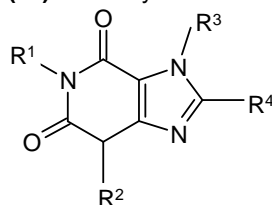
RU 2138500, 27.09.1999

JP 05-245492, 24.09.1993

EP 0215736, 25.03.1987

SI/EP 1104422, 30.06.2004

SU 1245261, 15.07.1986

**(57)** 1. Сполуки загальної формули

(I),

де

R<sup>1</sup> є водень, C<sub>1-4</sub>-алкіл, C<sub>3-5</sub>-алкеніл, 2-пропен-1-іл, заміщений метоксикарбонілом, C<sub>3-5</sub>-алкініл, феніл-C<sub>1-4</sub>-алкіл, заміщений в фенільному кільці одним або двома атомами фтору, одним або двома атомами хлору, бромом, однією - трьома метильними групами, бутилом, трифторметилом, гідроксилом, метокси, нітро, аміно, карбоксилом або етоксикарбонілом, 2-фенілетил, заміщений в етильному радикалі в положенні 2 гідроксилом, метокси або гідроксііміногрупою, фенілкарбонілметил, незаміщений або заміщений в фенільному кільці фтором або метил-, амінокарбоніл-, аміносульфонілом, ціано-, гідрокси-, метокси-, фенокси-, бензилокси-, 2-пропен-1-ілокси-, 2-пропін-1-ілокси-, ціанометокси-, (метоксикарбоніл)метокси-, (амінокарбоніл)метокси-, (метиламінокарбоніл)метокси-, (диметиламінокарбоніл)метокси-, метилсульфонілокси-, фенілсульфонілокси-, нітро-, аміно-, (метоксикарбоніл)метиламіно-, ацетиламіно-, метоксикарбоніламіно-, метилсульфоніламіно-

**(13) C2****(11) 76982****(19) UA**

но-, біс(метилсульфоніл)аміно-, амінокарбоніламіно-, диметиламінокарбоніламіно-, (метиламіно)тіокарбоніламіно-, (етоксикарбоніламіно)карбоніламіно- або ціанметиламіногрупою, фенілкарбонілметил, заміщений в фенільному кільці двома метоксигрупами або бромом, або диметиламіногрупою, 2-(фенілкарбоніл)етил, 2-фенілетеніл, 2-(феноксі)етил, фенілсульфанілметил- або фенілсульфінілметил, нафтилметил або нафтилетил, ізоксазолілметил, тіазолілметил, піридилметил, бензо[d]ізоксазолілметил, бензо[d]ізотіазолілметил, (1H-індазол-3-іл)метил, хінолінілметил або ізохінолінілметил, причому гетероцикл у кожному випадку може бути заміщений метилом, ізохінолінілметил, заміщений в ізохіноліновому радикалі нітро- або аміногрупою, (1,2-дигідро-2-оксохінолін-4-іл)метил, хромен-4-он-3-іл, піролілетил, триазолілетил, тієнілетил, тіазолілетил або піридилетил, причому гетероцикл у кожному випадку може бути заміщений метилом, тієнілкарбонілметил, метил, заміщений циклопропілом, ціано, карбоксиллом, амінокарбонілом або метоксикарбонілом, етил, заміщений в положенні 2 гідроксильом, метокси, диметиламіно, карбоксильом або метоксикарбонілом, пропіл, заміщений в положенні 3 гідроксильом, метокси, диметиламіно, карбоксильом або метоксикарбонілом, 2-оксопропіл, аміно- або бензоїламіногрупа, R<sup>2</sup> є водень, C<sub>1-6</sub>-алкіл, етеніл, 2-пропен-1-іл або 2-пропін-1-іл, феніл, феніл-C<sub>1-4</sub>-алкіл, причому фенільне кільце може бути заміщене фтором, метилом або метоксигрупою, фенілкарбонілметил, 2-фенілетеніл, метил, заміщений циклопропілом, ціано, карбоксильом або метоксикарбонілом, або етил, заміщений по 2 положенню ціано, гідроксильом, метокси- або диметиламіногрупою, R<sup>3</sup> є C<sub>4-6</sub>-алкеніл, 1-циклопентен-1-ілметил або 1-циклогексен-1-ілметил, 2-пропін-1-іл, 2-бутин-1-іл або 2-пентин-1-іл, феніл, незаміщений або заміщений фтором або ціано, метилом або трифторметилом, феніл, заміщений двома метильними групами, бензил, який може бути заміщений у фенільному кільці одним або двома атомами фтору, йодом або ціано, нітро- або аміногрупою, фуранілметил або тієнілметил, циклопропілметил, R<sup>4</sup> є азетидин-1-іл, заміщений амінометилом, піролідін-1-іл, заміщений амінометилом, піперидин-1-іл, заміщений в положенні 3 або в положенні 4 аміно-, метиламіно-, диметиламіно- або [(2-ціанопіролідін-1-іл)карбонілметил]аміногрупою, причому піперидин-1-іл може бути додатково заміщений метилом або етилом, 3-амінопіперидин-1-іл, в якому піперидин-1-іл-група в положенні 4 додатково заміщена гідроксильом, 3-амінопіперидин-1-іл, в якому атом водню в положенні 2 разом з атомом водню в положенні 5 замінений на CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-місток, піперидин-1-іл, заміщений амінометилом, піперидин-3-іл, гексагідроазепін-1-іл, заміщений в положенні 3 аміногрупою, [1,4]діазепан-1-іл, заміщений в положенні 6 аміногрупою, 3-амінопропіл-група, циклогексил, заміщений аміногрупою, 2-аміно-циклопентиламіно- або 3-аміно-циклопентиламіногрупа, 2-аміноциклогексиламіно-, 2-(метиламіно)-циклогексиламіно- або 3-аміноциклогексиламіно-група, N-(2-аміноциклогексил)метиламіногрупа, аміногрупа,

заміщена радикалами R<sup>15</sup> або R<sup>16</sup>, де R<sup>15</sup> є метил або етил, а R<sup>16</sup> є 2-аміноетил, причому етильний радикал незаміщений або заміщений однією або двома метильними групами або амінокарбонілом, метиламінокарбонілом, диметиламінокарбонілом або піролідін-1-ілкарбонілом, аміно- або метиламіногрупа, в якій атом азоту заміщений піролідін-3-ілом або піперидин-3-ілом, причому, якщо не вказано окремо, згадані вище алкільні й алкенільні групи можуть бути лінійними або розгалуженими, їх таутомери, енантіомери, діастереомери, їх суміші і їх солі.

2. Сполуки загальної формули (I) за п. 1, де R<sup>1</sup> є водень, C<sub>1-4</sub>-алкіл, C<sub>3-5</sub>-алкеніл, 2-пропен-1-іл, заміщений метоксикарбонілом, C<sub>3-5</sub>-алкініл, феніл-C<sub>1-4</sub>-алкіл, де фенільне кільце може бути заміщеним одним або двома атомами фтору, одним або двома атомами хлору, бромом, однією - трьома метильними групами, трифторметилом, гідроксильом, метокси, нітро, аміно, карбоксильом або етоксикарбонілом, 2-фенілетил, де етильний радикал в положенні 2 заміщений гідроксильом, метокси або гідроксіаміногрупою, фенілкарбонілметил, де фенільне кільце може бути заміщеним фтором або метилом, амінокарбонілом, аміносультфонілом, ціано, гідрокси-, метокси-, фенокси-, бензилокс-, 2-пропен-1-ілокси-, 2-пропін-1-ілокси-, ціанометокси-, (метоксикарбоніл)метокси-, (амінокарбоніл)метокси-, (метиламінокарбоніл)метокси-, (диметиламінокарбоніл)метокси-, метилсульфонілокси-, фенілсульфонілокси-, нітро-, аміно-, (метоксикарбоніл)метиламіно-, ацетиламіно-, метоксикарбоніламіно-, метилсульфоніламіно-, біс(метилсульфоніл)аміно-, амінокарбоніламіно-, диметиламінокарбоніламіно-, (метиламіно)тіокарбоніламіно-, (етоксикарбоніламіно)карбоніламіно- або ціанометиламіногрупою, фенілкарбонілметил, де фенільне кільце заміщено двома метоксигрупами або бромом, або диметиламіногрупою, 2-(фенілкарбоніл)етил, 2-фенілетеніл, 2-(феноксі)етил, фенілсульфанілметил або фенілсульфінілметил, нафтилметил або нафтилетил, ізоксазолілметил-, тіазолілметил-, піридилметил-, бензо[d]ізоксазолілметил-, бензо[d]ізотіазолілметил-, (1H-індазол-3-іл)метил-, хінолінілметил- або ізохінолінілметилгрупа, причому гетероцикл у кожному випадку може бути заміщений метильною групою, ізохінолінілметил, в якому ізохінолінільна група заміщена нітро- або аміногрупою, (1,2-дигідро-2-оксохінолін-4-іл)метил, піролілетил, триазолілетил, тієнілетил, тіазолілетил або піридилетил, причому гетероцикл у кожному випадку може бути заміщений метильною групою, тієнілкарбонілметил, метил, заміщений циклопропілом, ціано, карбоксильом, амінокарбонілом або метоксикарбонілом, етил, заміщений в положенні 2 гідроксильом, метокси, диметиламіно, карбоксильом або метоксикарбонілом, пропіл, заміщений в положенні 3 гідроксильом, диметиламіно, карбоксильом або метоксикарбонілом, 2-оксопропіл, аміно або бензоїламіно, R<sup>2</sup> є водень, C<sub>1-6</sub>-алкіл, етеніл, 2-пропен-1-іл або 2-пропін-1-іл, феніл, феніл-C<sub>1-4</sub>-алкіл, причому фенільне кільце може бути заміщене фтором, метилом або метоксигрупою, фенілкарбонілметил, 2-

фенілетеніл, метил, заміщений циклопропілом, ціано, карбоксиллом або метоксикарбонілом, етил, заміщений в положенні 2 ціано, гідроксиллом, метокси або диметиламіногрупою,

$R^3$  є  $C_{4-6}$ -алкеніл, 1-циклопентен-1-ілметил або 1-циклогексен-1-ілметил, 2-пропін-1-іл-, 2-бутін-1-іл або 2-пентін-1-іл, феніл, незаміщений або заміщений фтором або ціано-, метилом або трифторметилом, феніл, заміщений двома метильними групами, бензил, в якому фенільне кільце незаміщене або заміщене одним або двома атомами фтору, йодом або ціано-, нітро- або аміногрупою, фуранілметил, тіснїлметил або циклопропілметил,  $R^4$  є піперидин-1-іл, заміщений в положенні 3 аміногрупою, причому піперидин-1-їл група може бути додатково заміщена метилом, 3-амінопіперидин-1-їл, в якому піперидин-1-їл група в положенні 4 додатково заміщена гідроксиллом, 3-амінопіперидин-1-їл, в якому атом водню в положенні 2 разом з атомом водню в положенні 5 замінені на  $CH_2-CH_2$ -місток, гексагідроазепін-1-їл, заміщений в положенні 3 аміногрупою, [1,4]діазепан-1-їл, заміщений в положенні 6 аміногрупою, циклогексил, заміщений в положенні 3 аміногрупою, 2-аміноциклогексиламіно або аміногрупа, заміщена радикалами  $R^{15}$  і  $R^{16}$ , де  $R^{15}$  означає метил або етил, а  $R^{16}$  означає 2-аміноетил, причому етильний радикал незаміщений або заміщений однією або двома метильними групами або амінокарбонілом, метиламінокарбонілом, диметиламінокарбонілом або піролідін-1-їлкарбонілом, причому, якщо не вказано окремо, згадані вище алкільні й алкенільні групи можуть бути лінійними або розгалуженими, їх таутомери, енантіомери, діастереомери, їх суміші і їх солі.

3. Сполуки за п. 2, де

$R^1$ ,  $R^2$  і  $R^3$  мають значення, вказані в п. 2,

$R^4$  є означає піперидин-1-їл, який в положенні 3 заміщений аміногрупою, причому піперидин-1-їл може бути додатково заміщений метилом, 3-амінопіперидин-1-їл, в якому піперидин-1-їл додатково заміщений в положенні 4 гідроксиллом, 3-амінопіперидин-1-їл, в якому атом водню в положенні 2 разом з атомом водню в положенні 5 замінені на  $CH_2-CH_2$ -місток, циклогексил, заміщений в положенні 3 аміногрупою, 2-аміноциклогексиламіно, аміногрупу, заміщену радикалами  $R^{15}$  і  $R^{16}$ , де  $R^{15}$  означає метил або етил, а  $R^{16}$  означає 2-аміноетил, причому етильний радикал може бути заміщений однією або двома метильними групами або амінокарбонілом, метиламінокарбонілом, диметиламінокарбонілом або піролідін-1-їлкарбонілом, причому, якщо не вказано окремо, згадані вище алкільні й алкенільні групи можуть бути лінійними або розгалуженими, їх таутомери, енантіомери, діастереомери, їх суміші і їх солі.

4. Сполуки загальної формули (I) за п. 1, якими є:

- (1) 1,3-диметил-7-бензил-8-(3-амінопіперидин-1-їл)ксантин,
- (2) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-їл)-8-[(транс-2-аміноциклогексил)аміно]ксантин,
- (3) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-їл)-8-(3-амінопіперидин-1-їл)ксантин,

(4) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-їл)-8-[цис-2-аміноциклогексил)аміно]ксантин,

(5) 1,3-диметил-7-(2-бутін-1-їл)-8-(3-амінопіперидин-1-їл)ксантин,

(6) 1,3-диметил-7-[(1-циклопентен-1-їл)метил]-8-(3-амінопіперидин-1-їл)ксантин,

(7) 1,3-диметил-7-(2-тіснїлметил)-8-(3-амінопіперидин-1-їл)ксантин,

(8) 1,3-диметил-7-(3-фторбензил)-8-(3-амінопіперидин-1-їл)ксантин,

(9) 1,3-диметил-7-(2-фторбензил)-8-(3-амінопіперидин-1-їл)ксантин,

(10) 1,3-диметил-7-(4-фторбензил)-8-(3-амінопіперидин-1-їл)ксантин,

(11) 1,3-диметил-7-(2-бутен-1-їл)-8-(3-амінопіперидин-1-їл)ксантин,

(12) 1,3-біс(циклопропілметил)-7-бензил-8-(3-амінопіперидин-1-їл)ксантин,

(13) (R)-1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-їл)-8-(3-амінопіперидин-1-їл)ксантин,

(14) (S)-1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-їл)-8-(3-амінопіперидин-1-їл)ксантин,

(15) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-їл)-8-(3-аміногексагідроазепін-1-їл)ксантин,

(16) гідрохлорид 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-їл)-8-(цис-3-аміноциклогексил)ксантину,

(17) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-їл)-8-(3-метиламінопіперидин-1-їл)ксантин,

(18) 1-(2-фенілетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-їл)-8-(3-амінопіперидин-1-їл)ксантин,

(19) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-їл)-8-[N-(2-аміноетил)метиламіно]ксантин,

(20) 1-[2-(тіофен-2-їл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-їл)-8-(3-амінопіперидин-1-їл)ксантин,

(21) 1-[2-(тіофен-3-їл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-їл)-8-(3-амінопіперидин-1-їл)ксантин,

(22) 1-[2-(2-метилфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-їл)-8-(3-амінопіперидин-1-їл)ксантин,

(23) 1-[2-(3-метилфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-їл)-8-(3-амінопіперидин-1-їл)ксантин,

(24) 1-[2-(3-метоксифеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-їл)-8-(3-амінопіперидин-1-їл)ксантин,

(25) 1-((E)-2-фенілвініл)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-їл)-8-(3-амінопіперидин-1-їл)ксантин,

(26) 1-(2-фенілетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-їл)-8-((S)-3-амінопіперидин-1-їл)ксантин,

(27) 1-(2-фенілетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-їл)-8-((R)-3-амінопіперидин-1-їл)ксантин,

(28) 1-[2-(2-метоксифеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-їл)-8-(3-амінопіперидин-1-їл)ксантин,

(29) 1-[2-(тіофен-3-їл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-їл)-8-(3-амінопіперидин-1-їл)ксантин,

(30) 1-(2-феніл-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-їл)-8-((S)-3-амінопіперидин-1-їл)ксантин,

(31) 1-(2-феніл-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-їл)-8-((R)-3-амінопіперидин-1-їл)ксантин,

(32) 1-[(ізохінолін-1-їл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-їл)-8-((R)-3-амінопіперидин-1-їл)ксантин,

(33) 1-[(ізохінолін-1-їл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-їл)-8-((S)-3-амінопіперидин-1-їл)ксантин,

(34) 1-[(1-нафтил)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-їл)-8-(3-амінопіперидин-1-їл)ксантин,

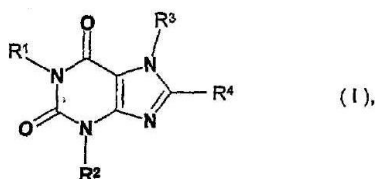
а також їх солі.

5. Фізіологічно переносимі солі сполук формули (I) за одним з пп. 1-4 з неорганічними або органічними кислотами.

6. Фармацевтична композиція, що інгібує активність ензиму ДПП-IV, яка містить сполуку за одним

з пп. 1-4 або фізіологічно переносиму сіль за п. 5, за необхідності, з одним або декількома інертними носіями і/або розріджувачами.

Об'єктом даного винаходу є заміщені ксантини загальної формули



їх таутомери, стереоізомери, їх суміші та солі, зокрема їх фізіологічно сприйнятні солі з неорганічними або органічними кислотами або основами, які проявляють цінні фармакологічні властивості, зокрема інгібуючий вплив на активність ензиму дипептидилпептидаза-IV (DPP-IV), їх одержання, їх використання для запобігання або лікування хвороб або станів, які пов'язані із підвищеною DPP-IV активністю та які можна попередити або пом'якшити внаслідок зменшення DPP-IV активності, зокрема цукрового діабету типу I або II, медикаменти, які містять сполуку загальної формули (I) або їх фізіологічно сприйнятну соль, а також спосіб їх одержання.

У зазначеній вище формулі I

$R^1$  означає атом водню,

$C_{1-8}$ -алкільну групу,  $C_{3-8}$ -алкенільну групу,

$C_{3-4}$ -алкенільну групу, заміщену  $C_{1-2}$ -алкілоксикарбонільною, амінокарбонільною,  $C_{1-3}$ -алкіламінокарбонільною, ді( $C_{1-3}$ -алкіл)амінокарбонільною, піролідин-1-ілкарбонільною, піперидин-1-ілкарбонільною або морфолін-4-ілкарбонільною групою,

$C_{3-8}$ -алкінільну групу,

$C_{1-6}$ -алкільну групу, заміщену групою  $R_a$ , причому

$R_a$  означає  $C_{3-7}$ -циклоалкільну, гетероарильну, ціано-, карбоксильну,  $C_{1-3}$ -алкілоксикарбонільну, амінокарбонільну,  $C_{1-3}$ -алкіламінокарбонільну, ді( $C_{1-3}$ -алкіл)амінокарбонільну, піролідин-1-ілкарбонільну, піперидин-1-ілкарбонільну, морфолін-4-ілкарбонільну, піперазин-1-ілкарбонільну, 4-метилпіперазин-1-ілкарбонільну або 4-етилпіперазин-1-ілкарбонільну групу,

$C_{1-6}$ -алкільну групу, заміщену фенольною групою, причому фенольне кільце заміщене групами  $R^{10}$ - $R^{14}$ , а

$R^{10}$  означає атом водню,

атом фтору, хлору, бромово або йоду,

$C_{1-4}$ -алкільну, гідроксильну або  $C_{1-4}$ -алкілоксигрупу,

нітро-, аміно-,  $C_{1-3}$ -алкіламіно-, ді( $C_{1-3}$ -алкіл)аміно-, ціан- $C_{1-3}$ -алкіламіно-, [N-(ціан- $C_{1-3}$ -алкіл)-N- $C_{1-3}$ -алкіламіно]-,  $C_{1-3}$ -алкілоксикарбоніл- $C_{1-3}$ -алкіламіно-, піролідин-1-ільну, піперидин-1-

ільну, морфолін-4-ільну, піперазин-1-ільну або 4-( $C_{1-3}$ -алкіл)піперазин-1-ільну групу,

$C_{1-3}$ -алкілкарбоніламіно-, арилкарбоніламіно-, арил- $C_{1-3}$ -алкілкарбоніламіно-,  $C_{1-3}$ -алкілоксикарбоніламіно-, амінокарбоніламіно-,  $C_{1-3}$ -алкіламінокарбоніламіно-, ді( $C_{1-3}$ -алкіл)амінокарбоніламіно-, піролідин-1-ілкарбоніламіно-, піперидин-1-ілкарбоніламіно-, морфолін-4-ілкарбоніламіно-, піперазин-1-ілкарбоніламіно- або 4-( $C_{1-3}$ -алкіл)піперазин-1-ілкарбоніламіно-,  $C_{1-3}$ -алкілсульфоніламіно-, біс-( $C_{1-3}$ -алкілсульфоніл)аміно-, аміносульфоніламіно-,  $C_{1-3}$ -алкіламіносульфоніламіно-, ді( $C_{1-3}$ -алкіл)аміносульфоніламіно-, піролідин-1-ілсульфоніламіно-, піперидин-1-ілсульфоніламіно-, морфолін-4-ілсульфоніламіно-, піперазин-1-ілсульфоніламіно- або 4-( $C_{1-3}$ -алкіл)піперазин-1-ілсульфоніламіно-,  $C_{1-3}$ -алкіламінотіокарбоніламіно-,  $C_{1-3}$ -алкілоксикарбоніламінокарбоніламіно-, арилсульфоніламіно- або арил- $C_{1-3}$ -алкілсульфоніламіногрупу,

N-( $C_{1-3}$ -алкіл)- $C_{1-3}$ -алкілкарбоніламіно-, N-( $C_{1-3}$ -алкіл)арилкарбоніламіно-, N-( $C_{1-3}$ -алкіл)арил- $C_{1-3}$ -алкілкарбоніламіно-, N-( $C_{1-3}$ -алкіл)- $C_{1-3}$ -алкілоксикарбоніламіно-, N-(амінокарбоніл)- $C_{1-3}$ -алкіламіно-, N-( $C_{1-3}$ -алкіламінокарбоніл)- $C_{1-3}$ -алкіламіно-, N-[ді( $C_{1-3}$ -алкіл)амінокарбоніл]- $C_{1-3}$ -алкіламіно-, N-( $C_{1-3}$ -алкіл)- $C_{1-3}$ -алкілсульфоніламіно-, N-( $C_{1-3}$ -алкіл)-арилсульфоніламіно- або N-( $C_{1-3}$ -алкіл)-арил- $C_{1-3}$ -алкілсульфоніламіногрупу,

2-оксоімідазолідин-1-ільну, 2,4-діоксоімідазолідин-1-ільну, 2,5-діоксоімідазолідин-1-ільну або 2-оксогексагідропіримідин-1-ільну групу, в якій атом азоту може в положенні 3 бути заміщений відповідно метильною або етильною групою,

ціано-, карбоксильну,  $C_{1-3}$ -алкілоксикарбонільну, амінокарбонільну,  $C_{1-3}$ -алкіламінокарбонільну, ді( $C_{1-3}$ -алкіл)амінокарбонільну, піролідин-1-ілкарбонільну, піперидин-1-ілкарбонільну, морфолін-4-ілкарбонільну, піперазин-1-ілкарбонільну або 4-( $C_{1-3}$ -алкіл)піперазин-1-ілкарбонільну групу,

$C_{1-3}$ -алкілкарбонільну або арилкарбонільну групу,

карбокси- $C_{1-3}$ -алкільну,  $C_{1-3}$ -алкілоксикарбоніл- $C_{1-3}$ -алкільну, ціан- $C_{1-3}$ -алкільну, амінокарбоніл- $C_{1-3}$ -алкільну,  $C_{1-3}$ -алкіламінокарбоніл- $C_{1-3}$ -алкільну, ді-( $C_{1-3}$ -алкіл)амінокарбоніл- $C_{1-3}$ -алкільну, піролідин-1-ілкарбоніл- $C_{1-3}$ -алкільну, піперидин-1-ілкарбоніл- $C_{1-3}$ -алкільну, морфолін-4-ілкарбоніл- $C_{1-3}$ -алкільну, піперазин-1-ілкарбоніл- $C_{1-3}$ -алкільну або 4-( $C_{1-3}$ -алкіл)піперазин-1-ілкарбоніл- $C_{1-3}$ -алкільну групу,

карбокси- $C_{1-3}$ -алкілокси-,  $C_{1-3}$ -алкілоксикарбоніл- $C_{1-3}$ -алкілокси-,  $C_{1-3}$ -алкілокси-, амінокарбоніл- $C_{1-3}$ -алкілокси-,  $C_{1-3}$ -алкіламінокарбоніл- $C_{1-3}$ -алкілокси-, ді( $C_{1-3}$ -алкіл)амінокарбоніл- $C_{1-3}$ -алкілокси-, піролідин-1-ілкарбоніл- $C_{1-3}$ -алкілокси-, піперидин-1-ілкарбоніл- $C_{1-3}$ -алкілокси-, морфолін-4-ілкарбоніл- $C_{1-3}$ -алкілокси-, піперазин-1-ілкарбоніл- $C_{1-3}$ -алкілокси- або 4-( $C_{1-3}$ -алкіл)-піперазин-1-ілкарбоніл- $C_{1-3}$ -алкілоксигрупу,

гідрокси- $C_{1-3}$ -алкільну,  $C_{1-3}$ -алкілокси- $C_{1-3}$ -алкільну, аміно- $C_{1-3}$ -алкільну,  $C_{1-3}$ -алкіламіно- $C_{1-3}$ -алкільну, ді( $C_{1-3}$ -алкіл)аміно- $C_{1-3}$ -алкільну, піролідин-1-іл- $C_{1-3}$ -алкільну, піперидин-1-іл- $C_{1-3}$ -алкільну, морфолін-4-іл- $C_{1-3}$ -алкільну, піперазин-1-іл- $C_{1-3}$ -алкільну, 4-( $C_{1-3}$ -алкіл)піперазин-1-іл- $C_{1-3}$ -алкільну групу,

гідрокси- $C_{1-3}$ -алкілокси-,  $C_{1-3}$ -алкілокси- $C_{1-3}$ -алкілокси-,  $C_{1-3}$ -алкілсульфаніл- $C_{1-3}$ -алкілокси-,  $C_{1-3}$ -алкілсульфініл- $C_{1-3}$ -алкілокси-,  $C_{1-3}$ -алкілсульфоніл- $C_{1-3}$ -алкілокси-, аміно- $C_{1-3}$ -алкілокси-,  $C_{1-3}$ -алкіламіно- $C_{1-3}$ -алкілокси-, ді( $C_{1-3}$ -алкіл)аміно- $C_{1-3}$ -алкілокси-, піролідин-1-іл- $C_{1-3}$ -алкілокси-, піперидин-1-іл- $C_{1-3}$ -алкілокси-, морфолін-4-іл- $C_{1-3}$ -алкілокси-, піперазин-1-іл- $C_{1-3}$ -алкілокси-, 4-( $C_{1-3}$ -алкіл)-піперазин-1-іл- $C_{1-3}$ -алкілоксигрупу,

меркапто-,  $C_{1-3}$ -алкілсульфанільну,  $C_{1-3}$ -алкілсульфінільну,  $C_{1-3}$ -алкілсульфонільну,  $C_{1-3}$ -алкілсульфонілокси-, арилсульфонілокси-, трифторметилсульфанільну, трифторметилсульфінільну або трифторметилсульфонільну групу,

сульфо-, аміноссульфонільну,  $C_{1-3}$ -алкіламіноссульфонільну, ді( $C_{1-3}$ -алкіл)аміноссульфонільну, піролідин-1-ілсульфонільну, піперидин-1-ілсульфонільну, морфолін-4-ілсульфонільну, піперазин-1-ілсульфонільну або 4-( $C_{1-3}$ -алкіл)-піперазин-1-ілсульфонільну групу,

метильну або метоксигрупу, заміщену 1-9 атомами фтору,

етильну або етоксигрупу, заміщену 1-5 атомами фтору,

$C_{2-4}$ -алкенільну або  $C_{2-4}$ -алкінільну групу,  $C_{3-4}$ -алкенілокси- або  $C_{3-4}$ -алкінілоксигрупу,  $C_{3-6}$ -циклоалкільну або  $C_{3-6}$ -циклоалкілоксигрупу,

$C_{3-6}$ -циклоалкіл- $C_{1-3}$ -алкільну або  $C_{3-6}$ -циклоалкіл- $C_{1-3}$ -алкілоксигрупу або арильну, арилокси-, арил- $C_{1-3}$ -алкільну або арил- $C_{1-3}$ -алкілоксигрупу,

$R^{11}$  та  $R^{12}$ , які можуть бути однаковими або різними, відповідно означають атом водню, атом фтору, хлору, бром або йоду,  $C_{1-3}$ -алкільну, трифторметильну, гідрокси- або  $C_{1-3}$ -алкілоксигрупу або ціаногрупу, або

$R^{11}$  разом з  $R^{12}$ , якщо зони з'єднані на сусідніх атомах вуглецю, також означають метилендіокси-, дифторметилендіокси- або нерозгалужену  $C_{3-5}$ -алкіленову групу, а

$R^{13}$  та  $R^{14}$ , які можуть бути однаковими або різними, відповідно означають атом водню, атом фтору, хлору або бром, трифторметильну,  $C_{1-3}$ -алкільну або  $C_{1-3}$ -алкілоксигрупу,

феніл- $C_{1-4}$ -алкільну групу, в якій алкільна частина заміщена ціано-, карбоксильною,  $C_{1-3}$ -

алкілоксикарбонільною, амінокарбонільною,  $C_{1-3}$ -алкіламінокарбонільною, ді( $C_{1-3}$ -алкіл)амінокарбонільною, піролідин-1-ілкарбонільною, піперидин-1-ілкарбонільною, морфолін-4-ілкарбонільною групою, а фенільна частина заміщена групами  $R^{10}$ - $R^{14}$ , причому  $R^{10}$ - $R^{14}$  мають наведені вище значення,

фенільну групу, заміщену групами  $R^{10}$ - $R^{14}$ , причому  $R^{10}$ - $R^{14}$  мають наведені вище значення,

феніл- $C_{2-3}$ -алкенільну групу, в якій фенільна частина заміщена групами  $R^{10}$ - $R^{14}$ , причому  $R^{10}$ - $R^{14}$  мають наведені вище значення,

феніл- $(CH_2)_m$ -A- $(CH_2)_n$ -групу, в якій фенільна частина заміщена  $R^{10}$ - $R^{14}$ , причому  $R^{10}$ - $R^{14}$  мають наведені вище значення, а

A означає карбонільну, ціанімінометиленову, гідроксиімінометиленову або  $C_{1-3}$ -алкілоксиімінометиленову групу, m означає число 0, 1 або 2, а n - 1, 2 або 3,

фенілкарбонілметильну групу, в якій фенільна частина заміщена  $R^{10}$ - $R^{14}$ , причому  $R^{10}$ - $R^{14}$  мають наведені вище значення, а метальна частина заміщена  $C_{1-3}$ -алкільною групою,

феніл- $(CH_2)_m$ -B- $(CH_2)_n$ -групу, в якій фенільна частина заміщена  $R^{10}$ - $R^{14}$ , причому  $R^{10}$ - $R^{14}$  m та n мають наведені вище значення, а

B означає метильну групу, заміщену гідрокси-,  $C_{1-3}$ -алкілокси-, аміно-,  $C_{1-3}$ -алкіламіно-, ді( $C_{1-3}$ -алкіл)аміно-, меркапто-,  $C_{1-3}$ -алкілсульфанільною,  $C_{1-3}$ -алкілсульфінільною або  $C_{1-3}$ -алкілсульфонільною групою, та, в разі необхідності, додатково заміщену метильною або етильною групою,

нафтил- $C_{1-3}$ -алкільну групу, в якій нафтильна частина заміщена групами  $R^{10}$ - $R^{14}$ , причому  $R^{10}$ - $R^{14}$  мають наведені вище значення,

нафтил- $(CH_2)_m$ -A- $(CH_2)_n$ -групу, в якій нафтильна частина заміщена  $R^{10}$ - $R^{14}$ , причому  $R^{10}$ - $R^{14}$ , A, m та n мають наведені вище значення,

нафтил- $(CH_2)_m$ -B- $(CH_2)_n$ -групу, в якій нафтильна частина заміщена  $R^{10}$ - $R^{14}$ , причому  $R^{10}$ - $R^{14}$ , B, m та n мають наведені вище значення,

[1,4]нафтохінон-2-ільну, хромен-4-он-3-ільну, 1-оксоіндан-2-ільну, 1,3-діоксоіндан-2-ільну або 2,3-дигідро-3-оксобензофуран-2-ільну групу,

гетероарил- $(CH_2)_m$ -A- $(CH_2)_n$ -групу, причому A, m та n мають наведені вище значення,

гетероарил- $(CH_2)_m$ -B- $(CH_2)_n$ -групу, причому B, m та n мають наведені вище значення,

$C_{1-6}$ -алкіл-A- $(CH_2)_n$ -групу, причому A та n мають наведені вище значення,

$C_{3-7}$ -циклоалкіл- $(CH_2)_m$ -A- $(CH_2)_n$ -групу, причому A, m та n мають наведені вище значення,

$C_{3-7}$ -циклоалкіл- $(CH_2)_m$ -B- $(CH_2)_n$ -групу, причому B, m та n мають наведені вище значення,

$R^{21}$ -A- $(CH_2)_n$ -групу, в якій  $R^{21}$  означає  $C_{1-3}$ -алкілоксикарбонільну, амінокарбонільну,  $C_{1-3}$ -алкіламінокарбонільну, ді( $C_{1-3}$ -алкіл)амінокарбонільну, піролідин-1-ілкарбонільну, піперидин-1-ілкарбонільну або морфолін-4-ілкарбонільну, піперазин-1-ілкарбонільну, 4-метилпіперазин-1-ілкарбонільну або 4-етилпіперазин-1-ілкарбонільну групу, а A та n мають наведені вище значення,

феніл- $(CH_2)_m$ -D- $C_{1-3}$ -алкільну групу, в якій фенільна частина заміщена групами  $R^{10}$ - $R^{14}$ , причому

$R^{10}$ - $R^{14}$  та  $m$  мають наведені вище значення, а  $D$  означає атом кисню або сірки, іміно-,  $C_{1-3}$ -алкіліміно-, сульфінільну або сульфонільну групу,

нафтил- $(CH_2)_m$ - $D$ - $C_{1-3}$ -алкільну групу, в якій нафтильна частина заміщена групами  $R^{10}$ - $R^{14}$ , причому  $R^{10}$ - $R^{14}$ ,  $D$  та  $m$  мають наведені вище значення,

$C_{2-6}$ -алкільну групу, заміщену групою  $R_b$ , причому

$R_b$  в положенні 1 ксантинового скелету ізольована від атома кільцевого азоту щонайменше двома атомами вуглецю, та

$R_b$  означає гідрокси-,  $C_{1-3}$ -алкілокси-, меркапто-,  $C_{1-3}$ -алкілсульфанільну,  $C_{1-3}$ -алкілсульфінільну,  $C_{1-3}$ -алкілсульфонільну, аміно-,  $C_{1-3}$ -алкіламіно-, ді( $C_{1-3}$ -алкіл)аміно-, піролідін-1-ільну, піперидин-1-ільну, морфолін-4-ільну, піперазин-1-ільну або 4-( $C_{1-3}$ -алкіл)піперазин-1-групу,

$C_{3-6}$ -циклоалкільну групу або аміно- або арилкарбоніламіногрупу,

$R^2$  означає атом водню,

$C_{1-8}$ -алкільну групу,

$C_{2-6}$ -алкенільну групу,

$C_{3-6}$ -алкінільну групу,

$C_{1-6}$ -алкільну групу, заміщену групою  $R_a$ , причому  $R_a$  має наведені вище значення,

тетрагідрофуран-3-ільну, тетрагідропиран-3-ільну, тетрагідропиран-4-ільну, тетрагідрофураніл- $C_{1-3}$ -алкільну або тетрагідропираніл- $C_{1-3}$ -алкільну групу,

$C_{1-6}$ -алкільну групу, заміщену фенільною групою, причому фенольне кільце заміщене групами  $R^{10}$ - $R^{14}$ , і  $R^{10}$ - $R^{14}$  мають наведені вище значення,

фенільну групу, заміщену групами  $R^{10}$ - $R^{14}$ , причому  $R^{10}$ - $R^{14}$  мають наведені вище значення,

феніл- $C_{2-3}$ -алкенільну групу, в якій фенільна частина заміщена групами  $R^{10}$ - $R^{14}$ , причому  $R^{10}$ - $R^{14}$  мають наведені вище значення,

феніл- $(CH_2)_m$ - $A$ - $(CH_2)_n$ -групу, в якій фенільна частина заміщена групами  $R^{10}$ - $R^{14}$ , причому  $R^{10}$ - $R^{14}$ ,  $A$ ,  $m$  та  $n$  мають наведені вище значення,

феніл- $(CH_2)_m$ - $B$ - $(CH_2)_n$ -групу, в якій фенільна частина заміщена групами  $R^{10}$ - $R^{14}$ , причому  $R^{10}$ - $R^{14}$ ,  $B$ ,  $m$  та  $n$  мають наведені вище значення,

гетероарил- $(CH_2)_m$ - $A$ - $(CH_2)_n$ -групу, причому  $A$ ,  $m$  та  $n$  мають наведені вище значення,

гетероарил- $(CH_2)_m$ - $B$ - $(CH_2)_n$ -групу, причому  $B$ ,  $m$  та  $n$  мають наведені вище значення,

$C_{1-6}$ -алкіл- $A$ - $(CH_2)_n$ -групу, причому  $A$  та  $n$  мають наведені вище значення,

$C_{3-7}$ -циклоалкіл- $(CH_2)_m$ - $A$ - $(CH_2)_n$ -групу, причому  $A$ ,  $m$  та  $n$  мають наведені вище значення,

$C_{3-7}$ -циклоалкіл- $(CH_2)_m$ - $B$ - $(CH_2)_n$ -групу, причому  $B$ ,  $m$  та  $n$  мають наведені вище значення,

$R^{21}$ - $A$ - $(CH_2)_n$ -групу, в якій  $R^{21}$ ,  $A$  та  $n$  мають наведені вище значення,

феніл- $(CH_2)_m$ - $D$ - $C_{1-3}$ -алкільну групу, в якій фенільна частина заміщена групами  $R^{10}$ - $R^{14}$ , причому  $R^{10}$ - $R^{14}$ ,  $m$  та  $D$  мають наведені вище значення,

$C_{2-6}$ -алкільну групу, заміщену групою  $R_b$ , причому

$R_b$  в положенні 3 ксантинового скелету ізольована від атома кільцевого азоту щонайменше двома атомами вуглецю та має наведене вище значення, або

$C_{3-6}$ -циклоалкільну групу,

$R^3$  означає  $C_{1-8}$ -алкільну групу,

$C_{1-4}$ -алкільну групу, заміщену групою  $R_c$ , причому

$R_c$  означає в разі необхідності заміщену однією або двома  $C_{1-3}$ -алкільними групами  $C_{3-7}$ -циклоалкільну групу,

в разі необхідності заміщену однією або двома  $C_{1-3}$ -алкільними групами  $C_{5-7}$ -циклоалкенільну групу,

арильну групу або

фуранільну, тієнільну, оксазолільну, ізоксазолільну, тiazолільну, ізотiazолільну, піридинільну, піридазинільну, піримідинільну або піразинільну групу, причому наведені вище гетероциклічні залишки відповідно можуть бути заміщені однією або двома  $C_{1-3}$ -алкільними групами або атомом фтору, хлору, броду або йоду, або трифторметильною, ціано- або  $C_{1-3}$ -алкілоксигрупою,

$C_{3-8}$ -алкенільну групу,

$C_{3-6}$ -алкенільну групу, заміщену атомом фтору, хлору або броду або трифторметильною групою,

$C_{3-8}$ -алкінільну групу,

арильну групу або

арил- $C_{2-4}$ -алкієнільну групу,

а

$R^4$  означає ацетидин-1-ільну або піролідін-1-ільну групу, яка у положенні 3 заміщена  $R_eNR_d$ -групою та додатково може бути заміщена однією або двома  $C_{1-3}$ -алкільними групами, причому

$R_e$  означає атом водню або  $C_{1-3}$ -алкільну групу, а

$R_d$  означає атом водню,  $C_{1-3}$ -алкільну групу,  $R_f$ - $C_{1-3}$ -алкільну групу або  $R_g$ - $C_{2-3}$ -алкільну групу, причому

$R_f$  означає карбоксильну,  $C_{1-3}$ -алкілоксикарбонільну, амінокарбонільну,  $C_{1-3}$ -алкіламінокарбонільну, ді( $C_{1-3}$ -алкіл)амінокарбонільну, піролідін-1-ільну, карбонільну, 2-ціанпіролідін-1-ілкарбонільну, 2-карбоксипіролідін-1-ілкарбонільну, 2-метоксикарбонілпіролідін-1-ілкарбонільну, 2-етоксикарбонілпіролідін-1-ілкарбонільну, 2-амінокарбонілпіролідін-1-ілкарбонільну, 4-ціанотiazолідін-3-ілкарбонільну, 4-карбокситiazолідін-3-ілкарбонільну, 4-метоксикарбонілtiazолідін-3-ілкарбонільну, 4-етоксикарбонілtiazолідін-3-ілкарбонільну, 4-амінокарбонілtiazолідін-3-ілкарбонільну, піперидин-1-ілкарбонільну, морфолін-4-ілкарбонільну, піперазин-1-ілкарбонільну, 4-метилпіперазин-1-ілкарбонільну або 4-етилпіперазин-1-ілкарбонільну групу, а

$R_g$ , відділена від атому азоту  $R_eNR_d$ -групи щонайменше двома атомами вуглецю, означає гідрокси-, метокси- або етоксигрупу,

піперидин-1-ільну або гексагідроацепін-1-ільну групу, яка в положенні 3 або в положенні 4 заміщена  $R_eNR_d$ -групою та додатково може бути заміщена однією або двома  $C_{1-3}$ -алкільними групами, причому  $R_e$  та  $R_d$  мають наведені вище значення,

3-амінопіперидин-1-ільну групу, в якій піперидин-1-ільна частина додатково заміщена амінокарбонільною,  $C_{1-2}$ -алкіламінокарбонільною, ді( $C_{1-2}$ -алкіл)амінокарбонільною, піролідін-1-ілкарбонільною, (2-ціанпіролідін-1-іл)карбонільною, тiazолідін-3-ілкарбонільною, (4-

ціанотіазолідин-3-іл)карбонільною, піперидин-1-ілкарбонільною або морфолін-4-ілкарбонільною групою,

3-амінопіперидин-1-ільну групу, в якій піперидин-1-ільна частина в положенні 4 або в положенні 5 додатково заміщена гідрокси- або метоксигрупою,

3-амінопіперидин-1-ільну групу, в якій метилена група в положенні 2 або в положенні 6 замінена карбонільною групою,

піперидин-1-ільну або гексагідроацепін-1-ільну групи, заміщені в положенні 3 аміно-, С<sub>1-3</sub>-алкіламіно- або ді(С<sub>1-3</sub>-алкіл)аміногрупою, в яких 2 атоми водню на вуглецевому скелеті піперидин-1-ільної або гексагідроацепін-1-ільної групи відповідно замінені нерозгалуженим алкіленовим місточком, причому цей місточок містить 2-5 атомів вуглецю, якщо 2 атоми водню знаходяться на тому самому атомі вуглецю, або 1-4 атоми вуглецю, якщо атоми водню знаходяться на сусідніх атомах вуглецю, або 1-4 атоми вуглецю, якщо атоми водню знаходяться на атомах вуглецю, розділених одним атомом, або 1-3 атоми вуглецю, якщо 2 атоми водню знаходяться на атомах вуглецю, розділених двома атомами,

ацетидин-1-ільну, піролідин-1-ільну, піперидин-1-ільну або гексагідроацепін-1-ільну групу, яка заміщена аміно-С<sub>1-3</sub>-алкільною, С<sub>1-3</sub>-алкіламіно-С<sub>1-3</sub>-алкільною або ді(С<sub>1-3</sub>-алкіл)аміно-С<sub>1-3</sub>-алкільною групою,

піперазин-1-ільну або [1,4]діацепан-1-ільну групу, в разі необхідності на вуглецевому скелеті заміщену однією або двома С<sub>1-3</sub>-алкільними групами,

3-імінопіперазин-1-ільну, 3-іміно-[1,4]діацепан-1-ільну або 5-іміно-[1,4]діацепан-1-ільну групу, в разі необхідності на вуглецевому скелеті заміщену однією або двома С<sub>1-3</sub>-алкільними групами,

[1,4]діазепан-1-ільну групу, в разі необхідності заміщену однією або двома С<sub>1-3</sub>-алкільними групами, яка в положенні 6 заміщена аміногрупою,

С<sub>3-7</sub>-циклоалкілну групу, яка заміщена аміно-, С<sub>1-3</sub>-алкіламіно- або ді(С<sub>1-3</sub>-алкіл)аміногрупою,

С<sub>3-7</sub>-циклоалкілну групу, заміщену аміно-С<sub>1-3</sub>-алкільною, С<sub>1-3</sub>-алкіламіно-С<sub>1-3</sub>-алкільною або ді(С<sub>1-3</sub>-алкіл)аміно-С<sub>1-3</sub>-алкільною групою,

С<sub>3-7</sub>-циклоалкіл-С<sub>1-2</sub>-алкілну групу, в якій циклоалкільна частина заміщена аміно-, С<sub>1-3</sub>-алкіламіно- або ді(С<sub>1-3</sub>-алкіл)аміногрупою,

С<sub>3-7</sub>-циклоал-С<sub>1-2</sub>-алкілну групу, в якій циклоалкільна частина заміщена аміно-С<sub>1-3</sub>-алкільною, С<sub>1-3</sub>-алкіламіно-С<sub>1-3</sub>-алкільною або ді(С<sub>1-3</sub>-алкіл)аміно-С<sub>1-3</sub>-алкільною групою,

С<sub>3-7</sub>-циклоалкіламіногрупу, в якій циклоалкільна частина заміщена аміно-, С<sub>1-3</sub>-алкіламіно- або ді(С<sub>1-3</sub>-алкіл)аміногрупою, причому обидва атоми азоту у циклоалкільній частині відділені один від одного щонайменше двома атомами вуглецю,

N-(С<sub>3-7</sub>-циклоалкіл)-N-(С<sub>1-3</sub>-алкіл)аміногрупу, в якій циклоалкільна частина заміщена аміно-, С<sub>1-3</sub>-алкіламіно- або ді(С<sub>1-3</sub>-алкіл)аміногрупою, причому обидва атоми азоту у циклоалкільній частині відділені один від одного щонайменше двома атомами вуглецю,

С<sub>3-7</sub>-циклоалкіламіногрупу, в якій циклоалкільна частина заміщена аміно-С<sub>1-3</sub>-алкільною, С<sub>1-3</sub>-

алкіламіно-С<sub>1-3</sub>-алкільною або ді(С<sub>1-3</sub>-алкіл)аміно-С<sub>1-3</sub>-алкільною групою,

N-(С<sub>3-7</sub>-циклоалкіл)-N-(С<sub>1-3</sub>-алкіл)аміногрупу, в якій циклоалкільна частина заміщена аміно-С<sub>1-3</sub>-алкільною, С<sub>1-3</sub>-алкіламіно-С<sub>1-3</sub>-алкільною або ді(С<sub>1-3</sub>-алкіл)аміно-С<sub>1-3</sub>-алкільною групою,

С<sub>3-7</sub>-циклоалкіл-С<sub>1-2</sub>-алкіламіногрупу, в якій циклоалкільна частина заміщена аміно-, С<sub>1-3</sub>-алкіламіно- або ді(С<sub>1-3</sub>-алкіл)аміногрупою,

N-(С<sub>3-7</sub>-циклоалкіл-С<sub>1-2</sub>-алкіл)-N-(С<sub>1-2</sub>-алкіл)аміногрупу, в якій циклоалкільна частина заміщена аміно-, С<sub>1-3</sub>-алкіламіно- або ді(С<sub>1-3</sub>-алкіл)аміногрупою,

С<sub>3-7</sub>-циклоалкіл-С<sub>1-2</sub>-алкіламіногрупу, в якій циклоалкільна частина заміщена аміно-С<sub>1-3</sub>-алкільною, С<sub>1-3</sub>-алкіламіно-С<sub>1-3</sub>-алкільною або ді(С<sub>1-3</sub>-алкіл)аміно-С<sub>1-3</sub>-алкільною групою,

N-(С<sub>3-7</sub>-циклоалкіл-С<sub>1-2</sub>-алкіл)-N-(С<sub>1-2</sub>-алкіл)аміногрупу, в якій циклоалкільна частина заміщена аміно-С<sub>1-3</sub>-алкільною, С<sub>1-3</sub>-алкіламіно-С<sub>1-3</sub>-алкільною або ді(С<sub>1-3</sub>-алкіл)аміно-С<sub>1-3</sub>-алкільною групою,

аміногрупу, заміщену залишками R<sup>15</sup> та R<sup>16</sup>, в якій

R<sup>15</sup> означає С<sub>1-6</sub>-алкілну групу, С<sub>3-6</sub>-циклоалкілну, С<sub>3-6</sub>-циклоалкіл-С<sub>1-3</sub>-алкілну, арилну або арил-С<sub>1-3</sub>-алкілну групу, а

R<sup>16</sup> означає R<sup>17</sup>-С<sub>2-3</sub>-алкілну групу, причому С<sub>2-3</sub>-алкільна частина є нерозгалуженою та може бути заміщена 1-4 С<sub>1-3</sub>-алкільними групами, які можуть бути однаковими або різними, або може бути заміщена амінокарбонільною, С<sub>1-2</sub>-алкіламінокарбонільною, ді(С<sub>1-2</sub>-алкіл)амінокарбонільною, піролідин-1-ілкарбонільною, (2-ціанпіролідин-1-іл)карбонільною, тіазолідин-3-ілкарбонільною, (4-ціанотіазолідин-3-іл)карбонільною, піперидин-1-ілкарбонільною або морфолін-4-ілкарбонільною групою, а

R<sup>17</sup> означає аміно-, С<sub>1-3</sub>-алкіламіно- або ді(С<sub>1-3</sub>-алкіл)аміногрупу, причому, якщо R<sup>3</sup> означає метильну групу, R<sup>17</sup> не може означати ді(С<sub>1-3</sub>-алкіл)аміногрупу,

аміногрупу, заміщену R<sup>20</sup>, в якій

R<sup>20</sup> означає ацетидин-3-ільну, ацетидин-2-ілметильну, ацетидин-3-ілметильну, піролідин-3-ільну, піролідин-2-ілметильну, піролідин-3-ілметильну, піперидин-3-ільну, піперидин-4-ільну, піперидин-2-ілметильну, піперидин-3-ілметильну або піперидин-4-ілметильну групу, причому залишки R<sup>20</sup> можуть бути заміщені відповідно однією або двома С<sub>1-3</sub>-алкільними групами,

аміногрупу, заміщену залишками R<sup>15</sup> та R<sup>20</sup>, в якій

R<sup>15</sup> та R<sup>20</sup> мають наведені вище значення, причому залишки R<sup>20</sup> можуть бути заміщені відповідно однією або двома С<sub>1-3</sub>-алкільними групами,

R<sup>19</sup>-С<sub>3-4</sub>-алкілну групу, в якій С<sub>3-4</sub>-алкільна частина є нерозгалуженою та може бути заміщена залишком R<sup>15</sup> та додатково заміщена однією або двома С<sub>1-3</sub>-алкільними групами, причому R<sup>15</sup> має наведені вище значення, а R<sup>19</sup> означає аміно-, С<sub>1-3</sub>-алкіламіно- або ді(С<sub>1-3</sub>-алкіл)аміногрупу,

3-аміно-2-оксопіперидин-5-ільну або 3-аміно-2-оксо-1-метилпіперидин-5-ільну групу,

піролідин-3-ільну, піперидин-3-ільну, піперидин-4-ільну, гексагідроацепін-3-ільну або гексагідроацепін-4-ільну групу, яка у положенні 1 заміщена аміно-,  $C_{1-3}$ -алкіламіно- або ді( $C_{1-3}$ -алкіл)аміногрупою, або

ацетидин-2-іл- $C_{1-2}$ -алкільну, ацетидин-3-іл- $C_{1-2}$ -алкільну, піролідин-2-іл- $C_{1-2}$ -алкільну, піролідин-3-іл- $C_{1-2}$ -алкільну, піперидин-2-іл- $C_{1-2}$ -алкільну, піперидин-3-ільну, піперидин-3-іл- $C_{1-2}$ -алкільну, піперидин-4-ільну або піперидин-4-іл- $C_{1-2}$ -алкільну групу, причому наведені вище групи можуть бути заміщені відповідно однією або двома  $C_{1-3}$ -алкільними групами,

причому під арильним групами, згаданими при визначенні зазначених вище залишків, слід розуміти фенільну або нафтильну групи, які незалежно одна від одної можуть бути моно-або дизаміщені  $R_h$ , причому замісники можуть бути однаковими або різними, а  $R_h$  означає атом фтору, хлору, бромово або йоду, трифторметильну, ціано, нітро-, аміно-, амінокарбонільну, аміноссульфонільну, метилсульфонільну, ацетиламіно-, метилсульфоніламіно-,  $C_{1-3}$ -алкільну, циклопропілну, етенільну, етинільну, гідроксильну,  $C_{1-3}$ -алкілокси-, дифторметокси- або трифторметоксигрупу,

під гетероарильними групами, згаданими при визначенні зазначених вище залишків, слід розуміти піролілну, фуранільну, тієнілну, піридинільну, індолільну-, бензофуранільну, бензотіофенільну, хінолінілну або ізохінолінілну групу,

або піролілну, фуранільну, тієнілну або піридинільну групу, в якій одна або дві метинові групи замінені атомами азоту,

або індолільну, бензофуранільну, бензотіофенільну, хінолілну або ізохінолілну групу, в якій 1-3 метинові групи замінені атомами азоту,

або 1,2-дигідро-2-оксопіридинільну, 1,4-дигідро-4-оксопіридинільну, 2,3-дигідро-3-оксопіридазинільну, 1,2,3,6-тетрагідро-3,6-діоксопіридазинільну, 1,2-дигідро-2-оксопіримідинільну, 3,4-дигідро-4-оксопіримідинільну, 1,2,3,4-тетрагідро-2,4-діоксопіримідинільну, 1,2-дигідро-2-оксопіразинільну, 1,2,3,4-тетрагідро-2,3-діоксопіразинільну, 2,3-дигідро-2-оксоіндолільну, 2,3-дигідробензофуранільну, 2,3-дигідро-2-оксо-1H-бензоімідазолільну, 2,3-дигідро-2-оксобензоксазолільну, 1,2-дигідро-2-оксохінолінілну, 1,4-дигідро-4-оксохінолінілну, 1,2-дигідро-1-оксоізохінолінілну, 1,4-дигідро-4-оксохінолінілну, 1,2-дигідро-2-оксохінозолінільну, 1,4-дигідро-4-оксохінозолінільну, 1,2,3,4-тетрагідро-2,4-діоксохінозолінільну, 1,2-дигідро-2-оксохіноксалінільну, 1,2,3,4-тетрагідро-2,3-діоксохіноксалінільну, 1,2-дигідро-1-оксофалазинільну, 1,2,3,4-тетрагідро-1,4-діоксофалазинільну, хроманільну, кумаринільну, 2,3-дигідробензо[1,4]діоксинільну або 3,4-дигідро-3-оксо-2H-бензо[1,4]оксазинільну групу,

причому наведені вище гетероарильні групи можуть бути заміщені  $R^{10}$ - $R^{14}$ , причому  $R^{10}$ - $R^{14}$  мають наведені вище значення,

причому, якщо не наведені ніякі інші значення, алкільна, алкенільна та алкінільна групи можуть бути не розгалуженими або розгалуженими,

а також N-окисовані на атомі кільцевого азоту в положенні 9 ксантинового скелету або метильовані або етильовані похідні,

а також похідні, в яких 2-оксо-, 6-оксо- або 2-оксо- та 6-оксогрупа ксантинового скелету замінені тіоксогрупами,

із вказівкою, що виключені сполуки, в яких

$R^1$  означає атом водню, метильну, пропілну, 2-гідроксипропілну, амінокарбонільметильну або бензильну групу,

$R^2$  означає метильну групу,

$R^3$  означає  $C_{1-8}$ -алкільну групу, бензильну групу, в разі необхідності заміщену атомом фтору, хлору або бромово або металільною групою, 1-фенілетильну або 2-фенілетильну групу, 2-пропен-1-ільну, 2-бутен-1-ільну, 3-хлор-2-бутен-1-ільну або 2-метил-2-пропен-1-ільну групу,

а

$R^4$  означає піперазин-1-ільну групу,

та із вказівкою, що виключені сполуки, в яких

$R^1$  означає атом водню або метильну групу,

$R^2$  означає атом водню або метильну групу,

$R^3$  означає метильну групу,

а

$R^4$  означає 3-амінопропілну, 3-[ді( $C_{1-3}$ -алкіл)аміно]пропілну, 1-феніл-3-[ді( $C_{1-3}$ -алкіл)аміно]пропілну, 1-феніл-3-метил-3-(диметиламіно)пропілну, 1-(4-хлорфеніл)-3-(диметиламіно)пропілну, 1-феніл-2-метил-3-(диметиламіно)пропілну, 1-(3-метоксифеніл)-3-(диметиламіно)пропілну або 4-амінобутильну групу,

та із вказівкою, що виключена сполука

1,3,7-триметил-8-(1-аміноциклогексил)ксантин, їх таутомери, енантіомери, діастереомери, їх суміші та солі.

Карбоксильні групи, наведені при визначенні зазначених вище залишків, можуть бути замінені групою, здатною до перетворення на карбоксильну групу *in-vivo*, або за фізіологічних умов негативно зарядженою групою,

крім того іміно- та аміногрупи, наведені при визначенні зазначених вище залишків, можуть бути заміщені залишком, здатним відщеплюватися *in-vivo*. Такі групи описані, наприклад, у [WO 98/46576 та N. M. Nielsen et al. у International Journal of Pharmaceutics (Міжнародному журналі з фармацевтики під редакцією N. M. Nielsen та інш.) 39, 75-85 (1987)].

Групою, здатною до перетворення на карбоксильну групу *in-vivo*, є, наприклад, гідроксиметильна група, етерифікована спиртом карбоксильна група, в якій спиртова частина означає переважно  $C_{1-6}$ -алканол, феніл- $C_{1-3}$ -алканол,  $C_{3-9}$ -циклоалканол, причому  $C_{5-8}$ -циклоалканол може бути додатково заміщений однією або двома  $C_{1-3}$ -алкільними групами,  $C_{5-8}$ -циклоалканол, в якому метиленова група у положенні 3 або 4 замінена атомом кисню або іміногрупою, заміщеною, в разі необхідності,  $C_{1-3}$ -алкільною, феніл- $C_{1-3}$ -алкільною, феніл- $C_{1-3}$ -алкілоксикарбонільною або  $C_{2-6}$ -алканольною групою, а циклоалкільна частина додатково може бути заміщена одним або двома  $C_{1-3}$ -алкільними групами,  $C_{4-7}$ -циклоалкенол,  $C_{3-5}$ -алкенол, феніл- $C_{3-5}$ -алкенол,  $C_{3-5}$ -алкінол або феніл- $C_{3-5}$ -алкінол із вказівкою, що атом вуглецю,



який з'єднаний подвійним або потрійним зв'язком, не прикріплюється до атому кисню,  $C_{3-6}$ -циклоалкіл- $C_{1-3}$ -алканол, біциклоалканол, який має загалом 8-10 атомів вуглецю, який у біциклоалкілній частині може бути додатково заміщений однією або двома  $C_{1-3}$ -алкільними групами, 1,3-дигідро-3-оксо-1-ізобензофуранол або спирт формули

$R_p\text{-CO-O-(R}_q\text{CR}_r\text{)-OH}$ , в якій

$R_p$  означає  $C_{1-8}$ -алкільну,  $C_{5-7}$ -циклоалкільну,  $C_{1-8}$ -алкілокси-,  $C_{5-7}$ -циклоалкілокси-, фенільну або феніл- $C_{1-3}$ -алкільну групу,

$R_q$  означає атом водню,  $C_{1-3}$ -алкільну,  $C_{5-7}$ -циклоалкільну або фенільну групу та

$R_r$  означає атом водню або  $C_{1-3}$ -алкільну групу, негативно зарядженими за фізіологічних умов групами є, наприклад, тетразол-5-ільна, фенілкарбоніламінокарбонільна, трифторметилкарбоніламіно-карбонільна,  $C_{1-6}$ -алкілсульфоніламіно-, фенілсульфоніламіно-, бензилсульфоніламіно-, трифторметилсульфоніламіно-,  $C_{1-6}$ -алкілсульфоніламінокарбонільна, фенілсульфоніламіно-, карбонільна, бензилсульфоніламінокарбонільна або перфтор- $C_{1-6}$ -алкілсульфоніламінокарбонільна група, а

іміно- та аміногрупи, здатними відщеплюватися *in-vivo*, є, наприклад, гідроксильна, алкільна група, фенольна група, в разі необхідності моно- або дизаміщена атомом фтору, хлору, бромово або йоду,  $C_{1-3}$ -алкільною або  $C_{1-3}$ -алкілоксигрупами, причому замісники можуть бути однаковими або різними, піридиноільна група або  $C_{1-16}$ -алканоільна група, а також формалінова, ацетильна, пропіонілова, бутаноїлова, пентаноїлова або гексаноїлова група, 3,3,3-трихлорпропіонілова або алілоксикарбонільна група,  $C_{1-16}$ -алкілоксикарбонільна або  $C_{1-16}$ -алкілкарбонілоксигрупа, в яких атоми водню можуть бути повністю або частково замінені атомами фтору або хлору, а також метоксикарбонільна, етоксикарбонільна, пропоксикарбонільна, ізопроксикарбонільна, бутоксикарбонільна, трет.-бутоксикарбонільна, пентоксикарбонільна, гексоксикарбонільна, октилоксикарбонільна, нонилоксикарбонільна, децилоксикарбонільна, ундецилоксикарбонільна, додецилокси карбонільна, гексадецилокси карбонільна, метилкарбонілокси-, етилкарбонілокси-, 2,2,2-трихлоретилкарбонілокси-, пропілкарбонілокси-, ізопропілкарбонілокси-, бутилкарбонілокси-, трет.-бутилкарбонілокси-, пентилкарбонілокси-, гексилкарбонілокси-, октилкарбонілокси-, нонілкарбонілокси-, децилкарбонілокси-, ундецилкарбонілокси-, додецилкарбонілокси- або гексадецилкарбонілоксигрупа, феніл- $C_{1-6}$ -алкілоксикарбонільна група, а також бензилоксикарбонільна, фенілетоксикарбонільна або фенілпропоксикарбонільна група, 3-амінопропіонільна група, в якій аміногрупа моно- або дизаміщена  $C_{1-6}$ -алкільною або  $C_{3-7}$ -циклоалкільною групою, а замісники можуть бути однаковими або різними,  $C_{1-3}$ -алкілсульфоніл- $C_{2-4}$ -алкілоксикарбонільна,  $C_{1-3}$ -алкілокси- $C_{2-4}$ -алкілокси- $C_{2-4}$ -алкілоксикарбонільна,  $R_p\text{-CO-O-(R}_q\text{CR}_r\text{)-O-CO-}$ ,  $C_{1-6}$ -алкіл- $\text{CO-NH-(R}_s\text{CR}_t\text{)-O-CO-}$  або  $C_{1-6}$ -алкіл- $\text{CO-O-(R}_s\text{CR}_t\text{)-O-CO-}$  групи, в яких  $R_p\text{-R}_r$  мають наведені вище значення;

$R_s$  та  $R_t$ , які можуть бути однаковими або різними, атоми водню або  $C_{1-3}$ -алкільні групи.

Крім того наведені нижче або вище насичені алкіл- та алкілоксичастини, які містять більше 2 атомів вуглецю, якщо не зазначено нічого іншого, можуть також мати розгалужені ізомери, наприклад, ізопропілну, трет.бутилну, ізобутилну та інші групи.

$R^1$  та  $R^2$  означають, наприклад, атом водню, метильну, етильну, пропілну, 2-пропілну, бутилну, 2-бутилну, 2-метилпропілну, 2-пропен-1-ільну, 2-пропен-1-ільну, циклопропілметильну, бензилну, 2-фенілетильну, фенілкарбонілметильну, 3-фенілпропілну, 2-гідроксиетильну, 2-метоксиетильну, 2-етоксиетильну, 2-(диметиламіно)етильну, 2-(діетиламіно)етильну, 2-(піролідино)етильну, 2-(піперидино)етильну, 2-(морфоліно)етильну, 2-(піперазино)етильну, 2-(4-метилпіперазино)етильну, 3-гідроксипропілну, 3-метоксипропілну, 3-етоксипропілну, 3-(диметиламіно)пропілну, 3-(діетиламіно)пропілну, 3-(піролідино)пропілну, 3-(піперидино)пропілну, 3-(морфоліно)пропілну, 3-(піперазино)пропілну, 3-(4-метилпіперазино)пропілну, гарбоксиметильну, (метоксикарбоніл)метильну, (етоксикарбоніл)метильну, 2-карбоксиетильну, 2-(метоксикарбоніл)етильну, 2-(етоксикарбоніл)етильну, 3-карбоксипропілну, 3-(метоксикарбоніл)пропілну, 3-(етоксикарбоніл)пропілну, (амінокарбоніл)метильну, (метиламінокарбоніл)метильну, (диметиламінокарбоніл)метильну, (піролідинокарбоніл)метильну, (піперидинокарбоніл)метильну, (морфолінокарбоніл)метильну, 2-{амінокарбоніл}етильну, 2-(метиламінокарбоніл)етильну, 2-(диметиламінокарбоніл)етильну, 2-(піролідинокарбоніл)етильну, 2-(піперидинокарбоніл)етильну, 2-(морфолінокарбоніл)етильну, ціанметильну або 2-ціанетильну групу.

$R^3$  означає, наприклад, метильну, етильну, пропілну, 2-пропілну, бутилну, 2-бутилну, 2-метилпропілну, пентильну, 2-метилбутилну, 3-метилбутилну, 2,2-диметилпропілну, циклопропілметильну, {1-метилциклопропіл}метильну, (2-метилциклопропіл)метильну, циклобутилметильну, циклопентилметильну, циклогексилметильну, 2-(циклопропіл)етильну, 2-пропен-1-ільну, 2-метил-2-пропен-1-ільну, 3-феніл-2-пропен-1-ільну, 2-бутен-1-ільну, 4,4,4-трифтор-2-бутен-1-ільну, 3-бутен-1-ільну, 2-хлор-2-бутен-1-ільну, 2-бром-2-бутен-1-ільну, 3-хлор-2-бутен-1-ільну, 3-бром-2-бутен-1-ільну, 2-метил-2-бутен-1-ільну, 3-метил-2-бутен-1-ільну, 2,3-диметил-2-бутен-1-ільну, 3-трифторметил-2-бутен-1-ільну, 3-метил-3-бутен-1-ільну, 1-циклопентен-1-ілметильну, (2-метил-1-циклопентен-1-іл)метильну, 1-циклогексен-1-ілметильну, 2-(1-циклопентен-1-іл)етильну, 2-пропін-1-ільну, 2-бутін-1-ільну, 3-бутін-1-ільну, фенільну, метилфенільну, бензилну, фторбензилну, хлорбензилну, бромбензилну, метилбензилну, метоксибензилну, 1-фенілетильну, 2-фенілетильну, 3-фенілпропілну, 2-

фуранілметильну, 3-фуранілметильну, 2-тієнілметильну або 3-тієнілметильну групу.

$R^4$  означає, наприклад, 3-амінопіролідін-1-ільну, 3-амінопіперидин-1-ільну, 3-(метиламіно)піперидин-1-ільну, 3-(етиламіно)піперидин-1-ільну, 3-(диметиламіно)піперидин-1-ільну, 3-(діетиламіно)піперидин-1-ільну, 3-[(2-гідроксиетил)аміно]піперидин-1-ільну, 3-[N-метил-N-(2-гідроксиетил)аміно]піперидин-1-ільну, 3-[(3-гідроксипропіл)аміно]піперидин-1-ільну, 3-[N-метил-N-(3-гідроксипропіл)аміно]піперидин-1-ільну, 3-[(карбоксиметил)аміно]піперидин-1-ільну, 3-[(метоксикарбонілметил)аміно]піперидин-1-ільну, 3-[(етоксикарбонілметил)аміно]піперидин-1-ільну, 3-[N-метил-N-(метоксикарбонілметил)аміно]піперидин-1-ільну, 3-[N-метил-N-(етоксикарбонілметил)аміно]піперидин-1-ільну, 3-[(2-карбоксиетил)аміно]піперидин-1-ільну, 3-[(2-метоксикарбоніл)етил]аміно]піперидин-1-ільну, 3-[(2-(етоксикарбоніл)етил)аміно]піперидин-1-ільну, 3-{N-метил-N-[2-(метоксиокарбоніл)етил]аміно}піперидин-1-ільну, 3-{N-метил-N-[2-(етоксикарбоніл)етил]аміно}піперидин-1-ільну, 3-[(амінокарбонілметил)аміно]піперидин-1-ільну, 3-[(метиламінокарбонілметил)аміно]піперидин-1-ільну, 3-[(диметиламінокарбонілметил)аміно]піперидин-1-ільну, 3-[(етиламінокарбонілметил)аміно]піперидин-1-ільну, 3-[(диетиламінокарбонілметил)аміно]піперидин-1-ільну, 3-[(піролідін-1-ілкарбонілметил)аміно]піперидин-1-ільну, 3-[(2-ціанпіролідін-1-ілкарбонілметил)аміно]піперидин-1-ільну, 3-[(4-ціанотіазолідін-3-ілкарбонілметил)аміно]піперидин-1-ільну, 3-[(2-амінокарбонілпіролідін-1-ілкарбонілметил)аміно]піперидин-1-ільну, 3-[(2-карбоксипіролідін-1-ілкарбонілметил)аміно]піперидин-1-ільну, 3-[(2-метоксикарбонілпіролідін-1-ілкарбонілметил)аміно]піперидин-1-ільну, 3-[(2-етоксикарбонілпіролідін-1-ілкарбонілметил)аміно]піперидин-1-ільну, 3-[(піперидин-1-ілкарбонілметил)аміно]піперидин-1-ільну, 3-[(морфолін-4-ілкарбонілметил)аміно]піперидин-1-ільну, 3-аміно-2-метилпіперидин-1-ільну, 3-аміно-3-метилпіперидин-1-ільну, 3-аміно-4-метилпіперидин-1-ільну, 3-аміно-5-метилпіперидин-1-ільну, 3-аміно-6-метилпіперидин-1-ільну, 2-аміно-8-азабіцикло[3.2.1]окс-8-ильну, 6-аміно-2-азабіцикло[2.2.2]окт-2-ильну, 4-амінопіперидин-1-ільну, 3-аміногексагідроацепін-1-ільну, 4-аміногексагідроацерін-1-ільну, піперазин-1-ільну, [1,4]діацепан-1-ільну, 3-аміноциклопентильну, 3-аміноциклогексильну, 3-(метиламіно)циклогексильну, 3-(етиламіно)циклогексильну, 3-(диметиламіно)циклогексильну, 3-(діетиламіно)циклогексильну, 4-аміноциклогексильну, (2-аміноциклопропіл)аміно-,

(2-аміноциклобутил)аміно-, (3-аміноциклобутил)аміно-, (2-аміноциклопентил)аміно-, (3-аміноциклопентил)аміно-, (2-аміноциклогексил)аміно- або (3-аміноциклогексил)аміногрупу.

Особлива підгрупа, про яку слід окремо згадати, стосується тих сполук загальної формули I, в яких  $R^1$ - $R^4$  мають наведені вище значення, із додатковою вказівкою, що сполуки, в яких  $R^4$  означає заміщену, в разі необхідності, піперазин-1-ильну або [1,4]діацепан-1-ильну групу, виключаються, їх сумішей та солей.

Наступна підгрупа, про яку слід окремо згадати, стосується тих сполук загальної формули I, в яких

$R^1$  означає атом водню,  $C_{1-6}$ -алкільну групу,  $C_{3-6}$ -алкенільну групу,  $C_{3-4}$ -алкенільну групу, заміщену  $C_{1-2}$ -алкілоксикарбонільною групою,  $C_{3-6}$ -алкінільну групу,  $C_{3-6}$ -циклоалкіл- $C_{1-3}$ -алкільну групу, фенільну групу, яка може бути заміщена атомом фтору, хлору або броду або метильною, трифторметильною, гідрокси- або метоксигрупою, феніл- $C_{1-4}$ -алкільну групу, в якій фенільна частина заміщена  $R^{10}$ - $R^{12}$ , причому  $R^{10}$  означає атом водню, атом фтору, хлору або броду,

$C_{1-4}$ -алкільну, трифторметильну, гідроксиметильну,  $C_{3-6}$ -циклоалкільну, етинільну або фенільну групу,

гідрокси-,  $C_{1-4}$ -алкілокси-, дифторметокси, трифторметокси, 2,2,2-трифторетокси-, фенокси-, бензилокси-, 2-пропен-1-ілокси-, 2-пропіл-1-ілокси-, ціан- $C_{1-2}$ -алкілокси-,  $C_{1-2}$ -алкілсульфонілокси-, фенілсульфонілокси-, карбокси- $C_{1-3}$ -алкілокси-,  $C_{1-3}$ -алкілоксикарбоніл- $C_{1-3}$ -алкілокси-, амінокарбоніл- $C_{1-3}$ -алкілокси-,  $C_{1-2}$ -алкіламінокарбоніл- $C_{1-3}$ -алкілокси-, ді( $C_{1-2}$ -алкіл)амінокарбоніл- $C_{1-3}$ -алкілокси-, піролідін-1-ілкарбоніл- $C_{1-3}$ -алкілокси-, піперидин-1-ілкарбоніл- $C_{1-3}$ -алкілокси-, морфолін-4-ілкарбоніл- $C_{1-3}$ -алкілокси-, метилсульфанілметокси-, метилсульфінілметокси-, метилсульфонілметокси-,  $C_{3-6}$ -циклоалкілокси- або  $C_{3-6}$ -циклоалкіл- $C_{1-2}$ -алкілоксигрупу,

карбоксильну,  $C_{1-3}$ -алкілоксикарбонільну, карбокси- $C_{1-3}$ -алкільну,  $C_{1-3}$ -алкілоксикарбоніл- $C_{1-3}$ -алкільну, амінокарбонільну,  $C_{1-2}$ -алкіламінокарбонільну, ді( $C_{1-2}$ -алкіл)амінокарбонільну, морфолін-4-ілкарбонільну або ціаногрупу,

нітро-, аміно-,  $C_{1-2}$ -алкіламіно-, ді( $C_{1-2}$ -алкіл)аміно-, ціано- $C_{1-2}$ -алкіламіно-, [N-(ціано- $C_{1-2}$ -алкіл)-Nl- $C_{1-2}$ -алкіламіно]-,  $C_{1-2}$ -алкілоксикарбоніл- $C_{1-2}$ -алкіламіно-,  $C_{1-2}$ -алкілкарбоніламіно-,  $C_{1-2}$ -алкілоксикарбоніламіно-,  $C_{1-3}$ -алкілсульфоніламіно-, біс-( $C_{1-2}$ -алкілсульфоніл)аміно-, аміносульфоніламіно-,  $C_{1-2}$ -алкіламіносульфоніламіно-, ді( $C_{1-2}$ -алкіл)аміносульфоніламіно-морфолін-4-ілсульфоніламіно-, ( $C_{1-2}$ -алкіламіно)тіокарбоніламіно-, ( $C_{1-2}$ -алкілоксикарбоніламіно)карбоніламіно-, амінокар-

боніламіно-,  $C_{1-2}$ -алкіламінокарбоніламіно-, ді( $C_{1-2}$ -алкіл)амінокарбоніламіно- або морфолін-4-ілкарбоніламіногрупу,

2-оксоімідазолідин-1-ільну, 3-метил-2-оксоімідазолідин-1-ільну, 2,4-діоксоімідазолідин-1-ільну, 3-метил-2,4-діоксоімідазолідин-1-ільну, 2,5-діоксоімідазолідин-1-ільну, 3-метил-2,5-діоксоімідазолідин-1-ільну, 2-оксогексагідропіримідин-1-ільну або 3-метил-2-оксогексагідропіримідин-1-ільну групу,

або

$C_{1-2}$ -алкілсульфанільну,  $C_{1-2}$ -алкілсульфінільну,  $C_{1-2}$ -алкілсульфонільну, аміноссульфонільну,  $C_{1-2}$ -алкіламіноссульфонільну або ді( $C_{1-2}$ -алкіл)аміноссульфонільну групу,

а  $R^{11}$  та  $R^{12}$ , які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню, фтору, хлору або бром у

метильну, ціано, трифторметильну або метоксигрупу,

або  $R^{11}$  разом з  $R^{12}$ , якщо вони з'єднані на сусідніх атомах вуглецю, означають також метилендіокси-, дифторметилендіокси-, 1,3-пропіленову або 1,4-бутиленову групу,

феніл- $C_{1-3}$ -алкільну групу, в якій алкільна частина заміщена карбоксильною-,  $C_{1-2}$ -алкілоксикарбонільною, амінокарбонільною,  $C_{1-2}$ -алкіламінокарбонільною або ді( $C_{1-2}$ -алкіл)амінокарбонільною групою,

феніл- $C_{2-3}$ -алкенільну групу, причому фенільна частина може бути заміщена атомом фтору, хлору або бром у метильною, трифторметильною або метоксигрупою,

феніл- $(CH_2)_m$ -A- $(CH_2)_n$ -групу, в якій фенільна частина заміщена  $R^{10}$ - $R^{12}$ , причому  $R^{10}$ - $R^{12}$  мають наведені вище значення, а

A означає карбонільну, гідроксиімінометилєнову або  $C_{1-2}$ -алкілоксиімінометилєнову групу, m означає число 0 або 1, а n - число 1 або 2,

фенілкарбонілметильну групу, в якій фенільна частина заміщена  $R^{10}$ - $R^{12}$ , причому  $R^{10}$ - $R^{12}$  мають наведені вище значення, а метильна частина заміщена метильною або етильною групою,

фенілкарбонілметильну групу, в якій 2 сусідніх атоми водню -O-CH<sub>2</sub>-CO-NH-місточки замінені, причому зазначені вище місточки можуть бути заміщені однією або двома метильними групами,

феніл- $(CH_2)_m$ -B- $(CH_2)_n$ -групу, в якій фенільна частина заміщена  $R^{10}$ - $R^{12}$ , причому  $R^{10}$ - $R^{12}$ , m та n мають наведені вище значення, а

B означає метилєнову групу, заміщену гідрокси- або  $C_{1-2}$ -алкілоксигрупою та, в разі необхідності, додатково заміщена метильною групою,

нафтилметильну або нафтилєтильну групу, причому нафтилєна частина відповідно заміщена  $R^{10}$ - $R^{12}$ , причому  $R^{10}$ - $R^{12}$  мають наведені вище значення,

[1,4]нафтохінон-2-ільну, хромен-4-он-3-ільну або 1-оксоіндан-2-ільну групу,

гетероарил- $C_{1-3}$ -алкільну групу, причому гетероарил означає піролілну, імідазолільну, тριαзолільну, фуранільну, тієнілну, оксазолільну, ізоксазолільну, тіазолільну, ізотіазолільну, піридилну, піридазинільну, піримідинільну, піразинільну, індоільну, бензоімідазолільну, 2,3-дигідро-2-оксо-1Н-бензімідазолільну, індазолільну, бензофуранільну,

2,3-дигідробензофуранільну, бензоксазолільну, дигідро-2-оксобензоксазолільну, бензоізоксазолільну, бензотієфенільну, бензотіазолільну, бензоізоксохінолінілну, ізохінолінілну, 1,2-дигідро-2-оксоізохінолінілну, цинолінілну, хіназолінільну, 1,2-дигідро-2-оксохіназолінільну, 1,2-дигідро-1-оксофалазин-4-ільну, кумаринільну або 3,4-дигідро-3-оксо-2Н-бензо[1,4]оксазинільну групу,

причому згадані вище гетероарильні групи на атомах вуглецю можуть бути заміщені атомом фтору, хлору або бром у, метильною, трифторметильною, ціано, амінокарбонільною, аміноссульфоеильною, метилсульфонільною, нітро-, аміно-, ацетиламіно-, метилсульфоніламіно-, метокси-, дифторметокси або трифторметоксигрупою, а іміногрупи згаданих вище гетероарильних груп можуть бути заміщені метильною або етильною групами,

фураніл-A-CH<sub>2</sub>-, тієніл-A-CH<sub>2</sub>-, тіазоліл-A-CH<sub>2</sub>- або піридил-A-CH<sub>2</sub>-групу, причому A має наведене вище значення,

фураніл-B-CH<sub>2</sub>-, тієніл-B-CH<sub>2</sub>-, тіазоліл-B-CH<sub>2</sub>- або піридил-B-CH<sub>2</sub>-групу, причому B має наведене вище значення,

$C_{1-3}$ -алкіл-A- $(CH_2)_n$ -групу, причому A та n мають наведені вище значення,

$C_{3-6}$ -циклоалкіл- $(CH_2)_m$ -A- $(CH_2)_n$ -групу, причому A, m та n мають наведені вище значення,

$C_{3-6}$ -циклоалкіл- $(CH_2)_m$ -B- $(CH_2)_n$ -групу, причому B, m та n мають наведені вище значення,

$R^{21}$ -A- $(CH_2)_n$ -групу, в якій  $R^{21}$  означає  $C_{1-2}$ -алкілоксикарбонільну, амінокарбонільну,  $C_{1-2}$ -алкіламінокарбонільну, ді( $C_{1-2}$ -алкіл)амінокарбонільну, піролідин-1-ілкарбонільну, піперидин-1-ілкарбонільну або морфолін-4-ілкарбонільну групу, а A та n мають наведені вище значення,

феніл-D- $C_{1-3}$ -алкільну групу, в якій фенільна частина, в разі необхідності, заміщена атомом фтору, хлору або бром у, метильною, трифторметильною або метокси групою, а D означає атом кисню або сірки, сульфінільну або сульфонільну групу,

$C_{1-4}$ -алькільну групу, заміщену групою  $R_a$ , причому

$R_a$  означає ціано-, карбоксильну,  $C_{1-3}$ -алкілоксикарбонільну, амінокарбонільну,  $C_{1-2}$ -алкіламінокарбонільну, ді( $C_{1-2}$ -алкіл)амінокарбонільну, піролідин-1-ілкарбонільну, піперидин-1-ілкарбонільну або морфолін-4-ілкарбонільну групу,

$C_{2-4}$ -алкільну групу заміщену групою  $R_b$ , причому

$R_b$  означає гідроксильну,  $C_{1-3}$ -алкілокси-, аміно-,  $C_{1-3}$ -алкіламіно-, ді( $C_{1-3}$ -алкіл)аміно-, піролідин-1-ільну, піперидин-1-ільну, морфолін-4-ільну, піперазин-1-ільну, 4-метилпіперазин-1-ільну або 4-етилпіперазин-1-ільну групу і у положенні 1 ксантинового скелету ізольована щонайменше 2 атомами вуглецю від атома кільцевого азоту,

або аміно- або бензоіламіногрупу,

$R^2$  означає атом водню,

$C_{1-6}$ -алкільну групу,

$C_{2-4}$ -алкенільну групу,

$C_{3-4}$ -алкінілну групу,

С<sub>3-6</sub>-циклоалкільну групу,  
 С<sub>3-6</sub>-циклоалкіл-С<sub>1-3</sub>-алкільну групу,  
 тетрагідрофуран-3-ільну, тетрагідропіран-3-ільну, тетрагідропіран-4-ільну, тетрагідрофуранілметильну або тетрагідропіранілметильну групу,  
 фенільну групу, яка, в разі необхідності, може бути заміщена атомом фтору, хлору або броду або метильною, трифторметильною, гідрокси-, метокси-, дифторметокси- або феніл-С<sub>1-4</sub>-алкільною групою, в якій фенільна частина, в разі необхідності, заміщена, атомом фтору, хлору або броду, метил-, трифторметил-, диметиламіно-, гідрокси-, метокси-, дифторметокси- або трифторметоксигрупою,

феніл-С<sub>2-3</sub>-алкенільну груп, причому фенільна частина може бути заміщена атомом фтору, хлору або броду або метильною, трифторметильною або метоксигрупою,

фенілкарбоніл-С<sub>1-2</sub>-алкільну групу, в якій фенільна частина, в разі необхідності, заміщена атомом фтору, хлору або броду, метильною, трифторметильною, гідрокси-, метокси-, дифторметокси- або трифторметоксигрупою,

гетероарил-С<sub>1-3</sub>-алкільну групу, причому гетероарил має наведені вище значення,

фуранілкарбонілметильну, тіенілкарбонілметильну, тіазолілкарбонілметильну або піридилкарбонілметильну групу,

С<sub>1-4</sub>-алкілкарбоніл-С<sub>1-2</sub>-алкільну групу,

С<sub>3-6</sub>-циклоалкілкарбоніл-С<sub>1-2</sub>-алкільну групу,

феніл-D-С<sub>1-3</sub>-алкільну групу, в якій фенільна частина, в разі необхідності, заміщена атомом фтору, хлору або броду, метильною, трифторметильною, гідрокси-, метокси-, дифторметокси- або трифторметоксигрупою, а D має наведене вище значення, або

С<sub>1-4</sub>-алкільну групу, заміщену групою R<sub>a</sub>, причому R<sub>a</sub> має наведене вище значення, або

С<sub>2-4</sub>-алкільну групу, заміщену групою R<sub>b</sub>, причому R<sub>b</sub> має наведене вище значення та у положенні 3 ксантинового скелету ізольована щонайменше 2 атомами вуглецю від атому кільцевого азоту,

R<sup>3</sup> означає С<sub>1-3</sub>-алкільну групу, заміщену групою R<sub>c</sub>, причому

R<sub>c</sub> означає заміщену, в разі необхідності, однією або двома С<sub>1-3</sub>-алкільними групами С<sub>3-7</sub>-циклоалкільну групу,

заміщену, в разі необхідності, однією або двома С<sub>1-3</sub>-алкільними групами С<sub>5-7</sub>-циклоалкенільну групу або

арильну групу або

фуранільну, тіенільну, оксазолільну, ізоксазолільну, тіазолільну, ізотіазолільну, піридилільну, піридазинільну, піримідилільну або піразинільну групу, причому згадані вище гетероциклічні залишки можуть бути заміщені відповідно однією або двома С<sub>1-3</sub>-алкільними групами або атомом фтору, хлору, броду або йоду або однією трифторметильною, ціано- або С<sub>1-3</sub>-алкілоксигрупою,

С<sub>3-8</sub>-алкенільну групу,

С<sub>3-6</sub>-алкенільну групу, заміщену атомом фтору, хлору або броду або трифторметильною групою,

С<sub>3-8</sub>-алкінільну групу,

арильну групу або

арил-С<sub>2-4</sub>-алкенільну групу,

a

R<sup>4</sup> означає ацетидин-1-ільну або піролідін-1-ільну групу, яка в положенні 3 заміщена групою R<sub>e</sub>NR<sub>d</sub>, та додатково може бути заміщена однією або двома С<sub>1-3</sub>-алкільними групами, причому

R<sub>e</sub> означає атом водню або С<sub>1-3</sub>-алкільну групу та

R<sub>d</sub> означає атом водню або С<sub>1-3</sub>-алкільну групу,

піперидин-1-ільну або гексагідроацепін-1-ільну групу, яка в положенні 3 або 4 заміщена R<sub>e</sub>NR<sub>d</sub>-групою та додатково може бути заміщена однією або двома С<sub>1-3</sub>-алкільними групами, причому R<sub>e</sub> та R<sub>d</sub> мають наведені вище значення,

3-амінопіперидин-1-ільну групу, в якій піперидин-1-ільну частина додатково заміщена амінокарбонільною, С<sub>1-2</sub>-алкіламінокарбонільною, ді(С<sub>1-2</sub>-алкіл)амінокарбонільною, піролідін-1-ілкарбонільною, (2-ціанпіролідін-1-іл)карбонільною, тіазолідін-3-ілкарбонільною, (4-ціанотіазолідін-3-іл)карбонільною, піперидин-1-ілкарбонільною або морфолін-4-ілкарбонільною групою,

3-амінопіперидин-1-ільну групу, в якій піперидин-1-ільна частина в положенні 4 або 5 додатково заміщена гідрокси- або метоксигрупою,

3-аміно-піперидин-1-ільну групу, в якій метиленова група в положенні 2 або 6 замінена карбонільною групою,

піперидин-1-ільну або гексагідроацепін-1-ільну групи, які в положенні 3 заміщені аміно-, С<sub>1-3</sub>-алкіламіно- або ді(С<sub>1-3</sub>-алкіл)аміногрупою, в яких відповідно 2 атоми водню на вуглецевому скелеті піперидин-1-ільної або гексагідроацепін-1-ільної групи замінені на нерозгалужені алкіленові місточки, причому атоми водню знаходяться на тому ж атомі вуглецю, або містять 1-4 атоми вуглецю, якщо атоми водню знаходяться на сусідніх атомах вуглецю, або містять 1-4 атоми вуглецю, якщо атоми водню знаходяться на атомах вуглецю, які розділені одним атомом, або 1-3 атоми вуглецю, якщо 2 атоми водню знаходяться на атомах вуглецю, розділених двома атомами,

ацетидин-1-ільну, піролідін-1-ільну, піперидин-1-ільну або гексагідроацепін-1-ільну групу, заміщену аміно-С<sub>1-3</sub>-алкільною, С<sub>1-3</sub>-алкіламіно-С<sub>1-3</sub>-алкільною або ді(С<sub>1-3</sub>-алкіл)аміно-С<sub>1-3</sub>-алкільною групою,

3-імінопіперазин-1-ільну, 3-іміно[1,4]діацепан-1-ільну або 5-іміно[1,4]діацепан-1-ільну групу, в разі необхідності заміщену на вуглецевому скелеті однією або двома С<sub>1-3</sub>-алкільними групами,

[1,4]діацепан-1-ільну групу, заміщену, в разі необхідності, однією або двома С<sub>1-3</sub>-алкільними групами, яка в положенні 6 заміщена аміногрупою,

С<sub>3-7</sub>-циклоалкільну групу, заміщену аміно-, С<sub>1-3</sub>-алкіламіно- або ді(С<sub>1-3</sub>-алкіл)аміногрупою,

С<sub>3-7</sub>-циклоалкільну групу, заміщену аміно-С<sub>1-3</sub>-алкільною, С<sub>1-3</sub>-алкіламіно-С<sub>1-3</sub>-алкільною або ді(С<sub>1-3</sub>-алкіл)аміно-С<sub>1-3</sub>-алкільною групою,

С<sub>3-7</sub>-циклоалкіл-С<sub>1-2</sub>-алкільну групу, в якій циклоалкільна частина заміщена аміно-, С<sub>1-3</sub>-алкіламіно- або ді(С<sub>1-3</sub>-алкіл)аміногрупою,

С<sub>3-7</sub>-циклоалкіл-С<sub>1-2</sub>-алкільну групу, в якій циклоалкільна частина заміщена аміно-С<sub>1-3</sub>-

алкільною,  $C_{1-3}$ -алкіламіно- $C_{1-3}$ -алкільною або ді( $C_{1-3}$ -алкіл)аміно- $C_{1-3}$ -алкільною групою,

$C_{3-7}$ -циклоалкіламіногрупу, в якій циклоалкільна частина заміщена аміно-,  $C_{1-3}$ -алкіламіно- або ді( $C_{1-3}$ -алкіл)аміногрупою, причому обидва атоми азоту у циклоалкільній частині відокремлені один від одного щонайменше двома атомами вуглецю,

N-( $C_{3-7}$ -циклоалкіл)-N-( $C_{1-3}$ -алкіл)аміногрупу, в якій циклоалкільна частина заміщена аміно-,  $C_{1-3}$ -алкіламіно- або ді( $C_{1-3}$ -алкіл)аміногрупою, причому обидва атоми азоту у циклоалкільній частині відокремлені один від одного щонайменше двома атомами вуглецю,

$C_{3-7}$ -циклоалкіламіногрупу, в якій циклоалкільна частина заміщена аміно- $C_{1-3}$ -алкільною,  $C_{1-3}$ -алкіламіно- $C_{1-3}$ -алкільною або ді( $C_{1-3}$ -алкіл)аміно- $C_{1-3}$ -алкільною групою,

N-( $C_{3-7}$ -циклоалкіл)-N-( $C_{1-3}$ -алкіл)аміногрупу, в якій циклоалкільна частина заміщена аміно-,  $C_{1-3}$ -алкільною,  $C_{1-3}$ -алкіламіно- $C_{1-3}$ -алкільною або ді( $C_{1-3}$ -алкіл)аміно- $C_{1-3}$ -алкільною групою,

$C_{3-7}$ -циклоалкіл- $C_{1-2}$ -алкіламіногрупу, в якій циклоалкільна частина заміщена аміно-,  $C_{1-3}$ -алкіламіно- або ді( $C_{1-3}$ -алкіл)аміногрупою,

N-( $C_{3-7}$ -циклоалкіл- $C_{1-2}$ -алкіл)-N-( $C_{1-2}$ -алкіл)аміногрупу, в якій циклоалкільна частина заміщена аміно-,  $C_{1-3}$ -алкіламіно- або ді( $C_{1-3}$ -алкіл)аміногрупою,

$C_{3-7}$ -циклоалкіл- $C_{1-2}$ -алкіламіногрупу, в якій циклоалкільна частина заміщена аміно- $C_{1-3}$ -алкільною,  $C_{1-3}$ -алкіламіно- $C_{1-3}$ -алкільною або ді( $C_{1-3}$ -алкіл)аміно- $C_{1-3}$ -алкільною групою,

N-( $C_{3-7}$ -циклоалкіл- $C_{1-2}$ -алкіл)-N-( $C_{1-2}$ -алкіл)аміногрупу, в якій циклоалкільна частина може бути заміщена аміно- $C_{1-3}$ -алкільною,  $C_{1-3}$ -алкіламіно- $C_{1-3}$ -алкільною або ді( $C_{1-3}$ -алкіл)аміногрупою, заміщеною залишками  $R^{15}$  та  $R^{16}$ , в якій

$R^{15}$  означає  $C_{1-3}$ -алкільну групу, а

$R^{16}$  означає  $R^{17}$ - $C_{2-3}$ -алкілбну групу, причому  $C_{2-3}$ -алкільна частина є нерозгалуженою та може бути заміщена 1-4  $C_{1-3}$ -алкільними групами, які можуть бути однаковими або різними, або може бути заміщена амінокарбонільною,  $C_{1-2}$ -алкіламінокарбонільною, ді( $C_{1-2}$ -алкіл)амінокарбонільною, піролідін-1-ілкарбонільною, (2-ціанпіролідін-1-іл)карбонільною, тiazолідін-3-ілкарбонільною, (4-ціанотiazолідін-3-іл)карбонільною, піперидин-1-ілкарбонільною або морфолін-4-ілкарбонільною групою, а

$R^{17}$  означає аміно-,  $C_{1-3}$ -алкіламіно- або ді( $C_{1-3}$ -алкіл)аміногрупу, аміногрупу, заміщену залишком  $R^{20}$ , в якій

$R^{20}$  означає ацетидин-3-ільну, ацетиди n-2-ілметильну, ацетидин-3-ілметильну, піролідін-3-ільну, піролідін-2-ілметильну, піролідін-3-ілметильну, піперидин-3-ільну, піперидин-4-ільну, піперидин-2-ілметильну, піперидин-3-ілметильну або піперидин-4-ілметильну групу, причому залишки  $R^{20}$  відповідно можуть бути заміщені однією або двома  $C_{1-3}$ -алкільними групами,

аміногрупу, заміщену залишками  $R^{15}$  та  $R^{20}$ , в якій

$R^{15}$  та  $R^{20}$  мають наведені вище значення, причому залишки  $R^{20}$  відповідно можуть бути заміщені однією або двома  $C_{1-3}$ -алкільними групами,

$R^{19}$ - $C_{3-4}$ -алкільну групу, в якій  $C_{3-4}$ -алкільна частина є нерозгалуженою та може бути заміщена залишком  $R^{15}$  і додатково заміщена однією або двома  $C_{1-3}$ -алкільними групами, причому  $R^{15}$  має зазначене вище значення, а  $R^{19}$  означає аміно-,  $C_{1-3}$ -алкіламіно- або ді( $C_{1-3}$ -алкіл)аміногрупу,

3-аміно-2-оксопіперидин-5-ільну або 3-аміно-2-оксо-1-метилпіперидин-5-ільну групу,

піролідін-3-ільну, піперидин-3-ільну, піперидин-4-ільну, гексагідроацепін-3-ільну або гексагідроацепін-4-ільну групу, яка в положенні 1 заміщена аміно-,  $C_{1-3}$ -алкіламіно- або ді( $C_{1-3}$ -алкіл)аміногрупою,

або ацетидин-2-іл- $C_{1-2}$ -алкільну, ацетидин-3-іл- $C_{1-2}$ -алкільну, піролідін-2-іл- $C_{1-2}$ -алкільну, піролідін-3-ільну, піролідін-3-іл- $C_{1-2}$ -алкільну, піперидин-2-іл- $C_{1-2}$ -алкільну, піперидин-3-ільну, піперидин-3-іл- $C_{1-2}$ -алкільну, піперидин-4-ільну або піперидин-4-іл- $C_{1-2}$ -алкільну групу, причому згадані вище групи відповідно можуть бути заміщені однією або двома  $C_{1-3}$ -алкільними групами,

причому згадані при визначенні зазначених вище залишків алкільні групи означають фенільну або нафтильну групи, які незалежно одна від одної можуть бути моно- або дизаміщені  $R_h$ , причому замісники можуть бути однаковими або різними, а  $R_h$  означає атом фтору, хлору, бромово або йоду, трифторметильну, ціано-, нітро-, аміно-,  $C_{1-3}$ -алкільну, циклопропильну, етенільну, етинільну, гідрокси-,  $C_{1-3}$ -алкілокси-, дифторметокси- або трифторметоксигрупу, та

причому, якщо не зазначено нічого іншого, згадані вище алкільна і алкенільна групи можуть бути нерозгалуженими або розгалуженими,

їх таутомери, енантіомери, діастереомери, їх суміші та солі.

Третя підгрупа, про яку слід окремо згадати, стосується тих сполук загальної формули I, в яких  $R^1$ ,  $R^2$  та  $R^3$  мають зазначені вище значення, а

$R^4$  означає ацетидин-1-ільну або піролідін-1-ільну групу, яка в положенні 3 заміщена  $R_eNR_d$ -групою та додатково може бути заміщена однією або двома  $C_{1-3}$ -алкільними групами, причому

$R_e$  означає атом водню або  $C_{1-3}$ -алкільну групу, а

$R_d$  означає атом водню або  $C_{1-3}$ -алкільну групу,

піперидин-1-ільну або гексагідроацепін-1-ільну групу, яка в положенні 3 або 4 заміщена  $R_eNR_d$ -групою та додатково може бути заміщена однією або двома  $C_{1-3}$ -алкільними групами, причому  $R_e$  та  $R_d$  мають наведені вище значення,

3-амінопіперидин-1-ільну групу, в якій піперидин-1-ільна частина додатково заміщена амінокарбонільною,  $C_{1-2}$ -алкіламінокарбонільною, ді( $C_{1-2}$ -алкіл)амінокарбонільною, піролідін-1-ілкарбонільною, (2-ціанпіролідін-1-іл)карбонільною, тiazолідін-3-ілкарбонільною, (4-ціанотiazолідін-3-іл)карбонільною, піперидин-1-ілкарбонільною або морфолін-4-ілкарбонільною групою,

3-амінопіперидин-1-ільну групу, в якій піперидин-1-ільна частина в положенні 4 або 5 додатково заміщена гідрокси- або метоксигрупою,

3-аміно-піперидин-1-ільну групу, в якій метиленова частина в положенні 2 або 6 замінена карбонільною групою,

піперидин-1-ільну або гексагідроацепін-1-ільну групу, заміщену в положенні 3-аміно-,  $C_{1-3}$ -алкіламіно- або  $di(C_{1-3}\text{-алкіл})$ аміногрупою, в якій 2 атоми водню на вуглецевому скелеті піперидин-1-ільної або гексагідроацепін-1-ільної групи відповідно замінені нерозгалуженим алкіленовим містком, якщо атоми водню знаходяться на тому ж самому атомі вуглецю, або містить 1-4 атоми вуглецю, якщо атоми водню знаходяться на сусідніх атомах вуглецю, або 1-4 атоми вуглецю, якщо атоми водню знаходяться на атомах вуглецю, розділених одним атомом, або 1-3 атоми вуглецю, якщо 2 атоми водню знаходяться на атомах вуглецю, розділених 2 атомами,

ацетидин-1-ільну, піролідін-1-ільну, піперидин-1-ільну або гексагідроацепін-1-ільну групу, заміщену аміно- $C_{1-3}$ -алкільною,  $C_{1-3}$ -алкіламіно- $C_{1-3}$ -алкільною або  $di(C_{1-3}\text{-алкіл})$ аміно- $C_{1-3}$ -алкільною групою,

$C_{3-7}$ -циклоалкільну групу, заміщену аміно-,  $C_{1-3}$ -алкіламіно- або  $di(C_{1-3}\text{-алкіл})$ аміногрупою,

$C_{3-7}$ -циклоалкільну групу, заміщену аміно- $C_{1-3}$ -алкільною,  $C_{1-3}$ -алкіламіно- $C_{1-3}$ -алкільною або  $di(C_{1-3}\text{-алкіл})$ аміно- $C_{1-3}$ -алкільною групою,

$C_{3-7}$ -циклоалкіл- $C_{1-2}$ -алкільну групу, в якій циклоалкільна частина заміщена аміно-,  $C_{1-3}$ -алкіламіно- або  $di(C_{1-3}\text{-алкіл})$ аміногрупою,

$C_{3-7}$ -циклоалкіл- $C_{1-2}$ -алкільну групу, в якій циклоалкільна частина заміщена аміно- $C_{1-3}$ -алкільною,  $C_{1-3}$ -алкіламіно- $C_{1-3}$ -алкільною або  $di(C_{1-3}\text{-алкіл})$ аміно- $C_{1-3}$ -алкільною групою,

$C_{3-7}$ -циклоалкіламіногрупу, в якій циклоалкільна частина заміщена аміно-,  $C_{1-3}$ -алкіламіно- або  $di(C_{1-3}\text{-алкіл})$ аміногрупою, причому обидва атоми азоту у циклоалкільній частині відокремлені один від одного щонайменше двома атомами вуглецю,

$N-(C_{3-7}\text{-циклоалкіл})-N-(C_{1-3}\text{-алкіл})$ аміногрупу, в якій циклоалкільна частина заміщена аміно-,  $C_{1-3}$ -алкіламіно- або  $di(C_{1-3}\text{-алкіл})$ аміногрупою, причому обидва атоми азоту у циклоалкільній частині відокремлені один від одного щонайменше двома атомами вуглецю,

$C_{3-7}$ -циклоалкіламіногрупу, в якій циклоалкільна частина заміщена аміно- $C_{1-3}$ -алкільною,  $C_{1-3}$ -алкіламіно- $C_{1-3}$ -алкільною або  $di(C_{1-3}\text{-алкіл})$ аміно- $C_{1-3}$ -алкільною групою,

$N-(C_{3-7}\text{-циклоалкіл})-N-(C_{1-3}\text{-алкіл})$ аміногрупу, в якій циклоалкільна частина заміщена аміно-,  $C_{1-3}$ -алкільною,  $C_{1-3}$ -алкіламіно- $C_{1-3}$ -алкільною або  $di(C_{1-3}\text{-алкіл})$ аміно- $C_{1-3}$ -алкільною групою,

$C_{3-7}$ -циклоалкіл- $C_{1-2}$ -алкіламіногрупу, в якій циклоалкільна частина заміщена аміно-,  $C_{1-3}$ -алкіламіно- або  $di(C_{1-3}\text{-алкіл})$ аміногрупою,

$N-(C_{3-7}\text{-циклоалкіл})-(C_{1-2}\text{-алкіл})-N-(C_{1-2}\text{-алкіл})$ аміногрупу, в якій циклоалкільна частина заміщена аміно-,  $C_{1-3}$ -алкіламіно- або  $di(C_{1-3}\text{-алкіл})$ аміногрупою,

$C_{3-7}$ -циклоалкіл- $C_{1-2}$ -алкіламіногрупу, в якій циклоалкільна частина заміщена аміно- $C_{1-3}$ -

алкільною,  $C_{1-3}$ -алкіламіно- $C_{1-3}$ -алкільною або  $di(C_{1-3}\text{-алкіл})$ аміно- $C_{1-3}$ -алкільною групою.

$N-(C_{3-7}\text{-циклоалкіл}-C_{1-2}\text{-алкіл})-N-(C_{1-2}\text{-алкіл})$ аміногрупу, в якій циклоалкільна частина заміщена аміно- $C_{1-3}$ -алкільною,  $C_{1-3}$ -алкіламіно- $C_{1-3}$ -алкільною або  $di(C_{1-3}\text{-алкіл})$ аміно- $C_{1-3}$ -алкілною групою,

аміногрупа, заміщена залишками  $R^{15}$  та  $R^{16}$ , в якій

$R^{15}$  означає  $C_{1-4}$ -алкільну групу, а

$R^{16}$  означає  $R^{17}$ - $C_{2-3}$ -алкільну групу, причому  $C_{2-3}$ -алкільна частина є нерозгалуженою та може бути заміщена амінокарбонільною,  $C_{1-2}$ -алкіламінокарбонільною,  $di(C_{1-2}\text{-алкіл})$ амінокарбонільною, піролідін-1-ілкарбонільною, (2-ціан-піролідін-1-іл)карбонільною, тіазолідін-3-ілкарбонільною, (4-ціан-тіазолідін-3-іл)карбонільною, піперидин-1-ілкарбонільною або морфолін-4-ілкарбонільною групою, а

$R^{17}$  означає аміно-,  $C_{1-3}$ -алкіламіно- або  $di(C_{1-3}\text{-алкіл})$ аміногрупу, аміногрупу, заміщену залишком  $R^{20}$ , в якій

$R^{20}$  означає ацетидин-3-ільну, ацетидин-2-ілметильну, ацетидин-3-ілметильну, піролідін-3-ільну, піролідін-2-ілметильну, піролідін-3-ілметильну, піперидин-3-ільну, піперидин-4-ільну, піперидин-2-ілметильну, піперидин-3-ілметильну або піперидин-4-ілметильну групу, причому наведені для  $R^{20}$  залишки можуть бути відповідно заміщені однією або двома  $C_{1-3}$ -алкільними групами, аміногрупа, заміщена залишками  $R^{15}$  та  $R^{20}$ , в якій

$R^{15}$  та  $R^{20}$  мають зазначені вище значення, причому наведені для  $R^{20}$  залишки можуть бути відповідно заміщені одним або двома  $C_{1-3}$ -алкільними групами,

$R^{19}$ - $C_{3-4}$ -алкільну групу, в якій  $C_{3-4}$ -алкільна частина є нерозгалуженою і може бути заміщена залишком  $R^{15}$  та додатково може бути заміщена однією або двома  $C_{1-3}$ -алкільними групами, причому  $R^{15}$  має наведене вище значення, а  $R^{19}$  означає аміно-,  $C_{1-3}$ -алкіламіно- або  $di(C_{1-3}\text{-алкіл})$ аміногрупу,

3-аміно-2-оксопіперидин-5-ільну або 3-аміно-2-оксо-1-метилпіперидин-5-ільну групу,

піролідін-3-ільну, піперидин-3-ільну, піперидин-4-ільну, гексагідроацепін-3-ільну або гексагідроацепін-4-ільну групу, яка у положенні 1 заміщена аміно-,  $C_{1-3}$ -алкіламіно- або  $di(C_{1-3}\text{-алкіл})$ аміногрупою,

або ацетидин-2-іл- $C_{1-2}$ -алкільну, ацетидин-3-іл- $C_{1-2}$ -алкільну, піролідін-2-іл- $C_{1-2}$ -алкільну, піролідін-3-ільну, піролідін-3-іл- $C_{1-2}$ -алкільну, піперидин-2-іл- $C_{1-2}$ -алкільну, піперидин-3-ільну, піперидин-3-іл- $C_{1-2}$ -алкільну, піперидин-4-ільну або піперидин-4-іл- $C_{1-2}$ -алкільну групу, причому згадані вище групи можуть бути заміщені відповідно однією або двома  $C_{1-3}$ -алкільними групами,

їх таутомери, енантіомери, діастереомери, їх суміші та солі.

Переважаючими сполуками загальної формули I є такі сполуки, в яких

$R^1$  означає атом водню,

$C_{1-6}$ -алкільну групу,

$C_{3-6}$ -алкенільну групу,

С<sub>3-4</sub>-алкенільну групу, заміщену С<sub>1-2</sub>-алкілоксикарбонільною групою,

С<sub>3-6</sub>-алкінільну групу,

С<sub>3-7</sub>-циклоалкіл-С<sub>1-3</sub>-алкільну групу,

фенільну групу, яка може бути заміщена атомом фтору, хлору або бромом або метильною, трифторметильною, гідрокси- або метоксигрупою,

феніл-С<sub>1-4</sub>-алкільну групу, в якій фенільна частина заміщена R<sup>10</sup>-R<sup>12</sup>, причому

R<sup>10</sup> означає атом водню, атом фтору, хлору або бромом,

С<sub>1-4</sub>-алкільну, трифторметильну, гідроксиметильну, С<sub>3-6</sub>-циклоалкільну, етинільну або фенільну групу,

гідрокси-, С<sub>1-4</sub>-алкілокси-, дифторметокси-, трифторметокси-, 2,2,2-трифторетокси-, фенокси-, бензилокси-, 2-пропен-1-ілокси-, 2-пропін-1-ілокси-, ціан-С<sub>1-2</sub>-алкілокси-, С<sub>1-2</sub>-алкілсульфонілокси-, фенілсульфонілокси-, карбокси-С<sub>1-3</sub>-алкілокси-, С<sub>1-3</sub>-алкілоксикарбоніл-С<sub>1-3</sub>-алкілокси-, амінокарбоніл-С<sub>1-3</sub>-алкілокси-, С<sub>1-2</sub>-алкіламінокарбоніл-С<sub>1-3</sub>-алкілокси-, ді(С<sub>1-2</sub>-алкіл)амінокарбоніл-С<sub>1-3</sub>-алкілокси-, піролідін-1-ілкарбоніл-С<sub>1-3</sub>-алкілокси-, піперидин-1-ілкарбоніл-С<sub>1-3</sub>-алкілокси-, морфолін-4-ілкарбоніл-С<sub>1-3</sub>-алкілокси-, метилсульфанілметокси-, метилсульфінілметокси-, метилсульфонілметокси-, С<sub>3-6</sub>-циклоалкілокси- або С<sub>3-6</sub>-циклоалкіл-С<sub>1-2</sub>-алкілоксигрупу,

карбокси-, С<sub>1-3</sub>-алкілоксикарбонільну, карбокси-С<sub>1-3</sub>-алкільну, С<sub>1-3</sub>-алкілоксикарбоніл-С<sub>1-3</sub>-алкільну, амінокарбонільну, С<sub>1-3</sub>-алкіламінокарбонільну, ді(С<sub>1-2</sub>-алкіл)амінокарбонільну, морфолін-4-ілкарбонільну або ціаногрупу,

нітро-, аміно-, С<sub>1-2</sub>-алкіламіно-, ді(С<sub>1-2</sub>-алкіл)аміно-, ціан-С<sub>1-2</sub>-алкіламіно-, [N-(ціан-С<sub>1-2</sub>-алкіл)-N-С<sub>1-2</sub>-алкіламіно]-, С<sub>1-2</sub>-алкілоксикарбоніл-С<sub>1-2</sub>-алкіламіно-, С<sub>1-2</sub>-алкілкарбоніламіно-, С<sub>1-2</sub>-алкілоксикарбоніламіно-, С<sub>1-3</sub>-алкілсульфоніламіно-, біс-(С<sub>1-2</sub>-алкілсульфоніл)аміно-, аміносальфоніламіно-, С<sub>1-2</sub>-алкіламіносальфоніламіно-, ді(С<sub>1-2</sub>-алкіл)аміносальфоніламіно-, морфолін-4-ілсульфоніламіно-, (С<sub>1-2</sub>-алкіламіно)тіокарбоніламіно-, (С<sub>1-2</sub>-алкілоксикарбоніламіно)карбоніламіно-, амінокарбоніламіно-, С<sub>1-2</sub>-алкіламінокарбоніламіно-, ді(С<sub>1-2</sub>-алкіл)амінокарбоніламіно- або морфолін-4-ілкарбоніламіногрупу,

2-оксоімідазолідін-1-ільну, 3-метил-2-оксоімідазолідін-1-ільну, 2,4-діоксанімідазолідін-1-ільну, 3-метил-2,4-діоксанімідазолідін-1-ільну, 2,5-діоксанімідазолідін-1-ільну, 3-метил-2,5-діоксанімідазолідін-1-ільну, 2-оксогексагідропіримідін-1-ільну або 3-метил-2-оксогексагідропіримідін-1-ільну групу,

або

С<sub>1-2</sub>-алкілсульфанільну, С<sub>1-2</sub>-алкілсульфонільну, аміносальфонільну, С<sub>1-2</sub>-алкіламіносальфонільну або ді(С<sub>1-2</sub>-алкіл)аміносальфонільну групу,

а R<sup>11</sup> та R<sup>12</sup>, які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню, атом фтору, хлору або бромом або

метильну, ціано-, трифторметильну або метоксигрупу,

або, R<sup>11</sup> разом з R<sup>12</sup>, якщо вони з'єднані на сусідніх атомах вуглецю, також означають метилendioкси-, дифторметилendioкси-, 1,3-пропіленову або 1,4-бутиленову групу,

феніл-С<sub>1-3</sub>-алкільну групу, в якій алкільна частина заміщена карбокси-, С<sub>1-2</sub>-алкілоксикарбонільною, амінокарбонільною, С<sub>1-2</sub>-алкіламінокарбонільною або ді(С<sub>1-2</sub>-алкіл)амінокарбонільною групою,

феніл-С<sub>2-3</sub>-алкенільну групу, причому фенільна частина може бути заміщена атомом фтору, хлору або бромом або метильною, трифторметильною або метоксигрупою,

феніл-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-A-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-групу, в якій фенільна частина заміщена R<sup>10</sup>-R<sup>12</sup>, причому R<sup>10</sup>-R<sup>12</sup> мають наведені вище значення, а

A означає карбонільну, гідроксиімінометилєнову або С<sub>1-2</sub>-алкілоксиімінометилєнову групу, m означає число 0 або 1, а n означає число 1 або 2,

фенілкарбонілметильну групу, в якій фенільна частина заміщена R<sup>10</sup>-R<sup>12</sup>, причому R<sup>10</sup>-R<sup>12</sup> мають наведені вище значення, а метильна частина заміщена метильною або етильною групою,

фенілкарбонілметильну групу, в якій 2 сусідні атоми водню фенільної частини замінені -O-CO-NH-, -NH-CO-NH-, -N=CH-NH-, -N=CH-O- або -O-CH<sub>2</sub>-CO-NH-місточком, причому згадані вище місця можуть бути заміщені однією або двома метильними групами,

феніл-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-B-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-групу, а в якій фенільна частина заміщена R<sup>10</sup>-R<sup>12</sup>, причому R<sup>10</sup>-R<sup>12</sup>, m та n мають наведені вище значення, а

B означає метилєнову групу, заміщену гідрокси- або С<sub>1-2</sub>-алкілоксигрупою та, в разі необхідності, додатково заміщену метильною групою,

нафтилметильну або нафтилєтильну групу, причому нафтильна частина відповідно заміщена R<sup>10</sup>-R<sup>12</sup>, причому R<sup>10</sup>-R<sup>12</sup> мають наведені вище значення,

[1,4]нафтохінон-2-ільну, хромен-4-он-3-ільну або 1-оксоіндан-2-ільну групу,

гетероарил-С<sub>1-3</sub>-алкільну групу, гетероарил означає піролільну, імідазолільну, триазолільну, фуранільну, тієнільну, оксазолільну, ізоксазолільну, тіазолільну, ізотіазолільну, піридинільну, піридазинільну, піримідинільну, піразинільну, індоільну, бензоімідазолільну, 2,3-дигідро-2-оксо-1Н-бензоімідазолільну, індазолільну, бензофуранільну, 2,3-дигідробензофуранільну, бензоксазолільну, дигідро-2-оксобензоксазолільну, бензоізоксазолільну, бензотієнільну, бензотіазолільну, бензоізоксазолільну, хінолінільну, 1,2-дигідро-2-оксохінолінільну, ізохінолінільну, 1,2-дигідро-1-оксо-ізохінолінільну, цінолінільну, хіназолінільну, 1,2-дигідро-2-оксохіназолінільну, 1,2-дигідро-1-оксофталазин-4-ільну, кумаринільну або 3,4-дигідро-3-оксо-2Н-бензо[1,4]оксазинільну групу,

причому згадані вище гетероарильні групи на атомах вуглецю можуть бути заміщені атомом фтору, хлору або бромом, метильною, трифторметильною, ціано-, амінокарбонільною, аміносальфонільною, метилсульфонільною, нітро-, аміно-, ацетиламіно-, метилсульфоніламіно-, метокси-, дифторметокси- або трифторметоксигрупою, а іміногрупи згаданих вище гетероарильних груп

можуть бути заміщені метильною або етильною групою,

фураніл-А-CH<sub>2</sub>-, тієніл-А-CH<sub>2</sub>-, тiazоліл-А-CH<sub>2</sub>- або піридил-А-CH<sub>2</sub>-групу, причому А має наведене вище значення,

фураніл-В-CH<sub>2</sub>-, тієніл-В-CH<sub>2</sub>-, тiazоліл-В-CH<sub>2</sub>- або піридил-В-CH<sub>2</sub>-групу, причому В має наведене вище значення,

C<sub>1-4</sub>-алкіл-А-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-групу, причому А та n мають наведене вище значення,

C<sub>3-6</sub>-циклоалкіл-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-А-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-групу, причому А, m та n мають наведене вище значення,

C<sub>3-6</sub>-циклоалкіл-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-В-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-групу, причому В, m та n мають наведене вище значення,

R<sup>21</sup>-А-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-групу, в якій R<sup>21</sup> означає C<sub>1-2</sub>-алкілоксикарбонільну, амінокарбонільну, C<sub>1-2</sub>-алкіламінокарбонільну, ді(C<sub>1-2</sub>-алкіл)амінокарбонільну, піролідін-1-ілкарбонільну, піперидин-1-ілкарбонільну або морфолін-4-ілкарбонільну групу, а А та n мають наведене вище значення,

феніл-D-C<sub>1-3</sub>-алкільну групу, в якій фенільна частина, в разі необхідності, заміщена атомом фтору, хлору або броду, метильною, трифторметильною або метоксигрупою, а D означає атом кисню або сірки, сульфінільну або сульфонільну або C<sub>1-4</sub>-алкільну групу, заміщену групою R<sub>a</sub>, причому

R<sub>a</sub> означає ціано-, карбокси-, C<sub>1-3</sub>-алкілоксикарбонільну, амінокарбонільну, C<sub>1-2</sub>-алкіламінокарбонільну, ді(C<sub>1-2</sub>-алкіл)амінокарбонільну, піролідін-1-ілкарбонільну, піперидин-1-ілкарбонільну або морфолін-4-ілкарбонільну групу,

C<sub>2-4</sub>-алкільну групу, заміщену групою R<sub>b</sub>, причому

R<sub>b</sub> означає гідрокси-, C<sub>1-3</sub>-алкілокси-, аміно-, C<sub>1-3</sub>-алкіламіно-, ді(C<sub>1-3</sub>-алкіл)аміно-, піролідін-1-ільну, піперидин-1-ільну, морфолін-4-ільну, піперазин-1-ільну, 4-метилпіперазин-1-ільну або 4-етилпіперазин-1-ільну групу та у положенні 1 ксантинового скелету ізольована від атому кільцевого азоту щонайменше двома атомами вуглецю,

або аміно- або бензоїламіногрупу,

R<sup>2</sup> означає атом водню,

C<sub>1-6</sub>-алкільну групу,

C<sub>2-4</sub>-алкенільну групу,

C<sub>3-4</sub>-алкінільну групу,

C<sub>3-6</sub>-циклоалкільну групу,

C<sub>3-6</sub>-циклоалкіл-C<sub>1-3</sub>-алкільну групу,

тетрагідрофуран-3-ільну, тетрагідропіран-3-ільну, тетрагідропіран-4-ільну, тетрагідрофуранілметильну або тетрагідропіранілметильну групу,

фенільну групу, яка, в разі необхідності, заміщена атомом фтору, хлору або броду або метильною, трифторметильною, гідрокси-, метокси-, дифторметокси- або трифторметоксигрупою,

феніл-C<sub>1-4</sub>-алкільну групу, в якій фенільна частина, в разі необхідності, заміщена атомом фтору, хлору або броду, метильною, трифторметильною, диметиламіно-, гідрокси-, метокси-, дифторметокси- або трифторметоксигрупою,

феніл-C<sub>2-3</sub>-алкенільну групу, причому фенільна частина може бути заміщена атомом фтору, хлору або броду або метильною, трифторметильною або метоксигрупою,

фенілкарбоніл-C<sub>1-2</sub>-алкільну групу, в якій фенільна частина, в разі необхідності, заміщена атомом фтору, хлору або броду, метильною, трифторметильною, гідрокси-, метокси-, дифторметокси- або трифторметоксигрупою,

гетероарил-C<sub>1-3</sub>-алкільну групу, причому гетероарил має наведене вище значення,

фуранілкарбонілметильну, тієнілкарбонілметильну, тiazолілкарбонілметильну або піридилкарбонілметильну групу,

C<sub>1-4</sub>-алкілкарбоніл-C<sub>1-2</sub>-алкільну групу,

C<sub>3-6</sub>-циклоалкілкарбоніл-C<sub>1-2</sub>-алкільну групу,

феніл-D-C<sub>1-3</sub>-алкільну групу, в якій фенільна частина, в разі необхідності, заміщена атомом фтору, хлору або броду, метильною, трифторметильною, гідрокси-, метокси-, дифторметокси- або трифторметоксигрупою, а D має наведене вище значення, або

C<sub>1-4</sub>-алкільну групу, заміщену групою R<sub>a</sub>, причому R<sub>a</sub> має наведене вище значення, або

C<sub>2-4</sub>-алкілбну групу, заміщену групою R<sub>b</sub>, причому R<sub>b</sub> має наведене вище значення та у положенні 3 ксантинового скелету ізольована від атому кільцевого азоту щонайменше двома атомами вуглецю,

R<sup>3</sup> означає C<sub>2-6</sub>-алкільну групу,

C<sub>3-7</sub>-алкенільну групу,

C<sub>3-5</sub>-алкенільну групу, заміщену атомом фтору, хлору або броду або трифторметильною групою,

C<sub>3-6</sub>-алкінільну групу,

C<sub>1-3</sub>-алкільну групу, заміщену групою R<sub>c</sub>, причому

R<sub>c</sub> означає C<sub>3-6</sub>-циклоалкільну групу, в разі необхідності, заміщену однією або двома метильними групами,

C<sub>5-6</sub>-циклоалкенільну групу, в разі необхідності, заміщену однією або двома метильними групами,

фенільну групу, в разі необхідності, заміщену атомом фтору, хлору, броду або йоду, метильною, трифторметильною, ціано-, нітро-, аміно-, гідрокси-, метокси-, дифторметокси-, або трифторметоксигрупою,

фенільну групу, заміщену двома атомами фтору,

нафтильну групу або

фуранільну, тієнільну, оксазолільну, ізоксазолільну, тiazолільну, ізотiazолільну або піридилну групу, в разі необхідності, заміщену метильною або трифторметильною групою,

фенільну групу, в разі необхідності, заміщену атомом фтору, хлору або броду, метильною, трифторметильною, ціано-, гідрокси-, метокси-, дифторметокси- або трифторметоксигрупою,

фенільну групу, яка заміщена двома метильними групами,

нафтильну групу

або феніл-C<sub>2-3</sub>-алкенільну групу,

а

R<sup>4</sup> означає піролідін-1-ільну групу, яка в положенні 3 заміщена аміно-, метиламіно- або диметиламіногрупою,

ацетидин-1-ільну групу, заміщену амінометильною групою,

піролідін-1-ільну групу, заміщену амінометильною групою,



піперидин-1-ільну групу, яка в положенні 3 або 4 заміщена аміно-, метиламіно-, диметиламіно- або [(2-ціанпіролідін-1-іл)карбонілметил]аміногрупою, причому піперидин-1-ільна частина додатково може бути заміщена метильною або етильною групою,

3-амінопіперидин-1-ільну групу, в якій піперидин-1-ільна частина додатково заміщена амінокарбонільною,  $C_{1-2}$ -алкіламінокарбонільною, ді( $C_{1-2}$ -алкіл)амінокарбонільною, піролідін-1-ілкарбонільною, {2-ціанпіролідін-1-іл)карбонільною, тіазолідін-3-ілкарбонільною, (4-ціанотіазолідін-3-іл)карбонільною, піперидин-1-ілкарбонільною або морфолін-4-ілкарбонільною групою,

3-амінопіперидин-1-ільну групу, в якій піперидин-1-ільна частина в положенні 4 або 5 додатково заміщена гідрокси- або метоксигрупою,

3-амінопіперидин-1-ільну групу, в якій метильна група в положенні 2 або 6 замінена карбонільною групою,

3-амінопіперидин-1-ільну групу, в якій атом водню в положенні 2 разом з атомом водню в положенні 5 замінений  $-CH_2-CH_2-$ місточком,

3-амінопіперидин-1-ільну групу, в якій атом водню в положенні 2 разом з атомом водню в положенні 6 замінений  $-CH_2-CH_2-$ місточком,

3-амінопіперидин-1-ільну групу, в якій атом водню в положенні 4 разом з атомом водню в положенні 6 замінений  $-CH_2-CH_2-$ місточком,

піперидин-1-ільну групу, заміщену амінометильною групою,

піперидин-3-ільну або піперидин-4-ільну групу, піперидин-3-ільну або піперидин-4-ільну групу, яка в положенні 1 заміщена аміногрупою, гексагідроацепін-1-ільну групу, яка в положенні 3 або 4 заміщена аміногрупою,

піперазин-1-ільну або [1,4]діацепан-1-ільну групу, яка на вуглецевому скелеті, в разі необхідності, заміщена однією або двома метильними групами,

3-імінопіперазин-1-ільну, 3-іміно[1, 4]діацепан-1-ільну або 5-іміно[1,4]діацепан-1-ільну групу,

[1,4]діацепан-1-ільну групу, заміщену в положенні 6 аміногрупою,

$C_{3-6}$ -циклоалкіламіногрупу, в якій циклоалкільна частина заміщена аміно-, метиламіно- або диметиламіногрупою, причому обидва атоми азоту у циклоалкільній частині ізольовані один від одного щонайменше двома атомами вуглецю,

$N-(C_{3-6}\text{-циклоалкіл})-N-(C_{1-2}\text{-алкіл})$ аміногрупу, в якій циклоалкільна частина заміщена аміно-, метиламіно- або диметиламіногрупою, причому обидва атоми азоту у циклоалкільній частині ізольовані один від одного щонайменше двома атомами вуглецю,

$C_{3-6}$ -циклоалкіламіногрупу, в якій циклоалкільна частина заміщена амінометильною або аміноетильною групою,

$N-(C_{3-6}\text{-циклоалкіл})-N-(C_{1-2}\text{-алкіл})$ аміногрупу<sub>1</sub> в якій циклоалкільна частина заміщена амінометильною або аміноетильною групою,

$C_{3-6}$ -циклоалкіл- $C_{1-2}$ -алкіламіногрупу, в якій циклоалкільна частина заміщена аміно-, амінометильною або аміноетильною групою,

$N-(C_{3-6}\text{-циклоалкіл}-C_{1-2}\text{-алкіл})-N-(C_{1-2}\text{-алкіл})$ аміногрупу, в якій циклоалкільна частина заміщена аміно-, амінометильною або аміноетильною групою

Аміногрупу, заміщену залишками  $R^{15}$  та  $R^{16}$ , в якій

$R^{15}$  означає  $C_{1-4}$ -алкільну групу, а

$R^{16}$  означає 2-аміноетильну, 2-(метиламіно)етильну або 2-(диметиламіно)етильну групу, причому етильна частина відповідно може бути заміщена однією або двома метильними або етильними групами або амінокарбонільною,  $C_{1-2}$ -алкіламінокарбонільною, ді( $C_{1-2}$ -алкіл)амінокарбонільною, піролідін-1-ілкарбонільною, піперидин-1-ілкарбонільною або морфолін-4-ілкарбонільною групою,

аміногрупу, в якій атом азоту заміщений піролідін-3-ільною, піперидин-3-ільною, піперидин-4-ільною, піролідін-2-ілметильною, піролідін-3-ілметильною, піперидин-2-ілметильною, піперидин-3-ілметильною або піперидин-4-ілметильною групою,

$C_{1-2}$ -алкіламіногрупу, в якій атом азоту заміщений піролідін-3-ільною, піперидин-3-ільною, піперидин-4-ільною, піролідін-2-ілметильною, піролідін-3-ілметильною, піперидин-2-ілметильною, піперидин-3-ілметильною або піперидин-4-ілметильною групою,

3-амінопропільну, 3-метиламінопропільну або 3-диметиламінопропільну групу, в якій пропільна частина може бути заміщена однією або двома метильними групами,

4-амінобутильну, 4-метиламінобутильну або 4-диметиламінобутильну групу, в якій бутильна частина може бути заміщена однією або двома метильними групами,

$C_{1-2}$ -алкільну групу, заміщену 2-піролідінільною, 3-піролідінільною, 2-піперидинільною, 3-піперидинільною або 4-піперидинільною групою,

3-аміно-2-оксопіперидин-5-ільну або 3-аміно-2-оксо-1-метилпіперидин-5-ільну групу,

$C_{3-6}$ -циклоалкільну групу, заміщену аміно-, амінометильною або аміноетильною групою, або

$C_{3-6}$ -циклоалкіл- $C_{1-2}$ -алкільну групу, в якій циклоалкільна частина заміщена аміно-, амінометильною або аміноетильною групою,

причому якщо не зазначено нічого іншого, згадані вище алкільна, алкенільна та алкінільна групи можуть бути нерозгалуженими або розгалуженими,

із вказівкою, що сполуки, в яких

$R^1$  означає атом водню, метильну, пропільну, 2-гідроксипропільну, амінокарбонілметильну або бензильну групу,

$R^2$  означає метильну групу,

$R^3$  означає  $C_{1-5}$ -алкільну групу, бензильну групу, в разі необхідності, заміщену атомом фтору, хлору або броду або метильною групою, 1-фенілетильну або 2-фенілетильну групу, 2-пропен-1-ільну, 2-бутен-1-ільну, 3-хлор-2-бутен-1-ільну або 2-метил-2-пропен-1-ільну групу,

а

$R^4$  означає піперазин-1-ільну групу, виключаються,

їх таутимери, енантіомери, діастереомери, їх суміші та солі.

Підгрупа переважних сполук формули I, про яку слід окремо згадати, стосується тих сполук загальної формули I, в яких  $R^1$ - $R^4$  мають наведені вище значення, із додатковою вказівкою, що сполуки, в яких  $R^4$  означає заміщену, в разі необхідності, піперазин-1-ільну або [1,4]діацепан-1-ільну групу, виключаються, їх таутимеріє, енантіомерів, діастереомерів, їх сумішей та солей.

Друга підгрупа переважних сполук формули I, про яку слід окремо згадати, стосується тих сполук загальної формули I, в яких

$R^1$  означає атом водню,

$C_{1-4}$ -алکیلну групу,

$C_{3-5}$ -алкенільну групу,

2-пропен-1-ільну групу, заміщену метоксикарбонільною групою,

$C_{3-5}$ -алкінільну групу,

феніл- $C_{1-4}$ -алکیلну групу, в якій фенільна частина заміщена  $R^{10}$ - $R^{12}$ , причому

$R^{10}$  означає атом водню, атом фтору, хлору або бром,

метильну, етильну, трифторметильну або етильну групу,

гідрокси-, метокси-, етокси-, дифторметокси-, трифторметокси-, 2,2,2-трифторетокси-, фенокси-, бензилокси-, 2-пропен-1-ілокси-, 2-пропін-1-ілокси-, ціан- $C_{1-2}$ -алкокси-,  $C_{1-2}$ -алкілсульфонілокси-, фенілсульфонілокси-, карбокси- $C_{1-2}$ -алкілокси-,  $C_{1-2}$ -алкілоксикарбоніл- $C_{1-2}$ -галкілокси-, амінокарбоніл- $C_{1-2}$ -алкілокси-,  $C_{1-2}$ -алкіламінокарбоніл- $C_{1-2}$ -алкілокси-, ді( $C_{1-2}$ -алкіл)амінокарбоніл- $C_{1-2}$ -алкілокси-, піролідин-1-ілкарбоніл- $C_{1-2}$ -алкілокси-, піперидин-1-ілкарбоніл- $C_{1-2}$ -алкілокси-, морфолін-4-ілкарбоніл- $C_{1-2}$ -алкілоксигрупу,

карбоксильну,  $C_{1-2}$ -алкілоксикарбонільну, амінокарбонільну,  $C_{1-2}$ -алкіламінокарбонільну, ді( $C_{1-2}$ -алкіл)амінокарбонільну, морфолін-4-ілкарбонільну або ціаногрупу,

нітро-, аміно-,  $C_{1-2}$ -алкіламіно-, ді( $C_{1-2}$ -алкіл)аміно-, ціан- $C_{1-2}$ -алкіламіно-, [N-(ціан- $C_{1-2}$ -алкіл)-N-метиламіно]-,  $C_{1-2}$ -алкілоксикарбоніл- $C_{1-2}$ -алкіламіно-,  $C_{1-2}$ -алкілкарбоніламіно-,  $C_{1-2}$ -алкілоксикарбоніламіно-,  $C_{1-2}$ -алкілсульфоніламіно-, біс-( $C_{1-2}$ -алкілсульфоніл)аміно-, аміноссульфоніламіно-,  $C_{1-2}$ -алкіламіноссульфоніламіно-, ді( $C_{1-2}$ -алкіл)аміноссульфоніламіно-, морфолін-4-ілсульфоніламіно-, ( $C_{1-2}$ -алкіламіно)тіокарбоніламіно-, ( $C_{1-2}$ -алкілоксикарбоніламіно)карбоніламіно-, амінокарбоніламіно-,  $C_{1-2}$ -алкіламінокарбоніламіно-, ді( $C_{1-2}$ -алкіл)амінокарбоніламіно- або морфолін-4-ілкарбоніламіногрупу,

2-оксоімідазолідин-1-ільну, 3-метил-2-оксоімідазолідин-1-ільну, 2,4-діоксанімідазолідин-1-ільну, 3-метил-2,4-діоксанімідазолідин-1-ільну, 2,5-діоксанімідазолідин-1-ільну, 3-метил-2,5-діоксанімідазолідин-1-ільну, 2-оксогексагідропіримідин-1-ільну або 3-метил-2-оксогексагідропіримідин-і-ільну групу, або

$C_{1-2}$ -алкілсульфанільну,  $C_{1-2}$ -алкілсульфінільну,  $C_{1-2}$ -алкілсульфонільну, аміно-

сульфонільну,  $C_{1-2}$ -алкіламіноссульфонільну або ді( $C_{1-2}$ -алкіл)аміноссульфонільну групу,

а  $R^{11}$  та  $R^{12}$ , які можуть бути однаковими або різними, означають атом водню, фтору, хлору або бром

метильну, ціано- або метоксигрупу,

або  $R^{11}$  разом з  $R^{12}$ , якщо вони з'єднані на сусідніх атомах вуглецю, також означають метилendioкси групу,

фенілметильну групу, в якій метильна частина заміщена карбокси-, метоксикарбонільною або амінокарбонільною групою,

2-фенілетильну групу, в якій етильна частина заміщена карбокси-, метоксикарбонільною або амінокарбонільною групою,

2-фенілетильну групу, в якій етильна частина в положенні 2 заміщена гідрокси-, метокси-, гідроксимино- або метоксиминогрупою,

2-фенілетильну групу, в якій етильна частина в положенні 2 заміщена гідроксигрупою та метильною групою,

фенілкарбонілметильну групу, в якій фенільна частина заміщена  $R^{10}$ - $R^{12}$ , причому  $R^{10}$ - $R^{12}$  мають наведені вище значення,

1-(фенілкарбоніл)етильну або 2-(фенілкарбоніл)етильну групу,

2-фенілететильну групу,

фенілсульфанілметильну або фенілсульфонілметильну групу,

2-(фенілокси)етильну групу,

нафтилметильну або нафтилетильну групу, причому нафтильна частина відповідно може бути заміщена метильною, нітро-, аміно-, ацетиламіно-, метилсульфоніламіно-, ціано-, амінокарбонільною або аміноссульфонільною групою,

[1,4]нафтохінон-2-ільну, хромен-4-он-3-ільну або 1-оксоіндан-2-ільну групу,

оксазолілметильну, ізоксазолілметильну, тіазолілметильну, піридилметильну, бензофуранілметильну, 2,3-дигідробензофуранілметильну, бензо[d]ізоксазолілметильну,

бензо[d]ізотіазолілметильну, (1H-індазол-3-іл)метильну, хінолінілметильну, (1,2-дигідро-2-оксохінолін-4-іл)метильну, ізохінолінілметильну, (1,2-дигідро-1-оксоізохінолін-4-іл)метильну, цінолінілметильну, хіназолінілметильну, (1,2-дигідро-2-оксохіназолін-4-іл)метильну, (1,2-дигідро-1-оксофталазин-4-іл)метильну або кумаринілметильну групу, причому гетероциклічна частина може бути відповідно заміщена метильною групою,

хінолінілметильну або ізохінолінілметильну групу, причому гетероциклічна частина відповідно заміщена ціано-, нітро-, аміно-, ацетиламіно-, метилсульфоніламіно-, амінокарбонільною або аміноссульфонільною групою,

піролілетильну, триазолілетильну, тіенілетильну, тіазолілетильну або піридилетильну групу, причому гетероциклічна частина відповідно може бути заміщена метильною групою,

фуранілкарбонілметильну, тіенілкарбонілметильну, тіазолілкарбонілметильну або піридилкарбонілметильну групу,

метильну групу, заміщену циклопропільною, ціано-, карбокси-, амінокарбонільною або метоксикарбонільною групою,

етильну групу, яка в положенні 2 заміщена гідрокси-, метокси-, диметиламіно-, карбокси- або метоксикарбонільною групою, або

пропільну групу, яка в положенні 3 заміщена гідрокси-, диметиламіно-, карбокси- або метоксикарбонільною групою,

2-оксопропільну групу або

аміно-або бензоїламіногрупу,

$R^2$  означає атом водню,

$C_{1-6}$ -алкільну групу,

етенільну групу,

2-пропен-1-ільну або 2-пропін-1-ільну групу,

$C_{3-6}$ -циклоалкільну групу,

тетрагідрофуран-3-ільну, тетрагідропіран-3-ільну, тетрагідропіран-4-ільну, тетрагідрофуранілметильну або тетрагідропіранілметильну групу,

фенільну групу,

феніл- $C_{1-4}$ -алкільну групу, причому фенільна частина може бути заміщена атомом фтору або хлору, метильною, диметиламіно-, гідрокси-, метокси- або трифторметоксигрупою,

фенілкарбонілметильну групу, причому фенільна частина може бути заміщена атомом фтору або хлору, гідрокси-, метокси- або трифторметоксигрупою,

2-фенілетенільну групу,

2-(фенілокси)етильну групу,

піридилметильну або піридилетильну групу,

метильну групу, заміщену  $C_{3-6}$ -циклоалкільною, ціано-, карбокси- або метоксикарбонільною групою, або

етильну групу, яка в положенні 2 заміщена  $C_{3-6}$ -циклоалкільною, ціано-, карбокси-, метоксикарбонільною, гідрокси-, метокси- або диметиламіногрупою,

або пропільну групу, яка в положенні 3 заміщена  $C_{3-6}$ -циклоалкільною, ціано-, карбокси-, метоксикарбонільною, гідрокси-, метокси- або диметиламіногрупою,

$R^3$  означає  $C_{4-6}$ -алкенільну групу,

1-циклопентен-1-ілметильну або 1-циклогексен-1-ілметильну групу,

1-циклопентен-1-ілметильну групу, в якій 1-циклопентен-1-ільна частина заміщена метильною групою,

2-пропін-1-ільну, 2-бутин-1-ільну або 2-пентин-1-ільну групу,

фенільну групу, яка може бути заміщена атомом фтору або ціано-, метильною, метокси- або трифторметильною групою,

фенільну групу, заміщену двома метильними групами,

бензильну групу, в якій фенільна частина може бути заміщена одним або двома атомами фтору, хлору, бромом або йоду або метильною, метокси-, ціано-, нітро- або аміногрупою,

фуранілметильну або тіенілметильну групу,

циклопропілметильну групу або

циклопропілметильну групу, в якій циклопропілметильна частина заміщена метильною групою, а

$R^4$  означає піперидин-1-ільну групу, яка в положенні 3 заміщена аміногрупою, причому піперидин-1-ільна частина може бути додатково заміщена метильною групою,

3-амінопіперидин-1-ільну групу, в якій піперидин-1-ільна частина додатково заміщена амінока-

рбонільною, метиламінокарбонільною, диметиламінокарбонільною, піролідін-1-ілкарбонільною, (2-ціанпіролідін-1-іл)карбонільною, тiazолідін-3-ілкарбонільною, (4-ціанотiazолідін-3-іл)карбонільною, піперидин-1-ілкарбонільною або морфолін-4-ілкарбонільною групою,

3-амінопіперидин-1-ільну групу, в якій піперидин-1-ільна частина в положенні 4 або 5 додатково заміщена гідрокси- або метоксигрупою,

3-амінопіперидин-1-ільну групу, в якій атом водню в положенні 2 разом із атомом водню в положенні 5 замінений  $-CH_2-CH_2-$ містчком,

гексагідроацепін-1-ільну групу, яка в положенні 3 заміщена аміногрупою,

3-аміно-2-оксопіперидин-5-ільну або 3-аміно-2-оксо-1-метилпіперидин-5-ільну групу,

[1,4]діацепан-1-ільну групу, яка в положенні 6 заміщена аміногрупою,

циклогексильну групу, яка в положенні 3 заміщена аміногрупою,

2-аміноциклогексиламіногрупу,

або аміногрупу, заміщену залишками  $R^{15}$  та  $R^{16}$ , в якій

$R^{15}$  означає метильну або етильну групу, а

$R^{16}$  означає 2-аміноетильну групу, причому етильна частина може бути заміщена однією або двома метильними групами або амінокарбонільною, метиламінокарбонільною, диметиламінокарбонільною або піролідін-1-ілкарбонільною групою, причому якщо не зазначено нічого іншого, згадані вище алкільні та алкенільні групи можуть бути нерозгалуженими або розгалуженими,

їх туатомери, енантіомери, діастереомери, їх суміші та солі.

Третя підгрупа переважних сполук формули I, про яку слід окремо згадати, стосується тих сполук загальної формули I, в яких

$R^1$ ,  $R^2$  та  $R^3$  мають наведені вище значення, а

$R^4$  означає піперидин-1-ільну групу, заміщену в положенні 3 аміногрупою, причому піперидин-1-ільна частина може бути додатково заміщена метильною групою,

3-амінопіперидин-1-ільну групу, в якій піперидин-1-ільна частина додатково заміщена амінокарбонільною, метиламінокарбонільною, диметиламінокарбонільною, піролідін-1-ілкарбонільною, (2-ціанпіролідін-1-іл)карбонільною, тiazолідін-3-ілкарбонільною, (4-ціанотiazолідін-3-іл)карбонільною, піперидин-1-ілкарбонільною або морфолін-4-ілкарбонільною групою,

3-амінопіперидин-1-ільну групу, в якій піперидин-1-ільна частина в положенні 4 або 5 додатково заміщена гідрокси- або метоксигрупою,

3-амінопіперидин-1-ільну групу, в якій атом водню в положенні 2 разом з атомом водню в положенні 5 замінений  $-CH_2-CH_2-$ містчком,

гексагідроацепін-1-ільну групу, яка в положенні 3 заміщена аміногрупою, 3-аміно-2-оксопіперидин-5-ільну або 3-аміно-2-оксо-1-метилпіперидин-5-ільну групу,

циклогексильну групу, яка в положенні 3 заміщена аміногрупою,

2-аміноциклогексиламіногрупу,

або аміногрупу, заміщену залишками  $R^{15}$  та  $R^{16}$ , в якій

$R^{15}$  означає метильну або етильну групу, а

R<sup>16</sup> означає 2-аміноетильну групу, причому етильна частина може бути заміщена однією або двома метильними групами або амінокарбонільною, метиламінокарбонільною, диметиламінокарбонільною або піролідін-1-ілкарбонільною групою, причому якщо не зазначено нічого іншого, згадані вище алкільні та алкенільні групи можуть бути нерозгалудженими або розгалудженими, їх таутомери, енантіомери, діастереомери, їх суміші та їх солі.

Особливо переважними сполуками зазначеної вище загальної формули I є такі сполуки, в яких

R<sup>1</sup> означає атом водню,

C<sub>1-4</sub>-алкільну групу,

C<sub>3-5</sub>-алкенільну групу,

2-пропен-1-ільну групу, заміщену метоксикарбонільною групою,

C<sub>3-5</sub>-алкінільну групу,

фенільну групу,

феніл-C<sub>1-4</sub>-алкільну групу, в якій фенільна частина може бути заміщена одним або двома атомами фтору, одним або двома атомами хлору, атомом бром, однією - трьома метильними групами, бутильною, трифторметильною, гідрокси-, метокси-, нітро-, аміно-, карбокси- або етоксикарбонільною групою,

2-фенілетильною групою, в якій етильна частина в положенні 2 заміщена гідрокси-, метокси- або гідроксиаміногрупою,

фенілкарбонілметильну групу, в якій фенільна частина може бути заміщена атомом фтору або метильною, амінокарбонільною, аміносальфонільною, ціано-, гідрокси-, метокси-, феноксид-, бензил-, 2-пропен-1-ілокси-, 2-пропін-1-ілокси-, ціанметокси-, (метоксикарбоніл)метокси-, (амінокарбоніл)метокси-, (метиламінокарбоніл)метокси-, (диметиламінокарбоніл)метокси-, метилсульфонілокси-, фенілсульфонілокси-, нітро-, аміно-, (метоксикарбоніл)метиламіно-, ацетиламіно-, метоксикарбоніламіно-, метилсульфоніламіно-, біс-(метилсульфоніл)амін-, амінокарбоніламіно-, диметиламінокарбоніламіно-, (метиламіно)тіокарбоніламіно-, (етоксикарбоніламіно)-карбоніламіно- або ціанметиламіногрупою;

фенілкарбонілметильну групу, в якій фенільна частина заміщена двома метоксигрупами або атомом бром та диметиламіногрупою,

2-(фенілкарбоніл)етильну групу,

2-фенілетенільну групу,

2-(феноксид)етильну групу,

фенілсульфанілметильну або фенілсульфінілметильну групу,

нафтилметильну або нафтілетильну групу,

ізоксазолілметильну, тіазолілметильну, піридилметильну, бензо[b]ізоксазолілметильну, бензо[d]ізотіазолілметильну, (1H-ндазол-3-іл)метильну, хінолінілметильну або ізохінолінілметильну групу, причому гетероциклічна частина може бути відповідно заміщена метильною групою,

ізохінолінілметильну групу, в якій ізохінолінільна частина заміщена нітро- або аміногрупою,

(1,2-дигідро-2-оксохінолін-4-іл)метильну групу, хромен-4-он-3-ільну групу,

піролілетильну, тριαзолілметильну, тінілетильну, тіазолілметильну або піридилетильну групу,

причому гетероциклічна частина відповідно може бути заміщена метильною групою,

тінілкарбонілметилдильну групу,

метильну групу, заміщену циклопропільною, ціано-, карбокси-, амінокарбонільною або метоксикарбонільною групою,

етильну групу, яка в положенні 2 заміщена гідрокси-, метокси-, диметиламіно-, карбокси- або метоксикарбонільною групою,

пропільну групу, яка в положенні 3 заміщена гідрокси-, диметиламіно-, карбокси- або метоксикарбонільною групою,

2-оксопропільну групу або

аміно- або бензоїламіногрупу,

R<sup>2</sup> означає атом водню,

C<sub>1-6</sub>-алкільну групу,

етенільну групу,

2-пропен-1-ільну або 2-пропін-1-ільну групу,

фенільну групу,

феніл-C<sub>1-4</sub>-алкільну групу, причому фенільна частина може бути заміщена атомом фтору, метильною або метоксигрупою,

фенілкарбонілметильну групу,

2-фенілетенільну групу,

метильну групу, заміщену циклопропільною, ціано-, карбокси- або метоксикарбонільною групою, або

етильну групу, яка в положенні 2 заміщена ціано-, гідрокси-, метокси- або диметиламіногрупою,

R<sup>3</sup> означає C<sub>4-6</sub>-алкенільну групу,

1-циклопентен-1-ілметильну або 1-циклогексен-1-ілметильну групу,

2-пропін-1-ільну, 2-бутін-1-ільну або 2-пентін-1-ільну групу,

фенільну групу, яка може бути заміщена атомом фтору або ціано-, метильною або трифторметильною групою,

фенільну групу, заміщену двома метильними групами,

нафтилметильну групу,

бензилметильну групу, в якій фенільна частина може бути заміщена одним або двома атомами фтору, атомом йоду або ціано-, нітро- або аміногрупою,

нафтилметильну групу,

2-фенілетенільну групу,

фуранілметильну або тінілметильну групу або

циклопропілметильну групу, а

R<sup>4</sup> означає піролідін-1-ільну групу, яка в положенні 3 заміщена аміногрупою,

ацетидин-1-ільну групу, заміщену амінометильною групою,

піролідін-1-ільну групу, заміщену амінометильною групою,

піперидин-1-ільну групу, яка в положенні 3 або 4 заміщена аміно-, метиламіно-, диметиламіно- або [(2-ціанпіролідін-1-іл)карбонілметил]аміногрупою, причому піперидин-1-ільна частина додатково може бути заміщена метильною групою,

3-амінопіперидин-1-ільну групу, в якій піперидин-1-ільна частина додатково заміщена піролідін-1-ілкарбонільною групою,

3-амінопіперидин-1-ільну групу, в якій піперидин-1-ільна частина в положенні 4 додатково заміщена гідроксигрупою,

3-амінопіперидин-1-ільну групу, в якій атом водню в положенні 2 разом з атомом водню в положенні 5 замінена  $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ місточком,

піперидин-1-ільну групу, заміщену амінометильною групою,

піперидин-3-ільну або піперидин-4-ільну групу,

1-амінопіперидин-3-ільну або 1-амінопіперидин-4-ільну групу,

гексагідроацепін-1-ільну групу, яка в положенні 3 або 4 заміщена аміногрупою,

піперазин-1-ільну або [1,4]діацепан-1-ільну групу,

[1,4]діацепан-1-ільну групу, яка в положенні 6 заміщена аміногрупою,

3-амінопропільну групу,

циклогексильну групу, заміщену аміногрупою,

2-аміноциклопропіламіногрупу,

2-аміноциклобутиламіногрупу,

2-аміноциклопентиламіно- або 3-аміноциклопентиламіногрупу,

2-аміноциклогексиламіно-, 2- (метиламіно)циклогексиламіно- або 3-аміноциклогексиламіногрупу,

N-(2-аміноциклогексил)метиламіногрупу, аміногрупу, заміщену залишками  $\text{R}^{15}$  та  $\text{R}^{16}$ , в якій

$\text{R}^{15}$  означає метильну або етильну групу, а

$\text{R}^{16}$  означає 2-аміноетил-2-{метиламіно}етильну або 2-(диметиламіно)етильну групу, причому етильна частина може бути заміщена однією або двома метильними групами або амінокарбонільною, метиламінокарбонільною, диметиламінокарбонільною або піролідин-1-ілкарбонільною групою,

або аміно- або метиламіногрупу, в якій атом азоту заміщений піролідин-3-ільною, піперидин-3-ільною, піперидин-4-ільною або піперидин-2-ілметильною групою,

причому, якщо не зазначено нічого іншого, згадані вище алкільні та алкенільні групи можуть бути нерозгалуженими або розгалуженими, із вказівкою, що сполуки

3-метил-7-(2-бутен-1-іл)-8-(піперазин-1-іл)ксантин,

3-метил-7-(2-метил-2-пропен-1-іл)-8-

(піперазин-1-іл)ксантин,

3-метил-7-бензил-8-(піперазин-1-іл)ксантин,

1,7-добензил-3-метил-8-(піперазин-1-

іл)ксантин та

1,3-диметил-7-(4-фторбензил)-8-(піперазин-1-іл)ксантин

виключаються,

їх таутомери, енантіомери, діастереомери, їх суміші та солі.

Підгрупа особливо переважних сполук формули I, про яку слід окремо згадати, стосується тих сполук загальної формули I, в яких  $\text{R}^1-\text{R}^4$  мають наведені вище значення, із додатковою вказівкою, що сполуки, в яких  $\text{R}^4$  означає заміщену, в разі необхідності, піперазин-1-ільну або [1,4]діацепан-1-ільну групу, виключаються, їх таутомери, енантіомери, діастереомери, їх суміші та солі.

Друга підгрупа особливо переважних сполук формули I, про яку слід окремо згадати, стосується тих сполук загальної формули I, в яких

$\text{R}^1$  означає атом водню,

$\text{C}_{1-4}$ -алкільну групу,

$\text{C}_{3-5}$ -алкенільну групу,

2-пропен-1-ільну групу, заміщену метоксикарбонільною групою,

$\text{C}_{3-5}$ -алкінільну групу,

феніл- $\text{C}_{1-4}$ -алкільну групу, в якій фенільна частина може бути заміщена одним або двома атомами фтору, одним або двома атомами хлору, атомом бром, однією-трьома метильними групами, трифторметильною, гідрокси-, метокси-, нітро-, аміно-, карбокси-або етоксикарбонільною групою,

2-фенілетильну групу, в якій етильна частина в положенні 2 заміщена гідрокси-, метокси- або гідроксиіміногрупою,

фенілкарбонілметильну групу, в якій фенільна частина може бути заміщена атомом фтору або метильною, амінокарбонільною, аміносальфонільною, ціано-, гідрокси-, метокси-, фенокси-, бензил-, 2-пропен-1-ілокси-, 2-пропін-1-ілокси-, ціанметокси-, (метоксикарбоніл)метокси-, (амінокарбоніл)метокси-, (метиламінокарбоніл)метокси-, (диметиламінокарбоніл)метокси-, метилсульфонілокси-, фенілсульфонілокси-, нітро-, аміно-, (метоксикарбоніл)метиламіно-, ацетиламіно-, метоксикарбоніламіно-, метилсульфоніламіно-, біс-(метилсульфоніл)аміно-, амінокарбоніламіно-, диметиламінокарбоніламіно-, (метиламіно)тюкарбоніламіно-, (етоксикарбоніламіно-)карбоніламіно- або ціанметиламіногрупами,

фенілкарбонілметильну групу, в якій фенільна частина заміщена двома метоксигрупами або атомом бром та диметиламіногрупою,

2-(фенілкарбоніл)етильну групу,

2-фенілетенільну групу,

2-(фенокси)етильну групу,

фенілсульфанілметильну або фенілсульфінілметильну групу,

нафтилметильну або нафтилетильну групу,

ізоксазолілметильну, тіазолілметильну, піридилметильну, бензо[d]ізоксазолілметильну, бензо[d]ізазолілметильну, (1H-індазол-3-іл)метильну, хінолінілметильну або ізохінолінілметильну групу, причому гетероциклічна частина може бути відповідно заміщена метильною групою,

ізохінолінілметильну групу, в якій ізохінолінільна частина заміщена нітро- або аміногрупою, (1,2-дигідро-2-оксохінолін-4-іл)метильну групу,

піролілетильну, триазолілетильну, тіенілетильну, тіазолілетильну або піридилетильну групу, причому гетероциклічна частина може бути відповідно заміщена метильною групою,

тіенілкарбонілметильну групу,

метильну групу, заміщену циклопропільною, ціано-, карбокси-, амінокарбонільною або метоксикарбонільною групою,

етильну групу, яка в положенні 2 заміщена гідрокси-, метокси-, диметиламіно-, карбокси-або метоксикарбонільною групою,

пропільну групу, яка в положенні 3 заміщена гідрокси-, диметиламіно-, карбокси- або метоксикарбонільною групою,

2-оксопропілну групу або аміно- або бензоїламіногрупу,  $R^2$  означає атом водню,  $C_{1-6}$ -алкілну групу, етенільну групу, 2-пропен-1-ільну групу або 2-пропін-1-ільну групу, фенільну групу, феніл- $C_{1-4}$ -алкілну групу, причому фенільна частина може бути заміщена атомом фтору, метильною або метоксигрупою, фенілкарбонілметильну групу, 2-фенілетенільну групу, метильну групу, заміщену циклопропільною, ціано-, карбокси- або метоксикарбонільною групою, або етильну групу, яка в положенні 2 заміщена ціано-, гідрокси-, метокси- або диметиламіногрупою,  $R^3$  означає  $C_{4-6}$ -алкенільну групу, 1-циклопентен-1-ілметильну або 1-циклогексен-1-ілметильну групу, 2-пропін-1-ільну, 2-бутин-1-ільну або 2-пентин-1-ільну групу, фенільну групу, яка може бути заміщена атомом фтору або ціано-, метильною або трифторметильною групою, фенільну групу, заміщену двома метильними групами, бензильну групу, в якій фенільна частина може бути заміщена одним або двома атомами фтору, атомом йоду або ціано-, нітро- або аміногрупою, фуранілметильну або тіенілметильну групу або циклопропілметильну групу, а  $R^4$  означає піперидин-1-ільну групу, яка в положенні 3 заміщена аміногрупою, причому піперидин-1-ільна частина додатково може бути заміщена метильною групою, 3-амінопіперидин-1-ільну групу, в якій піперидин-1-ільна частина додатково заміщена піролідин-1-ілкарбонільною групою, 3-амінопіперидин-1-ільну групу, в якій піперидин-1-ільна частина в положенні 4 додатково заміщена гідроксигрупою, 3-амінопіперидин-1-ільну групу, в якій атом водню в положенні 2 разом з атомом водню в положенні 5 замінені  $-CH_2-CH_2-$ містчком, гексагідроацепін-1-ільну групу, яка в положенні 3 заміщена аміногрупою, [1,4]діацепан-1-ільну групу, яка в положенні 6 заміщена аміногрупою, циклогексильну групу, яка в положенні 3 заміщена аміногрупою, 2-аміноциклогексиламіногрупу, або аміногрупу, заміщену залишками  $R^{15}$  та  $R^{16}$ , в якій  $R^{15}$  означає метильну або етильну групу, а  $R^{16}$  означає 2-аміноетильну групу, причому етильна частина може бути заміщена однією або двома метильними групами або амінокарбонільною, метиламінокарбонільною, диметиламінокарбонільною або піролідин-1-ілкарбонільною групою, причому, якщо не зазначено нічого іншого, згадані вище алкільні та алкенільні групи можуть бути нерозгалуженими або розгалуженими, їх таутомери, енантіомери, діастереомери, їх суміші та солі.

Третя підгрупа особливо переважних сполук формули I, про яку слід окремо згадати, стосується тих сполук загальної формули I, в яких

$R^1$ ,  $R^2$  та  $R^3$  мають наведені вище значення, а  $R^4$  означає піперидин-1-ільну групу, яка в положенні 3 заміщена аміногрупою, причому піперидин-1-ільна частина додатково може бути заміщена метильною групою,

3-амінопіперидин-1-ільну групу, в якій піперидин-1-ільна частина додатково заміщена піролідин-1-ілкарбонільною групою,

3-амінопіперидин-1-ільну групу, в якій піперидин-1-ільна частина в положенні 4 додатково заміщена гідроксигрупою,

3-амінопіперидин-1-ільну групу, в якій атом водню в положенні 2 разом з атомом водню в положенні 5 замінені  $-CH_2-CH_2-$ містчком,

гексагідроацепін-1-ільну групу, яка в положенні 3 заміщена аміногрупою, циклогексильну групу, яка в положенні 3 заміщена аміногрупою,

2-аміноциклогексиламіногрупу, або аміногрупу, заміщену залишками  $R^{15}$  та  $R^{16}$ , в якій

$R^{15}$  означає метильну або етильну групу, а

$R^{16}$  означає 2-аміноетильну групу, причому етильна частина може бути заміщена однією або двома метильними групами або амінокарбонільною, метиламінокарбонільною, диметиламінокарбонільною або піролідин-1-ілкарбонільною групою, причому, якщо не зазначено нічого іншого, згадані вище алкільні та алкенільні групи можуть бути нерозгалуженими або розгалуженими, їх таутомери, енантіомери, діастереомери, їх суміші та солі.

Наступна підгрупа особливо переважних сполук формули I, про яку слід окремо згадати, стосується тих сполук загальної формули I, в яких

$R^1$  означає атом водню,

$C_{1-8}$ -алкілну групу,

$C_{3-8}$ -алкенільну групу,

$C_{3-8}$ -алкілільну групу,

$C_{1-6}$ -алкілну групу, заміщену групою  $R_a$ , причому

$R_a$  означає  $C_{3-7}$ -циклоалкілну, гетероарильну, ціано-, карбокси-,  $C_{1-3}$ -алкілоксикарбонільну, амінокарбонільну,  $C_{1-3}$ -алкіламінокарбонільну, ді( $C_{1-3}$ -алкіл)амінокарбонільну, піролідин-1-ілкарбонільну, піперидин-1-ілкарбонільну, морфолін-4-ілкарбонільну, піперазин-1-ілкарбонільну, 4-метилпіперазин-1-ілкарбонільну або 4-етилпіперазин-1-ілкарбонільну групу,

$C_{1-6}$ -алкілну групу, заміщену фенільною групою, причому фенільне кільце заміщене групами  $R^{10}$ - $R^{14}$ , а

$R^{10}$  означає атом водню,

атом фтору, хлору, бром або йоду,

$C_{1-4}$ -алкілну, гідрокси- або  $C_{1-4}$ -алкілоксигрупу,

нітро-, аміно-,  $C_{1-3}$ -алкіламіно-, ді( $C_{1-3}$ -алкіл)аміно-, піролідин-1-ільну, піперидин-1-ільну, морфолін-4-ільну, піперазин-1-ільну, 4-( $C_{1-3}$ -алкіл)піперазин-1-ільну,  $C_{1-3}$ -алкілкарбоніламіно-, арилкарбоніламіно-, арил-  $C_{1-3}$ -алкілкарбоніламіно-,  $C_{1-3}$ -алкілоксикарбоніламіно-, амінокарбоніламіно-,  $C_{1-3}$ -

алкіламінокарбоніламіно-, ді( $C_{1-3}$ -алкіл)амінокарбоніламіно-, алкілсульфоніламіно-, арилсульфоніламіно- або арил- $C_{1-3}$ -алкілсульфоніламіногрупу,

N-( $C_{1-3}$ -алкіл)- $C_{1-3}$ -алкілкарбоніламіно-, N-( $C_{1-3}$ -алкіл)арилкарбоніламіно-, N-( $C_{1-3}$ -алкіл)арил- $C_{1-3}$ -алкілкарбоніламіно-, N-( $C_{1-3}$ -алкіл)- $C_{1-3}$ -алкілоксикарбоніламіно-, N-(амінокарбоніл)- $C_{1-3}$ -алкіламіно-, N-( $C_{1-3}$ -алкіламінокарбоніл)- $C_{1-3}$ -алкіламіно-, N-[ді-( $C_{1-3}$ -алкіламінокарбоніл)- $C_{1-3}$ -алкіламіно-, N-( $C_{1-3}$ -алкіл)- $C_{1-3}$ -алкілсульфоніламіно-, N-( $C_{1-3}$ -алкіл)арилсульфоніламіно- або N-( $C_{1-3}$ -алкіл)-арил- $C_{1-3}$ -алкілсульфоніламіногрупу,

ціано-, карбокси-,  $C_{1-3}$ -алкілоксикарбонільну, амінокарбонільну,  $C_{1-3}$ -алкіламінокарбонільну, ді( $C_{1-3}$ -алкіл)амінокарбонільну, піролідін-1-ілкарбонільну, піперидин-1-ілкарбонільну, морфолін-4-ілкарбонільну, піперазин-1-ілкарбонільну або 4-( $C_{1-3}$ -алкіл)піперазин-1-ілкарбонільну групу,

$C_{1-3}$ -алкілкарбонільну або еіне арилкарбонільну групу,

карбокси- $C_{1-3}$ -алкільну,  $C_{1-3}$ -алкілоксикарбоніл- $C_{1-3}$ -алкільну, ціан- $C_{1-3}$ -алкілбу, амінокарбоніл- $C_{1-3}$ -алкільну,  $C_{1-3}$ -алкіламінокарбоніл- $C_{1-3}$ -алкільну, ді( $C_{1-3}$ -алкіл)амінокарбоніл- $C_{1-3}$ -алкільну, піролідін-1-ілкарбоніл- $C_{1-3}$ -алкільну, піперидин-1-ілкарбоніл- $C_{1-3}$ -алкільну, морфолін-4-ілкарбоніл- $C_{1-3}$ -алкільну, піперазин-1-ілкарбоніл- $C_{1-3}$ -алкільну або 4-( $C_{1-3}$ -алкіл)піперазин-1-ілкарбоніл- $C_{1-3}$ -алкільну групу,

карбокси- $C_{1-3}$ -алкілокси-,  $C_{1-3}$ -алкілоксикарбоніл- $C_{1-3}$ -алкілокси-, ціан- $C_{1-3}$ -алкілокси-, амінокарбоніл- $C_{1-3}$ -алкілокси-,  $C_{1-3}$ -алкіламінокарбоніл- $C_{1-3}$ -алкілокси-, ді( $C_{1-3}$ -алкіл)амінокарбоніл- $C_{1-3}$ -алкілокси-, піролідін-1-ілкарбоніл- $C_{1-3}$ -алкілокси-, піперидин-1-ілкарбоніл- $C_{1-3}$ -алкілокси-, морфолін-4-ілкарбоніл- $C_{1-3}$ -алкілокси-, піперазин-1-ілкарбоніл- $C_{1-3}$ -алкілокси- або 4-( $C_{1-3}$ -алкіл)піперазин-1-ілкарбоніл- $C_{1-3}$ -алкілоксигрупу,

гідрокси- $C_{1-3}$ -алкільну,  $C_{1-3}$ -алкілокси- $C_{1-3}$ -алкільну, аміно- $C_{1-3}$ -алкільну,  $C_{1-3}$ -алкіламіно- $C_{1-3}$ -алкільну, ді( $C_{1-3}$ -алкіл)аміно- $C_{1-3}$ -алкільну, піролідін-1-іл- $C_{1-3}$ -алкільну, піперидин-1-іл- $C_{1-3}$ -алкільну, морфолін-4-іл- $C_{1-3}$ -алкільну, піперазин-1-іл- $C_{1-3}$ -алкільну, 4-( $C_{1-3}$ -алкіл)піперазин-1-іл- $C_{1-3}$ -алкільну групу,

гідрокси- $C_{1-3}$ -алкілокси-,  $C_{1-3}$ -алкілокси-  $C_{1-3}$ -алкілокси-, аміно- $C_{1-3}$ -алкілокси-,  $C_{1-3}$ -алкіламіно- $C_{1-3}$ -алкілокси-, ді( $C_{1-3}$ -алкіл)-аміно- $C_{1-3}$ -алкілокси-, піролідін-1-іл- $C_{1-3}$ -алкілокси-, піперидин-1-іл- $C_{1-3}$ -алкілокси-, морфолін-4-іл- $C_{1-3}$ -алкілокси-, піперазин-1-іл- $C_{1-3}$ -алкілокси-, 4-( $C_{1-3}$ -алкіл)піперазин-1-іл- $C_{1-3}$ -алкілоксигрупу,

меркапто-,  $C_{1-3}$ -алкілсульфанільну,  $C_{1-3}$ -алкілсульфінільну,  $C_{1-3}$ -алкілсульфонільну,  $C_{1-3}$ -алкілсульфонілокси-, трифторметилсульфанільну, трифторметилсульфонільну або трифторметилсульфонільну групу,

сульфо-, аміноссульфонільну,  $C_{1-3}$ -алкіламіноссульфонільну, ді( $C_{1-3}$ -алкіл)аміноссульфонільну, піролідін-1-ілсульфонільну, піперидин-1-ілсульфонільну, морфолін-4-ілсульфонільну, піперазин-1-

ілсульфонільну або 4-( $C_{1-3}$ -алкіл)піперазин-1-ілсульфонільну групу,

метильну або метоксигрупу, заміщену 1-3 атомами фтору,

етильну або етоксигрупу, заміщену 1-5 атомами фтору,

$C_{2-4}$ -алкенільну або  $C_{2-4}$ -алкінільну групу,

2-пропен-1-ілокси- або 2-пропін-1-ілоксигрупу,

$C_{3-6}$ -циклоалкільну або  $C_{3-6}$ -циклоалкілоксидгирре,

$C_{3-6}$ -циклоалкіл- $C_{1-3}$ -алкільну або  $C_{3-6}$ -циклоалкіл- $C_{1-3}$ -алкілоксигрупу або арильну, алкілокси-, арил- $C_{1-3}$ -алкільну або арил- $C_{1-3}$ -алкілоксигрупу,

$R^{11}$  та  $R^{12}$ , які можуть бути однаковими або різними, відповідно означають атом водню, атом фтору, хлору, броду або йоду,  $C_{1-3}$ -алкільну, трифторометильну, гідрокси- або  $C_{1-3}$ -алкілоксигрупу або ціаногрупу, або

$R^{11}$  разом з  $R^{12}$ , якщо вони зв'язані на сусідніх атомах вуглецю, також означають метилендіокси-, дифторметилендіокси-, нерозгалужену  $C_{3-5}$ -алкіленову,  $-CH=CH-CH=CH-$ ,  $-CH=CH-CH=N-$  або  $-CH=CH-N=CH-$ групу, а

$R^{13}$  та  $R^{14}$ , які можуть бути однаковими або різними, означають відповідно атом водню, атом фтору, хлору або броду, трифторметильну,  $C_{1-3}$ -алюльну або  $C_{1-3}$ -алкілоксигрупу,

фенільну групу, заміщену групами  $R^{10}$ - $R^{14}$ , причому  $R^{10}$ - $R^{14}$  мають наведені вище значення,

феніл- $C_{2-3}$ -алкенільну групу, в якій фенільна частина заміщена групами  $R^{10}$ - $R^{14}$ , причому  $R^{10}$ - $R^{14}$  мають наведені вище значення,

феніл- $(CH_2)_m$ -A- $(CH_2)_n$ -групу, в якій фенільна частина заміщена  $R^{10}$ - $R^{14}$ , причому  $R^{10}$ - $R^{14}$  мають наведені вище значення, а

A означає карбонільну, ціанімінометиленову, гідроксиминометиленову або  $C_{1-3}$ -алкілоксиімінометиленову групу, m означає число 0, 1 або 2, а n - число 1, 2 або 3,

феніл- $(CH_2)_m$ -B- $(CH_2)_n$ -групу, в якій фенільна частина заміщена  $R^{10}$ - $R^{14}$ , причому  $R^{10}$ - $R^{14}$ , m та n мають зазначені вище значення, а

B означає метиленову групу, заміщену гідрокси-,  $C_{1-3}$ -алкілокси-, аміно-,  $C_{1-3}$ -алкіламіно-, ді( $C_{1-3}$ -алкіл)-аміно-, меркапто-,  $C_{1-3}$ -алкілсульфанільною,  $C_{1-3}$ -алкілсульфінільною або  $C_{1-3}$ -алкілсульфонільною групою та, в разі необхідності, додатково заміщена метильною або етильною групою,

гетероарил- $(CH_2)_m$ -A- $(CH_2)_n$ -групу, причому A, m та n мають наведені вище значення,

гетероарил- $(CH_2)_m$ -B- $(CH_2)_n$ -групу, причому B, m та n мають наведені вище значення,

$C_{1-6}$ -алкіл-A- $(CH_2)_n$ -групу, причому A та n мають наведені вище значення,

$C_{3-7}$ -циклоалкіл- $(CH_2)_m$ -A- $(CH_2)_n$ -групу, причому A, m та n мають наведені вище значення,

$C_{3-7}$ -циклоалкіл- $(CH_2)_m$ -B- $(CH_2)_n$ -групу, причому B, m та n мають наведені вище значення,

$R^{21}$ -A- $(CH_2)_n$ -групу, в якій  $R^{21}$  означає  $C_{1-3}$ -алкілоксикарбонільну, амінокарбонільну,  $C_{1-3}$ -алкіламінокарбонільну, ді( $C_{1-3}$ -алкіл)амінокарбонільну, піролідін-1-ілкарбонільну, піперидин-1-ілкарбонільну або морфолін-4-ілкарбонільну, піперазин-1-ілкарбонільну, 4-

метилпіперазин-1-ілкарбонільну або 4-етилпіперазин-1-ілкарбонільну групу, а А та п мають наведені вище значення,

феніл-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-D-C<sub>1-3</sub>-алкільну групу, в якій фенільна частина заміщена групами R<sup>10</sup>-R<sup>14</sup>, причому R<sup>10</sup>-R<sup>14</sup> та m мають наведені вище значення, а D означає атом кисню або сірки, іміно-, C<sub>1-3</sub>-алкіліміно-, сульфінільну або сульфонільну групу,

C<sub>2-6</sub>-алкільну групу, заміщену групою R<sub>b</sub>, причому

R<sub>b</sub> в положенні 1 ксантинового скелету ізольована від атому кільцевого азоту щонайменше двома атомами вуглецю та R<sub>b</sub> означає гідрокси-, C<sub>1-3</sub>-алкілокси-, меркапто-, C<sub>1-3</sub>-алкілсульфанільну, C<sub>1-3</sub>-алкілсульфінільну, C<sub>1-3</sub>-алкілсульфонільну, аміно-, C<sub>1-3</sub>-алкіламіно-, ді(C<sub>1-3</sub>-алкіл)аміно-, піролідін-1-ільну, піперидин-1-ільну, морфолін-4-ільну, піперазин-1-ільну або 4-(C<sub>1-3</sub>-алкіл)піперазин-1-ільну групу,

або C<sub>3-6</sub>-циклоалкільну групу,

R<sup>2</sup> означає атом водню,

C<sub>1-8</sub>-алкільну групу,

C<sub>3-6</sub>-алкенільну групу,

C<sub>3-6</sub>-алкінільну групу,

C<sub>1-6</sub>-алкільну групу, заміщену групою R<sub>a</sub>, причому R<sub>a</sub> має наведене вище значення,

C<sub>1-6</sub>-алкільну групу, заміщену фенільною групою, причому фенільне кільце заміщене групами R<sup>10</sup>-R<sup>14</sup>, і R<sup>10</sup>-R<sup>14</sup> мають наведені вище значення,

фенільну групу, заміщену групами R<sup>10</sup>-R<sup>14</sup>, причому R<sup>10</sup>-R<sup>14</sup> мають наведені вище значення,

феніл- C<sub>2-3</sub>-алкенільну групу, в якій фенільна частина заміщена групами R<sup>10</sup>-R<sup>14</sup>, причому, R<sup>10</sup>-R<sup>14</sup> мають наведені вище значення,

феніл-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-A-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-групу, в якій фенільна частина заміщена R<sup>10</sup>-R<sup>14</sup>, причому R<sup>10</sup>-R<sup>14</sup>, А, m та n мають наведені вище значення,

феніл-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-B-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-групу, в якій фенільна частина заміщена R<sup>10</sup>-R<sup>14</sup>, причому R<sup>10</sup>-R<sup>14</sup>, B, m та n мають наведені вище значення,

гетероарил-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-A-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-групу, причому А, m та n мають наведені вище значення,

гетероарил-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-B-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-групу, причому В, m та n мають наведені вище значення,

C<sub>1-6</sub>-алкіл-A-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-групу, причому А та n мають наведені вище значення,

C<sub>3-7</sub>-циклоалкіл-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-A-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-групу, причому А, m та n мають наведені вище значення,

C<sub>3-7</sub>-циклоалкіл-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-B-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-групу, причому В, m та n мають наведені вище значення,

R<sup>21</sup>-A-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-групу, в якій R<sup>21</sup>, А та n мають наведені вище значення,

феніл-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-D-C<sub>1-3</sub>-алкільну групу, в якій фенільна частина заміщена групами R<sup>10</sup>-R<sup>14</sup>, причому R<sup>10</sup>-R<sup>14</sup>, m та D мають наведені вище значення,

C<sub>2-6</sub>-алкільну групу, заміщену групою R<sub>b</sub>, причому

R<sub>b</sub> в положенні 3 ксантинового скелету ізольована від атому кільцевого азоту щонайменше двома атомами вуглецю та має наведене вище значення,

або C<sub>3-6</sub>-циклоалкільну групу,

R<sup>3</sup> означає C<sub>1-8</sub>-алкільну групу,

C<sub>1-4</sub>-алкільну групу, заміщену групою R<sub>c</sub>, причому

R<sub>c</sub> означає C<sub>3-7</sub>-циклоалкільну групу, заміщену, в разі необхідності, однією або двома C<sub>1-3</sub>-алкільними групами,

заміщену, в разі необхідності, однією або двома C<sub>1-3</sub>-алкільними групами C<sub>5-7</sub>-циклоалкенільну групу або арильну або гетероарильну групу,

C<sub>3-8</sub>-алкенільну групу,

C<sub>3-6</sub>-алкенільну групу, заміщену атомом фтору, хлору або броду або трифторметильною групою,

C<sub>3-8</sub>-алкінільну групу,

арильну групу або

арил-C<sub>2-4</sub>-алкенільну групу,

а

R<sup>4</sup> означає ацетидин-1-ільну або піролідін-1-ільну групу, яка в положенні 3 заміщена R<sub>e</sub>NR<sub>d</sub>-групою та додатково може бути заміщена однією або двома C<sub>1-3</sub>-алкільними групами, причому

R<sub>e</sub> означає атом водню або C<sub>1-3</sub>-алкільну групу, а

R<sub>d</sub> означає атом водню, C<sub>1-3</sub>-алкільну групу, R<sub>f</sub>-C<sub>1-3</sub>-алкільну групу або R<sub>g</sub>-C<sub>1-3</sub>-алкільну групу, причому

R<sub>f</sub> означає карбокси-, C<sub>1-3</sub>-алкілоксикарбонільну, амінокарбонільну, C<sub>1-3</sub>-алкіламінокарбонільну, ді(C<sub>1-3</sub>-алкіл)амінокарбонільну, піролідін-1-ілкарбонільну, 2-ціанопіролідін-1-ілкарбонільну, 2-карбоксипіролідін-1-ілкарбонільну, 2-метоксикарбонілпіролідін-1-ілкарбонільну, 2-етоксикарбонілпіролідін-1-ілкарбонільну, 2-амінокарбонілпіролідін-1-ілкарбонільну, 4-ціанотіазолідін-3-ілкарбонільну, 4-карбокситіазолідін-3-ілкарбонільну, 4-метоксикарбонілтіазолідін-3-ілкарбонільну, 4-етоксикарбонілтіазолідін-3-ілкарбонільну, 4-амінокарбонілтіазолідін-3-ілкарбонільну, піперидин-1-ілкарбонільну, морфолін-4-ілкарбонільну, піперазин-1-ілкарбонільну, 4-метилпіперазин-1-ілкарбонільну або 4-етилпіперазин-1-ілкарбонільну групу, а

R<sub>g</sub>, яка відокремлена від атому азоту R<sub>e</sub>NR<sub>d</sub>-групи щонайменше двома атомами вуглецю, означає гідрокси-, метокси- або етоксигрупу,

піперидин-1-ільну або гексагідроацепін-1-ільну групу, яка в положенні 3 або 4 заміщена R<sub>e</sub>NR<sub>d</sub>-групою та додатково може бути заміщена однією або двома C<sub>1-3</sub>-алкільними групами, причому R<sub>e</sub> та R<sub>d</sub> мають наведені вище значення,

піперидин-1-ільну або гексагідроацепін-1-ільну групи, які в положенні 3 заміщена аміно-, C<sub>1-3</sub>-алкіламіно- або ді(C<sub>1-3</sub>-алкіл)аміногрупою, в яких 2 атоми водню на вуглецевому скелеті піперидин-1-ільної або гексагідроацепін-1-ільної групи замінені нерозгалуженим алкіленовим місточком, причому цей місточок містить 2-5 атомів вуглецю, якщо 2 атоми водню знаходяться на тому самому атомі вуглецю, або 1-4 атоми вуглецю, якщо атоми водню знаходяться на сусідніх атомах вуглецю, або 1-4 атоми вуглецю, якщо атоми водню знаходяться на атомах вуглецю, розділених одним атомом, або 1-3 атоми (вуглецю, якщо два атоми водню знаходяться на атомах вуглецю, розділених двома атомами,

ацетидин-1-ільну, піролідін-1-ільну, піперидин-1-ільну або гексагідроацепін-1-ільну групу, заміщену аміно-C<sub>1-3</sub>-алкільною, C<sub>1-3</sub>-алкіламіно-C<sub>1</sub>-



3-алкільною або ді(С<sub>1-3</sub>-алкіл)аміно-С<sub>1-3</sub>-алкільною групою,

піперазин-1-ільну або [1,4]діацепан-1-ільну групу, в разі необхідності, заміщену на вуглецевому скелеті однією або двома С<sub>1-3</sub>-алкільними групами,

3-іміно-піперазин-1-ільну, 3-іміно-[1,4]діацепан-1-ільну або 5-іміно-[1,4]діацепан-1-ільну групу, в разі необхідності, заміщену на вуглецевому скелеті однією або двома С<sub>1-3</sub>-алкільними групами,

[1,4]діацепан-1-ільну групу, заміщену, в разі необхідності, однією або двома d-3-алкільними групами, яка в положенні 6 заміщена аміногрупою,

С<sub>3-7</sub>-циклоалкільну групу, заміщену аміно-, С<sub>1-3</sub>-алкіламіно- або ді(С<sub>1-3</sub>-алкіл)аміногрупою,

С<sub>3-7</sub>-циклоалкільну групу, заміщену аміно-С<sub>1-3</sub>-алкільною, С<sub>1-3</sub>-алкіламіно-С<sub>1-3</sub>-алкільною або ді(С<sub>1-3</sub>-алкіл)аміно-С<sub>1-3</sub>-алкільною групою,

С<sub>3-7</sub>-циклоалкіл-С<sub>1-2</sub>-алкільну групу, в якій циклоалкільна частина заміщена аміно-, С<sub>1-3</sub>-алкіламіно- або ді(С<sub>1-3</sub>-алкіл)аміногрупою,

С<sub>3-7</sub>-циклоалкіл-С<sub>1-2</sub>-алкільну групу, в якій циклоалкільна частина заміщена аміно-С<sub>1-3</sub>-алкільною, С<sub>1-3</sub>-алкіламіно-С<sub>1-3</sub>-алкільною або ді(С<sub>1-3</sub>-алкіл)аміно-С<sub>1-3</sub>-алкільною групою,

С<sub>3-7</sub>-циклоалкіламіногрупу, в якій циклоалкільна частина заміщена аміно-, С<sub>1-3</sub>-алкіламіно- або ді(С<sub>1-3</sub>-алкіл)аміногрупою, причому обидва атоми азоту в циклоалкільній частині відокремлені один від одного щонайменше двома атомами вуглецю,

N-(С<sub>3-7</sub>-циклоалкіл)-N-(С<sub>1-3</sub>-алкіл)аміногрупу, в якій циклоалкільна частина заміщена аміно-, С<sub>1-3</sub>-алкіламіно- або ді(С<sub>1-3</sub>-алкіл)аміногрупою, причому обидва атоми азоту в циклоалкільній частині відокремлені один від одного щонайменше двома атомами вуглецю,

С<sub>3-7</sub>-циклоалкіламіногрупу, в якій циклоалкільна частина заміщена аміно-С<sub>1-3</sub>-алкільною, С<sub>1-3</sub>-алкіламіно-С<sub>1-3</sub>-алкільною або ді(С<sub>1-3</sub>-алкіл)аміно-С<sub>1-3</sub>-алкільною групою,

N-(С<sub>3-7</sub>-циклоалкіл)-N-(С<sub>1-3</sub>-алкіл)аміногрупу, в якій циклоалкільна частина заміщена аміно-С<sub>1-3</sub>-алкільною, С<sub>1-3</sub>-алкіламіно-С<sub>1-3</sub>-алкільною або ді(С<sub>1-3</sub>-алкіл)аміно-С<sub>1-3</sub>-алкільною групою,

С<sub>3-7</sub>-циклоалкіл-С<sub>1-2</sub>-алкіламіногрупу, в якій циклоалкільна частина заміщена аміно-, С<sub>1-3</sub>-алкіламіно- або ді(С<sub>1-3</sub>-алкіл)аміногрупою,

N-(С<sub>3-7</sub>-циклоалкіл-С<sub>1-2</sub>-алкіл)-N-(С<sub>1-2</sub>-алкіл)аміногрупу, в якій циклоалкільна частина заміщена аміно-, С<sub>1-3</sub>-алкіламіно- або ді(С<sub>1-3</sub>-алкіл)аміногрупою,

С<sub>3-7</sub>-циклоалкіл-С<sub>1-2</sub>-алкіламіногрупу, в якій циклоалкільна частина заміщена аміно-С<sub>1-3</sub>-алкільною, С<sub>1-3</sub>-алкіламіно-С<sub>1-3</sub>-алкільною або ді(С<sub>1-3</sub>-алкіл)аміно-С<sub>1-3</sub>-алкільною групою,

N-(С<sub>3-7</sub>-циклоалкіл-С<sub>1-2</sub>-алкіл)-N-(С<sub>1-2</sub>-алкіл)аміногрупу, в якій циклоалкільна частина заміщена аміно-С<sub>1-3</sub>-алкільною, С<sub>1-3</sub>-алкіламіно-С<sub>1-3</sub>-алкільною або ді(С<sub>1-3</sub>-алкіл)аміно-С<sub>1-3</sub>-алкільною групою,

аміногрупу, заміщену залишками R<sup>15</sup> та R<sup>16</sup>, в якій

R<sup>15</sup> означає С<sub>1-6</sub>-алкільну групу, С<sub>3-6</sub>-циклоалкільну, С<sub>3-6</sub>-циклоалкіл-С<sub>1-3</sub>-алкільну, арилну або арил-С<sub>1-3</sub>-алкільну групу, а

R<sup>16</sup> означає Н<sup>17</sup>-С<sub>2-3</sub>-алкільну групу, причому С<sub>2-3</sub>-алкільна частина є нерозгалуженою та може

бути заміщена 1-4 С<sub>1-3</sub>-алкільними групами, які можуть бути однаковими або різними, а

R<sup>17</sup> означає аміно-, С<sub>1-3</sub>-алкіламіно- або ді(С<sub>1-3</sub>-алкіл)аміногрупу, причому, якщо R<sup>3</sup> означає метильну групу, R<sup>17</sup> не може означати ді(С<sub>1-3</sub>-алкіл)аміногрупу,

аміногрупу, заміщену залишком R, в якій

R<sup>20</sup> означає ацетидин-3-ільну, ацетидин-2-ілметильну, а цетидин-3-іл метильну, піролідін-3-ільну, піролідін-2-ілметильну, піролідін-3-ілметильну, піперидин-3-ільну, піперидин-4-ільну, піперидин-2-ілметильну, піперидин-3-ілметильну або піперидин-4-ілметильну групу, причому наведені для R<sup>20</sup> залишки можуть бути відповідно заміщені однією або двома С<sub>1-3</sub>-алкільними групами, аміногрупу, заміщену залишками R<sup>15</sup> та R<sup>20</sup>, в якій

R<sup>15</sup> та R<sup>20</sup> мають наведені вище значення, причому наведені для R<sup>20</sup> залишки можуть бути відповідно заміщені однією або двома С<sub>1-3</sub>-алкільними групами,

R<sup>19</sup>-С<sub>3-4</sub>-алкільну групу, в якій С<sub>3-4</sub>-алкільна частина є нерозгалуженою і може бути заміщена залишком R<sup>15</sup> та додатково замінена однією або двома С<sub>1-3</sub>-алкільними групами, причому R<sup>15</sup> має наведене вище значення, а R<sup>19</sup> означає аміно-, С<sub>1-3</sub>-алкіламіно- або ді(С<sub>1-3</sub>-алкіл)аміногрупу,

піролідін-3-ільну, піперидин-3-ільну, піперидин-4-ільну, гексагідроацепін-3-ільну або гексагідроацепін-4-ільну групу, яка в положенні 1 заміщена аміно-, С<sub>1-3</sub>-алкіламіно- або ді(С<sub>1-3</sub>-алкіл)аміногрупою,

або ацетидин-2-іл-С<sub>1-2</sub>-алкільну, ацетидин-3-іл-С<sub>1-2</sub>-алкільну, піролідін-2-іл-С<sub>1-2</sub>-алкільну, піролідін-3-ільну, піролідін-3-іл-С<sub>1-2</sub>-алкільну, піперидин-2-іл-С<sub>1-2</sub>-алкільну, піперидин-3-ільну, піперидин-3-іл-С<sub>1-2</sub>-алкільну, піперидин-4-ільну або піперидин-4-іл-С<sub>1-2</sub>-алкільну групу, причому зазначені вище групи можуть бути відповідно заміщені однією або двома С<sub>1-3</sub>-алкільними групами,

причому алкільні групи, згадані при визначенні зазначених вище залишків, означають фенільні групи, які незалежно одна від одної, можуть бути моно- або дизаміщені R<sub>h</sub>, причому замісники можуть бути однаковими або різними, а R<sub>h</sub> означає атом фтору, хлору, бромово або йоду, трифторметильну, С<sub>1-3</sub>-алкільну, циклопропильну, етенільну, етинільну, гідрокси-, С<sub>1-3</sub>-алкілокси-, дифторметоксис- або трифторметоксигрупу,

гетероарильні групи, згадані при визначенні зазначених вище залишків, означають піролілну, фуранільну, тіенільну, піридилну, індолільну, бензофуранільну, бензотіофенільну, хінолінільну або ізохінолінільну групу,

або піролілну, фуранільну, тіенільну або піридилну групу, в якій одна або дві метинові групи замінені атомами азоту,

або індолільну, бензофуранільну, бензотіофенільну, хінолінільну або ізохінолінільну групу, в якій 1-3 метинові групи замінені атомами азоту,

причому 5-членні групи або молекулярні частини можуть бути відповідно заміщені С<sub>1-3</sub>-алкільною або трифторметильною групою,

а 6-членні групи або молекулярні частини можуть бути відповідно заміщені однією або двома С<sub>1-3</sub>-алкільними групами або атомом фтору, хлору,

брому або йоду, трифторметильною, гідрокси-, С<sub>1-3</sub>-алкілокси-, дифторметокси- або трифторметокси групою,

причому, якщо не зазначено нічого іншого, алкільна, алкенільна та алкінільна групи можуть бути нерозгалуженими або розгалуженими,

а також N-окисовані на атомі кільцевого азоту в положенні 9 ксантинового скелету метильовані або етильовані похідні,

з вказівкою, що сполуки, в яких

R<sup>1</sup> означає атом водню, метильну, пропільну, 2-гідроксипропільну, амінокарбонілметильну або бензильну групу,

R<sup>2</sup> означає метильну групу,

R<sup>3</sup> означає С<sub>1-3</sub>-алкільну групу, бензильну групу, заміщену, в разі необхідності, атомом фтору, хлору або брому або метильною групою, 1-фенілетильну або 2-фенілетильну групу, 2-пропен-1-ільну, 2-бутен-1-ільну, 3-хлор-2-бутен-1-ільну або 2-метил-2-пропен-1-ільну групу,

а

R<sup>4</sup> означає піперазин-1-ільну групу, включаються,

та з вказівкою, що сполуки, в яких

R<sup>1</sup> означає атом водню або метильну групу,

R<sup>2</sup> означає атом водню або метильну групу,

R<sup>3</sup> означає метильну групу,

R<sup>4</sup> означає 3-амінопропільну, 3-[ді(С<sub>1-3</sub>-алкіл)аміно]пропільну, 1-феніл-3-[ді(С<sub>1-3</sub>-алкіл)аміно]пропільну, 1-феніл-3-метил-3-(диметиламіно)пропільну, 1-(4-хлорфеніл)-3-(диметиламіно)пропільну, 1-феніл-2-метил-3-(диметиламіно)-пропільну, 1-(3-метоксифеніл)-3-(диметиламіно)пропільну або 4-амінобутильну групу, включаються,

та з вказівкою, що сполука

1,3,7-триметил-8-(1-аміноциклогексил)ксантин виключається,

їх ізомери та їх солі.

Наприклад, перевага надають таким згаданим вище сполукам:

(1) 1,3-диметил-7-бензил-8-(3-амінопіролідин-1-іл)ксантин,

(2) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіролідин-1-іл)ксантин,

(3) 1,3-диметил-7-бензил-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин,

(4) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[(транс-2-аміноциклогексил)аміно]ксантин,

(5) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин,

(6) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(4-амінопіперидин-1-іл)ксантин,

(7) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[(ціс-2-аміноциклогексил)аміно]ксантин,

(8) 1,3-диметил-7-(2-бути-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин,

(9) 1,3-диметил-7-[(1-циклопентен-1-іл)метил]-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин,

(10) 1,3-диметил-7-(2-тієнілметил)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин,

(11) 1,3-диметил-7-(3-фторбензил)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин,

(12) 1,3-диметил-7-(2-фторбензил)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин,

(13) 1,3-диметил-7-(4-фторбензил)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин,

(14) 1,3-диметил-7-(2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин,

(15) 1,3-біс-(циклопропілметил)-7-бензил-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин,

(16) (R)-1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин,

(17) (S)-1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин,

(18) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-аміногексагідроацепін-1-іл)ксантин,

(19) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(4-аміно-гексагідроацепін-1-іл)ксантин,

(20) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(Ціс-3-аміноциклогексил)ксантингідрохлорид,

(21) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-метиламінопіперидин-1-іл)ксантин,

(22) 1-(2-фенілетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин,

(23) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[N-(2-аміноетил)метиламіно]ксантин,

(24) 1-[2-(тіофен-2-іл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-аміно-піперидин-1-іл)ксантин,

(25) 1-[2-(тіофен-3-іл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин,

(26) 1-[2-(2-метилфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин,

(27) 1-[2-(3-метилфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин,

(28) 1-[2-(3-метоксифеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин,

(29) 1-((E)-2-фенілвініл)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин,

(30) 1-(2-фенілетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-((5)-3-амінопіперидин-1-іл)ксантин,

(31) 1-(2-фенілетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-((R)-3-амінопіперидин-1-іл)ксантин,

(32) 1-[2-(2-метоксифеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин,

(33) 1-[2-(тіофен-3-іл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин,

(34) 1-(2-феніл-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-((S)-3-амінопіперидин-1-іл)ксантин,

(35) 1-(2-феніл-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-((R)-3-амінопіперидин-1-іл)ксантин,

(36) 1-[(ізохінолін-1-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-((R)-3-амінопіперидин-1-іл)ксантин,

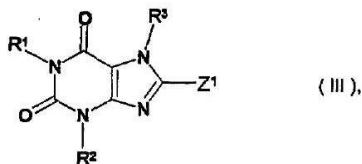
(37) 1-[(ізохінолін-1-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-((S)-3-амінопіперидин-1-іл)ксантин та

(38) 1-[(1-нафтил)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин, а також їх солі.

Згідно з винаходом сполуки загальної формули I одержуть вже відомим способами, наприклад, такими як:

а) Одержання сполук загальної формули I, в якій R<sup>4</sup> означає один із згаданих вище залишків, зв'язаних з ксантиновим скелетом атомом азоту:

шляхом взаємодії сполуки загальної формули



в якій

R<sup>1</sup>-R<sup>3</sup> мають наведені вище значення, а

Z<sup>1</sup> означає вихідну групу, наприклад, атом галогену, заміщену гідрокси-, меркапто-, сульфінільну, сульфонільну або сульфонілоксигрупу, а також атом хлору або броду, метансульфонільну або метансульфонілоксигрупу, зі сполукою загальної формули

H-R<sup>4</sup> (IV),

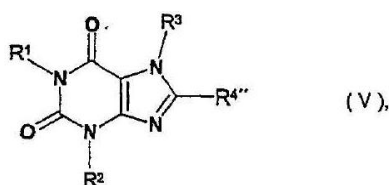
в якій

R<sup>4</sup> означає один із згаданих вище для R<sup>4</sup> залишків, який зв'язаний атомом кільцевого азоту з ксантиновим скелетом загальної формули.

Взаємодія здійснюється у розчиннику, наприклад, в ізопропанолі, бутанолі, тетрагідрофурані, діоксані, толуолі, хлорбензолі, диметилформаміді, диметилсульфоксиді, метиленхлориді, монометильному етері етилендіколю, діетиловому етері етиленгліколю або сульфолані, в разі необхідності, в присутності неорганічної або третинної органічної основи, наприклад, карбонату натрію або гідроксиду калію, третинної органічної основи, наприклад, триетиламіну, або в присутності N-етилдіізопропіламіну (основа Хюніга), причому ці органічні основи одночасно можуть використовуватися як розчинники, та, в разі необхідності, в присутності промотора реакції, наприклад, галогеніду лужного металу або каталізатора на основі паладія при температурі від -20 до 180°C, переважно від -10 до 120°C. Взаємодія може здійснюватися також без наявності розчинника або в надлишковій кількості використовуваної сполуки загальної формули IV.

б) Одержання сполуки загальної формули I, в якій R<sup>4</sup> згідно із наведеним вище визначення містить аміногрупу або, в разі необхідності, заміщену в алкільній частині алкіламіногрупу:

шляхом видалення захисної групи сполуки загальної формули



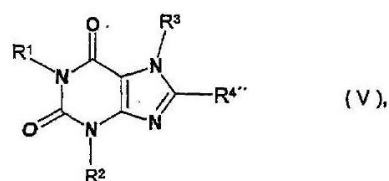
в якій R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> та R<sup>3</sup> мають наведені вище значення, а

R<sup>4</sup>'' містить N-трет.-бутилоксикарбоніламіногрупу або N-трет.-бутилоксикарбоніл-N-алкіламіногрупу, причому алкільна частина N-трет.-бутилоксикарбоніл-N-алкіламіногрупи може бути заміщена, як зазначено вище.

Відщеплення трет.-бутилоксикарбонільного залишку відбувається переважно внаслідок обробки сполуки кислотою, наприклад, трифтороцтовою кислотою або соляною кислотою або обробки її бромтриметилсиланом або йодтриметилсиланом, в разі необхідності, у присутності розчинника, такого як метиленхлорид, естер оцтової кислоти, діоксан, метанол або діетиловий етер, при температурі 0-80°C.

с) Одержання сполуки загальної формули I, в якій R<sup>2</sup> згідно із згаданим вище визначення означає атом водню:

шляхом видалення захисної групи сполуки загальної формули



в якій R<sup>1</sup>, R<sup>3</sup> та R<sup>4</sup> мають наведені вище значення, а R<sup>2</sup> означає захисну групу, наприклад, метоксиметильну, бензилоксиметильну, метоксисетоксиметильну або 2-(триметилсиліл)етилоксиметильну групу.

Відщеплення захисного залишку відбувається, наприклад, за допомогою кислоти, такої як оцтова, трифтороцтова, соляна, сірчана кислота або кислотного іонообмінника в розчиннику, наприклад, в метиленхлориді, тетрагідрофурані, метанолі, етанолі або ізопропанолі або в їх сумішах, причому 2-(триметилсиліл)етилоксиметильна група може відокремлюватися також за допомогою фторводневої кислоти або солі фторводневої кислоти: наприклад, тетрабутиламонійфториду.

Якщо згідно з винаходом одержують сполуку загальної формули I, яка містить аміно-, алкіламіно- або іміногрупу, то її шляхом ацилювання та сульфонування можна перетворити на відповідну ацильну або сульфонільну сполуку загальної формули I;

якщо одержують сполуку загальної формули I, яка містить аміно-, алкіламіно- або іміногрупу, то її шляхом алкілювання або відновлювального алкілювання можна перетворити на відповідну алкільну сполуку загальної формули I,

якщо одержують сполуку загальної формули I, яка містить нітрогрупу, то її шляхом відновлювання можна перетворити на відповідну аміносполуку;

якщо одержують сполуку загальної формули I, яка містить іміногрупу, то її шляхом нітрузування та подальшого відновлення можна перетворити на відповідну N-аміноіміносполуку;

якщо одержують сполуку загальної формули I, яка містить C<sub>1-3</sub>-алкілоксикарбонільну групу, то її шляхом розщеплення естеру можна перетворити на відповідну карбоксильну сполуку;

якщо одержують сполуку загальної формули I, в якій R<sup>1</sup> містить карбонільну групу, то її, наприклад, шляхом відновлення за допомогою гідроксил аміну можна перетворити на відповідний оксим загальної формули I;

якщо одержують сполуку загальної формули I, яка містить карбоксильну групу, то її шляхом етерифікації можна перетворити на відповідний естер загальної формули I;

або якщо одержують сполуку загальної формули I, яка містить карбоксильну або естерову групу, то її внаслідок взаємодії з аміном можна перетворити на відповідний амід загальної формули I.

Наступна етерифікація, в разі необхідності, відбувається у розчиннику або суміші розчинників, наприклад, метиленхлориді, диметилформаміді, бензолі, толуолі, хлорбензолі, тетрагідрофурані, бензол/тетрагідрофурані або діоксані або особливо переважно у відповідному спирті, в разі необхідності, в присутності кислоти, такої як соляна кислота, або в присутності дегідратизуючих засобів, наприклад, в присутності ізобутильного естеру хлор метанової кислоти, тіонілхлориду, триметилхлорсилану, сірчаної кислоти, метансульфонової кислоти, р-толуолсульфонової кислоти, фосфортрихлориду, фосфорпентоксиду, N,N'-дициклогексилкарбодііміду, N,N'-дициклогексилкарбодііміду/N-гідроксисуциніміду або 1-гідроксибензотриазолу та, в разі необхідності, додатково в присутності 4-диметиламінопіридину, N,N'-карбонілдіімідазолу або трифенілфосфіну/тетрахлорвуглеводу, при температурі 0-150°C, переважно при температурі 0-80°C.

Утворення естеру може також відбуватися внаслідок взаємодії сполуки, яка містить карбоксильну групу, з відповідним галогенідом алкілу.

Наступне ацилювання або сульфонування, в разі необхідності, відбувається в розчиннику або суміші розчинників, наприклад, метиленхлориді, диметилформаміді, бензолі, толуолі, хлорбензолі, тетрагідрофурані, бензол/тетрагідрофурані або діоксані за допомогою відповідної похідної ацилу або сульфонілу, в разі необхідності, в присутності третинної органічної основи або в присутності неорганічної основи або в присутності зневоднюючих засобів, наприклад, в присутності ізобутильного естеру хлорметанової кислоти, тіонілхлориду, триметилхлорсилану, сірчаної кислоти, метансульфонової кислоти, р-толуолсульфонової кислоти, фосфортрихлориду, фосфорпентоксиду, N,N'-дициклогексилкарбодііміду, N,N'-дициклогексилкарбодііміду/N-гідроксисуциніміду або 1-гідроксибензотриазолу та, в разі необхідності, додатково в присутності 4-диметиламінопіридину, N,N'-карбонілдіімідазолу або трифенілфосфіну/тетрахлорводню при температурі 0-150°C, переважно 0-80°C.

Наступне алкілювання відбувається, в разі необхідності, в розчиннику або суміші розчинників, наприклад, диметилформаміді, бензолі, толуолі, хлорбензолі, тетрагідрофурані, бензол/тетрагідрофурані або діоксані за допомогою алкілюючого агента, наприклад, відповідного галогеніду або естеру сульфонової кислоти, за допомогою метилйодиду, етилброміду, диметилсуль-

фату або бензилхлориду, в разі необхідності, в присутності третинної органічної основи або в присутності неорганічної основи при температурі 0-150°C, переважно 0-100°C.

Наступне відновлювальне алкілювання відбувається за допомогою відповідної карбонільної сполуки, наприклад, формальдегіду, ацетальдегіду, пропіональдегіду, ацетону або бутиральдегіду в присутності комплексного гідриду металу, наприклад, боргідриду натрію, боргідриду літію, ацетоксидоборгідриду натрію або ціаноборгідриду натрію при рН-значенні 6-7 та кімнатній температурі або в присутності каталізатору гідрювання, наприклад, з воднем в присутності паладію/вугілля при гідростатичному тиску 1-5бар. Метилування може відбуватися також в присутності метанової кислоти як відновлювана при підвищених температурах, наприклад, при температурі 60-120°C.

Наступне відновлювання нітрогрупи, відбувається, наприклад, за допомогою водню та каталізатора, наприклад, паладію, на активованому вугіллі, діоксиді платини або еікелі Ренея або за допомогою інших відновлювачів, наприклад, заліза або цинку в присутності кислоти, наприклад, оцтової кислоти.

Наступне нітразування іміногрупи з наступним відновлюванням до утворення N-аміноіміносполуки відбувається, наприклад, таким чином, що іміносполуку нітروزують алкілнітритом, наприклад, ізоамілнітритом, а утворену N-нітрозоеіміносполуку відновлюють безпосередньо до утворення N-аміноіміносполуки, використовуючи для цього, наприклад, цинк в присутності кислоти, наприклад, оцтової кислоти.

Наступне розщеплення C<sub>1-3</sub> - алкілоксикарбонільної групи на карбоксигрупу відбувається, наприклад, гідролітично за допомогою кислоти, наприклад, соляної або сірчаної кислоти або гідроксиду лужного металу, наприклад, гідроксиду літію, гідроксиду натрію або гідроксиду калію.

Наступне утворення амідів відбувається внаслідок взаємодії відповідної похідної карбонової кислоти, здатної вступати в реакцію, з відповідним амідом, в разі необхідності, в розчиннику або суміші розчинників, наприклад, метиленхлориді, диметилформаміді, бензолі, толуолі, хлорбензолі; тетрагідрофурані, бензол/тетрагідрофурані або діоксані, причому амін одночасно може виступати розчинником, в разі необхідності, в присутності третинної органічної основи або в присутності неорганічної основи або за допомогою відповідної карбонової кислоти в присутності зневоднюючих засобів, наприклад, в присутності ізобутильного естеру хлорметанової кислоти, тіонілхлориду, триметилхлорсилану, фосфортрихлориду, фосфорпентоксиду, N,N'-дициклогексилкарбодііміду, N,N'-дициклогексилкарбодііміду/N-гідроксисуциніміду або 1-гідроксибензотриазолу та, в разі необхідності, додатково а присутності 4-диметиламінопіридину, N,N'-карбонілдіімідазолу або трифенілфосфіну/тетрахлорвуглецю при температурі 0-150°C, переважно 0-80°C.

Під час описаної вище взаємодії, в разі необхідності, наявні реактивні групи, такі як гідрокси-, карбокси-, аміно-, алкіламіно- або іміногрупи, в процесі взаємодії можуть бути захищені іншими

захисними групами, які після взаємодії знову відщеплюються.

Захисними залишками для гідроксигрупи є наприклад, триметилсилільна, ацетильна, бензоїльна, метильна, етильна, трет.-бутильна, тритильна, бензильна або тетрагідропіранільна група,

захисними залишками для карбоксигрупи є триметилсилільна, метильна, етильна, трет.-бутильна, бензильна або тетрагідропіранільна група,

захисними залишками для аміно-, алкіламіно- або іміногрупи є формільна, ацетильна, трифторацетильна, етоксикарбонільна, трет.-бутоксикарбонільна, бензилоксикарбонільна, бензильна, метоксибензильна або 2,4-диметоксибензильна група, а для аміногрупи додатково фталильна група.

В разі необхідності, наступне відокремлення використаного захисного залишку відбувається, наприклад, гідролітично у водному розчиннику, наприклад, у воді, ізопропанол/вода, оцтова кислота/вода, тетрагідрофуран/вода або діоксан/вода, в присутності кислоти, такої, як трифтороцтова кислота, соляна або сірчана кислота, або в присутності основи лужного металу, наприклад, гідроксиду натрію або гідроксиду калію, або апротонно, наприклад, в присутності йодтриметилсилану, при температурі 0-120°C, переважно 10-100°C:

Відокремлення бензильного, метоксибензильного або бензилоксикарбонільного залишку відбувається, наприклад, гідрогенолітично, наприклад, за допомогою водню в присутності каталізатора, такого як паладій/вугілля у відповідному розчиннику, такому як метанол, етанол, етильний естер оцтової кислоти або льодяна оцтова кислота, в разі необхідності, з використанням кислоти, наприклад, соляної, при температурі 0-100°C, переважно при кімнатній температурі 20-60°C, та гідростатичному тиску 1-7бар, переважно 3-5бар. Відокремлення 2,4-диметоксибензильного залишку відбувається переважно в трифтороцтовій кислоті в присутності анізолу.

Відокремлення трет.-бутильного трет.-бутилоксикарбонільного залишку відбувається переважно шляхом обробки кислотою, такою як трифтороцтова кислота або соляна кислота, або шляхом обробки йодтриметилсиланом, в разі необхідності, з використанням розчинника, наприклад, метиленхлориду, діоксану, метанолу або діетильного етеру.

Відокремлення трифторацетильного залишку відбувається переважно шляхом обробки кислотою, такою як соляна кислота, в разі необхідності, в присутності розчинника, наприклад, оцтової кислоти при температурі 50-120°C або шляхом обробки натрієвим лугом, в разі необхідності, в присутності розчинника, наприклад, тетрагідрофурану при температурі 0-50°C.

Відокремлення фталильного залишку відбувається переважно в присутності гідразину або первинного аміну, такого як метиламін, етиламін або n-бутиламін, в розчиннику, наприклад, метанолі, етанолі, ізопропанолі, толуол/вода або діоксані при температурі 20-50°C.

Крім того одержані сполуки загальної формули I, згадані вище, можуть бути розділені на їх енантіомери та/або діастереомери. Так, наприклад, ціс-/транс-суміші можуть бути розділені на їх ціс та транс-ізомери, а сполуки, що містять щонайменше один оптично активний атом вуглецю, можуть бути розділені на їх енантіомери.

Таким чином одержані ціс-/транс-суміші за допомогою хроматоргасьа можуть бути розділені на їх ціс- та транс-ізомери; а одержані сполуки загальної формули I, які входять до складу рацемічної суміші, відомими способами [див. Ailingner N. L. та Eliel E. L. "Topics in Stereochemistry" ("Питання в галузі стереохімії" під редакцією Ailingner N. L. та Elief E. L.), том 6, Wiley Interscience, 1971] можуть бути розділені на їх оптичні антиподи, а сполуки загальної формули I, що містять щонайменше 2 асиметричних атоми вуглецю, на основі їх фізико-хімічних розбіжностей відомими способами, наприклад, хроматографом та/або за допомогою фракційної кристалізації можуть бути розділені на їх діастереомери, які, якщо вони представлені у рацемічній формі, можуть бути розділені на енантіомери, як описано вище.

Розділення енантіомерів відбувається переважно внаслідок розділення колонни на хіральні фази або внаслідок перекристалізації з оптично активного розчинника або внаслідок взаємодії із оптично активною субстанцією, яка з рацемічною сполукою утворює солі або похідні, наприклад естер або амід, зокрема з кислотами та їх активними похідними або спиртами, та розділення одержаної таким чином діастереомерної суміші солей або похідної, наприклад, на основі різних розчинностей, причому вільні антиподи можуть вивільнитись із чистих діастереомерних солей або похідних під впливом відповідних засобів. Оптично активними солями, які найчастіше використовуються, є, наприклад, D- та L-форми винної кислоти або дибензоїлвинної кислоти, ді-о-толілзінної кислоти, яблучної кислоти, мигдалевої кислоти, кампферсульфонової кислоти, глутамінової кислоти, аспарагінової кислоти або хінної кислоти. Оптично активним спиртом є, наприклад, (+)- або (-)-метанол, а оптично активним ациловим залишком в амідах є, наприклад, (+)- або (-)-ментилоксикарбоніл.

Крім того одержані сполуки формули I можуть бути перетворені на їх солі, зокрема для фармацевтичного використання на їх фізіологічно прийнятні солі за допомогою неорганічних або органічних кислот. Як кислоти, наприклад, використовують соляну, бромводневу, сірчану, метансульфонову, фосфорну, фумарову, бурштинову, молочну, лимонну, винну або малеїнову кислоту.

Крім того одержані нові сполуки формули I, якщо вони містять карбоксигрупу, можуть бути перетворені на їх солі за допомогою неорганічних або органічних основ, зокрема для фармацевтичного використання на їх фізіологічно прийнятні солі. Як основи використовують, наприклад, гідроксид натрію, гідроксид калію, аргінін, циклогексамін, етаноламін, діетаноламін та триетаноламін.

Сполуки загальної формули III-VI, які використовуються як вихідна речовина, або відомі з літе-

ратурних джерел, або їх одержують відомими з літературних джерел способами (див. приклади I-XXXI).

Вихідну сполуку загальної формули III одержують, наприклад, внаслідок взаємодії похідної теофіліну, галогенованої в положенні 8, з відповідно заміщеним галогенідом алкілу.

Як вже було зазначено вище, сполуки загальної формули I та їх фізіологічно прийнятні солі згідно з винаходом проявляють цінні фармакологічні властивості, зокрема інгібуючий вплив на ензим DPP-IV.

Біологічні властивості нових сполук були перевірені наступним чином:

Здатність субстанцій та їх солей, інгібувати активність DPP-IV, можна продемонструвати на макеті, на якому екстракт клітин карциноми кишечника людини Caco-2 використовують як джерело DPP-IV. Цю лінію клітин одержали з American Type Culture Collection (ATCC HTB 37). Диференціювання клітин з метою індукування вираження DPP-IV, здійснювалося згідно з описом [Reiner та інш. в статті під заголовком "Increased expression of intestinal cell line Caco-2", опублікованій в Proc. Natl. Acad. Sci. том 90, стор.5757-5761 (1993)]. Клітинний екстракт одержували з клітин, солюбілізованих у буферному розчині (10mM Tris HCl, 0,15M NaCl, 0,04 аprotиніну, 0,5% нонідет-P40, pH 8.0) шляхом центрифугування 35,000g протягом 30 хвилин при температурі 4°C (до видалення фрагментів зруйнованих клітин).

Аналіз DPP-IV здійснювався наступним чином:

50 (μl розчину субстрату (AFC; AFC означає амідо-4-трифторметилкумарин), кінцевої концентрації 100μM, представлені у вигляді мікропластин титру. 20μl буферного розчину (кінцевої концентрації 50μM Tris HCl pH 7, 8,50μM NaCl, 1% DMSO) додають за допомогою піпетки. Реакція починається після додавання 30μl солюбілізованого Caco-2 протеїну (кінцевої концентрації 0,14μl протеїніну). Випробувану речовину додають у концентрації 20μl у попередньо розрідженій формі, причому об'єм буферного розчину значно зменшується. Реакція здійснюється при кімнатній температурі, період інкубації триває 60 хвилин. Після цього вимірюють флуоресценцію за допомогою вимірювального приладу Victor 1420 Multilabel Counter, причому довжина хвилі збудження складала 405nm, а довжина хвилі випромінювання - 535nm. Значення без активної речовини (відповідно 0% активності) вимірюють у композиції без Caco-2 протеїну (з використанням буферного розчину), контрольні значення (відповідно 100% активності) - без додавання субстанції. Активність відповідної випробовуваної речовини, виражена як IC<sub>50</sub>-значення, підраховують з кривої доза-ефект, яка складається відповідно з 11 точок вимірювання. Нижче наведені одержані результати:

Сполука (приклад №)	DPP IV-інгібування IC <sub>50</sub> [нМ]
1(2)	82
1(6)	230
1(15)	624
1(16)	78
1(19)	2770

1(21)	124
1(25)	56
1(27)	125
1(28)	166
1(30)	2050
1(34)	205
1(35)	95
1(55)	142
1(60)	57
1(62)	167
1(70)	32
1(97)	212
1(121)	10
2(1)	22
2(22)	66
2(28)	5
2(56)	64
2(77)	22
2(85)	17
2(88)	6
2(113)	20
2(119)	2
2(127)	22
2(131)	127
2(136)	3
6	55

Одержані сполуки згідно з винаходом добре переносяться, оскільки, наприклад, після орального прийняття пацюками 30мг/кг сполуки прикладу 1 (2) точична побічна дія не спостерігалася.

З огляду на затність інгібувати активність DPP-IV згідно з винаходом сполуки загальної формули I та їх відповідні фармакологічно прийнятні солі здатні впливати на всі стани або хвороби, на які може справляти вплив інгібування активності DPP-IV. Тому слід очікувати, що сполуки згідно з винаходом придатні для попередження або лікування хвороб або станів, таких як цукровий діабет типу I та II, ускладнення після діабету, метаболічний ацидоз або кетоз, резистентність до інсуліну, дієліпідемію різного походження, артрит, атеросклероз та споріднені хвороби, адипозит, порушення при трансплантації алотрансплантанту та остеопороз, спричинений кальцитоніном. Крім того ці субстанції придатні для запобігання дегенерації В-клітин, наприклад, запобігання апатозу або некрозу панкреатичних В-клітин. Крім того субстанції придатні покращувати або відновлювати функціональність панкреатичних клітин, підвищуючи при цьому кількість та розміри панкреатичних В-клітин. Додатково з огляду на роль глюкагоноподібного пептиду, такого як, наприклад, GLP-1 та GLP-2, та їх поєднання з інгібуванням DPP-IV очікують, що сполуки згідно з винаходом придатні крім того проявляти седативний ефект або ефект позбавлення страху, сприятливо впливати на катаболічні післяопераційні стани або гормональні стреси або зменшувати відсоток смертності та захворюваності після інфаркту міокарди. Крім того вони придатні для лікування всіх станів, пов'язаних із зазначеними вище впливами та які передаються GLP-1 або GLP-2. Сполуки згідно з винаходом можуть також використовуватися як диуретики або протигіперто-

нічні засоби та придатні для запобігання та лікування гострих ниркових захворювань. Також вони придатні для запобігання та терапії хронічних запальних захворювань кишкового тракту. Крім того очікується, що інгібітори DPP-IV, а також сполуки згідно з винаходом можуть використовуватись для лікування безпліддя або для покращення репродуктивних здібностей у людини або в організмі ссавців, зокрема тоді, коли безпліддя пов'язане з резистентністю до інсуліну або з поліцистичним оваріальним синдромом. Крім того субстанції придатні впливати на дефіцит гормону росту, що пов'язаного з карликовим зростом:

Сполуки згідно з винаходом можуть також використовуватись у комбінації з іншими активними речовинами. До лікарських засобів, придатних використовуватись у комбінації з даними сполуками, належать, наприклад, антидіабетичні засоби, такі як метформін, сульфонілкарбаміди (наприклад, глібенкламід, толбутамід, глімепірид), нателініди, репаглініди, тіазолідиндіони (наприклад, розіглітазони, піоглітазони), PPAR-гама-агоністи (наприклад, GI 262570), інгібітори альфа-глюкозидози (наприклад, акарбози, вогдібози), альфа2-антагоністи, інсулін та аналоги інсуліну, GLP-1 та аналоги GLP-1 (наприклад, ексендин-4) або амилін. Сюди належать також інгібітори протеїнтірозинфасфатази 1, субстанції, які впливають на deregульоване вироблення глюкози в печінці, такі як, наприклад, глюкоза-6-фасфатаза або фруктоза-1,6-бісфосфатаза, глюкогенфосфорилаза, глюкогенрецептор антагоністів та інгібіторів фосфоенолпіруваткарбоксикінази, глюкогенсинтазакінази або піруватдегідрокінази, засоби, що знижують вміст ліпідів, такі як інгібітори HMG-CoA-редуктази (наприклад, сімвастанін, аторвестанін), фібрати (наприклад, безафібрат, фенофібрат), нікотинові кислоти та їх похідні, інгібітори резорбції холестеролу, наприклад, езетиміби, субстанції, що зв'язують жовчну кислоту, наприклад, коlestирамін, сполуки, що підвищують HDL, наприклад, інгібітори CETP або регулятори ABC1 або активні речовини для лікування ожиріння, такі як сибутрамін або тетрагідополіпстатин або (33-агоністи, такі як SB-418790 або AD-9677.

Крім того комбінація медикаментів придатна для впливу на високий кров'яний тиск, наприклад, антагоністи AII або інгібітори ACE, диуретики,  $\beta$ -блокатори та інші або їх комбінації.

Дозування, необхідне для 'досягнення відповідного ефекту, складає при введенні внутрішньовенно 1-100мг, переважно 1-30мг, а при введенні орально - 1-1000мг, переважно 1-100мг, відповідно 1-4 х щоденно. Крім того вводять одержані згідно з винаходом сполуки формули I, в разі необхідності, в комбінації з іншими активними речовинами, разом з одним або кількома інертними носіями та/або розріджувачами, такими як кукурудзяний крохмаль, лактоза, сахароза, мікрокристалічна целюлоза, стеарат магнію, полівінілпіролідон, лимонна кислота, винна кислота, вода, вода/етанол, вода/гліцерин, вода/сорбіт, вода/поліетилеогліколь, пропіленгліколь, цетилстеариловий спирт, карбоксиметилцелюлоза або субстанції, що містять жири, наприклад, затверджений жир, або їх придатні суміші, у інші галенові компо-

зиції, такі як пігулки, драже, капсули, порошки, суспензії або супозиторії.

Наступні приклади пояснюють винахід:

Одержання вихідних сполук:

Приклад 1

1,3-диметил-7-бензил-8-хлорксантин

Суміш із 20г 8-хлортеофіліну, 150мл диметилформаміду, 10,2мл бензилброміду та 15,5мл N-етилдіізопропіламіну протягом доби перемішують при кімнатній температурі. У реакційну суміш додають 600мл води. Тверду речовину відсмоктують, промивають водою та діетильним етером та висушують.

Вихід: 14,6г (51% від теоретичного)

Температура плавлення: 155°C

Rf-значення: 0,84 (силікагель, естер оцтової кислоти/метанол = 9:1)

Аналогічно до прикладу I одержують такі сполуки:

(1) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантин

Температура плавлення : 104°C

Мас-спектр (EI): m/z=282, 284 [M]<sup>+</sup>

(2) 1,3-диметил-7-(2-бутин-1-іл)-8-хлорксантин

Температура плавлення: 105-108°C

Rf-значення: 0,55 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 20:1)

(3) 1,3-диметил-7-[(1-циклопентен-1-іл)метил]-8-хлорксантин

Rf-значення: 0,50 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 20:1)

(4) 1, 3-диметил-7-(2-тієнілметил)-8-хлорксантин

Rf-значення: 0,35 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 50:1)

Мас-спектр (EI): m/z=310, 312 [M]<sup>+</sup>

(5) 1,3-диметил-7-(3-фторбензил)-8-хлорксантин

Rf-значення: 0,60 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 20:1)

(6) 1,3-диметил-7-(2-фторбензил)-8-хлорксантин

Мас-спектр (EI): m/z=322, 324 [M]<sup>+</sup>

(7) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(ціс-3-трет.-

бутилоксикарбоніламіноциклогексил)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=446 [M+H]<sup>+</sup>

(8) 1,3-диметил-7-(4-фторбензил)-8-хлорксантин

Rf-значення: 0,60 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 20:1)

(9) 1,3-диметил-7-(2-бутен-1-іл)-8-хлорксантин

Rf-значення: 0,70 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 10:1)

(10) 3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантин

Температура плавлення: 226-228°C

Rf-значення: 0,66 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 9:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=269, 271 [M+H]<sup>+</sup>

(11) 3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-бромксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=313, 315 [M+H]<sup>+</sup>

Rf-значення: 0,48 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 10:1)

(12) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)пропіл]ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=406 [M+H]<sup>+</sup>

(13) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[1-(трет.-бутилоксикарбоніл)піперидин-4-іл]ксантин  
Здійснення в присутності карбонату калію у диметилформаміду при температурі 60°C.

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=432 [M+H]<sup>+</sup>

(14) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[транс-2-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)циклогексил]ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=446 [M+H]<sup>+</sup>

(15) 1,3-диметил-7-(2-пентин-1-іл)-8-хлорксантин

Мас-спектр (ESJ<sup>+</sup>): m/z=281, 283 [M+H]<sup>+</sup>

(16) 3-метил-7-бензил-8-хлорксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=291, 293 [M+H]<sup>+</sup>

(17) 3-метил-7-циклопропілметил-8-хлорксантин

Мас-спектр (B): m/z=254, 256 [M]<sup>+</sup>

(18) 3-метил-7-(2-бутин-1-іл)-8-хлорксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=253, 255 [M+H]<sup>+</sup>

(19) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-бромксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=327, 329 [M+H]<sup>+</sup>

(20) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)циклогексил]ксантин  
(ціс/транс-суміші)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=446 [M+H]<sup>+</sup>

(21) 1,3-диметил-7-[(тіофен-3-іл)метил]-8-хлорксантин

Rf-значення: 0,42 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:1)

(22) 1,3-диметил-7-[(тіофен-2-іл)метил]-8-хлорксантин

<sup>1</sup>H-ЯМР (300МГц, CDCl<sub>3</sub>): характерні сигнали при 3,40 та 3,52ppm (відповідно s, відповідно 3H), 5,70ppm (s, 2H), 6,95 ppm (m, 1H) та 7,25 ppm (m, 2H)

(23) 1,3-диметил-7-[(фуран-3-іл)метил]-8-хлорксантин

Rf-значення: 0,44 (силікагель, естер оцтової кислоти/гексан = 1:1)

(24) 1,3-диметил-7-[(фуран-2-іл)метил]-8-хлорксантин

Rf-значення: 0,50 (силікагель, естер оцтової кислоти/гексан = 1:1)

(25) 1,3-диметил-7-(2-пропін-1-іл)-8-хлорксантин

Rf-значення: 0,33 (силікагель, естер оцтової кислоти/гексан = 1:1)

(26) 1,3-диметил-7-(2,3-диметил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантин

Rf-значення: 0,51 (силікагель, естер оцтової кислоти/гексан = 1:1)

(27) 1,3-диметил-7-((Е)-2-метил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантин

Rf-значення: 0,57 (силікагель, естер оцтової кислоти/гексан = 1:1)

(28) 1,3-диметил-7-[(циклогексен-1-іл)метил]-8-хлорксантин

Rf-значення: 0,62 (силікагель, естер оцтової кислоти/гексан = 1:1)

(29) 1,3-диметил-7-[(циклопентен-1-іл)метил]-8-хлорксантин

Rf-значення: 0,54 (силікагель, естер оцтової кислоти/гексан = 1:1)

(30) 1,3-диметил-7-((Z)-2-метил-2-бутен-1-іл)-8-(піперазин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,51 (силікагель, естер оцтової кислоти = 1:1)

(31) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[1-(трет.-бутилоксикарбоніл)піперидин-3-іл]ксантин

Здійснення в присутності карбонату калію

Мас-спектр (ESr): m/z=432 [M+H]<sup>+</sup>

(32) 1,3-диметил-7-[(2-нафтил)метил]-8-хлорксантин

Здійснення в присутності карбонату калію,

Rf-значення: 0,60 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=377, 379 [M+Na]<sup>+</sup>

(33) 1,3-диметил-7-[(1-нафтил)метил]-8-хлорксантин

Здійснення в присутності карбонату калію

Rf-значення: 0,60 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:1)

Мас-спектр (ESr): m/z=355, 357 [M+H]<sup>+</sup>

(34) 1,3-диметил-7-(2-ціанобензил)-8-хлорксантин

Здійснення в присутності карбонату калію

Rf-значення: 0,60 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=330, 332 [M+H]<sup>+</sup>

(35) 1,3-диметил-7-(3-ціанобензил)-8-хлорксантин

Здійснення в присутності карбонату калію

Rf-значення: 0,60 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=330, 332 [M+H]<sup>+</sup>

(36) 1,3-диметил-7-(3,5-дифторбензил)-8-хлорксантин

Здійснення в присутності карбонату калію

Rf-значення: 0,60 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:1)

Мас-спектр (EI): m/z=340, 342 [M]<sup>+</sup>

(37) 1,3-диметил-7-(4-ціанобензил)-8-хлорксантин

Здійснення в присутності карбонату калію

Rf-значення: 0,60 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:1)

Мас-спектр (EI): m/z=329, 331 [M]<sup>+</sup>

(38) 1,3-диметил-7-(3-нітробензил)-8-хлорксантин

Здійснення в присутності карбонату калію

Rf-значення: 0,60 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=350, 352 [M+H]<sup>+</sup>

(39) 1,3-диметил-7-(4-нітробензил)-8-хлорксантин

Здійснення в присутності карбонату калію

Rf-значення: 0,60 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:1)

(40) 3-метил-7-(2-ціанобензил)-8-хлорксантин

Rf-значення: 0,60 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=316, 318 [M+H]<sup>+</sup>

(41) 1,3-диметил-7-(2-нітробензил)-8-хлорксантин

Здійснення в присутності карбонату калію

Rf-значення: 0,60 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:1)



(42) 1,3-диметил-7-(2-йодбензил)-8-хлорксантин

Здійснення в присутності карбонату калію

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=431, 433 [M+H]<sup>+</sup>

Приклад II

(R)-1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Суміш із 1г 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантину, 1,32г (R)-3-трет.-бутилоксикарбоніламінопіперидину, 1мл триетиламіну та 10мл диметилформаміду протягом двох з половиною днів перемішують при температурі 50°C, Реакційну суміш розбавляють 100мл води та зрештою екстрагують естером оцтової кислоти. Органічну фазу висушують, концентрують та залишок перемішують із диетильним етером. Тверду речовину відсмоктують та висушують. Вихід: 1,0г (63% від теоретичного) Температура плавлення: 164°C

Rf-значення: 0,36 (оксид алюмінію, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:1) Аналогічно до прикладу II одержують такі сполуки:

(1) (S)-1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Температура плавлення: 164°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=445 [M-H]<sup>-</sup>

(2) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)гексагідроацепін-1-іл]ксантин

Температура плавлення: 154°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=459 [M-H]<sup>-</sup>

(3) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[4-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)гексагідроацепін-1-іл]ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=459 [M-H]<sup>-</sup>

Rf-значення: 0,67 (силікагель, естер оцтової кислоти)

(4) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)-4-метилпіперидин-1-іл]ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=461 [M+H]<sup>+</sup>

Rf-значення: 0,88 (силікагель, естер оцтової кислоти/метанол = 5:1)

(5) 1-метил-3-(4-метоксибензил)-7-бензил-8-[(S)-3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=575 [M+H]<sup>+</sup>

Rf-значення: 0,74 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 95:5)

(6) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[N-2-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)етил]-N-етиламіно}ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=435 [M+H]<sup>+</sup>

(7) 1-метил-3-гексил-7-бензил-8-[(S)-3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Температура плавлення: 152-159°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=539 [M+H]<sup>+</sup>

(8) 1-метил-3-(2-триметилсиланілетоксиметил)-7-бензил-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Здійснення за допомогою карбонату калію при температурі 120°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=485 [M+H]<sup>+</sup>

(9) 1-метил-3-(2-гідроксиетил)-7-бензил-8-[(S)-3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Здійснення за допомогою карбонату калію при температурі 110°C

Rf-значення: 0,41 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 9:1:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=499 [M+H]<sup>+</sup>

(10) 1-(2-фенілетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[(S)-3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Здійснення за допомогою основи Хюніга при температурі 100°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=537 [M+H]<sup>+</sup>

(11) 1-(2-фенілетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[(R)-3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=537 [M+H]<sup>+</sup>

(12) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[2-[(трет.-бутилоксикарбоніламіно)метил]піперидин-1-іл]ксантин

Здійснення за допомогою карбонату калію та йодиду натрію у диметилсульфоксиді при температурі 120°C

Rf-значення: 0,73 (силікагель, естер оцтової кислоти)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=461 [M+H]<sup>+</sup>

(13) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[[1-(трет.-бутилоксикарбоніл)піролідин-3-іл]аміно]ксантин

Здійснення за допомогою карбонату натрію у диметилсульфоксиді при температурі 130°C

Rf-значення: 0,50 (силікагель, естер оцтової кислоти)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=433 [M+H]<sup>+</sup>

(14) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[N-[1-(трет.-бутилоксикарбоніл)піперидин-3-іл]-N-метиламіно]ксантин

Здійснення за допомогою основи Хюніга, 4-диметиламінопіридину та карбонату натрію у диметилсульфоксиді при температурі 150°C

Rf-значення: 0,62 (силікагель, естер оцтової кислоти)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=461 [M+H]<sup>+</sup>

(15) 3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[(S)-3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Rf-значення: 0,30 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 9:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=433 [M+H]<sup>+</sup>

(16) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[[1-(трет.-бутилоксикарбоніл)піперидин-4-іл]аміно]ксантин

Здійснення за допомогою основи Хюніга та 4-диметиламінопіридину у диметилсульфоксиді при температурі 100°C

Rf-значення: 0,81 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 9:1:0,1)

(17) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[[1-(трет.-бутилоксикарбоніл)піперидин-3-іл]аміно]ксантин

Здійснення за допомогою основи Хюніга та 4-диметиламінопіридину у диметилсульфоксиді при температурі 100°C

Rf-значення: 0,37 (силікагель, естер оцтової кислоти/гексан = 7:3)

(18) 3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Rf-значення: 0,49 (силікагель, петролейний естер/оцтовий естер/метанол = 5:4:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=433 [M+H]<sup>+</sup>

(19) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-{N-[1-(трет.-бутилоксикарбоніл)піролідин-3-іл]-N-метиламін}ксантин

Здійснення за допомогою карбонату натрію у диметилсульфоксиді при температурі 160°C

Rf-значення: 0,68 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=447 [M+H]<sup>+</sup>

(20) 1-[2-(2-нітрофеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Rf-значення: 0,34 (силікагель, петролейний естер/естер оцтової кислоти/метанол = 7:2:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=582 [M+H]<sup>+</sup>

(21) 1-[2-(3,5-дифторфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Rf-значення: 0,38 (силікагель, петролейний естер/естер оцтової кислоти/метанол = 7:2:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=573 [M+H]<sup>+</sup>

(22) 1-[2-(2,6-дифторфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Rf-значення: 0,38 (силікагель, петролейний естер/естер оцтової кислоти/метанол = 7:2:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=573 [M+H]<sup>+</sup>

(23) 3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[(R)-3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=433 [M+H]<sup>+</sup>

(24) 1-[2-(3,5-диметилфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=565 [M+H]<sup>+</sup>

(25) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[ціс-2-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)циклопропіламіно]ксантин

Rf-значення: 0,41 (силікагель, естер оцтової кислоти)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=419 [M+H]<sup>+</sup>

(26) 3-метил-7-(2-ціанобензил)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Здійснення за допомогою карбонату натрію у диметилсульфоксиді

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=478 [M-H]<sup>-</sup>

(27) 1-(2-феніл-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[4-(трет.-бутилоксикарбоніл)піперазин-1-іл]ксантин

Здійснення за допомогою карбонату калію при температурі 100°C

Rf-значення: 0,70 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=537 [M+H]<sup>+</sup>

(28) 1-[2-(3-нітро-феніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=596 [M+H]<sup>+</sup>

(29) 1-(2-феніл-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[4-(трет.-бутилоксикарбоніл)гомопіперазин-1-іл]ксантин

Rf-значення: 0,70 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:1)

(30) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[4-[(трет.-бутилоксикарбоніламіно)метил]піперидин-1-іл]ксантин

Здійснення у 1-метил-2-піролідоні при температурі 135°C

Rf-значення: 0,69 (силікагель, естер оцтової кислоти)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=461 [M+H]<sup>+</sup>

(31) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-[(трет.-бутилоксикарбоніламіно)метил]піперидин-1-іл]ксантин

Здійснення у 1-метил-2-піролідоні при температурі 135°C

Rf-значення: 0,74 (силікагель, естер оцтової кислоти)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=461 [M+H]<sup>+</sup>

(32) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[транс-2-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)циклобутиламіно]ксантин

Здійснення в присутності основи Хюніга у 1-метил-2-піролідоні при температурі 135°C

Rf-значення: 0,65 (силікагель, естер оцтової кислоти/петролейний естер = 8:2)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=433 [M+H]<sup>+</sup>

(33) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-{N-[(S)-2-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)-1-метилетил]-N-метиламін}ксантин

Здійснення за допомогою карбонату натрію у диметилсульфоксиді

Rf-значення: 0,69 (силікагель, естер оцтової кислоти)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=435 [M+H]<sup>+</sup>

(34) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-{N-[(R)-2-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)-1-метилетил]-N-метиламін}ксантин

Здійснення за допомогою карбонату натрію у диметилсульфоксиді

Rf-значення: 0,32 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=435 [M+H]<sup>+</sup>

(35) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[ціс-2-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)циклогексиламіно]ксантин

Здійснення за допомогою карбонату натрію у диметилсульфоксиді

Rf-значення: 0,35 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=461 [M-MH]<sup>+</sup>

(36) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[6-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)-[1,4]діацелан-1-іл]ксантин

Здійснення за допомогою карбонату натрію у диметилсульфоксиді

Rf-значення: 0,08 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 95:5)

(37) 1-[(піридин-2-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Здійснення за допомогою карбонату натрію у диметилсульфоксиді

Rf-значення: 0,43 (силікагель, естер оцтової кислоти)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=524 [M+H]<sup>+</sup>

(38) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[транс-2-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)циклопентиламіно]ксантин

Здійснення в присутності основи Хюніга у 1-метил-2-піролідоні при температурі 135°C

Температура плавлення: 177-179°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=447 [M+H]<sup>+</sup>

(39) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)циклогексиламіно]ксантин (ціс/транс-суміші)

Здійснення в присутності основи Хюніга у 1-метил-2-піролідоні при температурі 135°C

Rf-значення: 0,36 (силікагель, естер оцтової кислоти/петролейний естер = 1:1)

Мас-спектр (ESP): m/z=459 [M-H]<sup>-</sup>

(40) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[ціс-2-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)циклопентиламіно]ксантин

Температура плавлення: 175-178°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=445 [M-H]<sup>+</sup>

(41) 1-[(ізохінолін-1-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Здійснення за допомогою карбонату натрію у диметилсульфоксиді

Rf-значення: 0,51 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 95:5)

(42) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[ціс-3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)циклопентиламіно]ксантин

Здійснення в присутності основи Хюніга у 1-метил-2-піролідоні при температурі 135°C

Rf-значення: 0,23 (силікагель, естер оцтової кислоти/петролейний естер = 1:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=447 [M+H]<sup>+</sup>

(43) 1-[(піридин-3-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Здійснення за допомогою карбонату натрію у диметилсульфоксиді

Rf-значення: 0,44 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 95:5)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=524 [M+H]<sup>+</sup>

(44) 1-[(піридин-4-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Здійснення за допомогою карбонату натрію у диметилсульфоксиді

Rf-значення: 0,28 (силікагель, естер оцтової кислоти)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=524 [M+H]<sup>+</sup>

(45) 1-[(ізохінолін-1-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[(R)-3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Здійснення за допомогою карбонату калію у диметилсульфоксиді

Rf-значення: 0,37 (силікагель, естер оцтової кислоти)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=574 [M+H]<sup>+</sup>

(46) 1-[(ізохінолін-1-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[(S)-3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Здійснення за допомогою карбонату калію у диметилсульфоксиді

Rf-значення: 0,37 (силікагель, естер оцтової кислоти)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=574 [M+H]<sup>+</sup>

(47) 1-(2-феніл-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)-3-метилпіперидин-1-іл]ксантин

Rf-значення: 0,51 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти/метанол = 6:3:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=565 [M+H]<sup>+</sup>

(48) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)метилпіперидин-1-іл]ксантин

Rf-значення: 0,48 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти/метанол = 6:3:1)

Мас-спектр (EI): m/z=460 [M]<sup>+</sup>

(49) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-{N-[2-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)-3-диметиламіно-3-оксопропіл]-N-метиламіно}ксантин

Rf-значення: 0,48 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 9:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=492 [M+H]<sup>+</sup>

(50) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-{N-[2-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)-3-аміно-3-оксопропіл]-N-метиламіно}ксантин

Rf-значення: 0,40 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 9:1)

Мас-спектр (EI): m/z=463 [M]<sup>+</sup>

(51) 1-[2-(2-нітрофеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Здійснення за допомогою карбонату натрію у диметилсульфоксиді

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=596 [M+H]<sup>+</sup>

(52) 1-[(ізохінолін-4-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Здійснення за допомогою карбонату натрію у диметилсульфоксиді

Rf-значення: 0,48 (силікагель, естер оцтової кислоти)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=574 [M+H]<sup>+</sup>

(53) 1-[(1-метил-1H-індазол-3-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Здійснення за допомогою карбонату натрію у диметилсульфоксиді

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=577 [M+H]<sup>+</sup>

(54) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-{N-[2-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)-3-оксо-3-(піролідин-1-іл)пропіл]-N-метиламіно}ксантин

Здійснення за допомогою основи Хюніга у N-метилпіролідині

Температура плавлення: 173-175°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=518 [M+H]<sup>+</sup>

(55) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-{N-[2-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)-3-метиламіно-3-оксопропіл]-N-метиламіно}ксантин

Здійснення за допомогою Ньїгбейса у N-метилпіролідині

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=478 [M+H]<sup>+</sup>

(56) 1-[2-(2-гідрокси-феніл)-2-оксо-етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=567 [M+H]<sup>+</sup>

(57) 1-метил-3-[2-(4-метоксифеніл)етил]-7-(2-ціанобензил)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Здійснення в присутності карбонату натрію у диметилсульфоксиді

Rf-значення: 0,50 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 9:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=614 [M+H]<sup>+</sup>

(58) 1-метил-3-(2-фенілетил)-7-(2-ціанобензил)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Здійснення в присутності карбонату натрію у диметилсульфоксиді

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=584 [M+H]<sup>+</sup>

(59) 1-[(хінолін-4-іл)метил-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Здійснення в присутності карбонату натрію у диметилсульфоксиді

Rf-значення: 0,50 (силікагель, естер оцтової кислоти)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=574 [M+H]<sup>+</sup>

(60) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[ендо-6-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)-2-азабіцикло[2.2.2]окт-2-іл]ксантин

Здійснення в присутності карбонату калію та основи Хюніга у диметилсульфоксиді

Rf-значення: 0,52 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=473 [M+H]<sup>+</sup>

(61) 1-[(хінолін-8-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Здійснення в присутності карбонату натрію у диметилсульфоксиді

Rf-значення: 0,73 (силікагель, естер оцтової кислоти)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=574 [M+H]<sup>+</sup>

(62) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[екзо-6-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)-2-азабіцикло[2.2.2]окт-2-іл]ксантин

Здійснення в присутності карбонату калію та основи Хюніга у диметилсульфоксиді

Rf-значення: 0,45 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=473 [M+H]<sup>+</sup>

(63) 1-[2-(3-ціанофеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Здійснення в присутності карбонату натрію у диметилсульфоксиді

Rf-значення: 0,33 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=576 [M+H]<sup>+</sup>

(64) 1-[2-(3-аміносультфонілфеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Здійснення в присутності карбонату натрію у диметилсульфоксиді

Rf-значення: 0,15 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=628 [M+H]<sup>+</sup>

(65) 1-[2-(3-амінокарбонілфеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Здійснення в присутності карбонату натрію у диметилсульфоксиді

Rf-значення: 0,36 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 9:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=594 [M+H]<sup>+</sup>

Приклад III

3-(трет.-

бутилоксикарбоніламіно)гексагідроацепін

2г

1-бензил-3-(трет.-

бутилоксикарбоніламіно)гексагідроацепіну протягом 24 годин при кімнатній температурі та тиску водню 3бар гідрують 20мл метанолу в присутності 200мг паладію на активованому вугіллі (10% Pd). Після цього відсмоктують каталізатором та фільтрат концентрують до одержання сухої речовини.

Вихід :1,3г (90 % від теоретичного)

Температура плавлення: 78°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=215 [M+H]<sup>+</sup>

Аналогічно до прикладу III одержують такі сполуки:

(1) (S)-3-(трет.-

бутилоксикарбоніламіно)піперидин

Температура плавлення: 122°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=201 [M+H]<sup>+</sup>

(2) (R)-3-(трет.-

бутилоксикарбоніламіно)піперидин

Вихідний матеріал (R)-1-бензил-3-(трет.-

бутилоксикарбоніламіно)піперидин одержують аналогічно до відомого з літературних джерел (S)-енантіомеру [Moon, Sung Hwan; Lee, Sujin; Synth. Commun.; 28; 21; 1998; 3919-3926]

Температура плавлення: 119°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=201 [M+H]<sup>+</sup>

(3) 4-(трет.-

бутилоксикарбоніламіно)гексагідроацепін

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=215 [M+H]<sup>+</sup>

Rf-значення: 0,02 (оксид алюмінію, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:1)

(4) 3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)-4-метилпіперидин

Вихідний продукт відразу перетворюють на сполуку прикладу II (4).

(5) 6-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)-

[1,4]діацепан

Вихідний матеріал 1,4-добензил-6-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)-[1,4]діацепан одержують аналогічно до відомого з літературних джерел [J. Heterocycl. Chem. 1995, 32, 637-642].

Вихідний продукт відразу перетворюють на сполуку прикладу II (36).

(6) диметиламід пропіонової кислоти 2-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)-3-метиламіно

Rf-значення: 0,40 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 40:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=246 [M+H]<sup>+</sup>

(7) амід пропіонової кислоти 2-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)-3-метиламіно

Rf-значення: 0,20 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 40:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=218 [M+H]<sup>+</sup>

(8) 2-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)-3-метиламіно-1-(піролідін-1-іл)пропан-1-он  
Як каталізатор використовується гідроксид палладію (II).

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=272 [M+H]<sup>+</sup>

(9) 2-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)-1,3-біс(метиламіно)пропан-1-он

Як каталізатор використовується гідроксид палладію (II)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=232 [M+H]<sup>+</sup>

(10) ендо-6-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)-2-азабіцикло[2.2.2]октан

Rf-значення: 0,25 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний аміак = 90:10:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=227 [M+H]<sup>+</sup>

(11) екзо-6-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)-2-азабіцикло[2.2.2]октан

Rf-значення: 0,27 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

(12) 1-(трет.-бутилоксикарбоніл)-3-аміно-4-гідроксипіперидин

Rf-значення: 0,17 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=217 [M+H]<sup>+</sup>

Приклад IV

1-бензил-3-(трет.-

бутилоксикарбоніламіно)гексагідроаієпін

Одержують внаслідок взаємодії 1-бензил-3-аміногексагідроаієпіну з піровугільною кислотою-дитрет.-бутильним естером

Температура плавлення: 48-50°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=305 [M+H]<sup>+</sup>

Аналогічно до прикладу IV одержують такі сполуки:

(1) 1-бензил-4-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)гексагідроаієпін

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=305 [M+H]<sup>+</sup>

Rf-значення: 0,79 (оксид алюмінію, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:1)

(2) 3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)-4-метилпіридин

Здійснення за допомогою натрій-біс-(триметилсиліл)аміду/піровуглецевої кислоти-дитрет.-бутильного естеру у тетрагідрофурані при температурі 0°C.

Rf-значення: 0,45 (силікагель, естер оцтової кислоти)

(3) 1-(трет.-бутилоксикарбоніл)-3-[(2,2,2-трифтороацетил)аміно]піролідін

Здійснення за допомогою триетиламіну у тетрагідрофурані

Rf-значення: 0,77 (силікагель, метиленхлорид/метанол/конц. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=281 [M+H]<sup>+</sup>

(4) транс-2-аміно-1-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)циклобутан

Здійснення за допомогою піровугільної кислоти-дитрет.-бутильного естеру в присутності 1N натрієвого лугу в метанолі при температурі 0°C

Rf-значення: 0,60 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=187 [M+H]<sup>+</sup>

(5) (5)-1-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)-2-метиламінопропан

Здійснення за допомогою піровугільної кислоти-дитрет.-бутильного естеру в присутності основи Хюніга в метанолі.

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=189 [M+H]<sup>+</sup>

Rf-значення: 0,30 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

(6) (R)-1-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)-2-метиламінопропан

Здійснення за допомогою міт піровугільної кислоти-дитрет.-бутильного естеру в присутності Hbnigbase в метанолі.

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=189 [M+H]<sup>+</sup>

(7) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[2-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)-2-метилпропіламіно]ксантин

Здійснення за допомогою піровугільної кислоти-дитрет.-бутильного естеру в присутності основи Хюніга в метанолі.

Rf-значення: 0,82 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

(8) ціс-3-аміно-1-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)циклопентан

Здійснення за допомогою піровугільної кислоти-дитрет.-бутильного естеру в присутності 1N натрієвого лугу в метанолі.

Rf-значення: 0,63 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 40:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=201 [M+H]<sup>+</sup>

(9) ендо-6-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)-2-бензил-2-азабіцикло[2.2.2]октан

Rf-значення: 0,53 (оксид алюмінію, циклогексан/естер оцтової кислоти = 9:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=317 [M+H]<sup>+</sup>

(10) екзо-6-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)-2-бензил-2-азабіцикло[2.2.2]октан

Rf-значення: 0,37 (оксид алюмінію, циклогексан/естер оцтової кислоти = 9:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=317 [M+H]<sup>+</sup>

Приклад V

1,3-диметил-8-(ціс-3-трет.-

бутилоксикарбоніламіно)циклогексил]ксантин

Одержують із сполуки прикладу VI шляхом її обробки 4N натрієвим лугом у метанолі при температурі 100°C у реакторі високого тиску

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=378 [M+H]<sup>+</sup>

Аналогічно до прикладу V одержують такі сполуки:

(1) 1,3-диметил-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)пропіл]ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=338 [M+H]<sup>+</sup>

(2) 1,3-диметил-8-[1-(трет.-бутилоксикарбоніл)піперидин-4-іл]ксантин

(3) 1,3-диметил-8-[транс-2-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)циклогексил]ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=378 [M+H]<sup>+</sup>

(4) 1,3-диметил-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)циклогексил]ксантин

(ціс/транс-суміші)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=378 [M+H]<sup>+</sup>

(5) 1,3-диметил-8-[1-(трет.-бутилоксикарбоніл)піперидин-3-іл]ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=364 [M+H]<sup>+</sup>

Приклад VI

1,3-диметил-5-[(ціс-3-трет.-

бутилоксикарбоніламіно)ікло-  
гексил]карбоніламіно]-6-аміноураціл

Одержують із 5,6-діаміно-1,3-диметилурацилу та ціс-3-трет.-бутилоксикарбоніламіноциклогексанкарбонової кислоти в присутності О-(бензотриазол-1-іл)-N,N,N',N'-тетраметилуронійгексафторфосфату та N-етилдіізопропіламіну в диметилформаміді при кімнатній температурі

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=396 [M+H]<sup>+</sup>

Аналогічно до прикладу VI одержують такі сполуки:

(1) 1,3-диметил-5-[[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)пропіл]карбоніламіно]-6-аміноураціл

(2) 1,3-диметил-5-[[1-(трет.-бутилоксикарбоніл)піперидин-4-іл]карбоніламіно]-6-аміноураціл

Здійснення за допомогою О-(бензотриазол-1-іл)-N,N,N',N'-тетраметилуронійтетрафторборату та N-гідроксибензотриазолу

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=382 [M+H]<sup>+</sup>

(3) 1,3-диметил-5-[(транс-2-[(фторен-9-ілметокси)карбоніл]аміно)циклогексил]карбоніламіно]-6-аміноураціл

Здійснення за допомогою О-(бензотриазол-1-іл)-N,N,N',N'-тетраметилуронійтетрафторборату

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=518 [M+H]<sup>+</sup>

(4) 1,3-диметил-5-[[3-(трет.-бутилоукарбоніламіно)циклогексил]карбоніламіно]-6-аміноурацилу (ціс/транс-суміші)

Здійснення за допомогою О-(бензотриазол-1-іл)-N,N,N',N'-тетраметилуронійтетрафторборату

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=396 [M+H]<sup>+</sup>

(5) 1,3-диметил-5-[[1-(трет.-бутилоксикарбоніл)піперидин-3-іл]карбоніламіно]-6-аміноураціл

Здійснення за допомогою О-(бензотриазол-1-іл)-N,N,N',N'-тетраметилуронійтетрафторборату

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=382 [M+H]<sup>+</sup>

(6) диметиламід 2-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)-3-(N-бензил-N-метиламіно)пропіонової кислоти

Здійснення за допомогою диметиламіну в присутності О-(бензотриазол-1-іл)-N,N,N',N'-тетраметилуронійтетрафторборату та гідроксибензотриазолу в тетрагідрофурані

Rf-значення: 0,80 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 40:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=336 [M+H]<sup>+</sup>

(7) амід 2-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)-3-(N-бензил-N-метиламіно)пропіонової кислоти

Здійснення за допомогою крбонату амонію в присутності О-(бензотриазол-1-іл)-N,N,N',N'-тетраметилуронійтетрафторборату та гідроксибензотриазолу в тетрагідрофурані

Rf-значення: 0,75 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 40:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=308 [M+H]<sup>+</sup>

(8) 2-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)-3-(N-бензил-N-метиламіно)-1-(піролідин-1-іл)пропан-1-он

Здійснення за допомогою піролідину в присутності О-(бензотриазол-1-іл)-N,N,N',N'-тетраметилуронійтетрафторборату та гідроксибензотриазолу в тетрагідрофурані

Rf-значення: 0,40 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 9:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=362 [M+H]<sup>+</sup>

(9) 2-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)-3-(N-бензил-N-метиламіно)-1-диметиламінопропан-1-он

Здійснення за допомогою метиламіну (40%-ного водного розчину) в присутності О-(бензотриазол-1-іл)-N,N,N',N'-тетраметилуронійтетрафторборату та гідроксибензотриазолу в тетрагідрофурані

Rf-значення: 0,40 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 9:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=322 [M+H]<sup>+</sup>

(10) 1-(трет.-бутилоксикарбоніл)-3-[(9Н-фторен-9-ілметокси)карбоніл]аміно]-3-(піролідин-1-ілкарбоніл)піперидин

Здійснення за допомогою піролідину в присутності О-(бензотриазол-1-іл)-N,N,N',N'-тетраметилуронійтетрафторборату, гідроксибензотриазолу та основи Хюніга в диметилформаміді. Вихідний матеріал 1-(трет.-бутилоксикарбоніл)-3-[(9Н-фторен-9-ілметокси)карбоніл]аміно)ліперидин-3-ілкарбонова кислоту можна придбати у фірми Pharmascor, Inc. (США).

Rf-значення: 0,52 (оксид алюмінію, метиленхлорид/метанол = 9:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=520 [M+H]<sup>+</sup>

Приклад VII

1,3-біс-(іклопропілметил)-7-бензил-8-хлорксантин

Одержують із сполуки прикладу VIII внаслідок взаємодії з N-хлорсуцінімідом в 1,2-дихлоретані у флегмі

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=407, 409 [M+Na]<sup>+</sup>

Аналогічно до прикладу VII одержують такі сполуки:

(1) 1-метил-3-(циклопропілметил)-7-бензил-8-хлорксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=345, 347 [M+H]<sup>+</sup>

(2) 1,3-диетил-7-бензил-8-хлорксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=355, 357 [M+H]<sup>+</sup>

(3) 1-метил-3-етил-7-бензил-8-хлорксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=341, 343 [M+Na]<sup>+</sup>

(4) 1-метил-3-(4-метоксибензил)-7-бензил-8-хлорксантин

Температура плавлення: 172-175°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=411, 413 [M+H]<sup>+</sup>

(5) 1-метил-3,7-добензил-8-хлорксантин

Rf-значення: 0,72 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 98:2:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=381, 383 [M+H]<sup>+</sup>

(6) 1-метил-3-[(метилоксикарбоніл)метил]-7-бензил-8-хлорксантин

Rf-значення: 0,83 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 95:5:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=363, 365 [M+H]<sup>+</sup>

(7) 1-метил-3-ізопропіл-7-бензил-8-хлорксантин  
Rf-значення: 0,69 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 98:2:1)  
Мас-спектр (EI):  $m/z=332, 334 [M]^+$   
(8) 1-метил-3-гексил-7-бензил-8-хлорксантин  
Rf-значення: 0,68 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 98:2:1)  
Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=375, 377 [M+H]^+$   
(9) 1-метил-3-(2-триметилсиланілетоксиметил)-7-бензил-8-хлорксантин  
Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=421, 423 [M+H]^+$   
(10) 1-метил-3-(2-метоксиетил)-7-бензил-8-хлорксантин  
Rf-значення: 0,84 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 9:1:0,1)  
Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=349, 351 [M+H]^+$   
(11) 1-метил-3-ціанометил-7-бензил-8-хлорксантин  
Rf-значення: 0,90 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 95:5:1)  
Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=352 [M+Na]^+$   
(12) 1-метил-3-(2-гідроксиетил)-7-бензил-8-хлорксантин  
Rf-значення: 0,48 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 9:1:0,1)  
Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=335, 337 [M+H]^+$   
(13) 1-метил-3-(2-триметилсиланілетоксиметил)-7-бензил-8-хлорксантин  
Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=421, 423 [M+H]^+$   
(14) 1-метил-3-(2-триметилсиланілетоксиметил)-7-(2-ціанобензил)-8-хлорксантин  
Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=468, 470 [M+Na]^+$   
Приклад VIII  
1,3-біс-(циклопропілметил)-7-бензилксантин  
Одержують із 7-бензилксантину внаслідок взаємодії з циклопропілметилбромідом у диметилформамід в присутності карбонату цезію  
Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=351 [M+H]^+$   
Аналогічно до прикладу VIII одержують такі сполуки:  
(1) 3-(циклопропілметил)-7-бензилксантин  
Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=297 [M+H]^+$   
(2) 1,3-діетил-7-бензилксантин  
Здійснення за допомогою карбонату калію  
Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=321 [M+Na]^+$   
(3) 3-етил-7-бензилксантин  
Здійснення за допомогою карбонату калію  
Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=293 [M+Na]^+$   
(4) 3-(4-метоксибензил)-7-бензилксантин  
Здійснення за допомогою 1,8-діазабіцикло[5.4.0]ундец-7-ену  
Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=363 [M+H]^+$   
(5) 3,7-добензилксантин  
Здійснення за допомогою 1,8-діазабіцикло[5.4.0]ундец-7-ену  
Температура плавлення: 184-187°C  
Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=333 [M+H]^+$

(6) 3-[(метоксикарбоніл)-метил]-7-бензилксантин  
Здійснення за допомогою 1,8-діазабіцикло[5.4.0]ундец-7-ену  
Rf-значення: 0,21 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 95:5:1)  
Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=315 [M+H]^+$   
(7) 3-ізопропіл-7-бензилксантин  
Здійснення за допомогою 1,8-діазабіцикло[5.4.0]ундец-7-ену  
Температура плавлення: 215-218°C  
Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=285 [M+H]^+$   
(8) 3-гексил-7-бензилксантин  
Здійснення за допомогою 1,8-діазабіцикло[5.4.0]ундец-7-ену  
Rf-значення: 0,52 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 9:1:0,1)  
Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=327 [M+H]^+$   
(9) 3-(2-триметилсиланілетоксиметил)-7-бензилксантин  
Здійснення за допомогою 1,8-діазабіцикло[5.4.0]ундец-7-ену  
Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=373 [M+H]^+$   
(10) 3-(2-метоксиетил)-7-бензилксантин  
Здійснення за допомогою 1,8-діазабіцикло[5.4.0]ундец-7-ену  
Rf-значення: 0,45 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 9:1:0,1)  
Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=301 [M+H]^+$   
(11) 3-ціанометил-7-бензилксантин  
Здійснення за допомогою 1,8-діазабіцикло[5.4.0]ундец-7-ену  
Rf-значення: 0,41 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 9:1:0,1)  
Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=280 [M+H]^+$   
(12) 3-(2-гідроксиетил)-7-бензилксантин  
Здійснення за допомогою 1,8-діазабіцикло[5.4.0]ундец-7-ену  
Rf-значення: 0,28 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 9:1:0,1)  
Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=287 [M+H]^+$   
(13) 3-(2-триметилсиланілетоксиметил)-7-бензилксантин  
Здійснення за допомогою 1,8-діазабіцикло[5.4.0]ундец-7-ену  
Rf-значення: 0,30 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 98:2)  
Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=373 [M+H]^+$   
(14) 3-[(метоксикарбоніл)метил]-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин  
Здійснення за допомогою 1,8-діазабіцикло[5.4.0]ундец-7-ену  
Rf-значення: 0,31 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)  
Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=491 [M+H]^+$   
(15) 3-(2-триметилсиланілетоксиметил)-7-(2-ціанобензил)ксантин  
Здійснення в присутності 1,8-діазабіцикло[5.4.0]ундец-7-ену

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=420 [M+Na]<sup>+</sup>

Приклад IX

1-етил-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-бромксантин

Одержують із 3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-бромксантин внаслідок взаємодії з етилбромідом в присутності карбонату калію в диметилформаміді при температурі 70°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=341, 343 [M+H]<sup>+</sup>

Час утримування: 1,48хв. (HPLC, мультисфера 100FBS, 50мм, 50% ацетонітрил)

Аналогічно до прикладу IX одержують такі сполуки:

(1) 1-пропіл-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-бромксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=355, 357 [M+H]<sup>+</sup>

(2) 1-бутил-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-бромксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=369, 371 [M+H]<sup>+</sup>

(3) 1-(2-пропіл)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-бромксантин

Час утримування: 2,11хв. (HPLC, мультисфера 100FBS, 50мм, 50% ацетонітрил)

(4) 1-(2-метилпропіл)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-бромксантин

Час утримування: 2,46хв. (HPLC, мультисфера 100FBS, 50мм, 50% ацетонітрил)

(5) 1-(2-пропен-1-іл)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-бромксантин

Час утримування: 1,55хв. (HPLC, мультисфера 100FBS, 50мм, 50% ацетонітрил)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=353, 355 [M+H]<sup>+</sup>

(6) 1-(2-пропіл-1-іл)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-бромксантин

Час утримування: 1,20хв. (HPLC, мультисфера 100FBS, 50мм, 50% ацетонітрил)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=351, 353 [M+H]<sup>+</sup>

(7) 1-(циклопропілметил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-бромксантин

Час утримування: 2,19хв. (HPLC, мультисфера 100FBS, 50мм, 50% ацетонітрил)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=367, 369 [M+H]<sup>+</sup>

(8) 1-бензил-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-бромксантин

Час утримування: 2,40хв. (HPLC, мультисфера 100FBS, 50мм, 50% ацетонітрил)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=403, 405 [M+H]<sup>+</sup>

(9) 1-(2-фенілетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-бромксантин

Час утримування: 3,29хв. (HPLC, мультисфера 100FBS, 50мм, 50% ацетонітрил)

(10) 1-(3-фенілпропіл)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-бромксантин

Час утримування: 2,95хв. (HPLC, мультисфера 100FBS, 50мм, 50% ацетонітрил)

(11) 1-(2-гідроксиетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-бромксантин

Час утримування: 2,35хв. (HPLC, мультисфера 100FBS, 50мм, 20% ацетонітрил)

(12) 1-(2-метоксиетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-бромксантин

Час утримування: 2,54хв. (HPLC, мультисфера 100FBS, 50мм, 30% ацетонітрил)

(13) 1-(3-гідроксипропіл)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-бромксантин

Час утримування: 2,52хв. (HPLC, мультисфера 100FBS, 50мм, 20% ацетонітрил)

(14) 1-[2-(диметиламіно)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-бромксантин

Час утримування: 2,73хв. (HPLC, мультисфера 100FBS, 50мм, 5% ацетонітрил)

(15) 1-[3-(диметиламіно)пропіл]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-бромксантин

Час утримування: 2,79хв. (HPLC, мультисфера 100FBS, 50мм, 5% ацетонітрил)

(16) 1-метил-3-(циклопропілметил)-7-бензилксантин

Здійснення за допомогою метилйодиду при кімнатній температурі

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=311 [M+H]<sup>+</sup>

(17) 1-метил-3-етил-7-бензилксантин

Здійснення за допомогою метилйодиду при кімнатній температурі

(18) 1-метил-3-(4-метоксибензил)-7-бензилксантин

Здійснення за допомогою метилйодиду при кімнатній температурі

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=377 [M+H]<sup>+</sup>

(19) 1-метил-3,7-добензилксантин

Здійснення за допомогою метилйодиду при кімнатній температурі

Rf-значення: 0,51 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку 95:5:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=347 [M+H]<sup>+</sup>

(20) 1-метил-3-[(метоксикарбоніл)-метил]-7-бензилксантин

Здійснення за допомогою метилйодиду при кімнатній температурі

Температура плавлення: 182°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=329 [M+H]<sup>+</sup>

(21) 1-метил-3-ізопропіл-7-бензилксантин

Здійснення за допомогою метилйодиду при кімнатній температурі

Rf-значення: 0,66 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 9:1:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=299 [M+H]<sup>+</sup>

(22) 1-метил-3-гексил-7-бензилксантин

Здійснення за допомогою метилйодиду при кімнатній температурі

Rf-значення: 0,77 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 95:5:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=341 [M+H]<sup>+</sup>

(23) 1-метил-3-(2-триметилсиланілетоксиметил)-7-бензилксантин

Здійснення за допомогою метилйодиду при кімнатній температурі

(24) 1-метил-3-(2-метоксиетил)-7-бензилксантин

Здійснення за допомогою метилйодиду при кімнатній температурі

Rf-значення: 0,70 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 9:1:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=315 [M+H]<sup>+</sup>

(25) 1-метил-3-ціанометил-7-бензилксантин

Здійснення за допомогою метилйодиду при кімнатній температурі



Rf-значення: 0,74 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр, водний розчин аміаку = 9:1:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=296 [M+H]<sup>+</sup>

(26) 1-метил-3-(2-гідроксиетил)-7-бензилксантин

Здійснення за допомогою метилйодиду при кімнатній температурі

Rf-значення: 0,44 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр, водний розчин аміаку = 9:1:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=301 [M+H]<sup>+</sup>

(27) 1-метил-3-(2-триметилсиланілетоксиметил)-7-бензилксантин

Здійснення за допомогою метилйодиду при кімнатній температурі

Rf-значення: 0,44 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 95:5)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=387 [M+H]<sup>+</sup>

(28) 1-(2-фенілетил)-3-метил-7-бензил-8-хлорксантин

Здійснення за допомогою 2-фенілетилброміду при температурі 60°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=395, 397 [M+H]<sup>+</sup>

(29) 1-(2-фенілетил)-3-метил-7-циклопропілметил-8-хлорксантин

Здійснення за допомогою 2-фенілетилброміду при температурі 60°C

Мас-спектр (ЕБГ): m/z=359, 361 [M+H]<sup>+</sup>

(30) 1-(2-фенілетил)-3-метил-7-(2-бутин-1-іл)-8-хлорксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=357, 359 [M+H]<sup>+</sup>

(31) 1-(2-фенілетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=395, 397 [M+Na]<sup>+</sup>

(32) 1-[(метоксикарбоніл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[(S)-3-(трет.-

бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Здійснення за допомогою метильного естеру бромоецтової кислоти при температурі 50°C

Температура плавлення: 143-145°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=505 [M+H]<sup>+</sup>

(33) 1-[3-(метоксикарбоніл)пропіл]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[(S)-3-(трет.-

бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Здійснення за допомогою метильного естеру 4-броммасляної кислоти при температурі 50°C

Температура плавлення: 130-131°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=533 [M+H]<sup>+</sup>

(34) 1-{2-[4-(етоксикарбоніл)феніл]етил}-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[(S)-3-(трет.-

бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Здійснення за допомогою етильного естеру 4-(2-брометил)бензойної кислоти при температурі 50°C

Rf-значення: 0,40 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=609 [M+H]<sup>+</sup>

(35) 1-[2-(метоксикарбоніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[(S)-3-(трет.-

бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Здійснення за допомогою метильного естеру 3-бромпропіонової кислоти при температурі 50°C

Rf-значення: 0,35 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=519 [M+H]<sup>+</sup>

(36) 1-ціанометил-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-бромксантин

Rf-значення: ,58 (силікагель, петролейний естер/естер оцтової кислоти/метанол = 6:3,5:0,5)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=352, 354 [M+H]<sup>+</sup>

(37) 1-(2-феніл-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-

бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Rf-значення: 0,30 (силікагель, петролейний естер/естер оцтової кислоти/метанол = 7:2,5:0,5)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=551 [M+H]<sup>+</sup>

(38) 1-[2-(2-метоксифеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-

бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=581 [M+H]<sup>+</sup>

(39) 1-[2-(тіофен-3-іл)-2-оксоетил]-3-метил-7-{3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-

бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=557 [M+H]<sup>+</sup>

(40) 1-[2-(4-метоксифеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-

бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=581 [M+H]<sup>+</sup>

(41) 1-(2-феніл-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[(S)-3-(трет.-

бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

(42) 1-(2-феніл-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[(R)-3-(трет.-

бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=551 [M+H]<sup>+</sup>

(43) 1-(фенілсульфанілметил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-

бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Rf-значення: 0,30 (силікагель, петролейний естер/естер оцтової кислоти/метанол = 7:2:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=555 [M+H]<sup>+</sup>

(44) 1-[2-(3-метоксифеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-

бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Rf-значення: 0,30 (силікагель, петролейний естер/естер оцтової кислоти/метанол = 7:2:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=565 [M+H]<sup>+</sup>

(45) 1-[2-(4-метилфеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-

бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Rf-значення: 0,20 (силікагель, петролейний естер/естер оцтової кислоти/метанол = 7:2:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=565 [M+H]<sup>+</sup>

(46) 1-(2-метоксикарбоніл-2-пропен-1-іл)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-3-[3-(трет.-

бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Rf-значення: 0,15 (силікагель, петролейний естер/естер оцтової кислоти/метанол = 75:20:5)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=531 [M+H]<sup>+</sup>

(47) 1-(3-оксо-3-фенілпропіл)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-

бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=565 [M+H]<sup>+</sup>

(49) 1-(2-оксопропіл)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-

бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Rf-значення: 0,10 (силікагель, петролейний естер/естер оцтової кислоти/метанол = 6:3:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=489 [M+H]<sup>+</sup>

(50) 1-(2-феніл-2-оксоетил)-3-метил-7-(2-ціанобензил)-8-[3-(трет.-

бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=598 [M+H]<sup>+</sup>  
 (51) 1-(2-фенілетил)-3-метил-7-(2-ціанобензил)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин  
 Rf-значення: 0,50 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:1)  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=584 [M+H]<sup>+</sup>  
 (52) 1-(3-метоксикарбоніл-2-пропен-1-іл)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=531 [M+H]<sup>+</sup>  
 (53) 1-[2-(2,5-диметоксифеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин  
 Rf-значення: 0,31 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти/метанол = 6:3:1)  
 (54) 1-[2-(4-фторфеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин  
 Rf-значення: 0,40 (силікагель, петролейний естер/естер оцтової кислоти/метанол = 6:3:1)  
 (55) 1-[2-(3-гідроксифеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин  
 (Шляхом заміни сполуки прикладу II (18) 2-бром-1-[3-(трет.-бутилдиметилсиланілокси)феніл]етаном в присутності калійтрет.-бутилату в диметилформаміді при кімнатній температурі)  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=567 [M+H]<sup>+</sup>  
 (56) 1-(3-метоксикарбоніл-2-пропен-1-іл)-3-метил-7-(2-ціанобензил)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин  
 Rf-значення: 0,50 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:1)  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=600 [M+Na]<sup>+</sup>  
 (57) 1-[(піридин-2-іл)метил]-3-метил-7-(2-ціанобензил)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=571 [M+H]<sup>+</sup>  
 (58) 1-(2-феніл-2-оксоетил)-3-[(метоксикарбоніл)метил]-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин  
 Rf-значення: 0,68 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=609 [M+H]<sup>+</sup>  
 (59) 1-(2-феніл-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантин  
 Rf-значення: 0,55 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти/метанол = 6:3:1)  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=387, 389 [M+H]<sup>+</sup>  
 (60) 1-[2-(3-алілоксикарбоніламінофеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин  
 Rf-значення: 0,40 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти/метанол = 6:3:1)  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=650 [M+H]<sup>+</sup>  
 (61) 1-[2-(3-нітрофеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантин  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=432, 434 [M+H]<sup>+</sup>  
 (62) 1-[2-(2-бром-5-диметиламінофеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-

(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин  
 (63) 1-[(тіазол-2-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин  
 Rf-значення: 0,34 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 95:5)  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=530 [M+H]<sup>+</sup>  
 (64) 1-[(бензо[d]ізотіазол-3-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин  
 Rf-значення: 0,40 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:1)  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=580 [M+H]<sup>+</sup>  
 (65) 1-[(ізоксазол-3-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин  
 Rf-значення: 0,20 (силікагель, естер оцтової кислоти)  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=514 [M+H]<sup>+</sup>  
 (66) 1-[(1-нафтил)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин  
 Rf-значення: 0,41 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:1)  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=595 [M+Na]<sup>+</sup>  
 (67) 1-[(бензо[c]ізоксазол-3-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин  
 Rf-значення: 0,60 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 95:5)  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=564 [M+H]<sup>+</sup>  
 (68) 1-ціанометил-3-метил-7-(2-ціано-бензил)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин  
 Rf-значення: 0,40 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:1)  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=541 [M+Na]<sup>+</sup>  
 (69) 1-[2-(2-нітрофеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантин  
 Rf-значення: 0,25 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти/метанол = 7:2:1)  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=432, 434 [M+H]<sup>+</sup>  
 (70) 1-[(6-метилпіридин-2-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин  
 Здійснення в присутності йодиду натрію  
 Rf-значення: 0,47 (силікагель, естер оцтової кислоти)  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=538 [M+H]<sup>+</sup>  
 (71) 1-ціанометил-3-метил-7-(2-ціанобензил)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин  
 Rf-значення: 0,40 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:1)  
 (72) 1-[2-(2-метоксифеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантин  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=417, 419 [M+H]<sup>+</sup>  
 (73) 1-метил-3-(2-триметилсиланілетоксиметил)-7-(2-ціанобензил)ксантин  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=412 [M+H]<sup>+</sup>  
 (74) 1-[(3-метилпіридин-2-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Rf-значення: 0,27 (силікагель, естер оцтової кислоти)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=538 [M+H]<sup>+</sup>

(75) 1-[(5-метилпіридин-2-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Rf-значення: 0,45 (силікагель, естер оцтової кислоти)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=538 [M+H]<sup>+</sup>

(76) 1-[(4-метилпіридин-2-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Rf-значення: 0,26 (силікагель, естер оцтової кислоти)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=538 [M+H]<sup>+</sup>

(77) 1-[(5-нітроізохінолін-1-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Rf-значення: 0,54 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 95:5)

(78) 1-[(2-оксо-1,2-дигідрохінолін-4-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Rf-значення: 0,38 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 95:5)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=590 [M+H]<sup>+</sup>

(79) 1-[2-(3-ціанофеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантин

Rf-значення: 0,52 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=434, 436 [M+Na]<sup>+</sup>

(80) 1-[2-(3-аміносультоніфеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантин

Rf-значення: 0,25 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=466, 468 [M+H]<sup>+</sup>

(81) 1-[2-(3-амінокарбонілфеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантин

Rf-значення: 0,10 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=430, 432 [M+H]<sup>+</sup>

(82) 1-(2-феноксиетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Rf-значення: 0,75 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:4)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=553 [M+H]<sup>+</sup>

Приклад X

1-бензил-3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)-4-метилпіперидин

Одержують внаслідок каталітичного гідрування броміду 1-бензил-3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)-4-метилпіридину в метанолі в присутності оксиду платини та при тиску водню 4 бар.

Мас-спектр (EI): m/z=304 [M]<sup>+</sup>

Приклад XI

Бромід

1-бензил-3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)-4-гіетилпіридину

Одержують внаслідок взаємодії 3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)-4-метилпіридину з бензилбромідом в толуолі

Температура плавлення: 200-201°C

Приклад XII

1-[2-(2,4,6-триметилфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-бромксантин

Одержують внаслідок взаємодії 3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-бромксантину з 2-(2,4,6-триметилфеніл)етанолом в присутності трифенілфосфіну та діізопропілазодикарбоксилату в тетрагідрофурани при кімнатній температурі

Rf-значення: 0,40 (силікагель, метиленхлорид/естер оцтової кислоти = 15:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=459, 461 [M+H]<sup>+</sup>

Аналогічно до прикладу XII одержують такі сполуки:

(1) 1-[2-(2,4-дихлорфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-бромксантин

Rf-значення: 0,40 (силікагель, метиленхлорид/естер оцтової кислоти = 15:1)

Мас-спектр (EI): m/z=484, 486, 488 [M]<sup>+</sup>

(2) 1-[2-(тіофен-2-іл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-бромксантин

Rf-значення: 0,50 (силікагель, метиленхлорид/естер оцтової кислоти = 15:1)

Мас-спектр (EI): m/z=422, 424 [M]<sup>+</sup>

(3) 1-[2-(тіофен-3-іл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-бромксантин

Температура плавлення: 173,8-174,5°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=445, 447 [M+Na]<sup>+</sup>

(4) 1-[2-(4-трет.-бутилфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-бромксантин

Rf-значення: 0,85 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 30:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=473, 475 [M+H]<sup>+</sup>

(5) 1-[2-(4-фторфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-бромксантин

Rf-значення: 0,70 (силікагель, метиленхлорид/естер оцтової кислоти = 15:1)

(6) 1-[2-(4-метоксифеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-бромксантин

Rf-значення: 0,70 (силікагель, метиленхлорид/естер оцтової кислоти = 15:1)

(7) 1-[2-(2-фторфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантин

Rf-значення: 0,75 (силікагель, метиленхлорид/естер оцтової кислоти = 20:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=391, 393 [M+H]<sup>+</sup>

(8) 1-[2-(2-метилфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантин

Rf-значення: 0,60 (силікагель, метиленхлорид/естер оцтової кислоти = 20:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=387, 389 [M+H]<sup>+</sup>

(9) 1-[2-(3-метилфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантин

Rf-значення: 0,80 (силікагель, метиленхлорид/естер оцтової кислоти = 20:1)

Мас-спектр (EI): m/z=386, 388 [M]<sup>+</sup>

(10) 1-[2-(1-нафтил)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантин

Rf-значення: 0,70 (силікагель, метиленхлорид/естер оцтової кислоти = 20:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=423, 425 [M+H]<sup>+</sup>

(11) 1-[2-(2-нафтил)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантин

Rf-значення: 0,72 (силікагель, метиленхлорид/естер оцтової кислоти = 20:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=423, 425 [M+H]<sup>+</sup>

(12) 1-(4-фенілбутил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=401, 403 [M+H]<sup>+</sup>

- (13) 1-[2-(3-трифторметилфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантин  
Rf-значення: 0,55 (силікагель, петролейний естер/естер оцтової кислоти/метанол 75:20:5)  
Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=463, 465 [M+Na]<sup>+</sup>
- (14) 1-[2-(піридин-2-іл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-бромксантин  
Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=417, 419 [M+H]<sup>+</sup>
- (15) 1-[2-(пірол-1-іл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантин  
Rf-значення: 0,40 (силікагель, петролейний естер/естер оцтової кислоти/метанол = 75:20:5)  
Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=384, 386 [M+Na]<sup>+</sup>
- (16) 1-[2-([1,2,3]триазол-1-іл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантин  
Rf-значення: 0,22 (силікагель, петролейний естер/естер оцтової кислоти/метанол = 7:2:1)  
Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=364, 366 [M+H]<sup>+</sup>
- (17) 1-[2-(піридин-4-іл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантин  
Rf-значення: 0,15 (силікагель, петролейний естер/естер оцтової кислоти/метанол = 7:2:1)  
Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=374, 378 [M+H]<sup>+</sup>
- (18) 1-(3-бутин-1-іл)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-бромксантин  
Rf-значення: 0,45 (силікагель, петролейний естер/естер оцтової кислоти = 7:3)  
Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=387, 389 [M+Na]<sup>+</sup>
- (19) 1-(3-бутен-1-іл)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-бромксантин  
Rf-значення: 0, 45 (силікагель, петролейний естер/естер оцтової кислоти = 7:3)  
Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=389, 391 [M+Na]<sup>+</sup>
- (20) 1-(4-пентин-1-іл)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантин  
Rf-значення: 0,37 (силікагель, петролейний естер/естер оцтової кислоти/метанол = 80:15:5)  
Мас-спектр (EI): m/z=378, 380 [M]<sup>+</sup>
- (21) 1-(4-пентен-1-іл)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-бромксантин  
Rf-значення: 0,30 (силікагель, петролейний естер/естер оцтової кислоти = 8:2)  
Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=381, 383 [M+H]<sup>+</sup>
- (22) 1-[2-[4-(трет.-бутилдиметилсиланілокси)феніл]етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[(S)-3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин  
Rf-значення: 0,68 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 3:1)  
Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=667 [M+H]<sup>+</sup>
- (23) 1-[2-[3-(трет.-бутилдиметилсиланілокси)феніл]етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[(S)-3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин  
Rf-значення: 0,60 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:1)  
Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=667 [M+H]<sup>+</sup>
- (24) 1-[2-(піридин-3-іл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-бромксантин  
Rf-значення: 0,17 (силікагель, петролейний естер/естер оцтової кислоти/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 7:2:1:0,1)  
Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=418, 420 [M+H]<sup>+</sup>
- (25) 1-[2-(4-метилпіразол-5-іл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-бромксантин

- Rf-значення: 0,55 (силікагель, петролейний естер/естер оцтової кислоти/метанол = 5:4:1)  
Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=438, 440 [M+H]<sup>+</sup>
- (26) 1-[2-(3-метоксифеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-бромксантин  
Rf-значення: 0,60 (силікагель, петролейний естер/естер оцтової кислоти/метанол = 7:2,5:0,5)  
Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=447, 449 [M+H]<sup>+</sup>
- (27) 1-[2-(3-бромфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-бромксантин  
Rf-значення: 0,60 (силікагель, петролейний естер/естер оцтової кислоти/метанол = 7:2,5:0,5)  
Мас-спектр (EI): m/z=494, 496, 498 [M]<sup>+</sup>
- (28) 1-[2-(3-хлорфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-бромксантин  
Rf-значення: 0,60 (силікагель, петролейний естер/естер оцтової кислоти/метанол = 7:2,5:0,5)  
Мас-спектр (EI): m/z=450, 452, 454 [M]<sup>+</sup>
- (29) 1-[2-(2-хлорфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантин  
Rf-значення: 0,65 (силікагель, петролейний естер/естер оцтової кислоти/метанол = 7:2,5:0,5)  
Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=407, 409, 411 [M+H]<sup>+</sup>
- (30) 1-[2-(2-метоксифеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантин  
Rf-значення: 0,65 (силікагель, петролейний естер/естер оцтової кислоти/метанол = 7:2,5:0,5)  
Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=403, 405 [M+H]<sup>+</sup>
- (31) 1-[2-(2-трифторметилфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-бромксантин  
Rf-значення: 0,55 (силікагель, петролейний естер/естер оцтової кислоти = 8:2)  
Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=485, 487 [M+H]<sup>+</sup>
- (32) 1-[2-(2-бромфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантин  
Rf-значення: 0,55 (силікагель, петролейний естер/естер оцтової кислоти = 8:2)  
Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=451, 453, 455 [M+H]<sup>+</sup>
- (33) 1-[2-(3-фторфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантин  
Rf-значення: 0,60 (силікагель, петролейний естер/естер оцтової кислоти = 8:2)  
Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=391, 393 [M+H]<sup>+</sup>
- (34) 1-[2-(3-нітрофеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантин  
Rf-значення: 0,45 (силікагель, петролейний естер/естер оцтової кислоти/метанол = 7:2:1)  
Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=440, 442 [M+Na]<sup>+</sup>
- (35) 1-[2-(4-метилфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантин  
Rf-значення: 0,50 (силікагель, петролейний естер/естер оцтової кислоти/метанол = 7:2:1)  
Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=387, 389 [M+H]<sup>+</sup>
- (36) 1-[2-(2-нітрофеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантин  
Rf-значення: 0,85 (силікагель, петролейний естер/естер оцтової кислоти/метанол = 6:3:1)  
Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=418, 420 [M+H]<sup>+</sup>
- (37) 1-[2-(3,5-дифторфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантин  
Rf-значення: 0,50 (силікагель, петролейний естер/естер оцтової кислоти = 7:3)  
Мас-спектр (EI): m/z=408, 410 [M]<sup>+</sup>
- (38) 1-[2-(2,6-дифторфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантин

Rf-значення: 0,50 (силікагель, петролейний естер/естер оцтової кислоти = 7:3)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=409, 411 [M+H]<sup>+</sup>

(39) 1-[2-(3,5-диметилфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантин

Rf-значення: 0,58 (силікагель, петролейний естер/естер оцтової кислоти = 7:3)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=401, 403 [M+H]<sup>+</sup>

(40) 1-(2-фенілпропіл)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантин

Rf-значення: 0,60 (силікагель, петролейний естер/естер оцтової кислоти/метанол = 7:2:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=387, 389 [M+H]<sup>+</sup>

(41) 1-(2-метокси-2-фенілетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантин

Rf-значення: 0,70 (силікагель, петролейний естер/естер оцтової кислоти/метанол = 7:2:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=425, 427 [M+Na]<sup>+</sup>

(42) 1-[(піридин-2-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантин

Rf-значення: 0,14 (силікагель, петролейний естер/естер оцтової кислоти = 1:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=360, 362 [M+H]<sup>+</sup>

(43) 1-[(ізохінолін-1-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантин

Rf-значення: 0,31 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=410, 412 [M+H]<sup>+</sup>

(44) 1-[(піридин-3-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантин

Rf-значення: 0,10 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 98:2)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=360, 362 [M+H]<sup>+</sup>

(45) 1-[(піридин-4-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантин

Rf-значення: 0,24 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 95:2)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=360, 362 [M+H]<sup>+</sup>

(46) 1-[(ізохінолін-4-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантин

Rf-значення: 0,28 (силікагель, естер оцтової кислоти/петролейний естер = 2:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=410, 412 [M+H]<sup>+</sup>

(47) 1-[(1-метил-1H-індазол-3-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=413, 415 [M+H]<sup>+</sup>

(48) 1-[(хінолін-4-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантин

Rf-значення: 0,39 (силікагель, естер оцтової кислоти)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=410, 412 [M+H]<sup>+</sup>

(49) 1-[(хінолін-8-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантин

Rf-значення: 0,74 (силікагель, естер оцтової кислоти)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=410, 412 [M+H]<sup>+</sup>

Приклад XIII

1,3-диметил-5-[транс-2-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)циклогексил]карбоніламіно}-6-аміноурацил

Одержують шляхом обробки 1,3-Диметил-5-({транс-2-[(фторен-9-ілметоксикарбоніламіно)циклогексил]карбоніламіно)-6-аміноурацилу піперидином в диметилформаміді та

наступної взаємодії з піровугільною кислотою-дитрет.-бутильним естером

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=396 [M+H]<sup>+</sup>

Приклад XIV

1-метил-3-(2-пропіл-1-іл)-7-бензил-8-хлорксантин

Одержують внаслідок взаємодії 1-метил-7-бензил-8-хлорксантину з пропаргілбромідом в присутності карбонату калію в диметилформаміді при кімнатній температурі

Температура плавлення: 169-172°C

Мас-спектр (EI): m/z=328, 330 [M]<sup>+</sup>

Аналогічно до прикладу XIV одержують такі сполуки:

(1) 1-метил-3-(2-пропен-1-іл)-7-бензил-8-хлорксантин

Rf-значення: 0,83 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 95:5)

Мас-спектр (EI): m/z=330, 332 [M]<sup>+</sup>

(2) 1-метил-3-(2-фенілетил)-7-бензил-8-хлорксантин

Температура плавлення: 174-179°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=395, 397 [M+H]<sup>+</sup>

(3) 1-феніл-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[(3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,66 (оксид алюмінію, естер оцтової кислоти/петролейний естер = 8:2)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=509 [M+H]<sup>+</sup>

(4) 1-метил-3-(2-диметиламіноетил)-7-бензил-8-хлорксантин

Rf-значення: 0,30 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку=9:1:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=362, 364 [M+H]<sup>+</sup>

(5) 1,3-біс(2-фенілетил)-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Rf-значення: 0,79 (силікагель, петролейний естер/естер оцтової кислоти = 4:6)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=627 [M+H]<sup>+</sup>

(6) 1-(2-фенілетил)-3-ціанометил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Rf-значення: 0,74 (силікагель, естер оцтової кислоти/петролейний естер = 6:4)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=562 [M+H]<sup>+</sup>

(7) 1-(2-фенілетил)-3-[(метоксикарбоніл)метил]-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Rf-значення: 0,65 (силікагель, естер оцтової кислоти/петролейний естер = 6:4)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=595 [M+H]<sup>+</sup>

(8) 1-(2-фенілетил)-3-(2-диметиламіноетил)-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Rf-значення: 0,39 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=594 [M+H]<sup>+</sup>

(9) 1-(2-феніл-етил)-3-(2-пропіл-1-іл)-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Rf-значення: 0,77 (силікагель, естер оцтової кислоти/петролейний естер = 6:4)

- Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=561 [M+H]<sup>+</sup>  
 (10) 1-метил-3-(2-феніл-2-оксоетил)-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин  
 Rf-значення: 0,69 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 95:5:1)  
 Мас-спектр (ESr): m/z=551 [M+H]<sup>+</sup>  
 (11) 1-метил-3-ціанометил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин  
 Rf-значення: 0,80 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=472 [M+H]<sup>+</sup>  
 (12) 1-метил-3-(2-феніл-етил)-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин  
 Rf-значення: 0,88 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=537 [M+H]<sup>+</sup>  
 (13) 1-метил-3-(2-диметиламіноетил)-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин  
 Rf-значення: 0,21 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=504 [M+H]<sup>+</sup>  
 (14) 1-метил-3-ізопропіл-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин  
 Rf-значення: 0,54 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 95:5:1)  
 (15) 1-метил-3-(2-ціаноетил)-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин  
 Rf-значення: 0,59 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)  
 (16) 1-метил-3-[2-(4-метоксифеніл)етил]-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин  
 Rf-значення: 0,88 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=567 [M+H]<sup>+</sup>  
 (17) 1-метил-3-[2-(3-метоксифеніл)етил]-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин  
 Rf-значення: 0,76 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=567 [M+H]<sup>+</sup>  
 (18) 1-метил-3-[2-(2-метоксифеніл)етил]-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин  
 Rf-значення: 0,68 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)  
 (19) 1-метил-3-[2-(3-метилфеніл)етил]-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Rf-значення: 0,81 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): [M+H]<sup>+</sup>=551 [M+H]<sup>+</sup>  
 (20) 1-метил-3-[2-(4-метилфеніл)етил]-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Rf-значення: 0,81 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=551 [M+H]<sup>+</sup>  
 (21) 1-метил-3-[2-(2-метилфеніл)етил]-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Rf-значення: 0,72 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

(22) 1-метил-3-[2-(2-фторфеніл)етил]-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Rf-значення: 0,89 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=555 [M+H]<sup>+</sup>  
 (23) 1-метил-3-(4-фенілбутил)-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Rf-значення: 0,65 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=565 [M+H]<sup>+</sup>  
 (24) 1-метил-3-(3-фенілпропіл)-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Rf-значення: 0,84 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z = 551 [M+H]<sup>+</sup>  
 (25) 1-метил-3-[2-(4-фторфеніл)етил]-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Rf-значення: 0,80 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 98:2:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=555 [M+H]<sup>+</sup>  
 (26) 1-метил-3-[2-(3-фторфеніл)етил]-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Rf-значення: 0,82 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=555 [M+H]<sup>+</sup>  
 (27) 1-метил-3-(2-фенілетил)-7-(2-ціанобензил)-8-хлорксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=420, 422 [M+H]<sup>+</sup>

Приклад XV

1-метил-7-бензил-8-хлорксантин

Одержують шляхом обробки 1-метил-3-(2-триметилсиланілетоксиметил)-7-бензил-8-хлорксантин з трифтороцтовою кислотою в метиленхлориді при кімнатній температурі

Rf-значення: 0,10 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 98:2)

Аналогічно до прикладу XV одержують такі сполуки:

(1) 1-метил-7-(2-ціанобензил)-8-хлорксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=338, 340 [M+Na]<sup>+</sup>

Приклад XVI

1,3-диметил-7-(3-метилфеніл)-8-хлорксантин

Одержують внаслідок взаємодії 8-хлортеофіліну з 3-метилфенілбороною кислотою в присутності безводного ацетату міді (II), піридину та молярного фільтру 4Å в метиленхлориді при кімнатній температурі

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=305, 307 [M+H]<sup>+</sup>

Аналогічно до прикладу XVI одержують такі сполуки:

(1) 1,3-диметил-7-((E)-1-гексен-1-іл)-8-хлорксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=297, 299 [M+H]<sup>+</sup>

(2) 1,3-диметил-7-((E)-2-фенілвініл)-8-хлорксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=317, 319 [M+H]<sup>+</sup>

(3) 1,3-диметил-7-(2-нафтил)-8-хлорксантин

Rf-значення: 0,60 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=341, 343 [M+H]<sup>+</sup>

(4) 1,3-диметил-7-феніл-8-хлорксантин

Rf-значення: 0,60 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=291, 293 [M+H]<sup>+</sup>

(5) 1,3-диметил-7-(3,5-диметилфеніл)-8-хлорксантин

Rf-значення: 0,60 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=319, 321 [M+H]<sup>+</sup>

(6) 1,3-диметил-7-(4-метилфеніл)-8-хлорксантин

Rf-значення: 0,60 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=305, 307 [M+H]<sup>+</sup>

(7) 1,3-диметил-7-(3-трифторметилфеніл)-8-хлорксантин

Rf-значення: 0,60 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=381, 383 [M+Na]<sup>+</sup>

(8) 1,3-диметил-7-(3-ціанофеніл)-8-хлорксантин

Rf-значення: 0,50 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=338, 340 [M+Na]<sup>+</sup>

(9) 1,3-диметил-7-(3-фторфеніл)-8-хлорксантин

Rf-значення: 0,50 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:1)

Мас-спектр (EI): m/z=308, 310 [M]<sup>+</sup>

Приклад XVII

ціс-N-метиличлорексан-1,2-діамін

Одержують шляхом обробки ціс-N-(трет.-бутилоксикарбоніл)циклогексан-1,2-діаміну літійалюмінійгідридом в тетрагідрофурані у флегмі

Rf-значення: 0,10 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=129 [M+H]<sup>+</sup>

Приклад XVIII

1-(трет.-бутилоксикарбоніл)-3-метиламінопіперидин

Одержують шляхом обробки 1-(трет.-бутилоксикарбоніл)-3-[N-(2,2,2-трифторацетил)-N-метиламіно]піперидину 2N натрієвим лугом в метанолі при кімнатній температурі

Rf-значення: 0,40 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=215 [M+H]<sup>+</sup>

Аналогічно до прикладу XVIII одержують такі сполуки:

(1) 1-(трет.-бутилоксикарбоніл)-3-метиламінопіролідін

Rf-значення: 0,42 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=201 [M+H]<sup>+</sup>

(2) 2-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]-3-бензил-4-етоксикарбоніл-5-метиламіно-3H-імідазол

Здійснення за допомогою метилату натрію в етанолі

Rf-значення: 0,60 (силікагель, петролейний естер/естер оцтової кислоти = 1:1)

Приклад XIX

1-(трет.-бутилоксикарбоніл)-3-[N-(2,2,2-трифторацетил)-N-метиламіно]піперидин

Одержують внаслідок взаємодії 1-(трет.-бутилоксикарбоніл)-3-[(2,2,2-трифторацетил)-аміно]піперидину з гідридом натрію та метилйодидом в тетрагідрофурані при кімнатній температурі

Rf-значення: 0,78 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 95:5)

Аналогічно до прикладу XIX одержують такі сполуки:

(1) 1-(трет.-бутилоксикарбоніл)-3-[N-(2,2,2-трифторацетил)-N-метиламіно]піролідін

(2) 2-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]-3-бензил-4-етоксикарбоніл-5-[N-(2,2,2-трифторацетил)-N-метиламіно]-3H-імідазол

Здійснення за допомогою карбонату калію в диметилформаміді Rf-значення: 0,60 (силікагель, петролейний естер/естер оцтової кислоти = 1:1)

Приклад XX

1-(трет.-бутилоксикарбоніл)-3-[(2,2,2-трифторацетил)аміно]піперидин

Одержують внаслідок взаємодії 3-аміно-1-(трет.-бутилоксикарбоніл)піперидину з метильним естером трифтороцтової кислоти в метанолі при кімнатній температурі

Rf-значення: 0,73 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=295 [M-H]<sup>+</sup>

Аналогічно до прикладу XX одержують такі сполуки:

(1) 2-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]-3-бензил-4-етоксикарбоніл-5-[(2,2,2-трифторацетил)аміно]-3H-імідазол

Здійснення за допомогою ангідриду трифтороцтової кислоти в присутності 4-диметиламінопіридину в метиленхлориді при кімнатній температурі

Rf-значення: 0,70 (силікагель, петролейний естер/естер оцтової кислоти = 1:1)

Приклад XXI

(3)-2-аміно-1-метиламінопропандигідрохлорид Одержують шляхом обробки (5)-аланінметиламідгідрохлориду гідридом літійалю-

мінію в тетрагідрофурані у флегмі та шляхом осадження одержаного внаслідок обробки продукту як дигідрохлориду

Rf-значення: 0,08 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI):  $m/z=159, 161, 163$   $[M+HCl+Cl]^-$

Аналогічно до прикладу XXI одержують такі сполуки:

(1) (R)-2-аміно-1-метиламінопропандигідрохлорид

Мас-спектр (EI):  $m/z=88$   $[M]^+$

Приклад XXII

1-феніл-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-843-(трет.-

бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іліксантин

Одержують шляхом обробки 2-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]-3-(3-метил-2-бутен-1-іл)-4-етоксикарбоніл-5-[(феніламінокарбоніл)аміно]-3Н-імідазолу трет.-бутилатом калію в етанолі флегмі

Rf-значення: 0,75 (оксид алюмінію, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 9:1:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=495$   $[M+H]^+$

Аналогічно до прикладу XXII одержують такі сполуки:

(1) 1-(2-фенілетил)-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Rf-значення: 0,71 (силікагель, естер оцтової кислоти)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=523$   $[M+H]^+$

(2) 1-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Здійснення за допомогою метилату натрію в етанолі при кімнатній температурі

Температура кипіння: 182-185°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=433$   $[M+H]^+$

(3) 1-аміно-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Забруднений 1-аміно-7-(3-метил-бутил)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантином

Здійснення за допомогою метилату натрію в етанолі при кімнатній температурі

Rf-значення: 0,26 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=434$   $[M+H]^+$

(4) 7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Rf-значення: 0,24 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=419$   $[M+H]^+$

(5) калій-3-метил-7-бензил-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин-2-тіолат

Здійснення в n-бутанолі при температурі 105°C

Rf-значення: 0,90 (оксид алюмінію, метиленхлорид/метанол = 10:1)

Приклад XXIII

2-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]-3-(3-метил-2-бутен-1-іл)-4-етоксикарбоніл-5-[(феніламінокарбоніл)аміно]-3Н-імідазол

Одержують внаслідок взаємодії 2-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]-3-(3-метил-2-бутен-1-іл)-4-етоксикарбоніл-5-аміно-3Н-імідазолу з фенілізоціанатом в 1,2-диметоксигетані у флегмі

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=541$   $[M+H]^+$

Аналогічно до прикладу XXIII одержують такі сполуки:

(1) 2-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]-3-(3-метил-2-бутен-1-іл)-4-етоксикарбоніл-5-[(2-фенілетил)амінокарбоніл]аміно-3Н-імідазол

Rf-значення: 0,70 (силікагель, естер оцтової кислоти)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=569$   $[M+H]^+$

(2) 2-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]-3-(3-метил-2-бутен-1-іл)-4-етоксикарбоніл-5-[(метиламінокарбоніл)аміно]-3Н-імідазол

Здійснення при температурі 130°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=479$   $[M+H]^+$

(3) 2-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]-3-(3-метил-2-бутен-1-іл)-4-етоксикарбоніл-5-[(етоксикарбоніламіно)карбоніл]аміно-3Н-імідазол

Rf-значення: 0,29 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=537$   $[M+H]^+$

(4) 1-[2-(3-[(етоксикарбоніламіно)карбоніл]аміно)феніл]-2-оксоетил-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Здійснення в присутності триетиламіну в суміші із метиленхлориду та диметилформаміду при кімнатній температурі

Rf-значення: 0,41 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:2)

(5) 2-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]-3-бензил-4-етоксикарбоніл-5-(N-[(етоксикарбоніламіно)тіокарбоніл]-N-метиламіно)-3Н-імідазол

Здійснення за допомогою етоксикарбонілізотіоціанату в тетрагідрофурані у флегмі

Rf-значення: 0,35 (силікагель, петролейний естер/естер оцтової кислоти = 1:1)

Приклад XXIV

2-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]-3-(3-метил-2-бутен-1-іл)-4-етоксикарбоніл-5-аміно-3Н-імідазол

Одержують внаслідок взаємодії ціаніміно-[N-(3-метил-2-бутен-1-іл)-N-(етоксикарбоніл)метил]аміно]-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]метану з натрієм в етанолі у флегмі

Rf-значення: 0,26 (оксид алюмінію, естер оцтової кислоти/петролейний естер = 8:2)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=422$   $[M+H]^+$

Аналогічно до прикладу XXIV одержують такі сполуки:



(1) 2-[3-(трет.-  
бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]-3-бензил-  
4-етоксикарбоніл-5-аміно-3H-імідазол

Rf-значення: 0,40 (силікагель, естер оцтової  
кислоти/петролейний естер = 4:1)

Приклад XXV

Ціаніміно-[N-(3-метил-2-бутен-1-іл)-N-  
(етоксикарбонілметил)аміно]-[3-(трет.-  
бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]метан

Одержують внаслідок взаємодії ціаніміно-  
но[(етоксикарбонілметил)аміно]-[3-(трет.-  
бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]метану з 1-  
бром-3-метил-2-бутеном в присутності карбонату  
калію в ацетоні при кімнатній температурі

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=422 [M+H]<sup>+</sup>

Аналогічно до прикладу XXV одержують такі  
сполуки:

(1) ціаніміно-[N-бензил-N-  
(етоксикарбонілметил)аміно]-[3-(трет.-  
бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]метан

Здійснення в присутності етильного естеру  
бромоцтової кислоти в присутності карбонату ка-  
лію в диметилформаміді

Rf-значення: 0,70 (силікагель, естер оцтової  
кислоти/петролейний естер = 4:1)

Приклад XXVI

Ціаніміно[(етоксикарбонілметил)аміно]-[3-  
(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-  
іл]метан

Одержують внаслідок взаємодії ціаніміно-  
но[(етоксикарбонілметил)аміно]фенілоксиметану з  
3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидином в  
ізопропанолі при температурі 70°C

Rf-значення: 0,45 (оксид алюмінію, естер оц-  
тової кислоти)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=354 [M+H]<sup>+</sup>

Аналогічно до прикладу XXVI одержують такі  
сполуки:

(1) ціанімінобензиламіно-[3-(трет.-  
бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]метан

Здійснення в диметилформаміді при темпера-  
турі 80°C

Rf-значення: 0,56 (оксид алюмінію, метиленх-  
лорид/метанол = 40:1)

Приклад XXVII

Ціаніміно-  
но[(етоксикарбонілметил)аміно]фенілоксиметан

Одержують внаслідок взаємодії дифенілціано-  
карбонімідату з гідрохлоридом етильного естеру  
амінооцтової кислоти в присутності триетиламіну в  
ізопропанолі при кімнатній температурі [аналогічно  
R. Besse et al., Tetrahedron 1990, 46, 7803-7812]

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=248 [M+H]<sup>+</sup>

Аналогічно до прикладу XXVII одержують такі  
сполуки:

(1) ціанімінобензиламінофенілоксиметан

Rf-значення: 0,20 (силікагель, петролейний ес-  
тер/естер оцтової кислоти = 3:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=252 [M+H]<sup>+</sup>

Приклад XXVIII

1-((E)-2-фенілвініл)-3-метил-7-(3-метил-2-  
бутен-1-іл)-8-бромксантин

Одержують внаслідок взаємодії 3-метил-7-(3-  
метил-2-бутен-1-іл)-8-бромксантину з (E)-2-  
фенілвініломвороновою кислотою в присутності

безводного ацетату міді (II) та піридину в метилен-  
хлориді при кімнатній температурі

Rf-значення: 0,70 (силікагель, петролейний ес-  
тер/естер оцтової кислоти/метанол = 6:3:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=415, 417 [M+H]<sup>+</sup>

Приклад XXIX

1,3-диметил-7-((E)-2-гексен-1-іл)-8-  
хлорксантин

Одержують внаслідок взаємодії 8-хлор-  
теофіліну з (E)-2-гексен-1-олом в присутності три-  
фенілфосфіну та діізопропілазодикарбоксилату в  
тетрагідрофурані при кімнатній температурі

Мас-спектр (EI): m/z=296, 298 [M]<sup>+</sup>

Приклад XXX

1-(Фенілсульфонілметил)-3-метил-7-(3-метил-  
2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-

бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Одержують внаслідок оксидації 1-  
(фенілсульфанілметил)-3-метил-7-(3-метил-2-  
бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-

бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантину з  
пероксидом водню в гексафторізопропанолі

Rf-значення: 0,40 (силікагель, петролейний ес-  
тер/естер оцтової кислоти/метанол = 6,5:2:1,5)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=571 [M+H]<sup>+</sup>

Приклад XXXI

1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(1-  
нітрозопіперидин-4-іл)ксантин

Одержують шляхом обробки 1,3-диметил-7-(3-  
метил-2-бутен-1-іл)-8-(піперидин-4-іл)ксантину  
ізоамілнітриду в тетрагідрофурані при температурі  
60°C

Вихідний продукт відразу піддають подальшо-  
му перетворенню (див. приклад 8)

(1) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(1-  
нітрозопіперидин-3-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=361 [M+H]<sup>+</sup>

Приклад XXXII

1,3-диметил-7-((E)-1-бутен-1-іл)-8-хлорксантин

Одержують шляхом обробки 1,3-диметил-7-(2-  
метансульфонілоксибутил)-8-хлорксантину

1,8-діазабіцикло[5.4.0]ундец-7-еном в діоксані  
у флегмі

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=269, 271 [M+H]<sup>+</sup>

Приклад XXXIII

1,3-диметил-7-(2-метансульфонілоксибутил)-  
8-хлорксантин

Одержують внаслідок взаємодії 1,3-диметил-7-  
(2-гідроксибутил)-8-хлорксантину з хлоридом ме-  
тансульфонової кислоти в метиленхлориді в при-  
сутності триетиламіну

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=365, 367 [M+H]<sup>+</sup>

Аналогічно до прикладу XXXIII одержують такі  
сполуки:

(1) 1-[2-(3-метансульфонілоксифеніл)-2-  
оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-  
(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-  
іл]ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=645 [M+H]<sup>+</sup>

(2) 1-(2-{3-[біс(метансульфоніл)аміно]феніл}2-  
оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-  
(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-  
іл]ксантин

(3) 1-[2-(3-метансульфоніламінофеніл)-2-  
оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-

(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Здійснення за допомогою піридину як допоміжної основи

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=644 [M+H]<sup>+</sup>

(4) 1-[2-(2-метансульфонілоксибеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=645 [M+H]<sup>+</sup>

(5) 1-(2-{2-[бис(метансульфоніл)аміно]беніл}-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Здійснення в дихлопентані за допомогою двох еквівалентів хлориду метансульфонової кислоти

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=722 [M+H]<sup>+</sup>

Приклад XXXIV

1,3-диметил-7-(2-гідроксибутил)-8-хлорксантин  
Одержують внаслідок взаємодії 8-хлортеофіліну з 2-етилоксираном в диметилформаміді в присутності основи Хюніга при температурі 65°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=287, 289 [M+H]<sup>+</sup>

Приклад XXXV

1-(2-фенілетил)-3-вініл-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

135мг 1-(2-фенілетил)-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин, 84μl вінілтриметоксисилану, 53мг безводного ацетату міді (II) та 0,53мл 1М розчину тетрабутиламонійфториду в тетрагідрофурані суспендують 5мл метиленхлориду та замінюють 200мг молярного фільтру 4Å. Потім додають 43μl піридину та перемішують реакційну суміш бірюзового кольору протягом трьох днів при кімнатній температурі. Зрештою її розбавляють метиленхлоридом та відсмоктують через тальк. Фільтрат конденсують у вакуумі, а вихідний продукт очищують за допомогою хроматографа через кремнієву кислоту циклогексаном/естером оцтової кислоти (8:2 до 1:1) як розчинником.

Вихід: 32мг (23 % від теоретичного)

Rf-значення: 0,50 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 2:1)

Мас-спектр (EI): m/z=548 [M]<sup>+</sup>

Приклад XXXVI

1-(2-фенілетил)-3-((E)-2-фенілвініл)-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-трет.-

бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Одержують внаслідок взаємодії 1-(2-фенілетил)-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]-ксантин з (E)-2-фенілвінілбороновою кислотою в метиленхлориді в присутності безводного ацетату міді (II), піридину та молекулярного фільтру 4Å при кімнатній температурі

Rf-значення: 0,71 (силікагель, петролейний естер/естер оцтової кислоти = 6:4)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=625 [M+H]<sup>+</sup>

Аналогічно до прикладу XXXVI одержують такі сполуки:

(1) 1-метил-3-феніл-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Rf-значення: 0,86 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 95:5:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=509 [M+H]<sup>+</sup>

(2) 1-метил-3-((E)-2-фенілвініл)-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-

бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Температура плавлення: 201-202,5°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=535 [M+H]<sup>+</sup>

Приклад XXXVII

1-(2-гідрокси-2-Фенілетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-

бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Одержують шляхом обробки 1-(2-феніл-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантину боргидридом натрію в метанолі при кімнатній температурі

Rf-значення: 0,30 (силікагель, петролейний естер/естер оцтової кислоти/метанол = 60:35:5)

Приклад XXXVIII

1-фенілкарбоніламіно-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Одержують внаслідок взаємодії 1-аміно-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантину (забрудненого 1-аміно-7-(3-метил-бутил)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантином) з бензоїлхлоридом в присутності піридину в метиленхлориді при кімнатній температурі

Одержаний продукт забруднений 1-фенілкарбоніламіно-7-(3-метилбутил)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантином

Rf-значення: 0,16 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=538 [M+H]<sup>+</sup>

Приклад XXXIX

2-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]-3-(3-метил-2-бутен-1-іл)-4-етоксикарбоніл-5-пдазинокарбоніламіно-3H-імідазол

Одержують внаслідок взаємодії 2-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]-3-(3-метил-2-бутен-1-іл)-4-етоксикарбоніл-5-етоксикарбоніламіно-3H-імідазолу з гідратом гідразину в ксилолі при температурі 150°C. Одержаний продукт забруднений 2-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]-3-(3-метилбутил)-4-етоксикарбоніл-5-гідразинокарбоніламіно-3H-імідазолом

Rf-значення: 0,10 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Приклад XL

2-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]-3-(3-метил-2-бутен-1-іл)-4-етоксикарбоніл-5-етоксикарбоніламіно-3H-імідазол

Одержують внаслідок взаємодії 2-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]-3-(3-метил-2-бутен-1-іл)-4-етоксикарбоніл-5-аміно-3H-імідазолу з етильним естером хлорметанової кислоти в присутності 0,5N натрієвого лугу в метиленхлориді при температурі 50°C

Температура плавлення: 129-131°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=494 [M+H]<sup>+</sup>

Приклад XLI

1-[2-(3-алілоксифеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-

бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Одержують внаслідок взаємодії 1-[2-(3-гідроксифеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-

бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантину з бромідом алілу в присутності карбонату калію в диметилформаміді при кімнатній температурі

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=607 [M+H]<sup>+</sup>

Аналогічно до прикладу XLI одержують такі сполуки:

(1) 1-[2-оксо-2-[3-(2-пропін-1-ілокси)феніл]етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=627 [M+Na]<sup>+</sup>

(2) 1-(2-{3-[(метоксикарбоніл)метокси]феніл}-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=639 [M+H]<sup>+</sup>

(3) 1-[2-(3-ціанометоксифеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=606 [M+H]<sup>+</sup>

(4) 1-[2-(3-бензилоксифеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=657 [M+H]<sup>+</sup>

(5) 1-[2-(3-фенілсульфонілоксифеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=707 [M+H]<sup>+</sup>

(6) 1-(2-{2-[(метоксикарбоніл)метокси]феніл}-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=639 [M+H]<sup>+</sup>

(7) 1-[2-(2-ціанометоксифеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=606 [M+H]<sup>+</sup>

(8) 1-(2-{3-[(диметиламінокарбоніл)метокси]феніл}-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Rf-значення: 0,25 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти/метанол = 5:4:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=652 [M+H]<sup>+</sup>

(9) 1-(2-{3-[(метиламінокарбоніл)метокси]феніл}-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Rf-значення: 0,24 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти/метанол = 5:4:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=638 [M+H]<sup>+</sup>

(10) 1-(2-{3-[(амінокарбоніл)метокси]феніл}-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Rf-значення: 0,30 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти/метанол = 5:4:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=624 [M+H]<sup>+</sup>

Приклад XLII

1-[2-(3-ФенілоксиФеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-

бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Одержують внаслідок взаємодії 1-[2-(3-гідроксифеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-

бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантину з фенілбороною кислотою в метиленхлориді в присутності безводного ацетату міді (II), піридину та молярного фільтру 4Å при кімнатній температурі

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=643 [M+H]<sup>+</sup>

Приклад XLIII

1-[2-(3-аміносізеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-

бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Одержують шляхом обробки 1-[2-(3-алілоксикарбоніламінофеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-

бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантину тетракіс(трифенілфосфін)паладієм (0) та 5,5-диметил-1,3-циклогександіоном у тетрагідрофурані при кімнатній температурі

Rf-значення: 0,22 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти/метанол/концентр.

водний розчин аміаку = 60:30:10:1)

Приклад XLIV

1-(3-алілоксикарбоніламіноФеніл)-2-брометан-1-он та 1-(3-алілоксикарбоніламінофеніл)-2-хлоретан-1-он

Одержують внаслідок взаємодії 1-(3-амінофеніл)-2-брометан-1-онгідроброміду з аліловим естером хлорметанової кислоти у метиленхлориді в присутності основи Хюніга.

Одержують суміш із хлор- та бром-сполук.

Rf-значення: 0,50 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти/метанол = 6:3:1)

Мас-спектр (ES<sup>f</sup>): m/z=252, 254 [M<sup>1</sup>-H]<sup>-</sup>; 296, 298 [M<sup>2</sup>-H]<sup>-</sup>

Приклад XLV

1-[2-(3-амінофеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-

бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Одержують шляхом обробки 1-[2-(3-нітрофеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-

бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантину залізним порошком у суміші з етанолу, води та льодяної оцтової кислоти (80:25:10) при температурі 100°C

Rf-значення: 0,55 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 50:30:20:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=566 [M+H]<sup>+</sup>

Аналогічно до прикладу XLV одержують такі сполуки:

(1) 1-[2-(2-амінофеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-

бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=566 [M+H]<sup>+</sup>

(2) 1-[(5-аміноізохінолін-1-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин  
Rf-значення: 0,53 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=589 [M+H]<sup>+</sup>

Приклад XLVI

2-бром-1-(3-диметиламінофеніл)етан-1-он та 2-бром-1-(2-бром-5-диметиламінофеніл)етан-1-он Одержують шляхом обробки 1-(3-диметиламінофеніл)етан-1-ону бромом в присутності оцтової кислоти в естері оцтової кислоти у флегмі. Суміш одержують із моно- та дибром-сполуки.

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=242, 244 [M<sup>+</sup>1+H]<sup>+</sup>; 320, 322, 324 [M<sup>+</sup>2+H]<sup>+</sup>

Приклад XLVII

1-[2-(3-метоксикарбоніламінофеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Одержують внаслідок взаємодії 1-[2-(3-амінофеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]-ксантину з металним естером хлорметанової кислоти в присутності триетиламіну в суміші з метиленхлориду та диметилформаміду (3:1) при кімнатній температурі.

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=624 [M+H]<sup>+</sup>

Аналогічно до прикладу XLVII одержують такі сполуки:

(1) 1-(2-{3-[(диметиламінокарбоніл)аміно]феніл}-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Взаємодія відбувається з диметилкарбамоїлхлоридом в присутності карбонату калію в диметилформаміді при температурі 75°C.

Rf-значення: 0,30 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти/метанол = 6:4:1)

Мас-спектр (EI): m/z=636 [M]<sup>+</sup>

Приклад XLVIII

1-[2-(3-ацетиламінофеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Одержують внаслідок взаємодії 1-[2-(3-амінофеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантину з ацетилхлоридом в присутності піридину в суміші з метиленхлориду та диметилформаміду (3:1) при кімнатній температурі.

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=608 [M+H]<sup>+</sup>

Аналогічно до прикладу XLVIII одержують такі сполуки:

(1) 1-[2-(2-ацетиламінофеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=608 [M+H]<sup>+</sup>

Приклад XLIX

1-[2-(3-ціанометиламінофеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Одержують внаслідок взаємодії 1-[2-(3-амінофеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-

бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантину з бромацетонітрилом в присутності основи Хюніга в диметилформаміді при температурі 70°C.

Rf-значення: 0,18 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:2)

Приклад L

1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(ціс-N-[2-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)циклогексил]-N-метиламіно)ксантин

Одержують шляхом обробки 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[ціс-2-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)циклогексиламіно]ксантину гідридом натрію в диметилформаміді при температурі 0°C та внаслідок подальшої взаємодії з метилйодидом при температурі від 0°C до кімнатної.

Rf-значення: 0,42 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 1:1)

Аналогічно до прикладу L одержують такі сполуки:

(1) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(N-[2-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)-2-метилпропіл]-N-метиламіно)ксантин

Rf-значення: 0,62 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 95:5)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=449 [M+H]<sup>+</sup>

Приклад LI

2-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)-3-(N-бензил-N-метиламіно)пропіонова кислота

Одержують внаслідок взаємодії 3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)оксетан-2-ону з N-бензил-N-метиламіном в ацетонітрилі при кімнатній температурі.

Rf-значення: 0,40 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 9:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=309 [M+H]<sup>+</sup>

Приклад LII

1-(2-{3-[(метиламіно)тіокарбоніламіно]феніл}-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Одержують внаслідок взаємодії 1-[2-(3-амінофеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-

бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантину з метилізотіоціанатом в диметилформаміді при температурі 90°C.

Rf-значення: 0,34 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти/метанол = 7:2:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=639 [M+H]<sup>+</sup>

Аналогічно до прикладу LII одержують такі сполуки:

(1) 1-(2-{3-[(амінокарбоніл)аміно]феніл}-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Взаємодія відбувається з триметилсилілізоціанатом.

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=609 [M+H]<sup>+</sup>

Приклад LIII

1-(2-{3-[(метоксикарбоніл)метиламіно]феніл}-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-

(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Одержують внаслідок взаємодії 1-[2-(3-амінофеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-

бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантину з металним естером бромцтової кислоти в присутності карбонату калію в диметилформаміді при температурі 80 °C.

Rf-значення: 0,38 (силікагель, циклогексан/естер оцтової кислоти = 3:7)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=638 [M+H]<sup>+</sup>

Приклад LIV

1-[2-(2-гідроксифеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантин

Одержують шляхом обробки 1-[2-(2-метоксифеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-хлорксантину бортрибромідом у метиленхлориді. Одержаний продукт забруднений приблизно 20% 1-[2-(2-гідроксифеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-бром-3-метил-бутил)-8-хлорксантином.

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=403, 405 [M+H]<sup>+</sup>

Приклад LV

1-метил-3-[2-(4-метоксифеніл)етил]-7-(2-ціанобензил)-8-хлорксантин

Одержують внаслідок взаємодії 1-метил-7-(2-ціанобензил)-8-хлорксантину з 2-(4-метоксифеніл)етанолом в присутності трифенілфосфіну та диетильного естеру азодикарбонової кислоти в тетрагідрофурані при кімнатній температурі.

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=450 [M+H]<sup>+</sup>

Приклад LVI

7-(2-ціанобензил)ксантин

Одержують шляхом обробки 16,68г 2-аміно-7-(2-ціанобензил)-1,7-дигідропурин-6-ону 17,00г нітротом натрію у суміші з 375мл концентрованої оцтової кислоти, 84мл води та 5,2мл концентрованої соляної кислоти при температурі 50 °C.

Вихід: 8,46г (50 % від теоретичного)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=268 [M+H]<sup>+</sup>

Приклад LVII

2-аміно-7-(2-ціанобензил)-1,7-дигідропурин-6-он

Одержують внаслідок взаємодії 20,00г гідрату гуанозину з 22,54г 2-ціанобензилбромідом в диметилсульфоксиді при температурі 60 °C та подальшої обробки 57мл концентрованої соляної кислоти.

Вихід: 18,00г (97% від теоретичного)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=267 [M+H]<sup>+</sup>

Приклад LVIII

1-(4-оксо-4Н-хромен-3-іл)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-

бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Одержують внаслідок взаємодії 1-[2-(2-гідроксифеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-

бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантину з диметилацетатом диметилформаміду в присутності піридину в толуолі у флегмі.

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=577 [M+H]<sup>+</sup>

Приклад LIX

ендо-6-аміно-2-бензил-2-

азабіцикло[2.2.2]октанта екзо-6-аміно-2-бензил-2-азабіцикло[2.2.2]октан

Одержують внаслідок взаємодії 2-бензил-2-азабіцикло[2.2.2]октан-6-ону [R. F. Borne et al., J. Het. Chem. 1973, 10, 241] з ацетатом амонію в присутності льодяної оцтової кислоти та молярного фільтру 4А в метанолі та подальшої обробки ціаноборгідридом натрію при кімнатній температурі. Одержують суміш із ендо- та екзо-сполуки, яку після взаємодії з дитрет.-бутильним естером піровугільної кислоти відокремлюють за допомогою хроматографа (див. приклад IV (9)).

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=217 [M+H]<sup>+</sup>

Приклад LX

3-аміно-3-(піролідин-1-ілкарбоніл)піперидин х трифтороїтова кислота

Одержують шляхом обробки 1-(трет.-бутилоксикарбоніл)-3-аміно-3-(піролідин-1-ілкарбоніл)піперидину трифтороцтовою кислотою в метиленхлориді при кімнатній температурі.

Аналогічно до прикладу LX одержують такі сполуки;

(1) 3-аміно-4-гідроксипіперидин х трифтороцтова кислота

Мас-спектр (EI): m/z=116 [M]<sup>+</sup>

Приклад LXI

1-(трет.-бутилоксикарбоніл)-3-аміно-3-(піролідин-1-ілкарбоніл)піперидин

Одержують шляхом обробки 1-(трет.-бутилоксикарбоніл)-3-[[9Н-фторен-9-ілметокси]карбоніл]аміно-3-(піролідин-1-ілкарбоніл)піперидину діетиламіном в тетрагідрофурані при кімнатній температурі.

Температура кипіння: 108,5 °C

Приклад LXII

1-(трет.-бутилоксикарбоніл)-3-бензиламіно-4-гідроксипіперидин та 1-(трет.-бутилоксикарбоніл)-4-бензиламіно-3-гідроксипіперидин

Одержують внаслідок взаємодії 3,10г 3-(трет.-бутилоксикарбоніл)-7-окса-3-азабіцикло[4.1.0]гептану з 1,7 мл бензиламіну в 30мл етанолу у флегмі.

Одержані регіоізмери можуть бути відокремлені хроматографом через силікагелеві колонну за допомогою естеру оцтової кислоти/метанолу/концентр. водного розчину аміаку (90:10:1) як розчинника:

1-{трет.-бутилоксикарбоніл)-4-бензиламіно-3-гідроксипіперидин

Вихід: 0,68г (14% від теоретичного)

Rf-значення: 0,68 (силікагель, естер оцтової кислоти/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=307 [M+H]<sup>+</sup>

1-(трет.-бутилоксикарбоніл)-3-бензиламіно-4-гідроксипіперидин

Вихід: 1,13г (24% від теоретичного)

Rf-значення: 0,56 (силікагель, естер оцтової кислоти/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=307 [M+H]<sup>+</sup>

Приклад LXIII

1,3-диметил-2-тіоксо-7-бензил-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин

Одержують внаслідок взаємодії калій-{3-метил-7-бензил-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантин}-2-тіолату з диметилсульфатом у суміші із води та диметилформаміду. Одержаний продукт за допомогою хроматографу відокремлюють від одержаного 2-метилсульфаніл-3-метил-7-бензил-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантину.

Мас-спектр (EI):  $m/z=484$   $[M]^+$

Одержання кінцевих сполук:

Приклад 1

1,3-диметил-7-бензил-8-(3-амінопіролідін-1-іл)ксантин

Суміш із 200мг 1,3-диметил-7-бензил-8-хлорксантину, 420мг 3-амінопіролідінгидрохлориду, 0,92мл триетиламіну та 2мл диметилформаміду перемішують протягом 2 днів при температурі 50°C. Реакційну суміш розводять 20мл води та двічі екстрагують відповідно 10мл естеру оцтової кислоти. Органічну фазу вимивають несиченим розчином хлористого натрію, висушують та концентрують. Залишок доводять до кристалізації за допомогою діетильного/діізопропільного етеру (1:1). Тверду речовину відсмоктують та висушують.

Вихід: 92мг (40 % від теоретичного)

Температура плавлення: 150°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=355$   $[M+H]^+$

Rf-значення: 0,08 (силікагель, естер оцтової кислоти/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 9:1:0,1)

Аналогічно до прикладу 1 одержують такі сполуки:

(1) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіролідін-1-іл)ксантин

Температура плавлення: 119°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=333$   $[M+H]^+$

Rf-значення: 0,07 (силікагель, естер оцтової кислоти/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 9:1:0,1)

(2) 1,3-диметил-7-бензил-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=369$   $[M+H]^+$

Rf-значення: 0,06 (силікагель, естер оцтової кислоти/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 9:1:0,1)

(3) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[(транс-2-аміноциклогексил)аміно]ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=361$   $[M+H]^+$

(4) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=347$   $[M+H]^+$

(5) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(4-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=347$   $[M+H]^+$

(6) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[(ціс-2-аміноциклогексил)аміно]ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=361$   $[M+H]^+$

(7) 1,3-диметил-7-(2-бутин-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=331$   $[M+H]^+$

Rf-значення: 0,08 (силікагель, естер оцтової кислоти/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 9:1:0,1)

(8) 1,3-диметил-7-[(1-циклопентен-1-іл)метил]-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=359$   $[M+H]^+$

Rf-значення: 0,09 (силікагель, естер оцтової кислоти/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 9:1:0,1)

(9) 1,3-диметил-7-(2-тієнілметил)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=375$   $[M+H]^+$

Rf-значення: 0,08 (силікагель, естер оцтової кислоти/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 9:1:0,1)

(10) 1,3-диметил-7-(3-фторбензил)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=387$   $[M+H]^+$

Rf-значення: 0,08 (силікагель, естер оцтової кислоти/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 9:1:0,1)

(11) 1,3-диметил-7-(2-фторбензил)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=387$   $[M+H]^+$

Rf-значення: 0,08 (силікагель, естер оцтової кислоти/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 9:1:0,1)

(12) 1,3-диметил-7-(4-фторбензил)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=387$   $[M+H]^+$

(13) 1,3-диметил-7-(2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=333$   $[M+H]^+$

(14) 1,3-біс(циклопропілметил)-7-бензил-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=449$   $[M+H]^+$

(15) 3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=333$   $[M+H]^+$

(16) 1-етил-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=361$   $[M+H]^+$

(17) 1-пропіл-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=375$   $[M+H]^+$

(18) 1-бутил-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=389$   $[M+H]^+$

(19) 1-(2-пропіл)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=375$   $[M+H]^+$

(20) 1-(2-метилпропіл)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=389$   $[M+H]^+$

(21) 1-(2-пропен-1-іл)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=373$   $[M+H]^+$

(22) 1-(2-пропін-1-іл)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=371$   $[M+H]^+$

(23) 1-(циклопропілметил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=387$   $[M+H]^+$

(24) 1-бензил-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=423$   $[M+H]^+$

(25) 1-(2-фенілметил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=437$   $[M+H]^+$

(26) 1-(3-фенілпропіл)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=451 [M+H]<sup>+</sup>  
 (27) 1-[2-гідроксиетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=377 [M+H]<sup>+</sup>  
 (28) 1-(2-метоксиетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=391 [M+H]<sup>+</sup>  
 (29) 1-(3-гідроксипропіл)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=391 [M+H]<sup>+</sup>  
 (30) 1-[2-(диметиламіно)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=404 [M+H]<sup>+</sup>  
 (31) 1-[3-(диметиламіно)пропіл]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=418 [M+H]<sup>+</sup>  
 (32) 1-метил-3-(циклопропшметил)-7-бензил-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=409 [M+H]<sup>+</sup>  
 (33) 1,3-діетил-7-бензил-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=397 [M+H]<sup>+</sup>  
 (34) 1-метил-3-етил-7-бензил-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=383 [M+H]<sup>+</sup>  
 (35) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[N-(2-аміноетил)метиламіно]ксантин  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=321 [M+H]<sup>+</sup>  
 (36) 1-[2-(2,4,6-триметилфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 Температура плавлення: 153-154,5°C  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=479 [M+H]<sup>+</sup>  
 (37) 1-[2-(2,4-дихлорфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 Температура плавлення: 130-132°C  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=505, 507, 509 [M+H]<sup>+</sup>  
 (38) 1-[2-(тіофен-2-іл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 Rf-значення: 0,20 (силікагель, естер оцтової кислоти/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 5:1:0,1)  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=443 [M+H]<sup>+</sup>  
 (39) 1-[2-(тіофен-3-іл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 Rf-значення: 0,20 (силікагель, естер оцтової кислоти/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 5:1:0,1)  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=443 [M+H]<sup>+</sup>  
 (40) 1-[2-(4-трет.-бутилфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 Rf-значення: 0,25 (силікагель, естер оцтової кислоти/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 5:1:0,1)  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=493 [M+H]<sup>+</sup>  
 (41) 1-[2-(4-фторфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,20 (силікагель, естер оцтової кислоти/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 5:1:0,1)  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=455 [M+H]<sup>+</sup>  
 (42) 1-[2-(4-метоксифеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 Rf-значення: 0,18 (силікагель, естер оцтової кислоти/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 5:1:0,1)  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=467 [M+H]<sup>+</sup>  
 (43) 1-метил-3,7-добензил-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=445 [M+H]<sup>+</sup>  
 (44) 1-метил-3-[(метоксикарбоніл)метил]-7-бензил-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 Rf-значення: 0,27 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 9:1:0,1)  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=427 [M+H]<sup>+</sup>  
 (45) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[N-(2-метиламіноетил)-N-метиламіно]ксантин  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=335 [M+H]<sup>+</sup>  
 (46) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[N-(2-диметиламіноетил)-N-метиламіно]ксантин  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=349 [M+H]<sup>+</sup>  
 (47) 1-метил-3-ізопропіл-7-бензил-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 Rf-значення: 0,32 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 9:1:0,1)  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=397 [M+H]<sup>+</sup>  
 (48) 1,3-диметил-7-(2-пентин-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=345 [M+H]<sup>+</sup>  
 (49) 1-метил-3-(2-метоксиетил)-7-бензил-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 Rf-значення: 0,31 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 9:1:0,1)  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=413 [M+H]<sup>+</sup>  
 (50) 1-метил-3-ціанометил-7-бензил-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 Rf-значення: 0,24 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 9:1:0,1)  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=394 [M+H]<sup>+</sup>  
 (51) 1-[2-(2-фторфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 Rf-значення: 0,30 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 10:1:0,1)  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=455 [M+H]<sup>+</sup>  
 (52) 1-[2-(2-метилфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 Rf-значення: 0,34 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 10:1:0,1)  
 Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=451 [M+H]<sup>+</sup>  
 (53) 1-метил-3-(2-пропін-1-іл)-7-бензил-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 Rf-значення: 0,23 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 9:1:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=393 [M+H]<sup>+</sup>  
(54) 1-метил-3-(2-пролен-1-іл)-7-бензил-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,31 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 9:1:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=395 [M+H]<sup>+</sup>

(55) 1-[2-(3-метилфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,20 (силікагель, естер оцтової кислоти/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 7:3:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=451 [M+H]<sup>+</sup>

(56) 1-[2-(1-нафтил)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,30 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 15:1:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=487 [M+H]<sup>+</sup>

(57) 1-[2-(2-нафтил)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,25 (силікагель, естер оцтової кислоти/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 7:3:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=487 [M+H]<sup>+</sup>

(58) 1-(4-фенілбутил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,22 (силікагель, естер оцтової кислоти/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 7:3:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=465 [M+H]<sup>+</sup>

(59) 1-[2-(3-трифторметилфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,30 (силікагель, естер оцтової кислоти/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 7:3:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=505 [M+H]<sup>+</sup>

(60) 1-[2-(піридин-2-іл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Температура плавлення: 117-120°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=438 [M+H]<sup>+</sup>

(61) 1-[2-(пірол-1-іл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Температура плавлення: 136-138,6°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=426 [M+H]<sup>+</sup>

(62) 1,3-диметил-7-(3-метилфеніл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=369 [M+H]<sup>+</sup>

(63) 1-[2-([1,2,3]-триазол-1-іл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,15 (силікагель, естер оцтової кислоти/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 7:3:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=428 [M+H]<sup>+</sup>

(64) 1-[2-(піридин-4-іл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,12 (силікагель, естер оцтової кислоти/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 7:3:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=438 [M+H]<sup>+</sup>

(65) 1-(3-бутин-1-іл)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Температура плавлення: 150-152°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=385 [M+H]<sup>+</sup>

(66) 1-(3-бутен-1-іл)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Температура плавлення: 111-112,6°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=387 [M+H]<sup>+</sup>

(67) 1-(4-пентин-1-іл)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,12 (силікагель, естер оцтової кислоти/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 8:2:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=399 [M+H]<sup>+</sup>

(68) 1-(2-фенілетил)-3-метил-7-бензил-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=459 [M+H]<sup>+</sup>

(69) 1-(2-фенілетил)-3-метил-7-циклопропілметил-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=423 [M+H]<sup>+</sup>

(70) 1-метил-3-(2-фенілетил)-7-бензил-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,23 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 9:1:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=459 [M+H]<sup>+</sup>

(71) 1-(2-фенілетил)-3-метил-7-{2-бутин-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=421 [M+H]<sup>+</sup>

(72) 1-(4-пентен-1-іл)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,18 (силікагель, естер оцтової кислоти/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 7:3:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=401 [M+H]<sup>+</sup>

(73) 1,3-диметил-7-бензил-8-(гомопіперазин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,33 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=369 [M+H]<sup>+</sup>

(74) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[[[піперидин-2-іл)метил]аміно]ксантин

Rf-значення: 0,24 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=361 [M+H]<sup>+</sup>

(75) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-{{(R)-[2-(амінометил)піролідин-1-іл]}ксантин

Rf-значення: 0,27 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=347 [M+H]<sup>+</sup>

(76) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-{{(S)-[2-(амінометил)піролідин-1-іл]}ксантин

Температура плавлення: 112-115°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=347 [M+H]<sup>+</sup>

(77) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[ціс-(2-метиламіноциклогексил)аміно]ксантин

Температура плавлення: 172,5-175°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=375 [M+H]<sup>+</sup>

(78) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(гомопіперазин-1-іл)ксантин



Rf-значення: 0,31 (силікагель, естер оцтової кислоти/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=347 [M+H]<sup>+</sup>

(79) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[N-((S)-2-амінопропіл)-N-метиламіно]ксантин

Здійснення за допомогою карбонату натрію та основи Хюніга в диметилсульфоксиді при температурі 150°C.

Rf-значення: 0,31 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=335 [M+H]<sup>+</sup>

(80) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(піперазин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,42 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 9:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=333 [M+H]<sup>+</sup>

(81) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-N-((R)-2-амінопропіл)-N-метиламіно]ксантин

Здійснення за допомогою карбонату натрію та основи Хюніга в диметилсульфоксиді при температурі 150°C.

Температура плавлення: 101-104,5°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=335 [M+H]<sup>+</sup>

(82) 1-[2-(піридин-3-іл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=438 [M+H]<sup>+</sup>

Rf-значення: 0,18 (силікагель, естер оцтової кислоти/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 7:3:0,1)

(83) 1-[2-(4-метилтіазол-5-іл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=458 [M+H]<sup>+</sup>

Rf-значення: 0,14 (силікагель, естер оцтової кислоти/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 7:3:0,1)

(84) 1-метил-3-(2-диметиламіно-етил)-7-бензил-8-(3-амінопіперидин-1-іл)-ксантин

Rf-значення: 0,18 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 9:1:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=426 [M+H]<sup>+</sup>

(85) 1-ціанометил-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,33 (силікагель, естер оцтової кислоти/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 7:3:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=372 [M+H]<sup>+</sup>

(86) 1-[2-(3-метоксифеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Температура плавлення: 118,5-119,5°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=467 [M+H]<sup>+</sup>

(87) 1-[2-(3-бромфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Температура плавлення: 116,5-117,5°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=515, 517 [M+H]<sup>+</sup>

(88) 1-[2-(3-хлорфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,21 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 9:1:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=471, 473 [M+H]<sup>+</sup>

(89) 1,3-диметил-7-((E)-1-гексен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=361 [M+H]<sup>+</sup>

(90) 1-((E)-2-фенілвініл)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,11 (силікагель, естер оцтової кислоти/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 7:3:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=435 [M+H]<sup>+</sup>

(91) 1-[2-(2-хлорфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,25 (силікагель, естер оцтової кислоти/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 7:3:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=471, 473 [M+H]<sup>+</sup>

(92) 1,3-диметил-7-((E)-2-фенілвініл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=381 [M+H]<sup>+</sup>

(93) 1-[2-(2-метоксифеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,15 (силікагель, естер оцтової кислоти/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 7:3:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=467 [M+H]<sup>+</sup>

(94) 1-[2-(2-трифторметилфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,16 (силікагель, естер оцтової кислоти/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 7:3:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=505 [M+H]<sup>+</sup>

(95) 1-[2-(2-бромфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,15 (силікагель, естер оцтової кислоти/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 7:3:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=515, 517 [M+H]<sup>+</sup>

(96) 1-(2-фенілетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(піперазин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=423 [M+H]<sup>+</sup>

(97) 1-(2-фенілетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(гомопіперазин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=437 [M+H]<sup>+</sup>

(98) 1-[2-(3-фторфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Температура плавлення: 126,8-127,5°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=455 [M+H]<sup>+</sup>

(99) 1-[2-(3-нітрофеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Температура плавлення: 120,8-122°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=482 [M+H]<sup>+</sup>

(100) 1-[2-(4-метилфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Температура плавлення: 129-130,2°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=451 [M+H]<sup>+</sup>

(101) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінометилпіролідин-1-іл)ксантин  
Rf-значення: 0,50 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=347 [M+H]<sup>+</sup>

(102) 1,3-диметил-7-[(тіофен-3-іл)-метил]-8-(піперазин-1-іл)ксантин  
(Здійснення у тетрагідрофурані при температурі 60°C)

Rf-значення: 0,14 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 9:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=361 [M+H]<sup>+</sup>

(103) 1,3-диметил-7-[(тіофен-2-іл)-метил]-8-(піперазин-1-іл)ксантин  
(Здійснення в тетрагідрофурані при температурі 60°C)

Rf-значення: 0,19 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 9:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=361 [M+H]<sup>+</sup>

(104) 1,3-диметил-7-[(фуран-3-іл)-метил]-8-(піперазин-1-іл)ксантин  
(Здійснення в тетрагідрофурані при температурі 60°C)

Rf-значення: 0,13 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 9:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=345 [M+H]<sup>+</sup>

(105) 1,3-диметил-7-[(фуран-2-іл)-метил]-8-(піперазин-1-іл)ксантин  
(Здійснення в тетрагідрофурані при температурі 60°C)

Rf-значення: 0,13 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 9:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=345 [M+H]<sup>+</sup>

(106) 1,3-диметил-7-(2-пропін-1-іл)-8-(піперазин-1-іл)ксантин  
(Здійснення в тетрагідрофурані при температурі 60°C)

Rf-значення: 0,16 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 9:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=303 [M+H]<sup>+</sup>

(107) 1,3-диметил-7-(2,3-диметил-2-бутен-1-іл)-8-(піперазин-1-іл)ксантин  
(Здійснення в тетрагідрофурані при температурі 60°C)

Rf-значення: 0,24 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 9:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=347 [M+H]<sup>+</sup>

(108) 1,3-диметил-7-((E)-2-метил-2-бутен-1-іл)-8-(піперазин-1-іл)ксантин  
(Здійснення в тетрагідрофурані при температурі 60°C)

Rf-значення: 0,27 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 9:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=333 [M+H]<sup>+</sup>

(109) 1,3-диметил-7-[(1-циклогексен-1-іл)метил]-8-(піперазин-1-іл)ксантин  
(Здійснення в тетрагідрофурані при температурі 60°C)

Rf-значення: 0,17 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 9:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=359 [M+H]<sup>+</sup>

(110) 1,3-диметил-7-[(1-циклопентен-1-іл)метил]-8-(піперазин-1-іл)ксантин  
(Здійснення у тетрагідрофурані при температурі 60°C)

Rf-значення: 0,19 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 9:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=345 [M+H]<sup>+</sup>

(111) 1,3-диметил-7-((2)-2-метил-2-бутен-1-іл)-8-(піперазин-1-іл)ксантин  
(Здійснення в тетрагідрофурані при температурі 60°C)

Rf-значення: 0,23 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 9:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=333 [M+H]<sup>+</sup>

(112) 1,3-диметил-7-((E)-2-гексен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=361 [M+H]<sup>+</sup>

(113) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-((5)-2-амінометилацетидин-1-іл)ксантин  
Rf-значення: 0,52 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=333 [M+H]<sup>+</sup>

(114) 1,3-диметил-7-((E)-1-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=333 [M+H]<sup>+</sup>

(115) 1,3,7-триметил-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
Здійснення в карбонаті калію в диметилформаміді  
Температура плавлення: 147°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=293 [M+H]<sup>+</sup>

(116) 1,3-диметил-7-(2-нафтил)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
Здійснення за допомогою карбонату калію в диметилформаміді

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=405 [M+H]<sup>+</sup>

(117) 1,3-диметил-7-феніл-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
Здійснення за допомогою карбонату калію в диметилформаміді

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=355 [M+H]<sup>+</sup>

(118) 1,3-диметил-7-(3, 5-диметилфеніл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
Здійснення за допомогою карбонату калію в диметилформаміді

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=383 [M+H]<sup>+</sup>

(119) 1,3-диметил-7-[(2-нафтил)метил]-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
Здійснення за допомогою карбонату калію в диметилформаміді

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=419 [M+H]<sup>+</sup>

(120) 1,3-диметил-7-[(1-нафтил)метил]-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
Здійснення за допомогою карбонату калію в диметилформаміді

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=419 [M+H]<sup>+</sup>

(121) 1,3-диметил-7-(2-ціанобензил)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
Здійснення за допомогою карбонату калію в диметилформаміді

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=394 [M+H]<sup>+</sup>

(122) 1,3-диметил-7-(4-метилфеніл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
Здійснення за допомогою карбонату калію в диметилформаміді

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=369 [M+H]<sup>+</sup>

(123) 1,3-диметил-7-(3-ціанобензил)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Здійснення за допомогою карбонату калію в диметилформаміді

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=394 [M+H]<sup>+</sup>

(124) 1,3-диметил-7-(3, 5-дифторбензил)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Здійснення за допомогою карбонату калію в диметилформаміді

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=405 [M+H]<sup>+</sup>

(125) 1,3-диметил-7-(4-ціанобензил)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Здійснення за допомогою карбонату калію в диметилформаміді

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=394 [M+H]<sup>+</sup>

(126) 1,3-диметил-7-(3-нітробензил)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Здійснення за допомогою карбонату калію в диметилформаміді

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=414 [M+H]<sup>+</sup>

(127) 1,3-диметил-7-(4-нітробензил)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Здійснення за допомогою карбонату калію в диметилформаміді

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=414 [M+H]<sup>+</sup>

(128) 1,3-диметил-7-(2-нітробензил)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Здійснення за допомогою карбонату калію в диметилформаміді

Мас-спектр (ESI<sup>-</sup>): m/z=414 [M+H]<sup>+</sup>

(129) 1,3-диметил-7-(3-трифторметилфеніл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Здійснення за допомогою карбонату калію в диметилформаміді

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=423 [M+H]<sup>+</sup>

(130) 1,3-диметил-7-(3-ціанофеніл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Здійснення за допомогою карбонату калію в диметилформаміді

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=380 [M+H]<sup>+</sup>

(131) 1-(2-фенілпропіл)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Здійснення за допомогою карбонату калію в диметилформаміді

Rf-значення: 0,50 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 80:20:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=451 [M+H]<sup>+</sup>

(132) 1,3-диметил-7-(3-фторфеніл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Здійснення за допомогою карбонату калію в диметилформаміді

Rf-значення: 0,10 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 9:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=373 [M+H]<sup>+</sup>

(133) 1-(2-метокси-2-фенілетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Здійснення за допомогою карбонату калію в диметилформаміді

Rf-значення: 0,20 (силікагель, естер оцтової кислоти/метанол = 8:2)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=467 [M+H]<sup>+</sup>

(134) 1,3-Диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(2-аміно-2-метилпропіламіно)ксантин

Здійснення за допомогою карбонату калію в диметилформаміді

Температура плавлення: 140,5-143°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=335 [M+H]<sup>+</sup>

(135) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-((R)-2-амінопропіламіно)ксантин

Здійснення за допомогою карбонату калію в диметилсульфоксиді

Температура плавлення: 141-144°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=321 [M+H]<sup>+</sup>

(136) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-((S)-2-амінопропіламіно)ксантин

Здійснення за допомогою калій-трет.-бутилату та карбонату натрію в диметилсульфоксиді

Температура плавлення: 142-145°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=321 [M+H]<sup>+</sup>

(137) 1,3-диметил-7-(2-ціанобензил)-8-(гомопіперазин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=394 [M+H]<sup>+</sup>

Rf-значення: 0,10 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 9:1)

(138) 1,3-диметил-7-(2-йодбензил)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=495 [M+H]<sup>+</sup>

(139) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-аміно-3-(піролідин-1-ілкарбоніл)піперидин-1-іл]ксантин

Здійснення в присутності карбонату натрію в диметилсульфоксиді

Температура плавлення: 159-160°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=444 [M+H]<sup>+</sup>

(140) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-аміно-4-гідроксипіперидин-1-іл)ксантин

Здійснення в присутності карбонату натрію в диметилсульфоксиді

Rf-значення: 0,64 (Reversed Phase DC-готова пластина (E. Merck), ацетонітрил/вода/трифтороцтова кислота = 50:50:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=63 [M+H]<sup>+</sup>

Приклад 2

(R)-1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

До 980мг (R)-1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[3-(трет.-

бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантину в 12мл метиленхлориду додають 3мл трифтороцтової кислоти та перемішують протягом 2 годин при кімнатній температурі. Потім розводять метиленхлоридом та 1М натрієвим лугом. Органічну фазу відокремлюють, висушують та концентрують.

Вихід : 680мг (89 % від теоретичного)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=347 [M+H]<sup>+</sup>

Rf-значення: 0,20 (оксид алюмінію, естер оцтової кислоти/метанол = 9:1)

Аналогічно до прикладу 2 одержують такі сполуки:

(1) (S)-1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=347 [M+H]<sup>+</sup>

(2) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-аміногексагідроацепін-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=361 [M+H]<sup>+</sup>

(3) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(4-аміногексагідроацепін-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=361 [M+H]<sup>+</sup>

(4) гідрохлорид 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(ціс-3-аміноциклогексил)ксантину

Реакція здійснюється за допомогою соляної кислоти

1H-ЯМР (400МГц, 6мг в 0,5мл DMSO-d<sub>6</sub>, 30 С): характерні сигнали при 3,03ppm (1H, m, H-1) та 3,15ppm (1H, m, H-3)

(5) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопропіл)ксантин

Реакція здійснюється за допомогою соляної кислоти

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=306 [M+H]<sup>+</sup>

(6) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-аміно-4-метилпіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=361 [M+H]<sup>+</sup>

(7) 1-метил-3-(4-метоксибензил)-7-бензил-8-((S)-3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=475 [M+H]<sup>+</sup>

Rf-значення : 0,38 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. воний розчин аміаку = 9:1:0,1)

(8) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[N-(2-аміноетил)-N-етиламіно]ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=335 [M+H]<sup>+</sup>

(9) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(піперидин-4-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=332 [M+H]<sup>+</sup>

(10) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(транс-2-аміноциклогексил)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=346 [M+H]<sup>+</sup>

(11) 1-метил-3-гексил-7-бензил-8-((S)-3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,18 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 9:1:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=439 [M+H]<sup>+</sup>

(12) 1-метил-3-(2-гідроксиетил)-7-бензил-8-((S)-3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,19 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 9:1:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=399 [M+H]<sup>+</sup>

(13) 1-(2-фенілетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-((S)-3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=437 [M+H]<sup>+</sup>

(14) 1-(2-фенілетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-((R)-3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=437 [M+H]<sup>+</sup>

(15) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[2-(амінометил)піперидин-1-іл]ксантин

Rf-значення: 0,34 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 9:1:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=361 [M+H]<sup>+</sup>

(16) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[[піролідин-3-іл)аміно]ксантин

Здійснення за допомогою соляної кислоти в діоксані

Rf-значення: 0,15 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 9:1:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=333 [M+H]<sup>+</sup>

(17) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[N-(піперидин-3-іл)-N-метиламіно]ксантин

Rf-значення: 0,44 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 9:1:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=361 [M+H]<sup>+</sup>

(18) 1-[2-(4-гідроксифеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-((S)-3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Здійснення в тетрагідрофурані/воді при температурі 50-80°C

Rf-значення: 0,58 (Reversed Phase DC-готова пластина (E. Merck), ацетонітрил/вода/трифтороцтова кислота = 50:50:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=453 [M+H]<sup>+</sup>

(19) 1-[(метоксикарбоніл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-((S)-3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Температура плавлення: 102-105°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=405 [M+H]<sup>+</sup>

(20) 1-[3-(метоксикарбоніл)пропіл]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-((S)-3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,15 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 9:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=433 [M+H]<sup>+</sup>

(21) 1-[2-[4-(етоксикарбоніл)феніл]етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-((S)-3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Температура плавлення: 142-144°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=509 [M+H]<sup>+</sup>

(22) 1-[2-(3-гідроксифеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-((S)-3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Здійснення в тетрагідрофурані/воді при температурі 80°C

Температура плавлення: 168-170°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=453 [M+H]<sup>+</sup>

(23) 1-[2-(метоксикарбоніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-((S)-3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,26 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 9:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=419 [M+H]<sup>+</sup>

(24) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[[піперидин-4-іл)аміно]ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=347 [M+H]<sup>+</sup>

Rf-значення: 0,25 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 9:1:0,1)

(25) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[[піперидин-3-іл)аміно]ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=347 [M+H]<sup>+</sup>

Rf-значення: 0,13 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 9:1)

(26) 1-феніл-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=395 [M+H]<sup>+</sup>

(27) 1-феніл-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,70 (оксид алюмінію, метиленхлорид/метанол = 19:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=409 [M+H]<sup>+</sup>

(28) 1-(2-феніл-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,16 (силікагель, естер оцтової кислоти/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 7:3:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=451 [M+H]<sup>+</sup>

(29) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[N-(піролідин-3-іл)-N-метиламіно]ксантин

Rf-значення: 0,43 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=347 [M+H]<sup>+</sup>

(30) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-аміноциклогексил)ксантин (Відповідно до ЯМР-спектру цис/транс-суміш = 65:35)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=346 [M+H]<sup>+</sup>

(31) 1,3-біс-(2-фенілетил)-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,33 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=527 [M+H]<sup>+</sup>

(32) 1-(2-фенілетил)-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=423 [M+H]<sup>+</sup>

(33) 1-(2-фенілетил)-3-ціанометил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,31 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=462 [M+H]<sup>+</sup>

(34) 1-(2-фенілетил)-3-[(метоксикарбоніл)метил]-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=495 [M+H]<sup>+</sup>

(35) 1-[2-(2-нітрофеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,25 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=482 [M+H]<sup>+</sup>

(36) 1-[2-(3,5-дифторфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Температура плавлення: 162-163,5°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=473 [M+H]<sup>+</sup>

(37) 1-[2-(2-метоксифеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=481 [M+H]<sup>+</sup>

(38) 1-[2-(тіофен-3-іл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=457 [M+H]<sup>+</sup>

(39) 1-[2-(2,6-дифторфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,35 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=473 [M+H]<sup>+</sup>

(40) 1-[2-(4-метоксифеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=481 [M+H]<sup>+</sup>

(41) 1-(2-фенілетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-((S)-3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=451 [M+H]<sup>+</sup>

(42) 1-(2-фенілетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-((R)-3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=451 [M+H]<sup>+</sup>

(43) 1-[2-(3,5-диметилфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,15 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=465 [M+H]<sup>+</sup>

(44) 1-(фенілсульфанілметил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,40 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=455 [M+H]<sup>+</sup>

(45) 1-(фенілсульфонілметил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,42 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=471 [M+H]<sup>+</sup>

(46) 1,3-диметил-7-{3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(ціс-2-аміноциклопропіламіно)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=319 [M+H]<sup>+</sup>

Rf-значення: 0,55 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:0,1)

(47) 1-[2-(3-метоксифеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,14 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=481 [M+H]<sup>+</sup>

(48) 1-[2-(4-метилфеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,35 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=465 [M+H]<sup>+</sup>

(49) 1-(2-метоксикарбоніл-2-пропен-1-іл)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,30 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=431 [M+H]<sup>+</sup>

(50) 1-(2-фенілетил)-3-(2-диметиламіноетил)-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,15 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=494 [M+H]<sup>+</sup>

(51) 1-(2-фенілетил)-3-(2-пропін-1-іл)-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,71 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 80:20:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=461 [M+H]<sup>+</sup>

(52) 1-(2-фенілетил)-3-((E)-2-фенілвініл)-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,27 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=525 [M+H]<sup>+</sup>

(53) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(піперидин-3-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=332 [M+H]<sup>+</sup>

(54) 1-(2-фенілетил)-3-вініл-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,26 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=449 [M+H]<sup>+</sup>

(55) 1-(3-оксо-3-фенілпропіл)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=465 [M+H]<sup>+</sup>

(56) 1-метил-3-(2-феніл-2-оксоетил)-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,30 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=451 [M+H]<sup>+</sup>

(57) 1-метил-3-ціанометил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,23 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=372 [M+H]<sup>+</sup>

(58) 1-метил-3-(2-фенілетил)-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,20 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=437 [M+H]<sup>+</sup>

(59) 1-метил-3-(2-диметиламіноетил)-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,14 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 80:20:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=404 [M+H]<sup>+</sup>

(60) 1-метил-3-ізопропіл-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Температура плавлення: 115-117°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=375 [M+H]<sup>+</sup>

(61) 1-(2-гідрокси-2-фенілетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,20 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=453 [M+H]<sup>+</sup>

(62) 1-метил-3-(2-ціаноетил)-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Температура плавлення: 146-149°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=386 [M+H]<sup>+</sup>

(63) 1-метил-3-[2-(4-метоксифеніл)етил]-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,34 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ЕВГ): m/z=467 [M+H]<sup>+</sup>

(64) 1-метил-3-феніл-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,38 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=409 [M+H]<sup>+</sup>

(65) 1-метил-3-[2-(3-метоксифеніл)етил]-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,35 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=467 [M+H]<sup>+</sup>

(66) 1-метил-3-[2-(2-метоксифеніл)етил]-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,31 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=467 [M+H]<sup>+</sup>

(67) 1-метил-3-[2-(3-метилфеніл)етил]-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,13 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=451 [M+H]<sup>+</sup>

(68) 1-метил-3-[2-(4-метилфеніл)етил]-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,16 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 95:5:1) концентр. водний розчин аміаку

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=451 [M+H]<sup>+</sup>

(69) 1-метил-3-[2-(2-метилфеніл)етил]-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,16 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 95:5:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=451 [M+H]<sup>+</sup>

(70) 1-метил-3-[2-(2-фторфеніл)етил]-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,35 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=455 [M+H]<sup>+</sup>

(71) 1-(2-оксопропіл)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин х трифтороцтова кислота

(Продукт ізолюють як трифторацетат)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=389 [M+H]<sup>+</sup>

(72) 1-метил-3-(4-фенілбутил)-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,36 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=465 [M+H]<sup>+</sup>

(73) 1-метил-3-(3-фенілпропіл)-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,33 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=451 [M+H]<sup>+</sup>

## 125

(74) 1-(2-феніл-2-оксоетил)-3-метил-7-(2-ціанобензил)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=498 [M+H]<sup>+</sup>

(75) 1-(2-фенілетил)-3-метил-7-(2-ціанобензил)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=484 [M+H]<sup>+</sup>

(76) 1-(3-метоксикарбоніл-2-пропен-1-іл)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,35 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 80:20:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=431 [M+H]<sup>+</sup>

(77) 1-метил-3-[2-(4-фторфеніл)етил]-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,28 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=455 [M+H]<sup>+</sup>

(78) 1-метил-3-[2-(3-фторфеніл)етил]-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,35 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=455 [M+H]<sup>+</sup>

(79) 1-[2-(2,5-диметоксифеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,29 (силікагель, естер оцтової кислоти/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 70:30:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=511 [M+H]<sup>+</sup>

(80) 1-[2-(4-фторфеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,35 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 80:20:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=469 [M+H]<sup>+</sup>

(81) 1-фенілкарбоніламіно-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

(Забруднений 1-фенілкарбоніламіно-7-(3-метилбутіл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантином)

Rf-значення: 0,26 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 80:20:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=438 [M+H]<sup>+</sup>

(82) 1-аміно-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

(Забруднений 1-аміно-7-(3-метилбутіл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантином)

Rf-значення: 0,22 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 80:20:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=334 [M+H]<sup>+</sup>

(83) 1-[2-(3-метансульфонілоксифеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=545 [M+H]<sup>+</sup>

(84) 1-[2-(3-алілоксифеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=507 [M+H]<sup>+</sup>

## 76982

(85) 1-{2-оксо-2-[3-(2-пропін-1-ілокси)феніл]етил}-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=505 [M+H]<sup>+</sup>

(86) 1-(3-метоксикарбоніл-2-пропен-1-іл)-3-метил-7-(2-ціанобензил)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=478 [M+H]<sup>+</sup>

(87) 1-(2-{3-[(метоксикарбоніл)метокси]феніл}-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=539 [M+H]<sup>+</sup>

(88) 1-[2-(3-ціанометоксифеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=506 [M+H]<sup>+</sup>

(89) 1-[2-(3-бензилоксифеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=557 [M+H]<sup>+</sup>

(90) 1-[2-(3-фенілсульфонілоксифеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=607 [M+H]<sup>+</sup>

(91) 1-[2-(3-гідроксифеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=467 [M+H]<sup>+</sup>

(92) 1-[(піридин-2-іл)метил]-3-метил-7-(2-ціанобензил)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,20 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=471 [M+H]<sup>+</sup>

(93) 1-[2-(3-фенілоксифеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=543 [M+H]<sup>+</sup>

(94) 1-(2-феніл-2-оксоетил)-3-[(метоксикарбоніл)метил]-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,29 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=509 [M+H]<sup>+</sup>

(95) 1-(2-феніл-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(піперазин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,10 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 90:10)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=437 [M+H]<sup>+</sup>

(96) 1-[2-(3-амінофеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,25 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 80:20:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=466 [M+H]<sup>+</sup>

(97) 1-(2-{3-[бис(метансульфоніл)аміно]феніл}-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,45 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 80:20:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=622 [M+H]<sup>+</sup>

## 126

(98) 1-[2-(2-бром-5-диметиламінофеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=572, 574 [M+H]<sup>+</sup>

(99) 1-[2-(3-нітрофеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=496 [M+H]<sup>+</sup>

(100) 1-[2-(3-метоксикарбоніламінофеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=524 [M+H]<sup>+</sup>

(101) 1-[2-(3-ацетиламінофеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=508 [M+H]<sup>+</sup>

(102) 1-[2-(3-{{(етоксикарбоніламіно)карбоніл}аміно}феніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=581 [M+H]<sup>+</sup>

(103) 1-(2-феніл-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(гомопіперазин-1-іл)ксантин  
Rf-значення: 0,10 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 90:10)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=451 [M+H]<sup>+</sup>

(104) 1-[2-(3-ціанометиламінофеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,35 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 80:20:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=505 [M+H]<sup>+</sup>

(105) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(4-амінометилпіперидин-1-іл)ксантин

Здійснення за допомогою ізопропанолової соляної кислоти (5-6M) в метиленхлориді

Температура плавлення: 110-112°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z= 61 [M+H]<sup>+</sup>

(106) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінометилпіперидин-1-іл)ксантин

Здійснення за допомогою ізопропанолової соляної кислоти (5-6M) в метиленхлориді Rf-значення: 0,48 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=361 [M+H]<sup>+</sup>

(107) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(транс-2-аміноциклобутиламіно)ксантин

Здійснення за допомогою ізопропанолової соляної кислоти (5-6M) в метиленхлориді

Rf-значення: 0,65 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=333 [M+H]<sup>+</sup>

(108) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[N-((S)-2-аміно-1-метилетил)-N-метиламіно]ксантин

Здійснення за допомогою ізопропанолової соляної кислоти (5-6M) в метиленхлориді

Температура плавлення: 109,5-113°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=335 [M+H]<sup>+</sup>

(109) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[N-((S)-2-аміно-1-метилетил)-N-метиламіно]ксантин за допомогою ізопропанолової соляної кислоти (5-6M) в метиленхлориді

Здійснення за допомогою ізопропанолової соляної кислоти (5-6M) в метиленхлориді

Rf-значення: 0,50 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=335 [M+H]<sup>+</sup>

(110) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[ціс-N-(2-аміноциклогексил)-N-метиламіно]ксантин

Здійснення за допомогою ізопропанолової соляної кислоти (5-6M) в метиленхлориді

Rf-значення: 0,71 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=375 [M+H]<sup>+</sup>

(111) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(6-аміно-[1,4]діацепа-1-іл)ксантин

Здійснення за допомогою ізопропанолової соляної кислоти (5-6M) в метиленхлориді

Rf-значення: 0,41 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=362 [M+H]<sup>+</sup>

(112) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[N-(2-аміно-2-метилпропіл)-N-метиламіно]ксантин

Здійснення за допомогою ізопропанолової соляної кислоти (5-6M) в метиленхлориді

Температура плавлення: 156,5-159,5°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=349 [M+H]<sup>+</sup>

(113) 1-[(піридин-2-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Здійснення за допомогою ізопропанолової соляної кислоти (5-6M) в метиленхлориді

Температура плавлення: 136-139,5°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=424 [M+H]<sup>+</sup>

(114) 1-[(тіазол-2-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Здійснення за допомогою ізопропанолової соляної кислоти (5-6M) в метиленхлориді

Температура плавлення: 124-127°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=430 [M+H]<sup>+</sup>

(115) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(транс-2-аміноциклопентиламіно)ксантин

Здійснення за допомогою ізопропанолової соляної кислоти (5-6M) в метиленхлориді

Rf-значення: 0,25 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 95:5:0,)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=347 [M+H]<sup>+</sup>

(116) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(транс-3-аміноциклогексиламіно)ксантин (приблизно 25% ціс-сполуки забруднено)

Здійснення за допомогою ізопропанолової соляної кислоти (5-6M) в метиленхлориді

Rf-значення: 0,16 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=359 [M+H]<sup>+</sup>

(117) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(ціс-3-аміноциклогексиламіно)ксантин (приблизно 21% транс-сполуки забруднено)

Здійснення за допомогою ізопропанолової соляної кислоти (5-6M) в метиленхлориді



Rf-значення: 0,21 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI):  $m/z=359$  [M-H]<sup>-</sup>

(118) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(ціс-2-аміноциклопентиламіно)ксантин

Здійснення за допомогою ізопропанолової соляної кислоти (5-6M) в метиленхлориді

Rf-значення: 0,25 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 95:5:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=347$  [M+H]<sup>+</sup>

(119) 1-[(ізохінолін-1-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Здійснення за допомогою ізопропанолової соляної кислоти (5-6M) в метиленхлориді

Температура плавлення: 146-149°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=474$  [M+H]<sup>+</sup>

(120) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(ціс-3-аміноциклопентиламіно)ксантин

Здійснення за допомогою ізопропанолової соляної кислоти (5-6M) в метиленхлориді

Температура плавлення: 146-148°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=347$  [M+H]<sup>+</sup>

(121) 1-[(бензо[о]ізотіазол-3-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Здійснення за допомогою ізопропанолової соляної кислоти (5-6M) в метиленхлориді

Температура плавлення: 129-131°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=480$  [M+H]<sup>+</sup>

(122) 1-[(піридин-3-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Здійснення за допомогою ізопропанолової соляної кислоти (5-6M) в метиленхлориді

Rf-значення: 0,42 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=424$  [M+H]<sup>+</sup>

(123) 1-[(піридин-4-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Здійснення за допомогою ізопропанолової соляної кислоти (5-6M) в метиленхлориді

Rf-значення: 0,48 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=424$  [M+H]<sup>+</sup>

(124) 1-[(ізоксазол-3-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Здійснення за допомогою ізопропанолової соляної кислоти (5-6M) в метиленхлориді

Температура плавлення: 124-127,5°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=414$  [M+H]<sup>+</sup>

(125) 1-[(ізохінолін-1-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-((R)-3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Здійснення за допомогою ізопропанолової соляної кислоти (5-6M) в метиленхлориді

Rf-значення: 0,50 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=474$  [M+H]<sup>+</sup>

(126) 1-[(ізохінолін-1-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-((S)-3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Здійснення за допомогою ізопропанолової соляної кислоти (5-6M) в метиленхлориді

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=474$  [M+H]<sup>+</sup>

(127) 1-[(1-нафтил)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Здійснення за допомогою ізопропанолової соляної кислоти (5-6M) в метиленхлориді

Rf-значення: 0,51 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=473$  [M+H]<sup>+</sup>

(128) 1-[(бензо[d]ізоксазол-3-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,20 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 9:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=464$  [M+H]<sup>+</sup>

(129) 1-(2-феніл-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-аміно-3-метилпіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,18 (силікагель, естер оцтової кислоти/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=465$  [M+H]<sup>+</sup>

(130) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-аміно-3-метилпіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,41 (оксид алюмінію, метиленхлорид/метанол = 20:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=361$  [M+H]<sup>+</sup>

(131) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[N-(2-аміно-3-диметиламіно-3-оксопропіл)-N-метиламіно]ксантин х трифтороцтова кислота

Rf-значення: 0,31 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 40:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=392$  [M+H]<sup>+</sup>

(132) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[N-(2,3-діаміно-3-оксопропіл)-N-метиламіно]ксантин х трифтороцтова кислота

Rf-значення: 0,28 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 40:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=364$  [M+H]<sup>+</sup>

(133) 1-[(амінокарбоніл)метил]-3-метил-7-(2-ціанобензил)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Одержують з 1-ціанометил-3-метил-7-(2-ціанобензил)-8-[3-(трет.-бутилоксикарбоніламіно)піперидин-1-іл]ксантину. При обробці трифтороцтовою кислотою відокремлюють захисну групу, а ціаногрупу гідролізують до утворення амідів.

Rf-значення: 0,10 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=437$  [M+H]<sup>+</sup>

(134) 1-[2-(3-метансульфоніламінофеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>):  $m/z=544$  [M+H]<sup>+</sup>

Rf-значення: 0,45 (силікагель, метиленхлорид/метанол/триетиламін = 90:10:0,1)

(135) 1-[2-(2-нітрофеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=496 [M+H]<sup>+</sup>

(136) 1-[2-{2-амінофеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=466 [M+H]<sup>+</sup>

(137) 1-(2-{3-[(метиламіно)тіокарбоніламіно]феніл-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,30 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 80:20:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=539 [M+H]<sup>+</sup>

(138) 1-[2-(2-ацетиламінофеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=508 [M+H]<sup>+</sup>

(139) 1-[(6-метилпіридин-2-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Здійснення за допомогою ізопропанолової соляної кислоти (5-6M) в метиленхлориді

Температура плавлення: 127,5-130°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=438 [M+H]<sup>+</sup>

(140) 1-[(ізохінолін-4-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Здійснення за допомогою ізопропанолової соляної кислоти (5-6M) в метиленхлориді

Rf-значення: 0,40 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=474 [M+H]<sup>+</sup>

(141) 1-[(1-метил-1H-індазол-3-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Здійснення за допомогою ізопропанолової соляної кислоти (5-6M) в метиленхлориді

Rf-значення: 0,31 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=477 [M+H]<sup>+</sup>

(142) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-{N-[2-аміно-3-оксо-3-(піролідин-1-іл)пропіл]-N-метиламіно}ксантин

Температура плавлення: 138°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=418 [M+H]<sup>+</sup>

(143) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[N-(2-аміно-3-метиламіно-3-оксопропіл)-N-метиламіно]ксантин

Rf-значення: 0,20 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=378 [M+H]<sup>+</sup>

(144) 1-(2-{3-[(метоксикарбоніл)метиламіно]феніл}-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,29 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 80:20:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=538 [M+H]<sup>+</sup>

(145) 1-ціанометил-3-метил-7-(2-ціанобензил)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Здійснення за допомогою ізопропанолової соляної кислоти (5-6M) в метиленхлориді

Rf-значення: 0,60 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 9:2)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=419 [M+H]<sup>+</sup>

(146) 1-[2-(2-гідроксифеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин х трифтороцтова кислота

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=467 [M+H]<sup>+</sup>

(147) 1-[2-{2-метансульфонілоксифеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=545 [M+H]<sup>+</sup>

(148) 1-(2-{2-[(метоксикарбоніл)метокси]феніл}-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=539 [M+H]<sup>+</sup>

(149) 1-[2-(2-ціанометоксибензил)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=506 [M+H]<sup>+</sup>

(150) 1-(2-{3-[(диметиламінокарбоніл)метокси]феніл}-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,45 (силікагель, метиленхлорид/метанол/триетиламін = 80:20:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=552 [M+H]<sup>+</sup>

(151) 1-(2-{3-[(метиламінокарбоніл)метокси]феніл}-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,55 (силікагель, метиленхлорид/метанол/триетиламін = 80:20:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=538 [M+H]<sup>+</sup>

(152) 1-(2-{3-[(амінокарбоніл)метокси]феніл}-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=524 [M+H]<sup>+</sup>

(153) 1-(2-{2-[біс(метансульфоніл)аміно]феніл}-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=622 [M+H]<sup>+</sup>

(154) 1-метил-3-[2-(4-метоксибензил)етил]-7-(2-ціанобензил)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,35 (силікагель, метиленхлорид/метанол = 9:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=514 [M+H]<sup>+</sup>

(155) 1-метил-3-(2-фенілетил)-7-(2-ціанобензил)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=484 [M+H]<sup>+</sup>

(156) 1-(2-{3-[(амінокарбоніл)аміно]феніл}-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=509 [M+H]<sup>+</sup>

(157) 1-(2-{3-[(диметиламінокарбоніл)аміно]феніл}-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=537 [M+H]<sup>+</sup>

(158) 1-метил-3-((Е)-2-фенілвініл)-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
Rf-значення: 0,49 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=435 [M+H]<sup>+</sup>

(159) 1-(4-оксо-4Н-хромен-3-іл)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин х трифтороцтова кислота

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=477 [M+H]<sup>+</sup>

(160) 1-[(3-метилпіридин-2-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Здійснення за допомогою ізопропанолової соляної кислоти (5-6М) в метиленхлориді

Rf-значення: 0,54 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=438 [M+H]<sup>+</sup>

(161) 1-[(5-метилпіридин-2-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Здійснення за допомогою ізопропанолової соляної кислоти (5-6М) в метиленхлориді

Rf-значення: 0,35 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=438 [M+H]<sup>+</sup>

(162) 1-[(4-метилпіридин-2-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Здійснення за допомогою ізопропанолової соляної кислоти (5-6М) в метиленхлориді

Rf-значення: 0,39 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=438 [M+H]<sup>+</sup>

(163) 1-[(хінолін-4-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Здійснення за допомогою ізопропанолової соляної кислоти (5-6М) в метиленхлориді

Rf-значення: 0,53 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=474 [M+H]<sup>+</sup>

(164) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(ендо-6-аміно-2-азабіцикло[2.2.2]окт-2-ил)ксантин

Здійснення за допомогою ізопропанолової соляної кислоти (5-6М) в метиленхлориді

Температура плавлення: 174-179°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=373 [M+H]<sup>+</sup>

(165) 1-[(хінолін-8-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Здійснення за допомогою ізопропанолової соляної кислоти (5-6М) в метиленхлориді

Температура плавлення: 175-177°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=474 [M+H]<sup>+</sup>

(166) 1-[(5-нітроізохінолін-1-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Здійснення за допомогою ізопропанолової соляної кислоти (5-6М) в метиленхлориді

Rf-значення: 0,47 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=519 [M+H]<sup>+</sup>

(167) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(екзо-6-аміно-2-азабіцикло[2.2.2]окт-2-ил)ксантин

Здійснення за допомогою ізопропанолової соляної кислоти (5-6М) в метиленхлориді

Rf-значення: 0,23 (силікагель ; метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 95:5:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=373 [M+H]<sup>+</sup>

(168) 1-[(2-оксо-1,2-дигідрохінолін-4-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Здійснення за допомогою ізопропанолової соляної кислоти (5-6М) в метиленхлориді

Rf-значення: 0,43 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=490 [M+H]<sup>+</sup>

(169) 1-[(5-аміноізохінолін-1-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Здійснення за допомогою ізопропанолової соляної кислоти (5-6М) в метиленхлориді

Rf-значення: 0,39 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=489 [M+H]<sup>+</sup>

(170) 1-[2-(3-ціанофеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,65 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=476 [M+H]<sup>+</sup>

(171) 1-[2-(3-аміносультонілфеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,24 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=530 [M+H]<sup>+</sup>

(172) 1-[2-(3-амінокарбонілфеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,10 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=494 [M+H]<sup>+</sup>

(173) 1-(2-феноксietил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=453 [M+H]<sup>+</sup>

(174) 1,3-диметил-2-тіоксо-7-бензил-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин х трифтороцтова кислота

Rf-значення: 0,50 (оксид алюмінію, метиленхлорид/метанол = 20:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=385 [M+H]<sup>+</sup>

Приклад 3

1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-метиламінопіпеоидин-1-іл)ксантин

До 154мг 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантину та 0,032мл водного розчину формальдегіду (37 масових про-

центів) у 0,5мл метанолу додають 24мг боргідриду натрію та перемішують при кімнатній температурі. Потім ще два рази додають по 0,01мл розчину формальдегіду та 10 мг боргідриду натрію та знову перемішують при кімнатній температурі. У реакційну суміш додають 1М натрієвий луг та неодноразово екстрагують естером оцтової кислоти. Органічну фазу об'єднують, висушують та концентрують. Залишок очищують за допомогою хроматографу, пропускаючи через колонну оксиду алюмінію, естером оцтової кислоти/метанолом.

Вихід: 160мг (25% від теоретичного)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=361 [M+H]<sup>+</sup>

Rf-значення: 0,80 (оксид алюмінію, естер оцтової кислоти/метанол = 4:1)

Аналогічно до прикладу 3 одержують такі сполуки:

(1) 1,3-диметил-7-(3-гіетил-2-бутен-1-іл)-8-(3-диметиламінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=375 [M+H]<sup>+</sup>

Rf-значення: 0,65 (оксид алюмінію, метиленхлорид/метанол = 100:1)

Приклад 4

(S)-1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-[(2-ціанпіролідин-1-іл)карбонілметил]аміно)піперидин-1-іл)ксантин

Одержують внаслідок взаємодії сполуки з прикладу 1 (4) з (S)-1-(бромацетил)-2-ціанопіролідіном в тетрагідрофурані в присутності триетиламіну при кімнатній температурі

Температура кипіння: 67-68°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=505 [M+Na]<sup>+</sup>

Приклад 5

1-метил-7-бензил-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Одержують шляхом обробки 1-метил-3-{2-триметилсиланілетоксиметил}-7-бензил-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантину трифтороцтовою кислотою в метиленхлориді при кімнатній температурі

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=355 [M+H]<sup>+</sup>

Приклад 6

1-метил-3-карбоксиметил-7-бензил-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Одержують шляхом обробки 1-метил-3-[(метоксикарбоніл)метил]-7-бензил-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантину 1N натрієвим лугом в метанолі

Температура плавлення: 212-215°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=413 [M+H]<sup>+</sup>

Аналогічно до прикладу 6 одержують такі сполуки:

(1) 1-карбоксиметил-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-((S)-3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,54 (Reversed Phase DC-готова пластинка (E. Merck), ацетонітрил/вода/трифтороцтова кислота = 50:50:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=391 [M+H]<sup>+</sup>

(2) 1-(3-карбоксипропіл)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-((S)-3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,42 (Reversed Phase DC-готова пластинка (E. Merck), ацетонітрил/вода/трифтороцтова кислота = 50:50:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=419 [M+H]<sup>+</sup>

(3) 1-[2-(4-карбоксифеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-((S)-3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,42 (Reversed Phase DC-готова пластинка (E. Merck), ацетонітрил/вода/трифтороцтова кислота = 50:50:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=481 [M+H]<sup>+</sup>

(4) 1-(2-карбоксиетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-((S)-3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Температура плавлення: 226-228°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=405 [M+H]<sup>+</sup>

(5) 1-(2-фенілетил)-3-карбоксиметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Температура плавлення: 228-235°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=481 [M+H]<sup>+</sup>

Приклад 7

1-[2-(3-амінофеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Одержують внаслідок відновлення 1-[2-(3-нітрофеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин залізом в суміші з етанолу, води льодяної оцтової кислоти (10:5:1)

Rf-значення: 0,45 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 9:1:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=452 [M+H]<sup>+</sup>

Аналогічно до прикладу 7 одержують такі сполуки:

(1) 1-[2-(2-амінофеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,20 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 9:1:0,1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=452 [M+H]<sup>+</sup>

(2) 1,3-диметил-7-(3-амінобензил)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Rf-значення: 0,20 (силікагель, метиленхлорид/метанол/концентр. водний розчин аміаку = 90:10:1)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=384 [M+H]<sup>+</sup>

(3) 1,3-диметил-7-{2-амінобензил}-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=384 [M+H]<sup>+</sup>

Приклад 8

1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(1-амінопіперидин-4-іл)ксантин

Одержують шляхом обробки 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(1-нітрозопіперидин-4-іл)ксантину цинком у суміші з оцтової кислоти та води (1:1,5) при температурі 80°C

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=347 [M+H]<sup>+</sup>

Аналогічно до прикладу 8 одержують такі сполуки:

(1) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(1-амінопіперидин-3-іл)ксантин

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=347 [M+H]<sup>+</sup>

Приклад 9

1-(2-гідроксиіміно-2-фенілетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-((R)-3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Одержують внаслідок взаємодії 1-(2-феніл-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-((R)-3-амінопіперидин-1-іл)ксантину з гідрохлоридом

гідроксиламіну в присутності карбонату калію в етанолі при температурі 85°C

Rf-значення: 0,54 (Reversed Phase DC-готова пластинка (E. Merck), ацетонітрил/вода/трифтороцтова кислота = 10:10:0,2)

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=466 [M+H]<sup>+</sup>

Приклад 10

1-[2-(2-метансульфоніламінофеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

Одержують шляхом обробки 1-(2-{2-[бІс-(метансульфоніламіно)феніл]-2-оксоетил}-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантину 5N натрієвим лугом в тетрагідрофурані при кімнатній температурі

Мас-спектр (ESI<sup>+</sup>): m/z=544 [M+H]<sup>+</sup>

Аналогічно до зазначених вище прикладів та інших способів, відомих з літературних джерел, можна також одержувати такі сполуки:

- (1) 7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (2) 1-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (3) 3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (4) 1-етил-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (5) 1-пропіл-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (6) 1-(2-пропіл)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (7) 1-бутил-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (8) 1-(2-бутил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (9) 1-(2-метилпропіл)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (10) 1-(2-пропен-1-іл)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (11) 1-(2-пропін-1-іл)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (12) 1-циклопропілметил-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (13) 1-бензил-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (14) 1-(2-фенілетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (15) 1-(2-гідроксиетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (16) 1-(2-метоксиетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (17) 1-(2-етоксиетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (18) 1-[2-(диметиламіно)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (19) 1-[2-(діетиламіно)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (20) 1-[2-(піролідін-1-іл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (21) 1-[2-{піперидин-1-іл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

(22) 1-[2-(морфолін-4-іл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

(23) 1-[2-(піперазин-1-іл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

(24) 1-[2-(4-метилпіперазин-1-іл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

(25) 1-(3-гідроксипропіл)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

(26) 1-(3-метоксипропіл)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

(27) 1-(3-етоксипропіл)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

(28) 1-[3-(диметиламіно)пропіл]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

(29) 1-[3-(діетиламіно)пропіл]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

(30) 1-[3-(піролідін-1-іл)пропіл]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

(31) 1-[3-(піперидин-1-іл)пропіл]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

(32) 1-[3-(морфолін-4-іл)пропіл]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

(33) 1-[3-(піперазин-1-іл)пропіл]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

(34) 1-[3-(4-метилпіперазин-1-іл)пропіл]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

(35) 1-(карбоксиметил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

(36) 1-(метоксикарбонілметил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

(37) 1-(етоксикарбонілметил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

(38) 1-(2-карбоксиетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

(39) 1-[2-(метоксикарбоніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

(40) 1-[2-(етоксикарбоніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

(41) 1-(амінокарбонілметил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

(42) 1-(метиламінокарбонілметил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

(43) 1-(диметиламінокарбонілметил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

(44) 1-(піролідін-1-іл-карбонілметил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

- (73) 1-метил-3-[3-(диметиламіно)пропіл]-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (74) 1-метил-3-[3-(діетиламіно)пропіл]-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (75) 1-метил-3-[3-(піролідин-1-іл)пропіл]-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (76) 1-метил-3-[3-(піперидин-1-іл)пропіл]-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (77) 1-метил-3-[3-(морфолін-4-іл)пропіл]-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (78) 1-метил-3-[3-(піперазин-1-іл)пропіл]-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (79) 1-метил-3-[3-(4-метилпіперазин-1-іл)пропіл]-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (80) 1-метил-3-(карбоксиметил)-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (81) 1-метил-3-(метоксикарбонілметил)-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (82) 1-метил-3-(етсикарбонілметил)-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (83) 1-метил-3-(2-карбоксиетил)-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (84) 1-метил-3-[2-(метоксикарбоніл)етил]-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (85) 1-метил-3-[2-(етоксикарбоніл)етил]-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (86) 1-метил-3-(амінокарбонілметил)-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (87) 1-метил-3-(метиламінокарбонілметил)-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (88) 1-метил-3-(диметиламінокарбонілметил)-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (89) 1-метил-3-(піролідин-1-ілкарбонілметил)-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (90) 1-метил-3-(піперидин-1-ілкарбонілметил)-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (91) 1-метил-3-(морфолін-4-ілкарбонілметил)-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (92) 1-метил-3-(ціанметил)-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (93) 1-метил-3-(2-ціанетил)-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (94) 1,3,7-триметил-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (95) 1,3-диметил-7-етил-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (96) 1,3-диметил-7-пропіл-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

- (129) 1,3-диметил-7-(2-пропін-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(130) 1,3-диметил-7-(3-бутин-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(131) 1,3-диметил-7-(4-фторбензил)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(132) 1,3-диметил-7-(2-хлорбензил)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(133) 1,3-диметил-7-(3-хлорбензил)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(134) 1,3-диметил-7-(4-хлорбензил)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(135) 1,3-диметил-7-(2-бромбензил)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(136) 1,3-диметил-7-(3-бромбензил)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(137) 1,3-диметил-7-(4-бромбензил)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(138) 1,3-диметил-7-(2-метилбензил)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(139) 1,3-диметил-7-(3-метилбензил)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(140) 1,3-диметил-7-(4-метилбензил)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(141) 1,3-диметил-7-(2-метоксибензил)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(142) 1,3-диметил-7-(3-метоксибензил)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(143) 1,3-диметил-7-(4-метоксибензил)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(144) 1,3-диметил-7-(2-фенілетил)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(145) 1,3-диметил-7-(3-фенілпропіл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(146) 1,3-диметил-7-(2-фуранілметил)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(147) 1,3-диметил-7-(3-фуранілметил)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(148) 1,3-диметил-7-(3-тіенілметил)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(149) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-метиламінопіперидин-1-іл)ксантин  
(150) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-етиламінопіперидин-1-іл)ксантин  
(151) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-диметиламінопіперидин-1-іл)ксантин  
(152) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-діетиламінопіперидин-1-іл)ксантин  
(153) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-{3-[(2-гідроксиетил)аміно]піперидин-1-іл}ксантин  
(154) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-{3-[N-метил-N-(2-гідроксиетил)аміно]піперидин-1-іл}ксантин  
(155) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-{3-[(3-гідроксипропіл)аміно]піперидин-1-іл}ксантин  
(156) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-{3-[N-метил-N-(3-гідроксипропіл)аміно]піперидин-1-іл}ксантин  
(157) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-{3-[(карбоксиметил)аміно]піперидин-1-іл}ксантин  
(158) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-{3-[(метоксикарбонілметил)аміно]піперидин-1-іл}ксантин  
(159) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-{3-[(етоксикарбонілметил)аміно]піперидин-1-іл}ксантин

- (182) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(4-метил-3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(183) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(5-метил-3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(184) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(6-метил-3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(185) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(2-аміно-8-азабіцикло[3.2.1]окт-8-іл)ксантин  
(186) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(6-аміно-2-азабіцикло[2.2.2]окт-2-іл)ксантин  
(187) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-аміноциклопентил)ксантин  
(188) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-метиламіноциклогексил)ксантин  
(189) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-етиламіноциклогексил)ксантин  
(190) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-диметиламіноциклогексил)ксантин  
(191) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-діетиламіноциклогексил)ксантин  
(192) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(4-аміноциклогексил)ксантин  
(193) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[(3-аміноциклогексил)аміно]ксантин  
(194) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[[2-аміноциклопентил)аміно]ксантин  
(195) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[(3-аміноциклопентил)аміно]ксантин  
(196) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[[2-аміноциклобутил)аміно]ксантин  
(197) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[(3-аміноциклобутил)аміно]ксантин  
(198) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[[2-аміноциклопропіл)аміно]ксантин  
(199) 1-[2-(4-гідроксифеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(200) 1-[2-(3-фтор-4-гідроксифеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(201) 1-[2-(4-метоксифеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(202) 1-[2-(4-етоксифеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(203) 1-(2-{4-[(карбоксиметил)окси]феніл)етил}-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(204) 1-(2-{4-[(метоксикарбоніл)метилокси]феніл)етил}-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(205) 1-[2-(3-гідроксифеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(206) 1-[2-(2-фтор-5-гідроксифеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(207) 1-[2-(3-метоксифеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(208) 1-{2-[3-(карбоксиметилокси)феніл]етил}-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин



- (229) 1-[2-(2-метилфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(230) 1-[2-(2-карбоксифеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(231) 1-[2-[2-(метоксикарбоніл)феніл]етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(232) 1-[2-(4-фторфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(233) 1-[2-(4-хлорфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(234) 1-[2-(4-бромфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(235) 1-[2-(4-ціанофеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(236) 1-[2-(4-трифторметоксифеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(237) 1-[2-(4-метилсульфанілфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(238) 1-[2-(4-метилсульфонілфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(239) 1-[2-(4-метилсульфонілфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(240) 1-[2-(4-трифторметилфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(241) 1-[2-(4-амінофеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(242) 1-(2-[4-[(метилкарбоніл)аміно]феніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(243) 1-(2-[4-[(метилсульфоніл)аміно]феніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(244) 1-[2-(3-нітрофеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(245) 1-[2-[4-(амінокарбоніл)феніл]етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(246) 1-[2-[4-(метиламінокарбоніл)феніл]етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(247) 1-(2-[4-(диметиламінокарбоніл)феніл]етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(248) 1-[2-[4-(аміноссульфоніл)феніл]етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(249) 1-(2-[4-(метиламіноссульфоніл)феніл]етил]-3-метил-7-(3-

метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 (250) 1-{2-[4-(диметиламіносультоніл)феніл]етил}-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 (251) 1-(3-карбоксіпропіл)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 (252) 1-[3-(метоксикарбоніл)пропіл]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 (253) 1-[3-(етоксикарбоніл)пропіл]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 (254) 1-[2-(3,4-диметилфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 (255) 1-[2-(2-фтор-5-хлорфеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 (256) 1-[2-(3,5-диметоксифеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 (257) 1-[2-(нафталін-2-іл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 (258) 1-[2-(піридин-3-іл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 (259) 1-[4-фенілбутил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 (260) 1-метил-3-(3-фенілпропіл)-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 (261) 1-метил-3-(3-карбоксіпропіл)-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 (262) 1-метил-3-[3-(метоксикарбоніл)пропіл]-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 (263) 1-метил-3-[3-(етоксикарбоніл)пропіл]-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 (264) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-аміно-1-метилпроп-1-іл)ксантин  
 (265) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-аміно-1,1-диметилпроп-1-іл)ксантин  
 (266) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-аміно-1-метил-бут-1-ил)ксантин  
 (267) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[1-(2-аміноетил)циклопропіл]ксантин  
 (268) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[1-(амінометил)циклопентилметил]ксантин  
 (269) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[2-(амінометил)циклопропіл]ксантин  
 (270) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[2-(амінометил)циклопентил]ксантин  
 (271) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(2-аміноциклопропілметил)ксантин  
 (272) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[[піперидин-3-іл]метил]ксантин  
 (273) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[2-(піролідін-2-іл)етил]ксантин  
 (274) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[N-(2-аміноетил)-N-етиламіно]ксантин  
 (275) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[N-(2-аміноетил)-N-ізопропіламіно]ксантин

(276) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[N-(2-аміноетил)-N-циклопропіламіно]ксантин  
 (277) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[N-(2-аміноетил)-N-циклопропілметиламіно]ксантин  
 (278) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[N-(2-аміноетил)-N-феніламіно]ксантин  
 (279) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[N-(2-аміноетил)-N-бензиламіно]ксантин  
 (280) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[N-(2-аміно-1-метилетил)-N-метиламіно]ксантин  
 (281) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[N-(2-амінопроп-1-іл)-N-метиламіно]ксантин  
 (282) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[N-(2-аміно-1-метилпроп-1-іл)-N-метиламіно]ксантин  
 (283) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[N-(2-аміно-2-метилпропіл)-N-метиламіно]ксантин  
 (284) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[N-(1-аміноциклопропілметил)-N-метиламіно]ксантин  
 (285) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[N-(2-аміноциклопропіл)-N-метиламіно]ксантин  
 (286) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[N-(2-аміноциклобутил)-N-метиламіно]ксантин  
 (287) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[N-(2-аміноциклопентил)-N-метиламіно]ксантин  
 (288) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[N-(2-аміноциклогексил)-N-метиламіно]ксантин  
 (289) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-{N-[[піролідін-2-іл]метил]-N-метиламіно}ксантин  
 (290) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[N-(піролідін-3-іл)-N-метиламіно]ксантин  
 (291) 1,3-диметил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-[N-{піперидин-3-іл)-N-метиламіно]ксантин  
 (292) 1-(2-фенілоксиетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 (293) 1-{2-фенілсульфанілетил}-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 (294) 1-(2-фенілсульфонілетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 (295) 1-(2-фенілсульфоніл-етил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 (296) 1-метил-3-(2-оксо-2-феілетил)-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 (297) 1-метил-3-(2-оксопропіл)-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 (298) 1-метил-3-феніл-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 (299) 1-метил-3-циклопропіл-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 (300) 1-[2-(3-фторфеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 (301) 1-[2-(3-хлорфеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
 (302) 1-[2-(3-бромфеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

(345) 1-(2-феніл-2-оксоетил)-3-метил-7-[(2-метил-1-циклопентен-1-іл)метил]-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

- (370) 1-[(5-метилізоксазол-3-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (371) 1-[(оксазол-2-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (372) 1-[(тіазол-2-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (373) 1-[(1H-індазол-3-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (374) 1-[(1-метил-1H-індазол-3-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (375) 1-[(бензо[о]ізоксазол-3-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (376) 1-[(бензо[а]ізотіазол-3-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (377) 1-[(5-фторбензо[с][ізотіазол-3-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (378) 1-[(5-фторбензо[с][ізоксазол-3-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (379) 1-[(5-метилбензо[с][ізоксазол-3-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (380) 1-[(5-метилбензо[с][ізотіазол-3-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (381) 1-(2-феніл-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-імінопіперазин-1-іл)ксантин
- (382) 1-(2-феніл-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(6-аміно[1,4]діацепан-1-іл)ксантин
- (383) 1-(2-циклогексилетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (384) 1-[2-(2-дифторметоксифеніл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (385) 1-(2-(2-диформетоксифеніл)-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (386) 1-[2-(2-триформетоксифеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (387) 1-[2-(індан-4-іл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (388) 1-[2-(бензо[1,3]діоксол-4-іл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (389) 1-[2-(2,2-дифторобензо[1,3]діоксол-4-іл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (390) 1-[2-(нафт-1-іл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (391) 1-[2-(2-ізопропілфеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

- (415) 1-метил-3-[2-(піридин-3-іл)-2-оксоетил]-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (416) 1-метил-3-[2-(тіофен-2-іл)-2-оксоетил]-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (417) 1-метил-3-[3-метил-2-оксобутил]-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (418) 1-метил-3-(2-циклопентил-2-оксоетил)-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (419) 1-метил-3-(2-фенілоксиетил)-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (420) 1-(2-феніл-2-оксоетил)-3-метил-7-(4-фторфеніл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (421) 1-(2-феніл-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-трифторметилфеніл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (422) 1-(2-феніл-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метокси-феніл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (423) 1-(2-феніл-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-дифторметоксифеніл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (424) 1-(2-феніл-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-трифторметоксифеніл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (425) 1-(2-феніл-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(4-аміно-2-азабіцикло[3.2.1]окт-2-ил)ксантин
- (426) 1-[2-(2-метиламінофеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (427) 1-{2-[2-(N-ціанометил-N-метиламіно)феніл]-2-оксоетил}-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (428) 1-[2-(2-ціанометиламінофеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (429) 1-(2-{2-[(метоксикарбоніл)метиламіно]феніл}-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (430) 1-[2-(2-метилсульфоніламінофеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (431) 1-(2-{3-[(метоксикарбоніл)метиламіно]феніл}-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (432) 1-[2-(3-метиламінофеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (433) 1-{2-[3-(N-ціанометил-N-метиламіно)феніл]-2-оксоетил}-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (434) 1-(2-{3-[(диметиламіно)сульфоніламіно]феніл}-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин
- (435) 1-(2-{3-[(морфолін-4-іл)сульфоніламіно]феніл}-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

- (458) 1-[(7-метилсульфоніламіноізохінолін-1-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(459) 1-[(7-ціаноізохінолін-1-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(460) 1-[(7-амінокарбонілізохінолін-1-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(461) 1-[2-(2-гідроксифеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(462) 1-[2-(2-ціанометоксифеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
241  
(463) 1-(2-[2-[(метоксикарбоніл)метокси]феніл]-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(464) 1-[2-(2-алілоксифеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(465) 1-(2-{3-[(амінокарбоніл)метокси]феніл}-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(466) 1-(2-{3-[(метиламінокарбоніл)метокси]феніл}-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(467) 1-(2-{3-[(диметиламінокарбоніл)метокси]феніл}-2-оксоетил)-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(468) 1-[2-(3-{[(морфолін-4-іл)карбоніл]метокси}феніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(469) 1-[2-(3-карбоксиметоксифеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(470) 1-[2-(3-метилсульфанілметоксифеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(471) 1-[2-(3-метилсульфонілметоксифеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(472) 1-[2-(3-метилсульфоілметоксифеніл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(473) 1-[2-(2-оксо-2,3-дигідробензооксазол-4-іл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(474) 1-[2-(2-оксо-2,3-дигідро-1H-бензоімідазол-4-іл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(475) 1-[2-(1-метил-2-оксо-2,3-дигідро-1H-бензоімідазол-4-іл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин  
(476) 1-[2-(1,3-диметил-2-оксо-2,3-дигідро-1H-бензоімідазол-4-іл)-2-оксоетил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

(519) 1-[2-оксо-2-(4-метил-3-оксо-3,4-дигідро-2Н-бензо[1,4]оксазин-8-іл)етил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіридин-1-іл)ксантин

(520) 1-[(цінолін-4-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

(521) 1-[(2-оксо-2Н-хромен-4-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

(522) 1-[(1-оксо-1,2-дигідроізохінолін-4-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

(523) 1-[(2-метил-1-оксо-1,2-дигідроізохінолін-4-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

(524) 1-[(4-оксо-3,4-дигідрофалазин-1-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

(525) 1-[(3-метил-4-оксо-3,4-дигідрофалазин-1-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

(526) 1-[(1,5)нафтиридин-4-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

(527) 1-[(1,7)нафтиридин-8-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

(528) 1-[(хінолін-2-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

(529) 1-[(ізохінолін-3-іл)метил]-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

(530) 1-{2-оксо-2-[3-(2-оксотетрагідропіримідин-1-іл)феніл]етил}-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

(531) 1-{2-оксо-2-[3-(3-метил-2-оксотетрагідропіримідин-1-іл)феніл]етил}-3-метил-7-(3-метил-2-бутен-1-іл)-8-(3-амінопіперидин-1-іл)ксантин

#### Приклад 11

Драже, що містить 75мг активної речовини

1 драже містить:

активної речовини	75,0мг
фосфату кальцію	93,0мг
кукурудзяного крохмалю	35,5мг
полівінілпіролідону	10,0мг
гідроксипропілметилцелюлози	15,0мг
стеарату магнію	1,5мг
	230,0мг

#### Одержання:

Активну речовину перемішують з фосфатом кальцію, кукурудзяним крохмалем, полівінілпіролідон, гідроксипропілметилцелюлозою та половиною вказаної кількості стеарату магнію. На рафінадному пресі одержують віджятий продукт діаметром приблизно 13мм, перетирають його за допомогою відповідного пристрою, пропускаючи через фільтр із шириною отворів 1,5мм та перемішують із другою половиною стеарату магнію. Цей гранулят пресують на рафінадному пресі до одержання пігулок бажаної форми.

Вага ядра: 230мг

Штамп: 9мм, випуклий

Одержані таким чином драже покривають плівкою, яка складається з в основному з гідроксипропілметилцелюлози. Готові драже глянуть бджолиним воском.

Вага драже: 245мг.

#### Приклад 12

Пігулки, що містять 100мг активної речовини

Вміст

1 пігулка містить:	
активної речовини	100,0мг
лактози	80,0мг
кукурудзяного крохмалю	34,0мг
полівінілпіролідон	4,0мг
стеарат магнію	2,0мг
	220,0мг

#### Спосіб одержання:

Активну речовину, лактозу та крохмаль перемішують та змочують водним розчином полівінілпіролідону. Після фільтрування вологої маси (ширина отворів 2,0мм) та висушування за допомогою сушили з решітками при температурі 50°C знову фільтрують (ширина отворів 1,5мм) та додають змазку. Суміш перероблюють на пігулки.

Вага пігулки: 220мг

Діаметр: 10мм, біпланарний з фасетом та одностороннім надрізом.

#### Приклад 13

Пігулки, що містять 150мг активної речовини

Вміст:

1 пігулка містить:	
Активної речовини	150,0мг
порошкової лактози	89,0мг
кукурудзяного крохмалю	40,0мг
колоїдної силікагелевої кислоти	10,0мг
полівінілпіролідон	10,0мг
стеарату магнію	1,0мг
	300,0мг

#### Одержання:

Активну речовину, змішану з лактозою, кукурудзяним крохмалем та кремнієвою кислотою, змочують 20%-тним водним розчином полівінілпіролідону та пропускають через фільтр із шириною отворів 1,5мм. Гранулят, висушений при температурі 45°C, ще раз пропускають через той самий фільтр та перемішують із вказаною вище кількістю стеарату магнію. Суміш пресують до одержання пігулок.

Вага пігулки: 300мг

Штамп: 10мм, плоский

#### Приклад 14

Капсули твердого желатину, що містять 150мг активної речовини

1 капсула містить:

Активної речовини	150,0мг
кукурудзяного крохмалю,	
сухого	приблизно 180,0мг
порошкової лактози	приблизно 87,0мг
стеарату магнію	3,0мг
	приблизно 420,0мг

#### Одержання:

Активну речовину змішують з допоміжними речовинами, пропускають через фільтр із шириною отворів 0,75мм та перемішують у відповідному приладі до утворення однорідної суміші.

Капсули твердого желатину розміром 1 наповнюють кінцевою сумішшю.

Наповнена капсула: приблизно 320мг

Пуста капсула: капсула твердого желатину розміром 1.

#### Приклад 15



## 161

Супозиторії, що містять 150мг активної речовини

1 супозиторій містить:

Активної речовини	150,0мг
поліетиленгліколю 1500	550,0мг
поліетиленгліколю 6000	460,0мг
поліоксидиленсорбітанмоностеарату	840,0мг
	2000,0мг

Одержання:

Після розплавлення супозиторійної маси активну речовину однорідно розподіляють та виливають розплав у охолоджені форми.

Приклад 16

Суспензія, що містить 50мг активної речовини

100мл суспензія містить:

Активної речовини	1,00г
карбоксиметилцелюлози-Na-солі	0,10г
метильного естеру р-гідроксибензойної кислоти	0,05г
пропільного естеру р-гідроксибензойної кислоти	0,01г
сахарози	10,00г
гліцерину	5,00г
розчину сорбіту 70%	20,00г
ароматичних речовин	0,30г
води дест.	100мл

Одержання:

Дест. воду нагрівають до температури 70°C. В ній при перемішування розчиняють метильний та пропільний естер р-гідроксибензойної кислоти, а

## 76982

## 162

також гліцерин та карбоксиметилцелюлозу-натрієву сіль. Суміш охолоджують до кімнатної температури та при перемішуванні додають активну речовину і диспергують в однорідній формі. Після додавання розчинення цукру, розчину сорбіту та ароматичних речовин суспензію вакуумують при перемішуванні.

5мл суспензії містять 50мг активної речовини.

Приклад 17

Ампули, що містять 10мг активної речовини

Вміст:

Активної речовини	10,0мг
0,01 n соляної кислоти двічі перегнаної води	2,0мл

Одержання:

Активну речовину розчиняють у необхідній кількості 0,01 n HCl, за допомогою повареної солі перетворюють на ізотонічну, стерилізують при фільтруванні та наповнюють нею 2мл ампули.

Приклад 18

Ампули, що містять 50мг активної речовини

Вміст:

Активної речовини	50,0мг
0,01 n соляної кислоти двічі перегнаної води	10,0мл

Одержання:

Активну речовину розчиняють у необхідній кількості 0,01 n HCl, за допомогою повареної солі перетворюють на ізотонічну, стерилізують при фільтруванні та наповнюють нею 10мл ампули.