



УКРАЇНА

(19) **UA** (11) **111137** (13) **C2**
(51) МПК (2016.01)
A61P 3/00
A61K 31/33 (2006.01)

ДЕРЖАВНА СЛУЖБА
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ
УКРАЇНИ

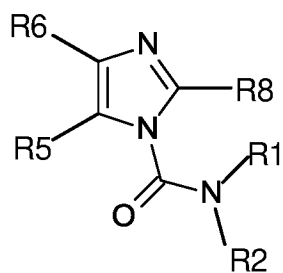
(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВІНАХІД

(21) Номер заявки:	а 2011 07657	(72) Винахідник(и):	Кіш Ласло Ернійо (HU/PT), Лірмонт Девід Александр (GB/PT), Роза Карла Патрісія да Кошта Перейра (PT), Гушман де Норонья Ріта (PT), Палма Педро Нуну Леал (PT), Соареш да Сілва Патрісіо Мануель Віейра Араужу (PT), Беляєв Александр (RU/PT)
(22) Дата подання заявки:	23.12.2009	(73) Власник(и):	БІАЛ-ПОРТЕЛА ЕНД КА, С.А., Av. da Siderurgia Nacional, 4547-457 S. Mamede do Coronado, Portugal (PT)
(24) Дата, з якої є чинними права на винахід:	11.04.2016	(74) Представник:	Слободянюк Олександр Валентинович, реєстр. №138
(31) Номер попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції:	61/140,640, 61/159,281, 61/174,712, 61/221,166, 61/242,472	(56) Перелік документів, взятих до уваги експертизою:	WO 2005014576 A1, 17.02.2005 ASANO, YASUTOMI ET AL: "Discovery, synthesis and biological evaluation of isoquinolones as novel and highly selective JNK inhibitors (2)", BIOORGANIC & MEDICINAL CHEMISTRY, 2008, pp. 16(8), 4699-4714 WO 0170671 A2, 27.09.2001 JP 2001302640 A, 31.10.2001 DATABASE CA [Online] CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; 1 November 1991 (1991-11-01), YANO, TOSHIHIKO ET AL: "Preparation of tribromoimidazoles as insecticides for cockroaches", XP002629248, retrieved from STN Database accession no. 1992:123311
(32) Дата подання попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції:	24.12.2008, 11.03.2009, 01.05.2009, 29.06.2009, 15.09.2009		
(33) Код держави-учасниці Паризької конвенції, до якої подано попередню заявку:	US, US, US, US, US		
(41) Публікація відомостей про заявку:	26.12.2011, Бюл.№ 24		
(46) Публікація відомостей про видачу патенту:	11.04.2016, Бюл.№ 7		
(86) Номер та дата подання міжнародної заявки, поданої відповідно до Договору РСТ	PCT/PT2009/000080, 23.12.2009		

(54) КАРБОКСАМІДНІ ПОХІДНІ ІМІДАЗОЛУ ТА ФАРМАЦЕВТИЧНА КОМПОЗИЦІЯ НА ЇХ ОСНОВІ**(57) Реферат:**

Винахід стосується сполук

UA 111137 C2



та композицій для інгібування ферменту гідролази амідів жирних кислот (ГАЖК), застосування сполук в лікуванні та, зокрема, для лікування або профілактики станів, розвиток або симптоми яких пов'язані із субстратами ферменту ГАЖК, і способів лікування або профілактики з використанням сполук та композицій.

Даний винахід стосується сполук та їх застосування, і, зокрема, сполук та їх терапевтичного застосування в лікуванні або профілактиці станів, пов'язаних із субстратами, такими як нейромедіаторний анандамід, які руйнуються ферментом гідролазою амідів жирних кислот (ГАЖК).

Фермент ГАЖК розщеплює амід жирних кислот, такі як анандамід (N-арахідоноїлетаноламін), N-олеоїлетаноламін, N-пальмітоїлетаноламін та олеамід. Анандамід, також відомий як N-арахідоноїлетаноламін або АЕА, — це ендogenous каннабіноїдний нейромедіатор, знайдений в органах тварин і людини, особливо в мозку. Також знайдено, що анандамід зв'язується з ванілоїдним рецептором. Анандамід розщеплюється ферментом гідролазою амідів жирних кислот (ГАЖК) до етаноламіну та арахідонової кислоти. Відповідно, інгібітори ГАЖК приводять до підвищення рівнів анандаміду.

Анандамід являє собою нейромедіатор в ендоканнабіноїдній системі і стимулює каннабіноїдні рецептори. Каннабіноїдні рецептори, такі як CB1 і CB2, являють собою сполучені з протеїном G рецептори. CB1 знайдений переважно в центральній нервовій системі, тоді як CB2 знайдений переважно в периферичній тканині. Ендоканнабіноїдна система залучена до зростаючої кількості фізіологічних функцій, як в центральній, так і в периферичній нервовій системі, а також в периферичних органах. Показано, що модуляція активності ендоканнабіноїдної системи володіє потенціалом терапевтичного впливу на широкий спектр інвалідизуючих захворювань і патологічних станів. Таким чином, ендоканнабіноїдна система, і фермент ГАЖК зокрема, стала терапевтичною мішенню для розробки потенційних засобів лікування численних захворювань. Ендоканнабіноїдна система залучена до регуляції апетиту, ожирінні, метаболічних розладів, кахексії, анорексії, болю, запалення, нейротоксичності, нейротравми, інсульту, множинного склерозу, пошкодження спинного мозку, хвороби Паркінсона,

індукованої леводопою дискінезії, хвороби Хантінгтона, синдрому Гійєна де ла Туретта, тардивної дискінезії, дистонії, аміотрофного латерального склерозу, хвороби Альцгеймера, епілепсії, шизофренії, тривожності, депресії, безсоння, нудоти, блювання, алкогольних розладів, зловживання наркотичними речовинами, такими як опіати, нікотин, кокаїн, алкоголь та психостимулятори, гіпертензії, циркуляторного шоку, реперфузійного пошкодження міокарду, атеросклерозу, астми, глаукоми, ретинопатії, раку, запального захворювання кишечника, гострого та хронічного захворювання печінки, такого як гепатит і цироз печінки, артриту та остеопорозу. Ендоканнабіноїдна система і стани, з якими вона пов'язана, детально обговорюється в Pacher et al. (2006) Pharmacol. Rev. 58:389-462.

Для того, щоб модулювати рівень ендogenous субстратів ГАЖК, таких як наприклад, які в свою чергу модулюють ендоканнабіноїдну систему, розроблені інгібітори ферменту ГАЖК. Це дозволяє, як мінімум частково, лікувати або попереджати стани і захворювання, пов'язані з ендоканнабіноїдною системою.

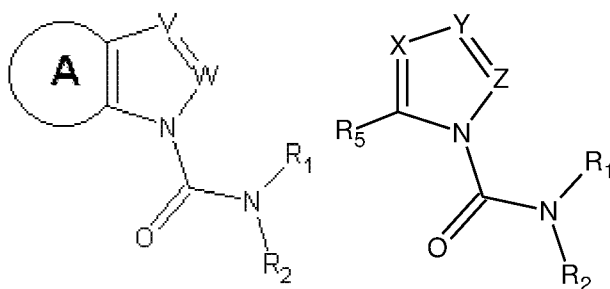
Оскільки субстрати ГАЖК зв'язуються з іншими рецепторами, наприклад, ванілоїдним рецептором, та/або залучені до інших шляхів проведення сигналу, інгібітори ГАЖК також можуть дозволяти як мінімум частково, лікувати або попереджати стани і захворювання, пов'язані з іншими шляхами або системами, наприклад, ванілоїдною системою.

У FR 2915198 і FR 2915199 розкриті сполуки, які є інгібіторами ГАЖК.

В US 7,208,504 і FR2915197 також розкритий ряд сполук, які не подібні до розкритих в FR 2915198 і FR 2915199. Вказані сполуки заявлені як придатні для інгібування гормон-чутливої ліпази (ГЧЛ) і моноацилгліцеринліпази (МАГЛ), відповідно. Однак, вказані сполуки не заявлені як придатні інгібування ГАЖК.

У WO 2009/117444 розкриті сполуки, що є інгібіторами як ГАЖК, так і МАГЛ.

У відповідності до першого аспекту винаходу запропонована сполука Формули I або Формули II:



Формула I Формула II

де:

кожен з R1 та R2 може бути незалежно вибраний з H, C₁₋₂₀ алкіл, C₁₋₆ алкокси, арил, гетероарил, частково або повністю насиченого гетероциклілу, C₃₋₁₀ циклоалкілу, арил C₁₋₆ алкілу, гетероарил C₁₋₆ алкілу, гетероцикліл C₁₋₆ алкілу, C₃₋₁₀ циклоалкіл C₁₋₆ алкілу, R1a, галогену, OH, OR1a, OCOR1a, SH, SR1a, SCOR1a, NH₂, NHR1a, NHSO₂NH₂, NHSO₂R1a, NR1aCOR1b, NHCOR1a, NR1aR1b, COR1a, CSR1a, CN, COOH, COOR1a, CONH₂, CONHOH, CONHR1a, CONHOR1a, SO₂R1a, SO₃H, SO₂NH₂, CONR1aR1b, SO₂NR1aR1b, де R1a та R1b незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R1a та R1b, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл,

де, якщо R1 або R2 являє собою C₁₋₂₀ алкіл, алкокси, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₃₋₁₀ циклоалкіл, арил C₁₋₆ алкіл, гетероарил C₁₋₆ алкіл, гетероцикліл C₁₋₆ алкіл, C₃₋₁₀ циклоалкіл C₁₋₆ алкіл, C₁₋₆ алкіл, C₃₋₈ циклоалкіл або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з R1c, галогену, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, арил C₁₋₆ алкілу, гетероарил C₁₋₆ алкілу, гетероцикліл C₁₋₆ алкілу, арил C₁₋₆ алкокси, гетероарил C₁₋₆ алкокси, гетероцикліл C₁₋₆ алкокси, C₁₋₆ алкіламіно, C₁₋₆ діалкіламіно, C₁₋₁₀ алкілу, OH, OR1c, OCOR1c, SH, SR1c, SCOR1c, NH₂, NO₂, NHR1c, NHSO₂NH₂, NHSO₂R1c, NR1cCOR1d, NHC(NH)NH₂, NHCOR1c, NR1cR1d, COR1c, CSR1c, CN, COOH, COOR1c, CONH₂, CONHOH, CONHR1c, CONHOR1c, C(NOH)NH₂, CONR1cR1d, SO₂R1c, SO₃H, SO₂NH₂, SO₂NR1cR1d, де R1c та R1d незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R1c та R1d, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл,

де, якщо замісник в R1 або R2 являє собою C₁₋₁₀ алкіл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, арил C₁₋₆ алкіл, гетероарил C₁₋₆ алкіл, гетероцикліл C₁₋₆ алкіл, арил C₁₋₆ алкокси, гетероарил C₁₋₆ алкокси, гетероцикліл C₁₋₆ алкокси, C₁₋₆ алкіламіно, C₁₋₆ діалкіламіно, C₁₋₆ алкіл, C₃₋₈ циклоалкіл або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з R1e, галогену, C₁₋₁₀ алкілу, OH, OR1e, OCOR1e, SH, SR1e, SCOR1e, NH₂, NO₂, NHR1e, NHSO₂NH₂, NHSO₂R1e, NR1eCOR1f, NHC(NH)NH₂, NHCOR1e, NR1eR1f, COR1e, CSR1e, CN, COOH, COOR1e, CONH₂, CONHOH, CONHR1e, CONHOR1e, C(NOH)NH₂, CONR1eR1f, SO₂R1e, SO₃H, SO₂NH₂, SO₂NR1eR1f, де R1e та R1f незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R1e та R1f, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл,

за винятком того, що R1 та R2 не являють собою обидва H або обидва незаміщений метил, або

R1 та R2, разом з N, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероарильну або гетероциклільну групу, кожна з яких необов'язково може бути заміщена одним або більше атомами кисню або однією або більше груп, вибраних з арилу, гетероарилу, частково або повністю насиченого гетероциклілу, C₃₋₈ циклоалкілу, C₁₋₆ алкілу, арил C₁₋₆ алкілу, гетероарил C₁₋₆ алкілу, гетероцикліл C₁₋₆ алкілу, C₃₋₈ циклоалкіл C₁₋₆ алкілу, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, R2a, галогену, OH, OR2a, OCOR2a, SH, SR2a, SCOR2a, NH₂, NO₂, NHR2a, NHSO₂NH₂, NHSO₂R2a, NR2aCOR2b, NHC(NH)NH₂, NHCOR2a, NR2aR2b, COR2a, CSR2a, CN, COOH, COOR2a, CONH₂, CONHOH, CONHR2a, CONHOR2a, C(NOH)NH₂, CONR2aR2b, SO₂R2a, SO₃H, SO₂NH₂, SO₂NR2aR2b, де R2a та R2b незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R2a та R2b, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл,

де, якщо замісник в гетероарилі або гетероциклілі, утворений R1 та R2 разом, являє собою арил, гетероарил, гетероцикліл, C₃₋₈ циклоалкіл, C₁₋₆ алкіл, арил C₁₋₆ алкіл, гетероарил C₁₋₆ алкіл, гетероцикліл C₁₋₆ алкіл, C₃₋₈ циклоалкіл C₁₋₆ алкіл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, або групу, що містить один або більше із вказаних фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, гідроксилу, C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₃₋₈ циклоалкілу, C₁₋₄ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, C₃₋₈ циклоалкілокси, арил C₁₋₄ алкокси, гетероарил C₁₋₆ алкокси, гетероцикліл C₁₋₄ алкокси, C₃₋₈ циклоалкіл C₁₋₄ алкокси, R2c, OR2c, OCOR2c, SH, SR2c, SCOR2c, NH₂, NO₂, NHR2c, NHSO₂NH₂, NHSO₂R2c, NR2cCOR2d, NHC(NH)NH₂, NHCOR2c, NR2cR2d, COR2c, CSR2c, CN, COOH, COOR2c, CONH₂, CONHOH, CONHR2c, CONHOR2c, C(NOH)NH₂, CONR2cR2d, SO₂R2c, SO₃H, SO₂NH₂, SO₂NR2cR2d, де R2c

та R2d незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R2c та R2d, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл,

де, якщо замісник в заміснику в гетероарилі або гетероциклілі, утворений R1 та R2 разом, являє собою C₁₋₆ алкіл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₃₋₈ циклоалкіл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, C₃₋₈ циклоалкілокси, арил C₁₋₄ алкокси, гетероарил C₁₋₄ алкокси, гетероцикліл C₁₋₄ алкокси, C₃₋₈ циклоалкіл C₁₋₄ алкокси, або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з C₁₋₄ алкокси, R2e, галогену, OH, OR2e, OCOR2e, SH, SR2e, SCOR2e, NH₂, NO₂, NHR2e, NHSO₂NH₂, NHSO₂R2e, NR2eCOR2f, NHC(NH)NH₂, NR2eR2f, NHCOR2e, COR2e, CSR2e, CN, COOH, COOR2e, CONH₂, CONHOH, CONHR2e, CONHOR2e, C(NOH)NH₂, CONR2eR2f, SO₂R2e, SO₃H, SO₂NH₂, SO₂NR2eR2f, де R2e та R2f незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R2e та R2f, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл;

кільце A вибране з арильних, гетероарильних та гетероциклільних фрагментів, кожен з яких необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, Ra, C₁₋₁₀ алкілу, OH, ORa, OCORa, SH, SRa, SCORa, NH₂, NO₂, NHRa, NHSO₂NH₂, NHSO₂Ra, NRaCORb, NHCORa, NHC(NH)NH₂, NRaRb, CORa, CSRa, CN, COOH, COORa, CONH₂, CONHRA, CONHOH, CONHORA, C(NOH)NH₂, CONRaRb, SO₂Ra, SO₃H, SO₂NH₂, SO₂NRaRb, де Ra та Rb незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або Ra та Rb, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл,

де, якщо кільце A заміщене C₁₋₆ алкілом, арилом, гетероарилом, гетероциклілом, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, C₁₋₁₀ алкілом, C₃₋₈ циклоалкілом або заміщене групою, що містить один або більше із вказаних фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, Rc, C₁₋₁₀ алкілу, арил C₁₋₆ алкілу, гетероарил C₁₋₆ алкілу, гетероцикліл C₁₋₆ алкілу, OH, ORc, OCORc, SH, SRC, SCORc, NH₂, NO₂, NHRc, NHSO₂NH₂, NHSO₂Rc, NRcCORd, NHCORc, NHC(NH)NH₂, NRcRd, CORc, CSRc, CN, COOH, COORc, CONH₂, CONHOH, CONHRc, CONHORc, C(NOH)NH₂, CONRcRd, SO₂Rc, SO₃H, SO₂NH₂, SO₂NRcRd, де Rc та Rd незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або Rc та Rd, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл;

V може являти собою N, CH або C-R3, де R3 являє собою галоген, C₁₋₁₀ алкіл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₃₋₈ циклоалкіл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, R3a, OH, OR3a, SH, SR3a, OCOR3a, SCOR3a, NH₂, NO₂, NHR3a, NHSO₂NH₂, NHSO₂R3a, NR3aCOR3b, NHCOR3a, NHC(NH)NH₂, NR3aR3b, COR3a, CSR3a, CN, COOH, COOR3a, CONH₂, CONHOH, CONHR3a, CONHOR3a, C(NOH)NH₂, CONR3aR3b, SO₂R3a, SO₃H, SO₂NH₂, SO₂NR3aR3b, де R3a та R3b незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R3a та R3b, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл,

де, якщо R3 являє собою C₁₋₁₀ алкіл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, C₁₋₆ алкіл, C₃₋₈ циклоалкіл, або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, R3c, C₁₋₁₀ алкілу, OH, OR3c, OCOR3c, SH, SR3c, SCOR3c, NH₂, NO₂, NHR3c, NHSO₂NH₂, NHSO₂R3c, NR3cCOR3d, NHCOR3c, NHC(NH)NH₂, NR3cR3d, COR3c, CSR3c, CN, COOH, COOR3c, CONH₂, CONHOH, CONHR3c, CONHOR3c, C(NOH)NH₂, CONR3cR3d, SO₂R3c, SO₃H, SO₂NH₂, SO₂NR3cR3d, де R3c та R3d незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R3c та R3d, з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл,

де, якщо замісник в R3 являє собою C₁₋₁₀ алкіл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, C₁₋₆ алкіл, C₃₋₈ циклоалкіл, або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, R3e, C₁₋₁₀ алкілу, OH, OR3e, OCOR3e, SH, SR3e, SCOR3e, NH₂, NO₂, NHR3e, NHSO₂NH₂, NHSO₂R3e, NR3eCOR3f, NHCOR3e, NHC(NH)NH₂, NR3eR3f, COR3e, CSR3e, CN, COOH, COOR3e, CONH₂, CONHOH,

CONHR3e, CONHOR3e, C(NOH)NH₂, CONR3eR3f, SO₂R3e, SO₃H, SO₂NH₂, SO₂NR3eR3f, де R3e та R3f незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R3e та R3f, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл;

5 W може являти собою N, CH або C-R4, де R4 являє собою галоген, C₁₋₁₀ алкіл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, C₃₋₈ циклоалкіл, R4a, OH, OR4a, SH, SR4a, OCOR4a, SCOR4a, NH₂, NO₂, NHR4a, NHSO₂NH₂, NHSO₂R4a, NR4aCOR4b, NHCOR4a, NHC(NH)NH₂, NR4aR4b, COR4a, CSR4a, CN, COOH, COOR4a, CONH₂, CONHOH, CONHR4a, CONHOR4a, C(NOH)NH₂, CONR4aR4b, SO₂R4a, SO₃H, SO₂NH₂, SO₂NR4aR4b, де R4a та R4b незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R4a та R4b, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл,

10 де, якщо R4 являє собою C₁₋₁₀ алкіл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, C₁₋₆ алкіл, C₃₋₈ циклоалкіл, або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, R4c, C₁₋₁₀ алкілу, OH, OR4c, OCOR4c, SH, SR4c, SCOR4c, NH₂, NO₂, NHR4c, NHSO₂NH₂, NHSO₂R4c, NR4cCOR4d, NHCOR4c, NHC(NH)NH₂, NR4cR4d, COR4c, CSR4c, CN, COOH, COOR4c, CONH₂, CONHOH, CONHR4c, CONHOR4c, C(NOH)NH₂, CONR4cR4d, SO₂R4c, SO₃H, SO₂NH₂, SO₂NR4cR4d, де R4c та R4d незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R4c та R4d, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл,

20 де, якщо замісник в R4 являє собою C₁₋₁₀ алкіл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, C₁₋₆ алкіл, C₃₋₈ циклоалкіл, або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, R4e, C₁₋₁₀ алкілу, OH, OR4e, OCOR4e, SH, SR4e, SCOR4e, NH₂, NO₂, NHR4e, NHSO₂NH₂, NHSO₂R4e, NR4eCOR4f, NHCOR4e, NHC(NH)NH₂, NR4eR4f, COR4e, CSR4e, CN, COOH, COOR4e, CONH₂, CONHOH, CONHR4e, CONHOR4e, C(NOH)NH₂, CONR4eR4f, SO₂R4e, SO₃H, SO₂NH₂, SO₂NR4eR4f, де R4e та R4f незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R4e та R4f, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл;

25 R5 разом з кільцевим атомом вуглецю, до якого він приєднаний, може утворювати карбонільну групу, де подвійний зв'язок в кільці Формули II, до якого він приєднаний, може бути перегрупований та/або насичений, відповідно, або R5 вибраний з H, C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₃₋₈ циклоалкілу, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, R5a, галогену, OH, OR5a, SH, SR5a, OCOR5a, SCOR5a, NH₂, NO₂, NHR5a, NHSO₂NH₂, NHSO₂R5a, NR5aCOR5b, NHCOR5a, NHC(NH)NH₂, NR5aR5b, COR5a, CSR5a, CN, COOH, COOR5a, CONH₂, CONHOH, CONHR5a, CONHOR5a, C(NOH)NH₂, CONR5aR5b, SO₂R5a, SO₃H, SO₂NH₂, SO₂NR5aR5b, де R5a та R5b незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R5a та R5b, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл,

40 де, якщо R5 являє собою C₁₋₆ алкіл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, C₁₋₆ алкіл, C₃₋₈ циклоалкіл, або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, R5c, C₁₋₆ алкілу, OH, OR5c, OCOR5c, SH, SR5c, SCOR5c, NH₂, NO₂, NHR5c, NHSO₂NH₂, NHSO₂R5c, NR5cCOR5d, NHCOR5c, NHC(NH)NH₂, NR5cR5d, COR5c, CSR5c, CN, COOH, COOR5c, CONH₂, CONHOH, CONHR5c, CONHOR5c, C(NOH)NH₂, CONR5cR5d, SO₂R5c, SO₃H, SO₂NH₂, SO₂NR5cR5d, де R5c та R5d незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R5c та R5d, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл,

55 де, якщо замісник в R5 являє собою C₁₋₆ алкіл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, C₃₋₈ циклоалкіл, або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, R5e, C₁₋₆ алкілу, OH, OR5e, OCOR5e, SH, SR5e, SCOR5e, NH₂, NO₂, NHR5e, NHSO₂NH₂, NHSO₂R5e, NR5eCOR5f, NHCOR5e, NHC(NH)NH₂, NR5eR5f, COR5e, CSR5e, CN, COOH, COOR5e, CONH₂, CONHOH, CONHR5e, CONHOR5e, C(NOH)NH₂, CONR5eR5f, SO₂R5e, SO₃H, SO₂NH₂, SO₂NR5eR5f, де R5e та R5f незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R5e та R5f, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл;

CONHOR5e, C(NOH)NH₂, CONR5eR5f, SO₂R5e, SO₃H, SO₂NH₂, SO₂NR5eR5f, де R5e та R5f незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R5e та R5f, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл;

Х може являти собою О (де подвійний зв'язок кільця, приєднаного до Х у Формулі II, замінений на одинарний зв'язок, відповідно), N, CH або C-R6, де R6 вибраний з C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, R6a, галогену, OH, OR6a, SH, SR6a, OCOR6a, SCOR6a, NH₂, NO₂, NHR6a, NHSO₂NH₂, NHSO₂R6a, NR6aCOR6b, NHCOR6a, NHC(NH)NH₂, NR6aR6b, COR6a, CSR6a, CN, COOH, COOR6a, CONH₂, CONHOH, CONHR6a, CONHOR6a, C(NOH)NH₂, CONR6aR6b, SO₂R6a, SO₃H, SO₂NH₂, SO₂NR6aR6b, де R6a та R6b незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R6a та R6b, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл,

де, якщо R6 являє собою гетероарил або гетероцикліл, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений одним або більше атомів кисню, та якщо R6 являє собою C₁₋₆ алкіл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, C₃₋₈ циклоалкіл, або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, R6c, C₁₋₆ алкілу, C₁₋₆ алкінілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, арил C₁₋₆ алкілу, гетероарил C₁₋₆ алкілу, гетероцикліл C₁₋₆ алкілу, арил C₁₋₆ алкокси, гетероарил C₁₋₆ алкокси, гетероцикліл C₁₋₆ алкокси, OH, OR6c, OCOR6c, SH, SR6c, SCOR6c, NH₂, NO₂, NHR6c, NHC(NH)NH₂, NHSO₂NH₂, NHSO₂R6c, NR6cCOR6d, NHCOR6c, NR6cR6d, COR6c, CSR6c, CN, COOH, COOR6c, CONH₂, CONHR6c, CONHOR6c, CONHOH, C(NOH)NH₂, CONR6cR6d, SO₂R6c, SO₃H, SO₂NH₂, SO₂NR6cR6d, де R6c та R6d незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R6c та R6d, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл,

де, якщо замісник в R6 являє собою гетероарил або гетероцикліл, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений одним або більше атомів кисню, або якщо замісник в R6 являє собою C₁₋₆ алкіл, C₁₋₆ алкініл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, арил C₁₋₆ алкіл, гетероарил C₁₋₆ алкіл, гетероцикліл C₁₋₆ алкіл, арил C₁₋₆ алкокси, гетероарил C₁₋₆ алкокси, гетероцикліл C₁₋₆ алкокси, C₃₋₈ циклоалкіл, або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, R6e, C₁₋₆ алкілу, C₁₋₄ алкокси, OH, OR6e, OCOR6e, SH, SR6e, SCOR6e, NH₂, NO₂, NHR6e, NHC(NH)NH₂, NHSO₂NH₂, NHSO₂R6e, NR6eCOR6f, NHCOR6e, NR6eR6f, COR6e, CSR6e, CN, COOH, COOR6e, CONH₂, CONHOH, CONHR6e, CONHOR6e, C(NOH)NH₂, CONR6eR6f, SO₂R6e, SO₃H, SO₂NH₂, SO₂NR6eR6f, де R6e та R6f незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщений C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R6e та R6f, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл;

У може являти собою N, CH або C-R7, де R7 вибраний з C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, R7a, галогену, OH, OR7a, SH, SR7a, OCOR7a, SCOR7a, NH₂, NO₂, NHR7a, NHSO₂NH₂, NHSO₂R7a, NR7aCOR7b, NHCOR7a, NHC(NH)NH₂, NR7aR7b, COR7a, CSR7a, CN, COOH, COOR7a, CONH₂, CONHOH, CONHR7a, CONHOR7a, C(NOH)NH₂, CONR7aR7b, SO₂R7a, SO₃H, SO₂NH₂, SO₂NR7aR7b, де R7a та R7b незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R7a та R7b, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл,

де, якщо R7 являє собою гетероарил або гетероцикліл, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений одним або більше атомів кисню, та якщо R7 являє собою C₁₋₆ алкіл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, C₃₋₈ циклоалкіл або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, R7c, C₁₋₆ алкілу, C₁₋₆ алкінілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, арил C₁₋₆ алкілу, гетероарил C₁₋₆ алкілу, гетероцикліл C₁₋₆ алкілу, арил C₁₋₆ алкокси, гетероарил C₁₋₆ алкокси, гетероцикліл C₁₋₆ алкокси, OH, OR7c, OCOR7c, SH, SR7c, SCOR7c, NH₂, NO₂, NHR7c, NHC(NH)NH₂, NHSO₂NH₂, NHSO₂R7c, NR7cCOR7d, NHCOR7c, NR7cR7d, COR7c, CSR7c, CN, COOH, COOR7c, CONH₂, CONHR7c, CONHOR7c, CONHOH, C(NOH)NH₂, CONR7cR7d, SO₂R7c, SO₃H, SO₂NH₂, SO₂NR7cR7d, де R7c та R7d незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆

алкілу, арилу, гетероарилу, С₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R7c та R7d, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл,

де, якщо замісник в R7 являє собою гетероарил або гетероцикліл, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений одним або більше атомів кисню, або якщо

5 замісник в R7 являє собою С₁₋₆ алкіл, С₁₋₆ алкініл, арил, гетероарил, гетероцикліл, С₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, арил С₁₋₆ алкіл, гетероарил С₁₋₆ алкіл, гетероцикліл С₁₋₆ алкіл, арил С₁₋₆ алкокси, гетероарил С₁₋₆ алкокси, гетероцикліл С₁₋₆ алкокси, С₃₋₈ циклоалкіл, або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з
10 галогену, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, арил С₁₋₆ алкілу, гетероарил С₁₋₆ алкілу, гетероцикліл С₁₋₆ алкілу, С₁₋₄ алкокси, R7e, С₁₋₆ алкілу, OH, OR7e, OCOR7e, SH, SR7e, SCOR7e, NH₂, NO₂, NHR7e, NHSO₂NH₂, NHSO₂R7e, NHC(NH)NH₂, NR7eCOR7f, NHCOR7e, NR7eR7f, COR7e, CSR7e, CN, COOH, COOR7e, CONH₂, CONHOH, CONHR7e, CONHOR7e, C(NOH)NH₂, CONR7eR7f, SO₂R7e, SO₃H, SO₂NH₂, SO₂NR7eR7f, де R7e та R7f незалежно вибрані з С₁₋₆
15 алкілу, заміщеного С₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, С₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R7e та R7f, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл;

Z може являти собою N, CH або C-R8, де R8 вибраний з С₁₋₁₀ алкілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, С₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, R8a, галогену, OH, OR8a, SH, SR8a, OCOR8a, SCOR8a, NH₂, NO₂, NHR8a, NHSO₂NH₂, NHSO₂R8a, NR8aCOR8b,
20 NHCOR8a, NHC(NH)NH₂, NR8aR8b, COR8a, CSR8a, CN, COOH, COOR8a, CONH₂, CONHOH, CONHR8a, CONHOR8a, C(NOH)NH₂, CONR8aR8b, SO₂R8a, SO₃H, SO₂NH₂, SO₂NR8aR8b, де R8a та R8b незалежно вибрані з С₁₋₆ алкілу, заміщеного С₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, С₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R8a та R8b, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл,

25 де, якщо R8 являє собою С₁₋₆ алкіл, С₁₋₁₀ алкіл, арил, гетероарил, гетероцикліл, С₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, С₃₋₈ циклоалкіл, або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, R8c, С₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, С₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, арил С₁₋₆ алкілу,
30 гетероарил С₁₋₆ алкілу, гетероцикліл С₁₋₆ алкілу, арил С₁₋₆ алкокси, гетероарил С₁₋₆ алкокси, гетероцикліл С₁₋₆ алкокси, OH, OR8c, OCOR8c, SH, SR8c, SCOR8c, NH₂, NO₂, NHR8c, NHSO₂NH₂, NHSO₂R8c, NR8cCOR8d, NHCOR8c, NHC(NH)NH₂, NR8cR8d, COR8c, CSR8c, CN, COOH, COOR8c, CONH₂, CONHOH, CONHR8c, CONHOR8c, C(NOH)NH₂, CONR8cR8d, SO₂R8c, SO₃H, SO₂NH₂, SO₂NR8cR8d, де R8c та R8d незалежно вибрані з С₁₋₆ алкілу, заміщеного С₁₋₆
35 алкілу, арилу, гетероарилу, С₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R8c та R8d, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл,

де, якщо замісник в R8 являє собою С₁₋₆ алкіл, арил, гетероарил, гетероцикліл, С₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, арил С₁₋₆ алкіл, гетероарил С₁₋₆ алкіл, гетероцикліл С₁₋₆ алкіл, арил С₁₋₆ алкокси, гетероарил С₁₋₆ алкокси, гетероцикліл С₁₋₆ алкокси,
40 С₃₋₈ циклоалкіл, або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, R8e, С₁₋₆ алкілу, OH, OR8e, OCOR8e, SH, SR8e, SCOR8e, NH₂, NO₂, NHR8e, NHSO₂NH₂, NHSO₂R8e, NR8eCOR8f, NHCOR8e, NHC(NH)NH₂, NR8eR8f, COR8e, CSR8e, CN, COOH, COOR8e, CONH₂, CONHOH, CONHR8e, CONHOR8e, C(NOH)NH₂, CONR8eR8f, SO₂R8e,
45 SO₃H, SO₂NH₂, SO₂NR8eR8f, де R8e та R8f незалежно вибрані з С₁₋₆ алкілу, заміщеного С₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, С₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R8e та R8f, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл;

де, не більше двох атомів або груп, позначених X, Y та Z може являти собою N;

де, якщо W являє собою N, група CONR1R2 може бути замість цього приєднана до W, з
50 перегрупуванням подвійних зв'язків у Формулі I, відповідно;

або її фармацевтично прийнятна сіль або естер;

за умови, що якщо R1 та R2 разом утворюють піперидиніл в сполуках Формули I, піперидиніл не заміщений метилом, диметилом, етилом, ізопропілом, трет-бутилом, метоксикарбонілом, трифторметилом, хлором, бромом або бензилом,

55 за умови, що R1 та R2 разом в сполуках Формули I не утворюють 6,7-диметокси-3,4-дигідро-1H-ізохінолін-2-іл, 6-метокси-3,4-дигідро-1H-ізохінолін-2-іл, 7-метокси-3,4-дигідро-1H-ізохінолін-2-іл, 7-аміно-3,4-дигідро-1H-ізохінолін-2-іл, 7-нітро-3,4-дигідро-1H-ізохінолін-2-іл, 3,4-дигідро-1H-ізохінолін-2-іл, 3,4-дигідро-1H-ізохінолін-1-іл, 3,4-дигідро-2H-хінолін-1-іл, піролідин-1-іл, 3,6-дигідро-2H-піридин-1-іл, 8-аза-спіро[4,5]дец-8-ил, 1,3-дигідроізоіндол-2-іл, оксагідроізоіндол-2-іл,
60 1,2,6-триаза-спіро[2,5]окт-1-ен-6-іл або азепан-1-іл,

за умови, що якщо R1 або R2 являє собою незаміщений метил, інший з R1 або R2 не являє собою 4-хлорбутил, 4-азидобутил, або 4-ізотіоціанатобутил,

за умови, що кільце A в сполуках Формули I не утворює піридин, піримідин, заміщений піридин або заміщений піримідин, якщо R1 та R2, разом з N, до якого вони приєднані, утворюють піперидиніл, піперазиніл, заміщений піперидиніл або заміщений піперазиніл, та

за умови, що сполука не являє собою (4-феніл-1H-імідазол-1-іл)(4-(хінолін-2-ілметил)піперазин-1-іл)метанон.

Виявлено, що сполуки за винаходом модулюють активність ферменту гідролази амідів жирних кислот (ГАЗК). Конкретно, сполуки володіють інгібіторними властивостями по відношенню до даного ферменту та демонструють інгібування ГАЗК *in vitro* при концентрації 10 мкМ або менше. Додатково, багато з даних сполук демонструють потужне інгібування ГАЗК *in vitro* при концентрації 100 нМ або менше, а також демонструють інгібування *in vivo* в тканині центральної нервової системи та периферичній тканині. Також виявлено, що сполуки за винаходом є відносно специфічними по відношенню до ГАЗК, таким чином, що вони демонструють відносно низький ступінь інгібування інших серингідролаз, наприклад, моноацилгліцерингідролази. Вони також є відносно метаболічно стабільними та демонструють відносно високу спорідненість у відношенні ГАЗК. Це означає. Що можна очікувати досягнення відносно тривалого інгібування ГАЗК з їх допомогою.

Додатково, було виявлено, що деякі сполуки за винаходом є селективними, таким чином, що вони інгібують ГАЗК більшою мірою в тканині центральної нервової системи в порівнянні з периферичною тканиною. Інші сполуки також виявили селективність, таким чином, що вони інгібують ГАЗК більшою мірою в периферичній тканині, ніж в тканині центральної нервової системи.

Виявлено, що деякі сполуки за винаходом є особливо придатними для введення в легені суб'єкта. Було виявлено, що сполуки можуть ефективно інгібувати ГАЗК в легенях, не проникаючи до кровотоку суб'єкта. Таким чином, вони володіють локалізованим інгібувальним впливом на ГАЗК, скоріше, ніж системним ефектом.

Термін 'C_{x-y} алкіл' в даному описі позначає лінійну або розгалужену насичену вуглеводневу групу, що містить від x до y атомів вуглецю. Наприклад, C₁₋₆ алкіл позначає лінійну або розгалужену насичену вуглеводневу групу, що містить від 1 до 6 атомів вуглецю. Приклади C₁₋₆ алкільних груп включають метил, етил, н-пропіл, ізопропіл, н-бутил, ізобутил, втор-бутил, трет-бутил, н-пентил, ізопентил, неопентил та гексил. Переважно, вуглеводнева група є лінійною. Група C₁₋₁₀ алкіл переважно являє собою C₁₋₆ алкіл. Термін 'C_{x-y} алкіл' також застосовується для позначення лінійної або розгалуженої насиченої вуглеводневої групи, що містить від x до y атомів вуглецю, та в якій кінцева метильна група додатково заміщена, тобто таким чином, щоб відображувати C_{x-y} алкіленову групу.

Термін "C_{x-y} алкініл" в даному описі позначає лінійну або розгалужену вуглеводневу групу, що містить від x до y атомів вуглецю та щонайменше один потрійний вуглець-вуглецевий зв'язок. Наприклад, C₁₋₆ алкініл позначає лінійну або розгалужену вуглеводневу групу, що містить від 1 до 6 атомів вуглецю. Приклади C₁₋₆ алкінільних груп включають етиніл, метилбутиніл (наприклад, 3-метил-1-бутиніл), 1,3-бутадіїніл та 1,3,5-гексатріїніл.

Термін "арил" в даному описі позначає C₆₋₁₂ моноциклічне або біциклічне вуглеводневе кільце, де щонайменше одне кільце є ароматичним. Приклади таких груп включають феніл, нафталініл і тетрагідронафталініл.

Термін 'гетероарил' в даному описі позначає 5–6 членне моноциклічне ароматичне або конденсоване 8–10-членне біциклічне ароматичне кільце, де моноциклічне або біциклічне кільце містить від 1 до 4 гетероатомів, вибраних з кисню, азоту та сірки. Приклади таких моноциклічних ароматичних кілець включають тієніл, фурил, фураніл, піроліл, триазоліл, тетразоліл, імідазоліл, оксазоліл, тіазоліл, оксадіазоліл, ізотіазоліл, ізоксазоліл, тіадіазоліл, піраніл, піразоліл, піримідил, піридазиніл, піразиніл, піридил, триазиніл, тетразиніл, і т. п. ... Приклади таких біциклічних ароматичних кілець включають хінолініл, ізохінолініл, хіназолініл, хіноксалініл, птеридиніл, цинолініл, фталазиніл, нафтиридиніл, індолил, ізоіндолил, азаіндолил, індолізиніл, індазоліл, пуриніл, піролпіридил, фуропіридил, бензофураніл, ізобензофураніл, бензотієніл, бензоімідазоліл, бензоксазоліл, бензоізоксазоліл, бензотіазоліл, бензоізотіазоліл, бензоксадіазоліл, бензотіадіазоліл та імідазопіридил.

Термін "гетероарил, заміщений одним або більше атомів кисню" позначає гетероарильне кільце, яке містить один або більше атомів кисню, приєднаних до кільця. Це не означає, що гетероарильне кільце містить один або більше атомів кисню як атоми кільця, хоча в деяких варіантах це може мати місце. Переважно, один або більше атомів кисню приєднані до гетероатома азоту в гетероарильному кільці. Гетероарил, заміщений атомом кисню може

містити N-оксид. Прикладом гетероарилу, заміщеного одним або більше атомів кисню, є 1-оксидопіридил, в якому піридинільний атом азоту окиснений.

Термін 'гетероцикліл' позначає 3–8(переважно, 4–8- та, більш переважно, 4–7-)членне моноциклічне кільце або конденсоване 8–12-членне біциклічне кільце, яке може бути насиченим або частково ненасиченим, де моноциклічне або біциклічне кільце містить від 1 до 4 гетероатомів, вибраних з кисню, азоту, кремнію або сірки. Приклади таких моноциклічних кілець включають оксазиридиніл, оксираніл, діоксираніл, азиридиніл, піролідиніл, азетидиніл, піразолідиніл, оксазолідиніл, піперидиніл, піперазиніл, морфолініл, тіоморфолініл, тiazолідиніл, гідантоїніл, валеролактаміл, оксираніл, оксетаніл, діоксоланіл, діоксаніл, оксатіоланіл, оксатіаніл, дитіаніл, дигідрофураніл, тетрагідрофураніл, дигідропіраніл, тетрагідропіраніл, тетрагідропіридил, тетрагідропіримідиніл, тетрагідротіофеніл, тетрагідротіопіраніл, діазепаніл та азепаніл. Приклади таких біциклічних кілець включають індолініл, ізоіндолініл, бензопіраніл, хінуклідиніл, 2,3,4,5-тетрагідро-1H-3-бензазепін, 4-(бензо[d][1,3]діоксол-5-ілметил)піперазин-1-іл і тетрагідроізохінолініл.

Термін "гетероцикліл, заміщений одним або більше атомів кисню" позначає гетероциклільне кільце, що містить один або більше атомів кисню, приєднаних до кільця. Це не означає, що гетероциклільне кільце містить один або більше атомів кисню як атоми кільця, хоча в деяких варіантах це може мати місце. Переважно, один або більше атомів кисню приєднані до гетероатому, такого як азот або сірка, в гетероциклільному кільці. Прикладом гетероциклілу, заміщеного одним або більше атомів кисню, є 1,1-діоксидо-1,3-тіазолідиніл.

Терміни "біциклічне кільце" та "конденсоване в контексті біциклічного кільця" позначає два кільця, які з'єднані разом вздовж зв'язку між двома атомами (наприклад, нафталін), вперек послідовності атомів, з утворенням містка (наприклад, хінуклідин), або разом при одному і тому ж атомі, з утворенням спіросполуки (наприклад, 1,4-діокса-8-аза-спіро[4,5]декан та N, 3,3-диметил-1,5-диоксаспірол[5,5]ундекан-9-іл).

Термін ' C_{x-y} циклоалкіл' в даному описі означає насичене вуглеводневе кільце, що містить від x до y атомів вуглецю, яке може бути моно-, бі- або трициклічним. Наприклад, C_{3-10} циклоалкіл позначає насичене моно-, бі- або трициклічне вуглеводневе кільце, що містить від 3 до 10 атомів вуглецю. Приклади C_{3-10} циклоалкільних груп включають циклопропіл, циклобутил, циклопентил, циклогексил, циклогептил, циклооктил та адамантил.

Термін "арил C_{x-y} алкіл" в даному описі позначає арильну групу, як визначено вище, приєднану до C_{x-y} алкілу, як визначено вище. Наприклад, арил C_{1-6} алкіл позначає арильну групу, приєднану до лінійної або розгалуженої насиченої вуглеводневої групи, що містить від 1 до 6 атомів вуглецю. Приклади арил C_{1-6} алкільних груп включають бензил, фенілетил, фенілпропіл, фенілбутил, фенілпентил та фенілгексил.

Терміни "гетероарил C_{x-y} алкіл", "гетероцикліл C_{x-y} алкіл" та " C_{x-y} циклоалкіл C_{x-y} алкіл" в даному описі позначають гетероарильну, гетероциклільну або C_{x-y} циклоалкільну групу, як визначено вище, приєднану до C_{x-y} алкілу, як визначено вище.

Термін ' C_{x-y} алкокси' в даному описі позначає -O- C_{x-y} алкільну групу, де C_{x-y} алкіл є таким, як визначено вище. Приклади таких груп включають метокси, етокси, пропокси, бутокси, пентокси та гексокси.

Термін 'арилокси' в даному описі позначає -O-арильну групу. Приклади таких груп включають фенокси. Терміни "гетероарилокси" та "гетероциклілокси" в даному описі посилаються на групи -O-гетероарил та -O-гетероцикліл, відповідно.

Термін 'галоген' в даному описі позначає атом фтору, хлору, броду або йоду, якщо не вказано інше.

Термін " C_{x-y} алкіламіно" в даному описі позначає вторинну аміногрупу (-NH(R)), в якій група R вибрана з лінійних або розгалужених насичених вуглеводневих груп, що містять від x до y атомів вуглецю. Приклади груп C_{x-y} алкіламіно включають метиламіно, етиламіно та пропіламіно.

Термін " C_{x-y} діалкіламіно" в даному описі позначає третинну аміногрупу (-NR(R*)), в якій кожна з груп R та R* незалежно вибрана з лінійних або розгалужених насичених вуглеводневих груп, що містять від x до y атомів вуглецю. Приклади груп C_{x-y} діалкіламіно включають диметиламіно, метилетиламіно та діетиламіно.

Термін "заміщений C_{1-6} алкіл" в даному описі застосовується з посиланням на ідентичність різноманітних груп, ідентифікованих як R (наприклад, у виразі "де R8e та R8f незалежно вибрані з C_{1-6} алкілу, заміщеного C_{1-6} алкілу, арилу, гетероарилу, C_{3-8} циклоалкілу та гетероциклілу"), та позначає, що конкретна група R (наприклад, R1a, R2c, R4d, R5e, тощо) може бути заміщена однією або більше груп, вибраних з R', галогену, OH, OR', SH, SR', OCOR', SCOR', NH₂, NO₂, NHR', NHSO₂NH₂, NHSO₂R', NR'COR'', NHC(NH)NH₂, NHCOR', NR'R'', COR', CSR', CN, COOH,

COOR', CONH₂, CONHOH, CONHR', CONR'R'', CONHOR', C(NOH)NH₂, SO₂R', SO₃H, SO₂NH₂, SO₂NR'R'', де R' та R'' незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R' та R'', разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероциклілу.

5 "Фармацевтично прийнятні солі сполук за даним винаходом включають солі з неорганічними основами, солі з органічними основами, солі з неорганічними кислотами, солі з органічними кислотами і солі з основними або кислотними амінокислотами. Солі з кислотами, можуть, зокрема, використовуватися в деяких випадках. Приклади солей включають сіль гідрохлорид, сіль ацетат, сіль трифторацетат, сіль метансульфонат, сіль 2-гідроксипропан-1,2,3-10 трикарбоксилат, сіль (2R, 3R)-2,3-дигідроксисукцинат, сіль фосфат і сіль оксалат. Сполука за даним винаходом може існувати у формі сольовату (наприклад, гідрату), або несольватованій формі (наприклад, не гідратній). У випадку форми сольовату, додаткові розчинники можуть являти собою спирти, такі як пропан-2-ол.

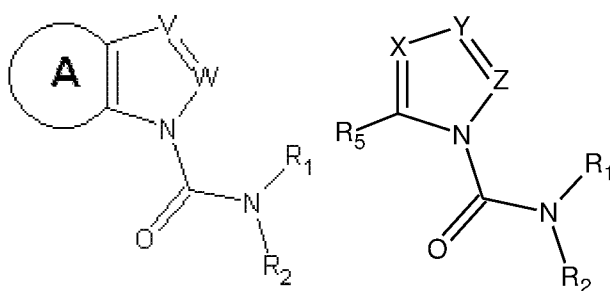
15 "Фармацевтично прийнятні ефіри сполук за винаходом" — це похідні, в яких одна або більше карбоксильних груп (тобто -C(O)OH) у вказаних сполуках модифіковані реакцією із спиртовим фрагментом U-OH з утворенням групи -C(O)OU, де U може являти собою C₁₋₁₈ алкіл (наприклад, C₁₋₆ алкіл), арил, гетероарил, C₃₋₈ циклоалкіл або їх комбінації.

20 Загальні способи одержання солей і естерів добре відомі фахівцю в даній галузі. Фармацевтична прийнятність солей і естерів буде залежати від різноманітних факторів, в тому числі характеристики обробки препарату та поведінку in vivo, і фахівець в даній галузі легко може оцінити такі фактори з урахуванням даного розкриття.

25 Якщо сполуки за винаходом існують в різноманітних енантіомерних та/або діастереомерних форми (в тому числі, геометрична ізомерія подвійного зв'язку), вказані сполуки можуть бути одержані як ізомерні суміші або рацемати, хоча винахід стосується всіх таких енантіомерів або ізомерів, присутніх в оптично чистій формі або у вигляді суміші з іншими ізомерами. Індивідуальні енантіомери або ізомери можуть бути одержані за способами, відомими з рівня техніки, такими як оптичне розділення продуктів або проміжних сполук (наприклад, хіральне хроматографічне розділення (наприклад, хіральна ВЕРХ)), або підхід енантіомерного синтезу. Так само, якщо сполуки за винаходом можуть існувати, як альтернативні таутомерні форми 30 (наприклад, кето/енольні, амід/імідна кислота), винахід стосується індивідуальних таутомерів окремо, а також сумішей таутомерів у всіх пропорціях.

У сполуках Формули II, 0, 1 або 2 атоми або групи, позначені X, Y та Z, можуть являти собою N.

35 В конкретному варіанті формула сполуки за винаходом вибрана з Формули I або Формули II:



Формула I Формула II

де:

40 кожен з R1 та R2 може бути незалежно вибраний з H, C₁₋₂₀ алкілу, алкокси, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₃₋₁₀ циклоалкілу, арил C₁₋₆ алкілу, гетероарил C₁₋₆ алкілу, гетероциклілу C₁₋₆ алкілу та C₃₋₁₀ циклоалкіл C₁₋₆ алкілу, кожен з яких, за винятком H, необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, 45 арил C₁₋₆ алкілу, гетероарил C₁₋₆ алкілу, гетероциклілу C₁₋₆ алкілу, арил C₁₋₆ алкокси, гетероарил C₁₋₆ алкокси, гетероциклілу C₁₋₆ алкокси, аміно, C₁₋₆ алкіламіно та C₁₋₆ діалкіламіно, за винятком того, що R1 та R2 не являють собою обидва H, або

50 R1 та R2, разом з N, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероарильну або гетероциклільную групу, кожна з яких необов'язково може бути заміщена однією або більше груп, вибраних з гідрокси, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₃₋₈ циклоалкілу, C₁₋₆ алкілу, арил C₁₋₆ алкілу, гетероарил C₁₋₆ алкілу, гетероциклілу C₁₋₆ алкілу, C₃₋₈ циклоалкіл C₁₋₆ алкілу, C₁₋₆ алкокси,

арилокси, гетероарилокси та гетероциклілокси, кожен з яких необов'язково може бути заміщений групою, вибраною з галогену, гідроксилу, C₁₋₄ алкілу, арилу, гетероарилу, C₁₋₄ алкокси, арилокси, гетероарилокси, арил C₁₋₄ алкокси та гетероарил C₁₋₄ алкокси, кожен з яких, за винятком галогену та гідроксилу, необов'язково може бути заміщений C₁₋₄ алкокси;

5 кільце A вибране з арилу, гетероарильного та гетероциклільного фрагментів, кожен з яких необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, гідроксилу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси та гетероциклілокси, кожен з яких, за винятком галогену та гідроксилу, необов'язково може бути заміщений галогеном, ціано, амідом та карбоною кислотою;

10 V може являти собою N, CH або C-R3, де R3 являє собою галоген, арил, гетероарил, гетероциклілу або C₃₋₈ циклоалкіл, кожен з яких, за винятком галогену, необов'язково може бути заміщений галогеном;

W може являти собою N, CH або C-R4, де R4 являє собою C₁₋₁₀ алкіл, арил, гетероарил, гетероциклілу або C₃₋₈ циклоалкіл, кожен з яких необов'язково може бути заміщений галогеном;

15 R5 вибраний з H, C₁₋₆ алкіл, арил, гетероарил, гетероциклілу та C₃₋₈ циклоалкіл, кожен з яких, за винятком H, необов'язково може бути заміщений галогеном;

X може являти собою N, CH або C-R6, де R6 вибраний з C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу та гетероциклілу, кожен з яких, за винятком H, необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, гідроксилу, аміну, амід, ціано, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, арил C₁₋₆ алкілу, гетероарил C₁₋₆ алкілу, гетероциклілу C₁₋₆ алкілу, арил C₁₋₆ алкокси, гетероарил C₁₋₆ алкокси та гетероциклілу C₁₋₆ алкокси;

20 Y може являти собою N, CH або C-R7, де R7 вибраний з C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу та гетероциклілу, кожен з яких, за винятком H, необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, арил C₁₋₆ алкілу, гетероарил C₁₋₆ алкілу, гетероциклілу C₁₋₆ алкілу, арил C₁₋₆ алкокси, гетероарил C₁₋₆ алкокси та гетероциклілу C₁₋₆ алкокси, кожен з яких необов'язково може бути заміщений C₁₋₄ алкілом, ціано, аміном, амід, галогеном, арилом, гетероарилом, гетероциклілом, арил C₁₋₆ алкілом, гетероарил C₁₋₆ алкілом та гетероциклілу C₁₋₆ алкілом;

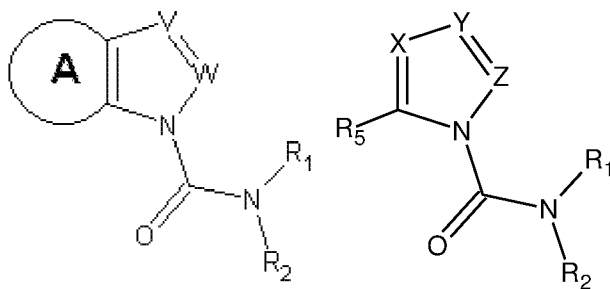
Z може являти собою N, CH або C-R8, де R8 вибраний з C₁₋₁₀ алкілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу або C₃₋₈ циклоалкілу, кожен з яких необов'язково може бути заміщений галогеном;

або її фармацевтично прийнятної солі або естеру;

35 за умови, що якщо R1 та R2 разом утворюють піперидиніл в сполуках Формули I, піперидиніл не заміщений метилом, диметилом, етилом, ізопропілом, трет-бутилом, трифторметилом, хлором, бромом або бензилом.

У відповідності до іншого варіанту винаходу запропонована сполука Формули I або Формули II:

40



Формула I Формула II

де:

45 кожен з R1 та R2 може бути незалежно вибраний з H, C₁₋₂₀ алкілу, алкокси, арилу, гетероарилу, частково або повністю насиченого гетероциклілу, C₃₋₁₀ циклоалкілу, арил C₁₋₆ алкілу, гетероарил C₁₋₆ алкілу, гетероциклілу C₁₋₆ алкілу, C₃₋₁₀ циклоалкіл C₁₋₆ алкілу, R1a, галогену, OH, OR1a, SH, SR1a, OCOR1a, SCOR1a, NH₂, NHR1a, NR1aR1b, COR1a, CSR1a, CN, COOH, COOR1a, CONH₂, SO₂R1a, SO₃H, SO₂NH₂, CONR1aR1b, SO₂NR1aR1b, де R1a та R1b незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, і R1a та R1b, разом із суміжним гетероатомом, можуть утворювати гетероциклілу,

50

де, якщо R1 або R2 являє собою C₁₋₂₀ алкіл, алкокси, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₃₋₁₀ циклоалкіл, арил C₁₋₆ алкіл, гетероарил C₁₋₆ алкіл, гетероцикліл C₁₋₆ алкіл, C₃₋₁₀ циклоалкіл C₁₋₆ алкіл, C₁₋₆ алкіл, C₃₋₈ циклоалкіл або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений R1c, галогеном, C₁₋₆ алкілом, арилом, гетероарилом, гетероциклілом, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, арил C₁₋₆ алкілом, гетероарил C₁₋₆ алкілом, гетероцикліл C₁₋₆ алкілом, арил C₁₋₆ алкокси, гетероарил C₁₋₆ алкокси, гетероцикліл C₁₋₆ алкокси, C₁₋₆ алкіламіно, C₁₋₆ діалкіламіно, C₁₋₁₀ алкілом, OH, OR1c, OCOR1c, SH, SR1c, SCOR1c, NH₂, NHR1c, NR1cR1d, COR1c, CSR1c, CN, COOH, COOR1c, CONH₂, SO₂R1c, SO₃H, SO₂NH₂, CONR1cR1d, SO₂NR1cR1d, де R1c та R1d незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, і R1c та R1d, разом із суміжним гетероатомом, можуть утворювати гетероцикліл,

де, якщо замісник в R1 або R2 являє собою C₁₋₁₀ алкіл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, арил C₁₋₆ алкіл, гетероарил C₁₋₆ алкіл, гетероцикліл C₁₋₆ алкіл, арил C₁₋₆ алкокси, гетероарил C₁₋₆ алкокси, гетероцикліл C₁₋₆ алкокси, C₁₋₆ алкіламіно, C₁₋₆ діалкіламіно, C₁₋₆ алкіл, C₃₋₈ циклоалкіл або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений з R1e, C₁₋₁₀ алкіл, OH, OR1e, OCOR1e, SH, SR1e, SCOR1e, NH₂, NHR1e, NR1eR1f, COR1e, CSR1e, CN, COOH, COOR1e, CONH₂, SO₂R1e, SO₃H, SO₂NH₂, CONR1eR1f, SO₂NR1eR1f, де R1e та R1f незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, і R1e та R1f, разом із суміжним гетероатомом, можуть утворювати гетероцикліл, за винятком того, що R1 та R2 не являють собою обидва H, або

R1 та R2, разом з N, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероарильну або гетероциклільну групу, кожна з яких необов'язково може бути заміщена однією або більше груп, вибраних з гідрокси, арилу, гетероарилу, частково або повністю насиченого гетероциклілу, C₃₋₈ циклоалкілу, C₁₋₆ алкілу, арил C₁₋₆ алкілу, гетероарил C₁₋₆ алкілу, гетероцикліл C₁₋₆ алкілу, C₃₋₈ циклоалкіл C₁₋₆ алкілу, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, R2a, галогену, OH, OR2a, SH, SR2a, OCOR2a, SCOR2a, NH₂, NHR2a, NR2aR2b, COR2a, CSR2a, CN, COOH, COOR2a, CONH₂, SO₂R2a, SO₃H, SO₂NH₂, CONR2aR2b, SO₂NR2aR2b, де R2a та R2b незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, і R2a та R2b, разом із суміжним гетероатомом, можуть утворювати гетероцикліл,

де, якщо замісник в гетероарилі або гетероциклілі, утворений R1 та R2 разом, являє собою арил, гетероарил, гетероцикліл, C₃₋₈ циклоалкіл, C₁₋₆ алкіл, арил C₁₋₆ алкіл, гетероарил C₁₋₆ алкіл, гетероцикліл C₁₋₆ алкіл, C₃₋₈ циклоалкіл C₁₋₆ алкіл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, або групи що містить один або більше із вказаних фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений групою, вибраною з галогену, гідроксилу, C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₃₋₈ циклоалкілу, C₁₋₄ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, C₃₋₈ циклоалкілокси, арил C₁₋₄ алкокси, гетероарил C₁₋₄ алкокси, гетероцикліл C₁₋₄ алкокси, C₃₋₈ циклоалкіл C₁₋₄ алкокси, R2c, OR2c, SH, SR2c, OCOR2c, SCOR2c, NH₂, NHR2c, NR2cR2d, COR2c, CSR2c, CN, COOH, COOR2c, CONH₂, SO₂R2c, SO₃H, SO₂NH₂, CONR2cR2d, SO₂NR2cR2d, де R2c та R2d незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, і R2c та R2d, разом із суміжним гетероатомом, можуть утворювати гетероцикліл,

де, якщо замісник в заміснику в гетероарилі або гетероциклілі, що складається з R1 та R2 разом, являє собою C₁₋₄ алкіл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₃₋₈ циклоалкіл, C₁₋₄ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, C₃₋₈ циклоалкілокси, арил C₁₋₄ алкокси, гетероарил C₁₋₄ алкокси, гетероцикліл C₁₋₄ алкокси, C₃₋₈ циклоалкіл C₁₋₄ алкокси, або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений C₁₋₄ алкокси, R2e, галогеном, OH, OR2e, SH, SR2e, OCOR2e, SCOR2e, NH₂, NHR2e, NR2eR2f, COR2e, CSR2e, CN, COOH, COOR2e, CONH₂, SO₂R2e, SO₃H, SO₂NH₂, CONR2eR2f, SO₂NR2eR2f, де R2e та R2f незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, і R2e та R2f, разом із суміжним гетероатомом, можуть утворювати гетероцикліл;

кільце A вибране з арильних, гетероарильних та гетероциклільних фрагмент, кожен з яких необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, C₁₋₆ алкілу, гідроксилу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, Ra, C₁₋₁₀ алкілу, OH, ORa, OCORa, SH, SRa, SCORa, NH₂, NHRa, NRaRb, CORa, CSRa, CN, COOH, COORa, CONH₂, SO₂Ra, SO₃H, SO₂NH₂, CONRaRb, SO₂NRaRb, де Ra та Rb незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, і Ra та Rb, разом із суміжним гетероатомом, можуть утворювати гетероцикліл,

де, якщо кільце A заміщене C₁₋₆ алкіл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₁₋₆ алкокси,

арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, C₁₋₁₀ алкіл, C₃₋₈ циклоалкіл або заміщене групою, що містить один або більше із вказаних фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений Rc, C₁₋₁₀ алкілом, OH, ORc, OCORc, SH, SRc, SCORc, NH₂, NHRc, NRcRd, CORc, CSRc, CN, COOH, COORc, CONH₂, SO₂Rc, SO₃H, SO₂NH₂, CONRcRd, SO₂NRcRd, де Rc та Rd незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, і Rc та Rd, разом із суміжним гетероатомом, можуть утворювати гетероцикліл;

V може являти собою N, CH або C-R3, де R3 являє собою галоген, C₁₋₁₀ алкіл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₃₋₈ циклоалкіл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, R3a, OH, OR3a, SH, SR3a, OCOR3a, SCOR3a, NH₂, NHR3a, NR3aR3b, COR3a, CSR3a, CN, COOH, COOR3a, CONH₂, SO₂R3a, SO₃H, SO₂NH₂, CONR3aR3b, SO₂NR3aR3b, де R3a та R3b незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, і R3a та R3b, разом із суміжним гетероатомом, можуть утворювати гетероцикліл,

де, якщо R3 являє собою C₁₋₁₀ алкіл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, C₁₋₆ алкіл, C₃₋₈ циклоалкіл, або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений арилом, гетероарилом, гетероциклілом, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, R3c, C₁₋₁₀ алкілом, OH, OR3c, OCOR3c, SH, SR3c, SCOR3c, NH₂, NHR3c, NR3cR3d, COR3c, CSR3c, CN, COOH, COOR3c, CONH₂, SO₂R3c, SO₃H, SO₂NH₂, CONR3cR3d, SO₂NR3cR3d, де R3c та R3d незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, і R3c та R3d, разом із суміжним гетероатомом, можуть утворювати гетероцикліл,

де, якщо замісник в R3 являє собою C₁₋₁₀ алкіл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, C₁₋₆ алкіл, C₃₋₈ циклоалкіл, або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений R3e, C₁₋₁₀ алкілом, OH, OR3e, OCOR3e, SH, SR3e, SCOR3e, NH₂, NHR3e, NR3eR3f, COR3e, CSR3e, CN, COOH, COOR3e, CONH₂, SO₂R3e, SO₃H, SO₂NH₂, CONR3eR3f, SO₂NR3eR3f, де R3e та R3f незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, і R3e та R3f, разом із суміжним гетероатомом, можуть утворювати гетероцикліл,

W може являти собою N, CH або C-R4, де R4 являє собою галоген, C₁₋₁₀ алкіл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, C₃₋₈ циклоалкіл, R4a, OH, OR4a, SH, SR4a, OCOR4a, SCOR4a, NH₂, NHR4a, NR4aR4b, COR4a, CSR4a, CN, COOH, COOR4a, CONH₂, SO₂R4a, SO₃H, SO₂NH₂, CONR4aR4b, SO₂NR4aR4b, де R4a та R4b незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, і R4a та R4b, разом із суміжним гетероатомом, можуть утворювати гетероцикліл,

де, якщо R4 являє собою C₁₋₁₀ алкіл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, C₁₋₆ алкіл, C₃₋₈ циклоалкіл, або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений арилом, гетероарилом, гетероциклілом, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, R4c, C₁₋₁₀ алкілом, OH, OR4c, OCOR4c, SH, SR4c, SCOR4c, NH₂, NHR4c, NR4cR4d, COR4c, CSR4c, CN, COOH, COOR4c, CONH₂, SO₂R4c, SO₃H, SO₂NH₂, CONR4cR4d, SO₂NR4cR4d, де R4c та R4d незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, і R4c та R4d, разом із суміжним гетероатомом, можуть утворювати гетероцикліл,

де, якщо замісник в R4 являє собою C₁₋₁₀ алкіл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, C₁₋₆ алкіл, C₃₋₈ циклоалкіл, або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений R4e, C₁₋₁₀ алкілом, OH, OR4e, OCOR4e, SH, SR4e, SCOR4e, NH₂, NHR4e, NR4eR4f, COR4e, CSR4e, CN, COOH, COOR4e, CONH₂, SO₂R4e, SO₃H, SO₂NH₂, CONR4eR4f, SO₂NR4eR4f, де R4e та R4f незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, і R4e та R4f, разом із суміжним гетероатомом, можуть утворювати гетероцикліл,

R5 вибраний з H, C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₃₋₈ циклоалкілу, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, R5a, галогену, OH, OR5a, SH, SR5a, OCOR5a, SCOR5a, NH₂, NHR5a, NR5aR5b, COR5a, CSR5a, CN, COOH, COOR5a, CONH₂, SO₂R5a, SO₃H, SO₂NH₂, CONR5aR5b, SO₂NR5aR5b, де R5a та R5b незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, і R5a та R5b, разом із суміжним гетероатомом, можуть утворювати гетероцикліл,

де, якщо R5 являє собою C₁₋₆ алкіл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, C₁₋₆ алкіл, C₃₋₈ циклоалкіл, або являє собою групу, що містить

один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений арилом, гетероарилом, гетероциклілом, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, R5c, C₁₋₆ алкіл, OH, OR5c, OCOR5c, SH, SR5c, SCOR5c, NH₂, NHR5c, NR5cR5d, COR5c, CSR5c, CN, COOH, COOR5c, CONH₂, SO₂R5c, SO₃H, SO₂NH₂, CONR5cR5d, SO₂NR5cR5d, де R5c та R5d незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, і R5c та R5d, разом із суміжним гетероатомом, можуть утворювати гетероцикліл,

де, якщо замісник в R5 являє собою C₁₋₆ алкіл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, C₃₋₈ циклоалкіл, або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений R5e, C₁₋₆ алкілом, OH, OR5e, OCOR5e, SH, SR5e, SCOR5e, NH₂, NHR5e, NR5eR5f, COR5e, CSR5e, CN, COOH, COOR5e, CONH₂, SO₂R5e, SO₃H, SO₂NH₂, CONR5eR5f, SO₂NR5eR5f, де R5e та R5f незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, і R5e та R5f, разом із суміжним гетероатомом, можуть утворювати гетероцикліл,

X може являти собою N, CH або C-R6, де R6 вибраний з C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, R6a, галогену, OH, OR6a, SH, SR6a, OCOR6a, SCOR6a, NH₂, NHR6a, NR6aR6b, COR6a, CSR6a, CN, COOH, COOR6a, CONH₂, SO₂R6a, SO₃H, SO₂NH₂, CONR6aR6b, SO₂NR6aR6b, де R6a та R6b незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, і R6a та R6b, разом із суміжним гетероатомом, можуть утворювати гетероцикліл,

де, якщо R6 являє собою C₁₋₆ алкіл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, C₃₋₈ циклоалкіл, або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений R6c, C₁₋₆ алкілом, арилом, гетероарилом, гетероциклілом, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, арил C₁₋₆ алкілом, гетероарил C₁₋₆ алкілом, гетероцикліл C₁₋₆ алкілом, арил C₁₋₆ алкокси, гетероарил C₁₋₆ алкокси, гетероцикліл C₁₋₆ алкокси, OH, OR6c, OCOR6c, SH, SR6c, SCOR6c, NH₂, NHR6c, NR6cR6d, COR6c, CSR6c, CN, COOH, COOR6c, CONH₂, SO₂R6c, SO₃H, SO₂NH₂, CONR6cR6d, SO₂NR6cR6d, де R6c та R6d незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, і R6c та R6d, разом із суміжним гетероатомом, можуть утворювати гетероцикліл,

де, якщо замісник в R6 являє собою C₁₋₆ алкіл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, арил C₁₋₆ алкіл, гетероарил C₁₋₆ алкіл, гетероцикліл C₁₋₆ алкіл, арил C₁₋₆ алкокси, гетероарил C₁₋₆ алкокси, гетероцикліл C₁₋₆ алкокси, C₃₋₈ циклоалкіл, або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений R6e, C₁₋₆ алкілом, OH, OR6e, OCOR6e, SH, SR6e, SCOR6e, NH₂, NHR6e, NR6eR6f, COR6e, CSR6e, CN, COOH, COOR6e, CONH₂, SO₂R6e, SO₃H, SO₂NH₂, CONR6eR6f, SO₂NR6eR6f, де R6e та R6f незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, і R6e та R6f, разом із суміжним гетероатомом, можуть утворювати гетероцикліл,

Y може являти собою N, CH або C-R7, де R7 вибраний з C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, R7a, галогену, OH, OR7a, SH, SR7a, OCOR7a, SCOR7a, NH₂, NHR7a, NR7aR7b, COR7a, CSR7a, CN, COOH, COOR7a, CONH₂, SO₂R7a, SO₃H, SO₂NH₂, CONR7aR7b, SO₂NR7aR7b, де R7a та R7b незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, і R7a та R7b, разом із суміжним гетероатомом, можуть утворювати гетероцикліл,

де, якщо R7 являє собою C₁₋₆ алкіл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, C₃₋₈ циклоалкіл або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений R7c, C₁₋₆ алкілом, арилом, гетероарилом, гетероцикліл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, арил C₁₋₆ алкілом, гетероарил C₁₋₆ алкілом, гетероцикліл C₁₋₆ алкілом, арил C₁₋₆ алкокси, гетероарил C₁₋₆ алкокси, гетероцикліл C₁₋₆ алкокси, OH, OR7c, OCOR7c, SH, SR7c, SCOR7c, NH₂, NHR7c, NR7cR7d, COR7c, CSR7c, CN, COOH, COOR7c, CONH₂, SO₂R7c, SO₃H, SO₂NH₂, CONR7cR7d, SO₂NR7cR7d, де R7c та R7d незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, і R7c та R7d, разом із суміжним гетероатомом, можуть утворювати гетероцикліл,

де, якщо замісник в R7 являє собою C₁₋₆ алкіл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, арил C₁₋₆ алкіл, гетероарил C₁₋₆ алкіл, гетероцикліл C₁₋₆ алкіл, арил C₁₋₆ алкокси, гетероарил C₁₋₆ алкокси, гетероцикліл C₁₋₆ алкокси, C₃₋₈ циклоалкіл, або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із

вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений R7e, C₁₋₆ алкілом, OH, OR7e, OCOR7e, SH, SR7e, SCOR7e, NH₂, NHR7e, NR7eR7f, COR7e, CSR7e, CN, COOH, COOR7e, CONH₂, SO₂R7e, SO₃H, SO₂NH₂, CONR7eR7f, SO₂NR7eR7f, де R7e та R7f незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, і R7e та R7f, разом із суміжним гетероатомом, можуть утворювати гетероцикліл,

Z може являти собою N, CH або C-R8, де R8 вибраний з C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, R8a, галогену, OH, OR8a, SH, SR8a, OCOR8a, SCOR8a, NH₂, NHR8a, NR8aR8b, COR8a, CSR8a, CN, COOH, COOR8a, CONH₂, SO₂R8a, SO₃H, SO₂NH₂, CONR8aR8b, SO₂NR8aR8b, де R8a та R8b незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, і R8a та R8b, разом із суміжним гетероатомом, можуть утворювати гетероцикліл,

де, якщо R8 являє собою C₁₋₆ алкіл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, C₃₋₈ циклоалкіл, або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений R8c, C₁₋₆ алкілом, арилом, гетероарилом, гетероциклілом, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, арил C₁₋₆ алкілом, гетероарил C₁₋₆ алкілом, гетероцикліл C₁₋₆ алкілом, арил C₁₋₆ алкокси, гетероарил C₁₋₆ алкокси, гетероцикліл C₁₋₆ алкокси, OH, OR8c, OCOR8c, SH, SR8c, SCOR8c, NH₂, NHR8c, NR8cR8d, COR8c, CSR8c, CN, COOH, COOR8c, CONH₂, SO₂R8c, SO₃H, SO₂NH₂, CONR8cR8d, SO₂NR8cR8d, де R8c та R8d незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, і R8c та R8d, разом із суміжним гетероатомом, можуть утворювати гетероцикліл,

де, якщо замісник в R8 являє собою C₁₋₆ алкіл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, арил C₁₋₆ алкіл, гетероарил C₁₋₆ алкіл, гетероцикліл C₁₋₆ алкіл, арил C₁₋₆ алкокси, гетероарил C₁₋₆ алкокси, гетероцикліл C₁₋₆ алкокси, C₃₋₈ циклоалкіл, або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений R8e, C₁₋₆ алкілу, OH, OR8e, OCOR8e, SH, SR8e, SCOR8e, NH₂, NHR8e, NR8eR8f, COR8e, CSR8e, CN, COOH, COOR8e, CONH₂, SO₂R8e, SO₃H, SO₂NH₂, CONR8eR8f, SO₂NR8eR8f, де R8e та R8f незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, і R8e та R8f, разом із суміжним гетероатомом, можуть утворювати гетероцикліл;

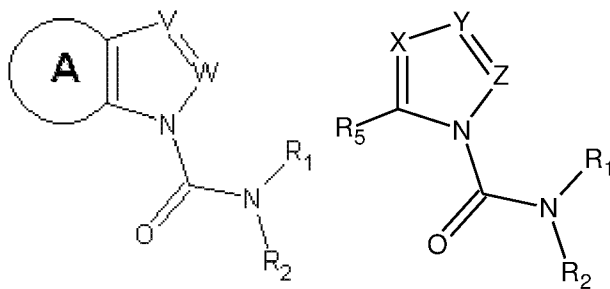
або її фармацевтично прийнятної солі або естеру;

за умови, що якщо R1 та R2 разом утворюють піперидиніл в сполуках Формули I, піперидиніл не заміщений метилом, диметилом, етилом, ізопропілом, трет-бутилом, трифторметилом, хлором, бромом або бензилом,

за умови, що R1 та R2 разом в сполуках Формули I не утворюють 6,7-диметокси-3,4-дигідро-1H-ізохінолін-2-іл, 6-метокси-3,4-дигідро-1H-ізохінолін-2-іл, 7-метокси-3,4-дигідро-1H-ізохінолін-2-іл, 7-аміно-3,4-дигідро-1H-ізохінолін-2-іл, 7-нітро-3,4-дигідро-1H-ізохінолін-2-іл, 3,4-дигідро-1H-ізохінолін-2-іл, 3,4-дигідро-1H-ізохінолін-1-іл, 3,4-дигідро-2H-хінолін-1-іл, піролідин-1-іл, 3,6-дигідро-2H-піридин-1-іл, 8-аза-спіро[4,5]дец-8-ил, 1,3-дигідроізоіндол-2-іл, оксагідроізоіндол-2-іл, 1,2,6-триаза-спіро[2,5]окт-1-ен-6-іл або азепан-1-іл, та

за умови, що кільце A в сполуках Формули I не утворює піридин, піразин, заміщений піридин або заміщений піразин, якщо R1 та R2, разом з N, до якого вони приєднані, утворюють піперидиніл, піперазиніл, заміщений піперидиніл або заміщений піперазиніл.

У відповідності до додаткового варіанту за винаходом, запропонована сполука Формули I або Формули II:



Формула I Формула II

де:

кожен з R1 та R2 може бути незалежно вибраний з H, C₁₋₂₀ алкілу, C₁₋₆ алкокси, арилу,

гетероарилу, частково або повністю насиченого гетероциклілу, C₃₋₁₀ циклоалкілу, арил C₁₋₆ алкілу, гетероарил C₁₋₆ алкілу, гетероциклі C₁₋₆ алкілу, C₃₋₁₀ циклоалкіл C₁₋₆ алкілу, R1a, галогену, OH, OR1a, SH, SR1a, OCOR1a, SCOR1a, NH₂, NHR1a, NR1aR1b, COR1a, CSR1a, CN, COOH, COOR1a, CONH₂, SO₂R1a, SO₃H, SO₂NH₂, CONR1aR1b, SO₂NR1aR1b, де R1a та R1b
 5 незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R1a та R1b, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероциклілу,

де, якщо R1 або R2 являє собою C₁₋₂₀ алкіл, алкокси, арил, гетероарил, гетероциклілу, C₃₋₁₀ циклоалкіл, арил C₁₋₆ алкіл, гетероарил C₁₋₆ алкіл, гетероциклі C₁₋₆ алкіл, C₃₋₁₀ циклоалкіл C₁₋₆
 10 алкіл, C₁₋₆ алкіл, C₃₋₈ циклоалкіл або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з R1c, галогену, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, арил C₁₋₆ алкілу, гетероарил C₁₋₆ алкілу, гетероциклі C₁₋₆ алкілу, арил C₁₋₆ алкокси, гетероарил C₁₋₆ алкокси, гетероциклі C₁₋₆ алкокси,
 15 C₁₋₆ алкіламіно, C₁₋₆ діалкіламіно, C₁₋₁₀ алкілу, OH, OR1c, OCOR1c, SH, SR1c, SCOR1c, NH₂, NO₂, NHR1c, NR1cR1d, COR1c, CSR1c, CN, COOH, COOR1c, CONH₂, SO₂R1c, SO₃H, SO₂NH₂, CONR1cR1d, SO₂NR1cR1d, де R1c та R1d незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R1c та R1d, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероциклілу,

де, якщо замісник в R1 або R2 являє собою C₁₋₁₀ алкіл, арил, гетероарил, гетероциклілу, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, арил C₁₋₆ алкіл, гетероарил C₁₋₆ алкіл, гетероциклі C₁₋₆ алкіл, арил C₁₋₆ алкокси, гетероарил C₁₋₆ алкокси, гетероциклі C₁₋₆ алкокси,
 20 C₁₋₆ алкіламіно, C₁₋₆ діалкіламіно, C₁₋₆ алкіл, C₃₋₈ циклоалкіл або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з R1e, галогену, C₁₋₁₀ алкілу, OH, OR1e, OCOR1e, SH, SR1e, SCOR1e, NH₂, NO₂, NHR1e, NR1eR1f, COR1e, CSR1e, CN, COOH, COOR1e, CONH₂, SO₂R1e, SO₃H, SO₂NH₂, CONR1eR1f, SO₂NR1eR1f, де R1e та R1f незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщений C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R1e та R1f, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероциклілу,

за винятком того, що R1 та R2 не являють собою обидва H,
 або

R1 та R2, разом з N, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероарильну або гетероциклільну групу, кожна з яких необов'язково може бути заміщена одним або більше атомами кисню або однією або більше груп, вибраних з гідрокси, арилу, гетероарилу, частково
 35 або повністю насиченого гетероциклілу, C₃₋₈ циклоалкілу, C₁₋₆ алкілу, арил C₁₋₆ алкілу, гетероарил C₁₋₆ алкілу, гетероциклі C₁₋₆ алкілу, C₃₋₈ циклоалкіл C₁₋₆ алкілу, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, R2a, галогену, OH, OR2a, SH, SR2a, OCOR2a, SCOR2a, NH₂, NO₂, NHR2a, NR2aR2b, COR2a, CSR2a, CN, COOH, COOR2a, CONH₂, SO₂R2a, SO₃H, SO₂NH₂, CONR2aR2b, SO₂NR2aR2b, де R2a та R2b незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу,
 40 заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R2a та R2b, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероциклілу,

де, якщо замісник в гетероарилі або гетероциклілі, утворений R1 та R2 разом, являє собою арил, гетероарил, гетероциклілу, C₃₋₈ циклоалкіл, C₁₋₆ алкіл, арил C₁₋₆ алкіл, гетероарил C₁₋₆ алкіл, гетероциклі C₁₋₆ алкіл, C₃₋₈ циклоалкіл C₁₋₆ алкіл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси,
 45 гетероциклілокси, або групу, що містить один або більше із вказаних фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, гідроксилу, C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₃₋₈ циклоалкілу, C₁₋₄ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, C₃₋₈ циклоалкілокси, арил C₁₋₄ алкокси, гетероарил C₁₋₆ алкокси, гетероциклі C₁₋₄ алкокси, C₃₋₈ циклоалкіл C₁₋₄ алкокси, R2c, OR2c, SH, SR2c, OCOR2c, SCOR2c, NH₂, NO₂, NHR2c, NR2cR2d, COR2c, CSR2c, CN, COOH, COOR2c, CONH₂, SO₂R2c, SO₃H, SO₂NH₂, CONR2cR2d, SO₂NR2cR2d, де R2c та R2d незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R2c та R2d, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероциклілу,

де, якщо замісник в заміснику в гетероарилі або гетероциклілі, утворений R1 та R2 разом, являє собою C₁₋₆ алкіл, арил, гетероарил, гетероциклілу, C₃₋₈ циклоалкіл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, C₃₋₈ циклоалкілокси, арил C₁₋₄ алкокси, гетероарил C₁₋₄ алкокси, гетероциклі C₁₋₄ алкокси, C₃₋₈ циклоалкіл C₁₋₄ алкокси, або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може
 60 бути заміщений однією або більше груп, вибраних з C₁₋₄ алкокси, R2e, галогену, OH, OR2e, SH, SR2e, OCOR2e, SCOR2e, NH₂, NO₂, NHR2e, NR2eR2f, NHCOR2e, COR2e, CSR2e, CN, COOH,

COOR2e, CONH₂, SO₂R2e, SO₃H, SO₂NH₂, CONR2eR2f, SO₂NR2eR2f, де R2e та R2f незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R2e та R2f, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл;

5 кільце A вибране з арильних, гетероарильних та гетероциклільних фрагментів, кожен з яких необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, C₁₋₆ алкілу, гідроксилу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, Ra, C₁₋₁₀ алкілу, OH, ORa, OCORa, SH, SRa, SCORa, NH₂, NO₂, NHRa, NRaRb, CORa, CSRa, CN, COOH, COORa, CONH₂, CONHOH, CONHORA, SO₂Ra, SO₃H, SO₂NH₂,
10 CONRaRb, SO₂NRaRb, де Ra та Rb незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або Ra та Rb, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл,

де, якщо кільце A заміщене C₁₋₆ алкілом, арилом, гетероарилом, гетероциклілом, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, C₁₋₁₀ алкілом, C₃₋₈ циклоалкілом або
15 заміщене групою, що містить один або більше із вказаних фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, Rc, C₁₋₁₀ алкілу, арил C₁₋₆ алкілу, OH, ORc, OCORc, SH, SRc, SCORc, NH₂, NO₂, NHRc, NRcRd, CORc, CSRc, CN, COOH, COORc, CONH₂, SO₂Rc, SO₃H, SO₂NH₂, CONRcRd, SO₂NRcRd, де Rc та Rd незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈
20 циклоалкілу та гетероциклілу, або Rc та Rd, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл;

V може являти собою N, CH або C-R3, де R3 являє собою галоген, C₁₋₁₀ алкіл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₃₋₈ циклоалкіл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, R3a, OH, OR3a, SH, SR3a, OCOR3a, SCOR3a, NH₂, NO₂, NHR3a, NR3aR3b, COR3a, CSR3a, CN, COOH, COOR3a, CONH₂, SO₂R3a, SO₃H, SO₂NH₂, CONR3aR3b, SO₂NR3aR3b, де R3a та R3b незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R3a та R3b, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл,

де, якщо R3 являє собою C₁₋₁₀ алкіл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, C₁₋₆ алкіл, C₃₋₈ циклоалкіл, або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, R3c, C₁₋₁₀ алкілу, OH, OR3c, OCOR3c, SH, SR3c, SCOR3c, NH₂, NO₂, NHR3c, NR3cR3d, COR3c, CSR3c, CN, COOH, COOR3c, CONH₂, SO₂R3c, SO₃H, SO₂NH₂, CONR3cR3d, SO₂NR3cR3d, де R3c та R3d незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R3c та R3d, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл,

де, якщо замісник в R3 являє собою C₁₋₁₀ алкіл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, C₁₋₆ алкіл, C₃₋₈ циклоалкіл, або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, R3e, C₁₋₁₀ алкілу, OH, OR3e, OCOR3e, SH, SR3e, SCOR3e, NH₂, NO₂, NHR3e, NR3eR3f, COR3e, CSR3e, CN, COOH, COOR3e, CONH₂, SO₂R3e, SO₃H, SO₂NH₂, CONR3eR3f, SO₂NR3eR3f, де R3e та R3f незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R3e та R3f, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл;

45 W може являти собою N, CH або C-R4, де R4 являє собою галоген, C₁₋₁₀ алкіл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, C₃₋₈ циклоалкіл, R4a, OH, OR4a, SH, SR4a, OCOR4a, SCOR4a, NH₂, NO₂, NHR4a, NR4aR4b, COR4a, CSR4a, CN, COOH, COOR4a, CONH₂, SO₂R4a, SO₃H, SO₂NH₂, CONR4aR4b, SO₂NR4aR4b, де R4a та R4b незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R4a та R4b, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл,

де, якщо R4 являє собою C₁₋₁₀ алкіл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, C₁₋₆ алкіл, C₃₋₈ циклоалкіл, або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, R4c, C₁₋₁₀ алкілу, OH, OR4c, OCOR4c, SH, SR4c, SCOR4c, NH₂, NO₂, NHR4c, NR4cR4d, COR4c, CSR4c, CN, COOH, COOR4c, CONH₂, SO₂R4c, SO₃H, SO₂NH₂, CONR4cR4d, SO₂NR4cR4d, де R4c та R4d незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R4c та

R4d, з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл,

де, якщо замісник в R4 являє собою C₁₋₁₀ алкіл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, C₁₋₆ алкіл, C₃₋₈ циклоалкіл, або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, R4e, C₁₋₁₀ алкілу, OH, OR4e, OCOR4e, SH, SR4e, SCOR4e, NH₂, NO₂, NHR4e, NR4eR4f, COR4e, CSR4e, CN, COOH, COOR4e, CONH₂, SO₂R4e, SO₃H, SO₂NH₂, CONR4eR4f, SO₂NR4eR4f, де R4e та R4f незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R4e та R4f, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл;

R5 вибраний з H, C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₃₋₈ циклоалкілу, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, R5a, галогену, OH, OR5a, SH, SR5a, OCOR5a, SCOR5a, NH₂, NO₂, NHR5a, NR5aR5b, COR5a, CSR5a, CN, COOH, COOR5a, CONH₂, SO₂R5a, SO₃H, SO₂NH₂, CONR5aR5b, SO₂NR5aR5b, де R5a та R5b незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R5a та R5b, з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл,

де, якщо R5 являє собою C₁₋₆ алкіл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, C₁₋₆ алкіл, C₃₋₈ циклоалкіл, або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, R5c, C₁₋₆ алкілу, OH, OR5c, OCOR5c, SH, SR5c, SCOR5c, NH₂, NO₂, NHR5c, NR5cR5d, COR5c, CSR5c, CN, COOH, COOR5c, CONH₂, SO₂R5c, SO₃H, SO₂NH₂, CONR5cR5d, SO₂NR5cR5d, де R5c та R5d незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R5c та R5d, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл,

де, якщо замісник в R5 являє собою C₁₋₆ алкіл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, C₃₋₈ циклоалкіл, або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, R5e, C₁₋₆ алкілу, OH, OR5e, OCOR5e, SH, SR5e, SCOR5e, NH₂, NO₂, NHR5e, NR5eR5f, COR5e, CSR5e, CN, COOH, COOR5e, CONH₂, SO₂R5e, SO₃H, SO₂NH₂, CONR5eR5f, SO₂NR5eR5f, де R5e та R5f незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщений C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R5e та R5f, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл;

X може являти собою N, CH або C-R6, де R6 вибраний з C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, R6a, галогену, OH, OR6a, SH, SR6a, OCOR6a, SCOR6a, NH₂, NO₂, NHR6a, NR6aR6b, COR6a, CSR6a, CN, COOH, COOR6a, CONH₂, SO₂R6a, SO₃H, SO₂NH₂, CONR6aR6b, SO₂NR6aR6b, де R6a та R6b незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R6a та R6b, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл,

де, якщо R6 являє собою гетероарил або гетероцикліл, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений одним або більше атомів кисню, та якщо R6 являє собою C₁₋₆ алкіл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, C₃₋₈ циклоалкіл, або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, R6c, C₁₋₆ алкілу, C₁₋₆ алкінілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, арил C₁₋₆ алкілу, гетероарил C₁₋₆ алкілу, гетероцикліл C₁₋₆ алкілу, арил C₁₋₆ алкокси, гетероарил C₁₋₆ алкокси, гетероцикліл C₁₋₆ алкокси, OH, OR6c, OCOR6c, SH, SR6c, SCOR6c, NH₂, NO₂, NHR6c, NR6cR6d, COR6c, CSR6c, CN, COOH, COOR6c, CONH₂, CONHOH, C(NOH)NH₂, SO₂R6c, SO₃H, SO₂NH₂, CONR6cR6d, SO₂NR6cR6d, де R6c та R6d незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R6c та R6d, з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл,

де, якщо замісник в R6 являє собою гетероарил або гетероцикліл, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений одним або більше атомів кисню, або якщо замісник в R6 являє собою C₁₋₆ алкіл, C₁₋₆ алкініл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, арил C₁₋₆ алкіл, гетероарил C₁₋₆ алкіл, гетероцикліл C₁₋₆ алкіл, арил C₁₋₆ алкокси, гетероарил C₁₋₆ алкокси, гетероцикліл C₁₋₆ алкокси, C₃₋₈ циклоалкіл, або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, R6e, C₁₋₆ алкілу, C₁₋₄ алкокси, OH, OR6e, OCOR6e, SH, SR6e, SCOR6e, NH₂, NO₂,

NHR6e, NR6eR6f, COR6e, CSR6e, CN, COOH, COOR6e, CONH₂, C(NOH)NH₂, SO₂R6e, SO₃H, SO₂NH₂, CONR6eR6f, SO₂NR6eR6f, де R6e та R6f незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R6e та R6f, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл;

5 Y може являти собою N, CH або C-R7, де R7 вибраний з C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, R7a, галогену, OH, OR7a, SH, SR7a, OCOR7a, SCOR7a, NH₂, NO₂, NHR7a, NR7aR7b, COR7a, CSR7a, CN, COOH, COOR7a, CONH₂, SO₂R7a, SO₃H, SO₂NH₂, CONR7aR7b, SO₂NR7aR7b, де R7a та R7b незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R7a та R7b, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл,

15 де, якщо R7 являє собою гетероарил або гетероцикліл, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений одним або більше атомів кисню, та якщо R7 являє собою C₁₋₆ алкіл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, C₃₋₈ циклоалкіл або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, R7c, C₁₋₆ алкілу, C₁₋₆ алкінілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, арил C₁₋₆ алкілу, гетероарил C₁₋₆ алкілу, гетероцикліл C₁₋₆ алкілу, арил C₁₋₆ алкокси, гетероарил C₁₋₆ алкокси, гетероцикліл C₁₋₆ алкокси, OH, O7c, OCOR7c, SH, SR7c, SCOR7c, NH₂, NO₂, NHR7c, NR7cR7d, COR7c, CSR7c, CN, COOH, COOR7c, CONH₂, CONHOH, C(NOH)NH₂, SO₂R7c, SO₃H, SO₂NH₂, CONR7cR7d, SO₂NR7cR7d, де R7c та R7d незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R7c та R7d, з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл,

25 де, якщо замісник в R7 являє собою гетероарил або гетероцикліл, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений одним або більше атомів кисню, або якщо замісник в R7 являє собою C₁₋₆ алкіл, C₁₋₆ алкініл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, арил C₁₋₆ алкіл, гетероарил C₁₋₆ алкіл, гетероцикліл C₁₋₆ алкіл, арил C₁₋₆ алкокси, гетероарил C₁₋₆ алкокси, гетероцикліл C₁₋₆ алкокси, C₃₋₈ циклоалкіл, або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, арил C₁₋₆ алкілу, гетероарил C₁₋₆ алкілу, гетероцикліл C₁₋₆ алкілу, C₁₋₄ алкокси, R7e, C₁₋₆ алкілу, OH, OR7e, OCOR7e, SH, SR7e, SCOR7e, NH₂, NO₂, NHR7e, NR7eR7f, COR7e, CSR7e, CN, COOH, COOR7e, CONH₂, C(NOH)NH₂, SO₂R7e, SO₃H, SO₂NH₂, CONR7eR7f, SO₂NR7eR7f, де R7e та R7f незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R7e та R7f, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл;

30 Z може являти собою N, CH або C-R8, де R8 вибраний з C₁₋₁₀ алкілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, R8a, галогену, OH, OR8a, SH, SR8a, OCOR8a, SCOR8a, NH₂, NO₂, NHR8a, NR8aR8b, COR8a, CSR8a, CN, COOH, COOR8a, CONH₂, SO₂R8a, SO₃H, SO₂NH₂, CONR8aR8b, SO₂NR8aR8b, де R8a та R8b незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R8a та R8b, з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл,

45 де, якщо R8 являє собою C₁₋₆ алкіл, C₁₋₁₀ алкіл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, C₃₋₈ циклоалкіл, або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, R8c, C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, арил C₁₋₆ алкілу, гетероарил C₁₋₆ алкілу, гетероцикліл C₁₋₆ алкілу, арил C₁₋₆ алкокси, гетероарил C₁₋₆ алкокси, гетероцикліл C₁₋₆ алкокси, OH, OR8c, OCOR8c, SH, SR8c, SCOR8c, NH₂, NO₂, NHR8c, NR8cR8d, COR8c, CSR8c, CN, COOH, COOR8c, CONH₂, SO₂R8c, SO₃H, SO₂NH₂, CONR8cR8d, SO₂NR8cR8d, де R8c та R8d незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R8c та R8d, з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл,

50 де, якщо замісник в R8 являє собою C₁₋₆ алкіл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, арил C₁₋₆ алкіл, гетероарил C₁₋₆ алкіл, гетероцикліл C₁₋₆ алкіл, арил C₁₋₆ алкокси, гетероарил C₁₋₆ алкокси, гетероцикліл C₁₋₆ алкокси, C₃₋₈ циклоалкіл, або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з

галогену, R8e, C₁₋₆ алкілу, OH, OR8e, OCOR8e, SH, SR8e, SCOR8e, NH₂, NO₂, NHR8e, NR8eR8f, COR8e, CSR8e, CN, COOH, COOR8e, CONH₂, SO₂R8e, SO₃H, SO₂NH₂, CONR8eR8f, SO₂NR8eR8f, де R8e та R8f незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R8e та R8f, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероциклі;

де не більше двох атомів або груп, позначених X, Y та Z, можуть являти собою N;

де, якщо W являє собою N, група CONR1R2 замість цього може бути приєднана до W, з перегрупуванням подвійних зв'язків у Формула I, відповідно;

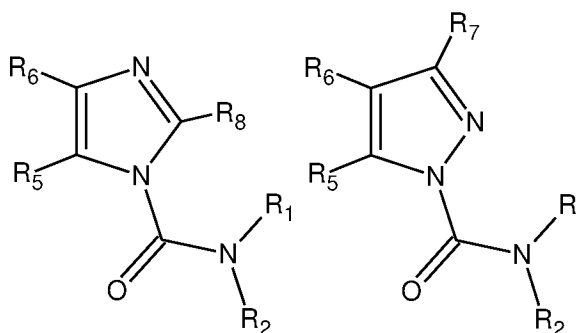
або її фармацевтично прийнятної солі або естеру;

за умови, що якщо R1 та R2 разом утворюють піперидиніл в сполуках Формули I, піперидиніл не заміщений метилом, диметилом, етилом, ізопропілом, трет-бутилом, метоксикарбонілом, трифторметилом, хлором, бромом або бензилом,

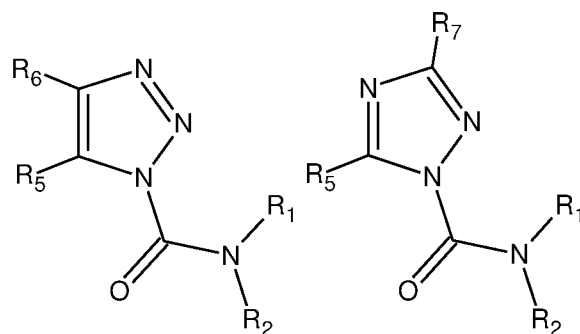
за умови, що R1 та R2 разом в сполуках Формули I не утворюють 6,7-диметокси-3,4-дигідро-1H-ізохінолін-2-іл, 6-метокси-3,4-дигідро-1H-ізохінолін-2-іл, 7-метокси-3,4-дигідро-1H-ізохінолін-2-іл, 7-аміно-3,4-дигідро-1H-ізохінолін-2-іл, 7-нітро-3,4-дигідро-1H-ізохінолін-2-іл, 3,4-дигідро-1H-ізохінолін-2-іл, 3,4-дигідро-1H-ізохінолін-1-іл, 3,4-дигідро-2H-хінолін-1-іл, піролідин-1-іл, 3,6-дигідро-2H-піридин-1-іл, 8-аза-спіро[4,5]дец-8-ил, 1,3-дигідроізоіндол-2-іл, оксагідроізоіндол-2-іл, 1,2,6-триаза-спіро[2,5]окт-1-ен-6-іл або азепан-1-іл, та

за умови, що кільце A в сполуках Формули I не утворює піридин, піримідин, заміщений піридин або заміщений піримідин, якщо R1 та R2, разом з N, до якого вони приєднані, утворюють піперидиніл, піперазиніл, заміщений піперидиніл або заміщений піперазиніл.

Переважно, формула сполуки за винаходом вибрана з Формули I, Формули IIa, Формули IIb, Формули IIc та Формули IId.

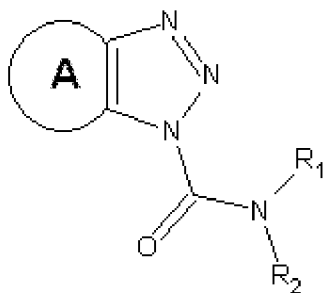


Формула IIa Формула IIb



Формула IIc Формула IId

Більш переважно, формула сполуки вибрана з Формули Ia, Формули IIa, Формули IIb, Формули IIb та Формули IId.



Формула Ia

В одному з варіантів винаходу R1 переважно вибраний з H та C₁₋₄ алкілу. Більш переважно, R1 вибраний з H та C₁₋₃ алкілу, навіть більш переважно, R1 вибраний з H, метилу та етилу, і найбільш переважно, R1 вибраний з H та метилу.

R2 переважно вибраний з C₁₋₄ алкілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₃₋₁₀ циклоалкілу, арил C₁₋₆ алкілу, гетероарил C₁₋₆ алкілу, гетероциклі C₁₋₆ алкілу та C₃₋₁₀ циклоалкіл C₁₋₆ алкілу, кожен з яких може бути заміщеним або незаміщеним. Переважно, арил, гетероарил, гетероциклі та C₃₋₁₀ циклоалкіл (в тому числі, в арил C₁₋₆ алкілі, гетероарил C₁₋₆ алкілі, гетероциклі C₁₋₆ алкілі та C₃₋₁₀ циклоалкіл C₁₋₆ алкілі) має структуру 6-членного моноциклічного кільця. Більш переважно, арил, гетероарил, гетероциклі та C₃₋₁₀ циклоалкіл (в тому числі, в арил C₁₋₆ алкілі, гетероарил C₁₋₆ алкілі, гетероциклі C₁₋₆ алкілі та C₃₋₁₀ циклоалкіл C₁₋₆ алкілі) вибрані з фенілу, циклогексилу, феніл C₁₋₆ алкілу та циклогексил C₁₋₆ алкілу, кожен з яких може бути заміщеним або незаміщеним. Переважно, C₁₋₆ алкіл в кожному з арил C₁₋₆ алкілу, гетероарил C₁₋₆ алкілу, гетероциклі C₁₋₆ алкілу та C₃₋₁₀ циклоалкіл C₁₋₆ алкілу являє собою лінійний алкіл.

Альтернативно, R2 може бути вибраний з арилу, гетероарилу, гетероциклілу, арил C₁₋₆ алкілу, гетероарил C₁₋₆ алкілу та гетероциклі C₁₋₆ алкілу, кожен з яких може бути заміщеним або незаміщеним, та де арил, гетероарил і гетероциклі (в тому числі, в арил C₁₋₆ алкілі, гетероарил C₁₋₆ алкілі та гетероциклі C₁₋₆ алкілі) мають структуру біциклічного кільця, переважно, структуру 10-членного біциклічного кільця. Більш переважно, R2 вибраний з нафталінілу та нафталініл C₁₋₆ алкілу.

Кожна з арильних, гетероарильних, гетероциклільних та C₃₋₁₀ циклоалкільних груп в R2 (в тому числі, в арил C₁₋₆ алкілі, гетероарил C₁₋₆ алкілі, гетероциклі C₁₋₆ алкілі та C₃₋₁₀ циклоалкіл C₁₋₆ алкілі) може бути заміщена одним або більше атомів галогену.

Альтернативно, кожна з арильних, гетероарильних, гетероциклільних та C₃₋₁₀ циклоалкільних груп (в тому числі, в арил C₁₋₆ алкілі, гетероарил C₁₋₆ алкілі, гетероциклі C₁₋₆ алкілі та C₃₋₁₀ циклоалкіл C₁₋₆ алкілі) може бути заміщені C₁₋₄ алкокси або арилокси. Переважно, C₁₋₄ алкокси являє собою метокси або етокси. Переважно, арилокси являє собою моноциклічний арилокси та, більш переважно, фенокси.

В переважному варіанті R1 вибраний з H та C₁₋₄ алкілу, і R2 вибраний з арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₃₋₁₀ циклоалкілу, арил C₁₋₆ алкілу, гетероарил C₁₋₆ алкілу, гетероциклі C₁₋₆ алкілу та C₃₋₁₀ циклоалкіл C₁₋₆ алкілу, кожен з яких може бути заміщеним або незаміщеним. Більш переважно, R1 вибраний з H, метилу та етилу, і R2 вибраний з арилу, гетероарилу, гетероциклілу та C₃₋₁₀ циклоалкілу, кожен з яких може бути заміщеним або незаміщеним. Більш переважно, R1 являє собою метил. Більш переважно, R2 вибраний з арилу, гетероарилу, гетероциклілу та C₅₋₈ циклоалкілу, кожен з яких є моноциклічним і може бути заміщеним або незаміщеним. Ще більш переважно R2 вибраний з насиченого гетероциклілу та C₅₋₈ циклоалкілу, кожен з яких є моноциклічним і може бути заміщеним або незаміщеним. Якщо R2 являє собою моноциклічний C₅₋₈ циклоалкіл, він переважно є незаміщеним. Переважно, R2 являє собою циклогексил, такий як незаміщений циклогексил. Якщо R2 являє собою моноциклічний насичений гетероциклі, гетероциклільне кільце переважно містить один гетероатом. Переважно, гетероатом являє собою атом азоту або кисню. Більш переважно, гетероциклі є 6-членным, таким як піперидинільна або тетрагідропіранільна група. Якщо гетероатом являє собою атом кисню, гетероциклі переважно є незаміщеним. Якщо гетероатом являє собою атом азоту, гетероатом азоту може бути заміщеним або незаміщеним. Якщо гетероатом азоту заміщений, він переважно заміщений групою, вибраною з C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₃₋₁₀ циклоалкілу, арил C₁₋₆ алкілу, гетероарил C₁₋₆ алкілу, гетероциклі C₁₋₆ алкілу та C₃₋₁₀ циклоалкіл C₁₋₆ алкілу, кожен з яких може бути заміщеним або незаміщеним. Більш переважно, гетероатом азоту заміщений групою, вибраною з C₁₋₄ алкілу,

арил C_{1-4} алкілу, гетероарил C_{1-4} алкілу, гетероцикліл C_{1-4} алкілу та C_{5-8} циклоалкіл C_{1-4} алкілу. Більш переважно, гетероатом азоту заміщеним групою, вибраною з арил C_{1-4} алкілу та гетероарил C_{1-4} алкілу, де арил та гетероарил є моноциклічними та, переважно, 6-членними. Переважно, гетероатом азоту заміщений групою, вибраною з феніл C_{1-2} алкілу та піридил C_{1-2} алкілу. Переважно, гетероатом у вказаній гетероциклічній групі знаходиться в положенні 4 відносно положення приєднання гетероциклічної групи R2 до азоту сечовини. Якщо R1 та R2 є такими, як визначено в даному абзаці, сполука переважно має формулу IIa. Переважно, якщо R1 та R2 є такими, як визначено в даному абзаці, R6 являє собою заміщений або незаміщений арил або гетероарил та, переважно, заміщений або незаміщений моноциклічний арил або гетероарил. Моноциклічний арил або гетероарил переважно 6-членним. В одному з варіантів R6 являє собою заміщений або незаміщений арил (такий як феніл) та, переважно, є незаміщеним. В іншому варіанті R6 являє собою заміщений або незаміщений гетероарил та, переважно, заміщений або незаміщений піридил. В одному з варіантів гетероарил заміщений атомом кисню. Наприклад, гетероатом азоту в піридилі може бути заміщений атомом кисню, таким чином, що він є окисненим, тобто, утворюється N-оксид.

Було виявлено, що сполуки з вибором R1 та R2 в попередньому абзаці демонструють відносно високу специфічність у відношенні ГАЖК. Додатково, було виявлено, що сполуки, в яких R2 являє собою гетероцикліл, такий як піперидиніл або тетрагідропіраніл, є відносно метаболічно стабільними.

В альтернативному варіанті R2 переважно являє собою C_{2-20} алкіл. Більш переважно, R2 являє собою C_{3-16} алкіл та, ще більш переважно, R2 являє собою C_{4-12} алкіл. Переважно, алкіл являє собою лінійний алкіл.

В переважному варіанті R1 вибраний з H та C_{1-4} алкілу, і R2 являє собою C_{2-20} алкіл.

В різноманітних варіантах, якщо R1 являє собою: H або C_{1-4} алкіл; H або C_{1-3} алкіл; H, метил або етил; H або метил; або метил, R2 може бути вибраний з C_{1-6} алкокси, арилу, гетероарила, частково або повністю насиченого гетероциклілу, C_{3-10} циклоалкілу, арил C_{1-6} алкілу, гетероарил C_{1-6} алкілу, гетероцикліл C_{1-6} алкілу, C_{3-10} циклоалкіл C_{1-6} алкілу, галогену, OH, OR1a, OCOR1a, SH, SR1a, SCOR1a, NH₂, NHR1a, NHSO₂NH₂, NHSO₂R1a, NR1aCOR1b, NHCOR1a, NR1aR1b, COR1a, CSR1a, CN, COOH, COOR1a, CONH₂, CONHOH, CONHR1a, CONHOR1a, SO₂R1a, SO₃H, SO₂NH₂, CONR1aR1b, SO₂NR1aR1b, де R1a та R1b незалежно вибрані з C_{1-6} алкілу, заміщеного C_{1-6} алкілу, арилу, гетероарила, C_{3-8} циклоалкілу та гетероциклілу, або R1a та R1b, з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл, де R2 може бути заміщеним або незаміщеним.

Альтернативно, в інших варіантах, якщо R1 являє собою: H та C_{1-4} алкіл; H та C_{1-3} алкіл; H, метил та етил; H та метил; або метил, R2 може бути вибраний з арилу, гетероарила, частково або повністю насиченого гетероциклілу, C_{3-10} циклоалкілу, арил C_{1-6} алкілу, гетероарил C_{1-6} алкілу, гетероцикліл C_{1-6} алкілу, C_{3-10} циклоалкіл C_{1-6} алкілу, де R2 може бути заміщеним або незаміщеним.

В переважному варіанті R1 та R2, разом з N, до якого вони приєднані, утворюють гетероциклічну групу, яка може бути заміщеною або незаміщеною. Переважно, гетероцикліл являє собою 5- або 6-членне моноциклічне кільце та, більш переважно, 5-членне моноциклічне кільце. В деяких варіантах вказаний гетероцикліл містить 1 або 2, переважно 1 додатковий гетероатом (тобто, на додаток до N). Вказані додаткові гетероатоми можуть являти собою, наприклад, N, O та/або S. Переважно, гетероцикліл являє собою оксазолідиніл. Переважно, атом кисню в оксазолідинілі знаходиться в положенні 3 відносно азоту сечовини. Переважно, оксазолідиніл заміщений 1, 2 або 3 метильними або етильними групами. Більш переважно, оксазолідиніл заміщений 2 метильними або етильними групами. Ще більш переважно, оксазолідиніл заміщений 2 метильними групами при одному і тому ж атомі вуглецю. Більш переважно, оксазолідиніл являє собою 4,4-диметилוקсазолідин-3-іл. Якщо R1 та R2 є такими, як визначено в даному абзаці, сполука переважно має формулу Ia або IIa. Переважно, якщо R1 та R2 є такими, як визначено в даному абзаці, та сполука має формулу IIa, R6 являє собою заміщений або незаміщений арил та, більш переважно, феніл. Якщо R1 та R2 є такими, як визначено в даному абзаці, та сполука має формулу Ia, кільце A переважно являє собою незаміщений або заміщений фрагмент бензо.

Було виявлено, що сполуки, що містять такі R1 та R2, як визначено в попередньому абзаці, є відносно потужними інгібіторами ГАЖК. Також було виявлено, що вони володіють відносно високою специфічністю у відношенні ГАЖК.

В альтернативному варіанті R1 та R2, разом з N, до якого вони приєднані, утворюють гетероциклічну групу, яка може бути заміщеною або незаміщеною. Переважно, гетероцикліл являє собою 5- або 6-членне моноциклічне кільце та, більш переважно, 6-членне моноциклічне

кільце. Переважно, R1 та R2 разом утворюють морфоліно, піперазиніл, оксазолідиніл, піролідиніл або піперидиніл. Більш переважно, R1 та R2 разом утворюють морфоліно або піперазиніл.

Переважно, гетероцикліл, утворений R1 та R2 разом, заміщений C₁₋₄ алкілом, арилом, гетероарилом, C₃₋₈ циклоалкіл арил C₁₋₆ алкілом, гетероарил C₁₋₆ алкілом, арилокси, гетероарилокси, арил C₁₋₆ алкокси та гетероарил C₁₋₆ алкокси, кожен з яких необов'язково може бути заміщений одним або більше атомів галогену або C₁₋₄ алкільних груп. Переважно, арильний, гетероарильний або C₃₋₈ циклоалкільний замісник являє собою 5- або 6-членне моноциклічне кільце. Більш переважно, гетероцикліл, утворений R1 та R2 разом, заміщений з арилом, арил C₁₋₆ алкілом та арилокси, кожен з яких необов'язково може бути заміщений одним або більше атомів галогену. Ще більш переважно, гетероцикліл, утворений R1 та R2 разом, заміщений фенілом, феніл C₁₋₆ алкілом або фенокси, кожен з яких необов'язково може бути заміщений одним або більше атомів галогену.

Альтернативно, гетероцикліл, утворений R1 та R2 разом, може бути заміщений гетероарилом або гетероарил C₁₋₆ алкілом. В одному з варіантів гетероарил має біциклічну кільцеву структуру, наприклад, бензодіоксолілметил. Альтернативно, гетероарил може бути моноциклічним, наприклад, піридил.

Як інша альтернатива, гетероцикліл, утворений R1 та R2 разом, може бути заміщений C₃₋₈ циклоалкілом. Переважно, C₃₋₈ циклоалкіл являє собою моноциклічний циклоалкіл, такий як циклогексил.

В одному з варіантів гетероцикліл, утворений R1 та R2 разом, може являти собою 1,4-диокса-8-азаспіро[4,5]дец-8-ил, диметилксазолідиніл, метилпіперазиніл, бензілоксибензілпіперазиніл, толілоксипіперидиніл, піролідиніл C₁₋₄ алкіл піперидиніл, піридилпіперидиніл, піридилоксадіазол-5-ілпіперидиніл або бензілоксипіперидиніл.

В одному з варіантів гетероцикліл, утворений R1 та R2 разом, являє собою піперидиніл, заміщений фенокси або феніл C₁₋₄ алкокси, феніл необов'язково може бути заміщений атомом галогену.

В одному з варіантів винаходу, якщо V являє собою C-R3, R3 являє собою H або галоген.

В іншому варіанті винаходу, якщо W являє собою C-R4, R4 вибраний з H та арилу. Переважно, R4 вибраний з H та фенілу. Більш переважно, R4 являє собою H.

У сполучі за винаходом кільце A переважно являє собою заміщений або незаміщений моноциклічний арильний або гетероарильний фрагмент та, більш переважно, моноциклічний арильний фрагмент. Переважно, кільце A являє собою заміщений або незаміщений фрагмент бензо. Якщо моноциклічний арил в кільці A заміщений, замісник являє собою один або більше атомів галогену, C₁₋₆ алкіл або арил, який необов'язково може бути заміщений одним або більше атомів галогену, ціано, карбоксильних або амідних груп. Переважно, арильний замісник являє собою моноциклічний арил та, більш переважно, феніл. В переважному варіанті сполука, що містить кільце A, як визначено в даному абзаці, має формулу Ia.

В одному з варіантів кільце A заміщене фрагментом, вибраним з C₁₋₆ алкокси, C₁₋₆ алкокси C₁₋₆ алкілу та C₀₋₆ алкіл-CO-C₀₋₆ алкілу, де C₁₋₆ алкокси, C₁₋₆ алкокси C₁₋₆ алкіл, або C₀₋₆ алкіл-CO-C₀₋₆ алкіл заміщений фрагментом, вибраним з арилу, гетероарилу, гетероциклілу та C₃₋₁₀ циклоалкілу, де кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений арилом, гетероарилом, гетероциклілом, C₃₋₁₀ циклоалкілом, арил C₁₋₆ алкілом, гетероарил C₁₋₆ алкілом, гетероцикліл C₁₋₆ алкілом та C₃₋₁₀ циклоалкіл C₁₋₆ алкілом. Переважно, кільце A заміщене C₀₋₆ алкіл-CO-C₀₋₆ алкілом, де C₀₋₆ алкіл-CO-C₀₋₆ алкіл заміщений фрагментом, вибраним з арилу, гетероарилу, гетероциклілу та C₃₋₁₀ циклоалкіл, де кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений арилом, гетероарилом, гетероциклілом, C₃₋₁₀ циклоалкілом, арил C₁₋₆ алкілом, гетероарил C₁₋₆ алкілом, гетероцикліл C₁₋₆ алкілом та C₃₋₁₀ циклоалкіл C₁₋₆ алкілом. Переважно, кільце A заміщене карбонільним фрагментом (тобто, C₀ алкіл-CO-C₀ алкіл). Переважно, C₀₋₆ алкіл-CO-C₀₋₆ алкіл заміщений гетероциклілом, більш переважно, моноциклічним гетероциклілом, ще більш переважно, гетероциклілом, що містить 1 або 2 гетероатоми азоту, навіть більш переважно, 6-членним гетероциклілом та, найбільш переважно, піперазином. Переважно, C₁₋₆ алкокси, C₁₋₆ алкокси C₁₋₆ алкіл, або C₀₋₆ алкіл-CO-C₀₋₆ алкіл є лінійним. Переважно, сполуки, описані в даному абзаці, мають формулу Ia.

В іншому варіанті кільце A заміщене однією або більше груп, вибраних з галогену, C₁₋₆ алкілу, C₁₋₆ алкокси, OH, ORa, OCORa, SH, SRa, SCORa, NH₂, NO₂, NHRa, NHSO₂NH₂, NHSO₂Ra, NRaCORb, NHCORa, NHC(NH)NH₂, NRaRb, CORa, CSRa, CN, COOH, COORa, CONH₂, CONHRa, CONHOH, CONHORA, C(NOH)NH₂, CONRaRb, SO₂Ra, SO₃H, SO₂NH₂, SO₂NRaRb, де Ra та Rb являють собою C₁₋₆ алкіл. Переважно, кільце A заміщене однією або більше груп, вибраних з галогену, OH, SH, NH₂, NO₂, NHC(NH)NH₂, CN, COOH, CONH₂,

CONHOH, C(NOH)NH₂, SO₃H та SO₂NH₂. Більш переважно, кільце А заміщене однією або більше груп, вибраних з галогену, OH, NH₂, NO₂, NHC(NH)NH₂, CN, COOH, CONH₂, CONHOH, C(NOH)NH₂, SO₃H та SO₂NH₂. Переважно, сполуки, описані в даному абзаці, мають формулу Ia.

5 Переважно, в сполучі за винаходом, R5 являє собою H або галоген, та, більш переважно, R5 являє собою H.

В одному з варіантів R5 разом з кільцевим атомом вуглецю, до якого він приєднаний, не утворює карбонільну групу. Сполука має Формулу II, як вказано вище.

В іншому варіанті X не являє собою O. Сполука має Формулу II, як вказано вище.

10 У сполуках Формули II, якщо X являє собою C-R6, R6 переважно являє собою заміщений або незаміщений арил. Переважно, арил R6 являє собою феніл або нафталініл. Більш переважно, арил R6 являє собою феніл. Переважно, арил R6 заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, C₁₋₄ алкокси, гідроксилу, аміду, арилу, гетероциклілу, гетероарилу, гетероциклілу, арилокси, кожен з яких може бути заміщеним або незаміщеним. Переважно, арильний замісник в R6 являє собою феніл, який може бути заміщеним або незаміщеним. Якщо 15 R6 є таким, як визначено в даному абзаці, сполука Формули II переважно являє собою імідазол (тобто, X являє собою CH або C-R6, Y являє собою N, та Z являє собою CH або C-R8) або 1,2,3-триазол (тобто, X являє собою CH або C-R6, Y являє собою N, та Z являє собою N). Більш переважно, сполука має формулу IIa.

Альтернативно, R6 переважно являє собою H, галоген або арил та, більш переважно, H. 20 Якщо R6 є таким, як визначено в даному абзаці, сполука Формули II переважно являє собою піразол (тобто, X являє собою CH або C-R6, Y являє собою CH або C-R7, та Z являє собою N).

В одному з варіантів винаходу, якщо Y являє собою C-R7, R7 вибраний з арилу або гетероарилу, кожен з яких може бути заміщеним або незаміщеним. Переважно, арил та гетероарил є моноциклічними. Переважно, арил або гетероарил заміщений одним або більше 25 атомів галогену. В переважному варіанті винаходу, R7 являє собою заміщений або незаміщений арил. Якщо R7 є таким, як визначено в даному абзаці, сполука Формули II переважно являє собою піразол (тобто, X являє собою CH або C-R6, Y являє собою CH або C-R7, та Z являє собою N) або 1,2,4-триазол (тобто, X являє собою N, Y являє собою CH або C-R7, та Z являє собою N).

30 В одному з варіантів, якщо Y являє собою C-R7, R7 являє собою H.

В іншому варіанті винаходу, якщо Z являє собою C-R8, R8 вибраний з H та арилу. Переважно, R8 вибраний з H та фенілу. Більш переважно, R8 являє собою H.

В одному з варіантів винаходу R6 являє собою групу, вибрану з арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₃₋₁₀ циклоалкілу, де R6 групи заміщеним групою, вибраною з C₁₋₆ алкокси, C₁₋₆ алкокси C₁₋₆ алкілу та C₀₋₆ алкіл-CO-C₀₋₆ алкілу, де C₁₋₆ алкокси, C₁₋₆ алкокси C₁₋₆ алкільна або C₀₋₆ алкіл-CO-C₀₋₆ алкільна група заміщена групою, вибраною з арилу, гетероарилу, гетероциклілу та C₃₋₁₀ циклоалкілу. Переважно, R6 являє собою групу, вибрану з арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₃₋₁₀ циклоалкілу, де група R6 заміщена групою, вибраною з C₁₋₆ алкокси та C₁₋₆ алкокси C₁₋₆ алкільна група заміщена групою, вибраною з арилу, гетероарилу, гетероциклілу та C₃₋₁₀ циклоалкілу. Переважно, R6 являє собою групу, вибрану з арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₃₋₁₀ циклоалкілу, де група R6 заміщена групою, вибраною з C₁₋₆ алкокси та C₁₋₆ алкокси C₁₋₆ алкілу, де C₁₋₆ алкокси або C₁₋₆ алкокси C₁₋₆ алкільна група заміщена гетероциклілом. Більш переважно, R6 являє собою арил, заміщений групою, вибраною з C₁₋₆ алкокси та C₁₋₆ алкокси C₁₋₆ алкілу, де C₁₋₆ алкокси або C₁₋₆ алкокси C₁₋₆ алкільна група заміщеною гетероциклілом. Ще більш переважно, R6 являє собою арил, заміщений C₁₋₆ алкокси, де C₁₋₆ алкокси заміщеним гетероциклілом. 45

Переважно, R6 являє собою арил. Переважно, R6 має структуру моноциклічного кільця, такого як моноциклічний арил. В одному з варіантів R6 має структуру 6-членного кільця, такого як феніл.

50 Переважно, C₁₋₆ алкокси, C₁₋₆ алкокси C₁₋₆ алкіл або C₀₋₆ алкіл-CO-C₀₋₆ алкіл є лінійним.

Переважно, замісник в C₁₋₆ алкокси або C₁₋₆ алкокси C₁₋₆ алкілі є моноциклічним. Переважно, замісник і C₁₋₆ алкокси або C₁₋₆ алкокси C₁₋₆ алкілі є 6-членным. Переважно, замісник і C₁₋₆ алкокси або C₁₋₆ алкокси C₁₋₆ алкілі являє собою гетероцикліл. Переважно, гетероцикліл є повністю насиченим. Переважно, гетероцикліл містить 1 або 2 гетероатоми, такі як азот або 55 кисень. Переважно, гетероцикліл містить щонайменше 1 гетероатом азоту. В одному з варіантів гетероцикліл являє собою піперидиніл, піперазиніл, або тетрагідропіраніл. В даному варіанті сполука переважно має формулу IIa.

В одному з варіантів якщо W являє собою N, і група CONR₁R₂ може не бути приєднана до W. В даному варіанті сполука має Формулу I, як показано вище.

60 Формула I та Ia

У сполуках Формули I та, зокрема, сполуках Формули Ia, кільце А переважно являє собою заміщений або незаміщений арильний або гетероарильний фрагмент. Більш переважно, кільце А являє собою заміщений або незаміщений моноциклічний арильний або гетероарильний фрагмент. Ще більш переважно, кільце А являє собою заміщений або незаміщений шіх-членний арильний або гетероарильний фрагмент. Найбільш переважно, кільце А являє собою заміщений або незаміщений моноциклічний арил, такий як фрагмент бензо.

Якщо кільце А заміщене, замісник може являти собою одну або більше груп, вибраних з галогену, OH, C₁₋₄ алкілу, C₁₋₄ алкокси, SH, NH₂, NO₂, CN, COOH, CONH₂, CONHOH, бензоксiamiнокарбонілу, SO₃H, SO₂NH₂, арилу, гетероарилу, гетероциклілу та C₃₋₈ циклоалкілу. Якщо замісник являє собою C₁₋₄ алкіл, арил, гетероарил, гетероциклілу, або C₃₋₈ циклоалкіл, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, OH, SH, NH₂, NO₂, CN, COOH, CONH₂, SO₃H, SO₂NH₂, C₁₋₃ алкілу, C₁₋₃ алкокси та бензилу.

Переважно, замісник і кільці А являє собою одну або більше груп, вибраних з галогену, OH, C₁₋₃ алкілу, C₁₋₃ алкокси, NH₂, NO₂, CN, COOH, CONH₂, моноциклічного арилу, моноциклічного гетероарилу, моноциклічного гетероциклілу та C₅₋₈ циклоалкілу. Якщо замісник являє собою C₁₋₃ алкіл, моноциклічний арил, моноциклічний гетероарил, моноциклічний гетероциклілу або C₅₋₈ циклоалкіл, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, CN, COOH, CONH₂ та C₁₋₃ алкокси.

Більш переважно, замісник в кільці А являє собою одну або більше груп, вибраних з галогену, OH, C₁₋₂ алкілу, C₁₋₂ алкокси та фенілу. Якщо замісник являє собою C₁₋₂ алкіл або феніл, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, CN, COOH, CONH₂ та C₁₋₃ алкокси.

В переважному варіанті сполук Формули I та, зокрема, в сполуках Формули Ia, R1 та R2, разом з N, до якого вони приєднані, утворюють гетероциклічну групу, яка може бути заміщеною або незаміщеною. Переважно, гетероциклілу являє собою 5- або 6-членне моноциклічне кільце, більш переважно, 6-членне моноциклічне кільце. В деяких варіантах вказаний гетероциклілу містить 1 або 2, переважно, 1 додатковий гетероатом (тобто, на додаток до N). Вказані додаткові гетероатоми можуть являти собою, наприклад, N, O та/або S. В одному з варіантів гетероциклілу являє собою морфоліно. В альтернативному варіанті гетероциклілу являє собою піперазиніл. В інших варіантах вказаний гетероциклілу не містить додаткових гетероатомів (тобто, він містить 1 атом N). В одному з варіантів гетероциклілу являє собою піперидиніл. Якщо гетероциклілу заміщений, він переважно являє собою заміщений арилом або арил C₁₋₄ алкілом, де арил переважно є моноциклічним та, більш переважно, являє собою феніл. Алкіл переважно є лінійним. Більш переважно, гетероциклілу заміщений арилом або арил C₁₋₂ алкілом, де арил переважно є моноциклічним та, більш переважно, являє собою феніл.

В переважному варіанті сполук Формули I та, зокрема, в сполуках Формули Ia, R1 вибраний з H та C₁₋₄ алкілу, і R2 вибраний з арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₃₋₁₀ циклоалкілу, арил C₁₋₆ алкілу, гетероарил C₁₋₆ алкілу, гетероциклілу C₁₋₆ алкілу та C₃₋₁₀ циклоалкілу C₁₋₆ алкілу, кожен з яких може бути заміщеним або незаміщеним. В одному з варіантів R1 вибраний з H, метилу та етилу, і R2 вибраний з арилу, гетероарилу, гетероциклілу та C₅₋₈ циклоалкілу, кожен з яких є моноциклічним і може бути заміщеним або незаміщеним. Більш переважно, R1 вибраний з H та метилу. В одному з варіантів R1 являє собою метил. В альтернативному варіанті R1 являє собою H. Більш переважно, R2 вибраний з насиченого гетероциклілу та C₅₋₈ циклоалкілу, кожен з яких є моноциклічним і може бути заміщеним або незаміщеним. Якщо R2 являє собою моноциклічний C₅₋₈ циклоалкіл, він переважно є незаміщеним. Переважно, R2 являє собою циклопентил або циклогексил. Більш переважно, R2 являє собою циклогексил, такий як незаміщений циклогексил. Якщо R2 являє собою моноциклічний насичений гетероциклілу, гетероциклілу кільце переважно містить 1 гетероатом. Більш переважно, гетероциклілу є 6-членним, таким як піперидинільна або тетрагідропіранільна група. Гетероатом азоту може бути заміщеним або незаміщеним.

В альтернативному варіанті R1 вибраний з H, метилу та етилу, і R2 вибраний з арил C₁₋₆ алкілу, гетероарил C₁₋₆ алкілу, гетероциклілу C₁₋₆ алкілу та C₅₋₈ циклоалкілу C₁₋₆ алкілу, кожен з яких є моноциклічним і може бути заміщеним або незаміщеним. Більш переважно, R2 являє собою арил C₁₋₆ алкіл, в якому арил є моноциклічним та може бути заміщеним або незаміщеним. Ще більш переважно, R2 являє собою арил C₁₋₆ алкіл, в якому арил є моноциклічним та може бути заміщеним або незаміщеним, та C₁₋₆ алкіл є лінійним. Навіть більш переважно, R2 являє собою феніл C₁₋₆ алкіл, який може бути заміщеним або незаміщеним, та C₁₋₆ алкіл є лінійним. В одному з варіантів феніл є незаміщеним.

В альтернативному варіанті R1 вибраний з H, метилу та етилу, та R2 являє собою C₁₋₄ алкіл,

заміщений групою, вибраною з арил C_{1-4} алкокси, гетероарил C_{1-4} алкокси, гетероцикліл C_{1-4} алкокси та C_{5-8} циклоалкіл C_{1-4} алкокси, кожен з яких є моноциклічним і може бути заміщеним або незаміщеним. Переважно, R2 являє собою заміщений C_{1-3} алкіл. В одному з варіантів R2 являє собою заміщений C_{1-2} алкіл. Переважно, замісник в R2 являє собою арил C_{1-4} алкокси, в якому арил є моноциклічним та може бути заміщеним або незаміщеним. Ще більш переважно, замісник в R2 являє собою арил C_{1-4} алкокси, в якому арил є моноциклічним та може бути заміщеним або незаміщеним, і C_{1-4} алкокси є лінійним. Навіть більш переважно, замісник в R2 являє собою феніл C_{1-4} алкокси, який може бути заміщеним або незаміщеним, і C_{1-4} алкокси є лінійним. В одному з варіантів замісник в R2 являє собою арил C_{1-3} алкокси, в якому арил є моноциклічним (наприклад, феніл) та може бути заміщеним або незаміщеним, і C_{1-3} алкокси є лінійним. В деяких варіантах феніл є незаміщеним.

В іншому варіанті сполук Формули I та, зокрема, в сполуках Формули Ia, R1 вибраний з H та C_{1-4} алкілу, і R2 вибраний з гетероциклілу, який може бути заміщеним або незаміщеним. Переважно, R1 являє собою H, метил або етил, та R2 являє собою біциклічний гетероцикліл, який може бути заміщеним або незаміщеним. Більш переважно, R1 являє собою H або метил, та R2 являє собою біциклічний гетероцикліл, який може бути заміщеним або незаміщеним, де одне з кілець гетероциклілу містить 2 атоми кисню. В одному з варіантів R2 являє собою 3,3-диметил-1,5-диоксаспіро[5,5]ундец-9-іл.

В альтернативному переважному варіанті сполук Формули I та, зокрема, в сполуках Формули Ia, R1 вибраний з H та C_{1-4} алкілу, та R2 являє собою C_{2-20} алкіл. Більш переважно, R1 являє собою H, метил або етил, та ще більш переважно, R1 являє собою H або метил. Переважно, R2 являє собою C_{3-16} алкіл, де алкіл є лінійним алкілом. Більш переважно, R2 являє собою C_{4-14} алкіл, де алкіл є лінійним алкілом.

Формула IIa

В переважному варіанті сполук Формули IIa, R1 вибраний з H та C_{1-4} алкілу, і R2 вибраний з арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C_{3-10} циклоалкілу, арил C_{1-6} алкілу, гетероарил C_{1-6} алкілу, гетероцикліл C_{1-6} алкілу та C_{3-10} циклоалкіл C_{1-6} алкілу, кожен з яких може бути заміщеним або незаміщеним. Більш переважно, R1 вибраний з H, метилу та етилу, і R2 вибраний з арилу, гетероарилу, гетероциклілу та C_{3-10} циклоалкілу, кожен з яких може бути заміщеним або незаміщеним. Більш переважно, R1 являє собою метил. Більш переважно, R2 вибраний з арилу, гетероарилу, гетероциклілу та C_{5-8} циклоалкілу, кожен з яких є моноциклічним і може бути заміщеним або незаміщеним. Ще більш переважно, R2 вибраний з арилу, такого як феніл, насичений гетероцикліл та C_{5-8} циклоалкіл, кожен з яких є моноциклічним і може бути заміщеним або незаміщеним. Якщо R2 являє собою моноциклічний C_{5-8} циклоалкіл (тобто, циклопентил, циклогексил, циклогептил або циклооктил) або арил, він переважно є незаміщеним. Переважно, R2 являє собою циклогексил, такий як незаміщений циклогексил. Якщо R2 являє собою моноциклічний насичений гетероцикліл, гетероциклільне кільце переважно містить 1 гетероатом, такий як азот або кисень. Більш переважно, гетероцикліл є 6-членним, таким як піперидинільна або тетрагідропіранільна група. В одному з варіантів гетероатом являє собою гетероатом азоту, який може бути заміщеним або незаміщеним. Переважно, гетероатом у вказаній гетероциклільній групі знаходиться в положенні 4 відносно положення приєднання гетероциклільної групи R2 до азоту сечовини. В одному з варіантів атом азоту заміщений моноциклічний арил (переважно, фенілом) C_{1-3} алкілом; переважно, атом азоту заміщений бензилом або фенілетилом; та, більш переважно, атом азоту заміщений бензилом.

В альтернативному переважному варіанті сполук Формули IIa, R1 та R2, разом з N, до якого вони приєднані, утворюють гетероциклільну групу, яка може бути заміщеною або незаміщеною. Переважно, гетероцикліл являє собою 5- або 6-членне моноциклічне кільце та, більш переважно, 5-членне моноциклічне кільце. В деяких варіантах вказаний гетероцикліл містить 1 або 2, переважно 1 додатковий гетероатом (тобто, на додаток до N). Вказані додаткові гетероатоми можуть являти собою, наприклад, N, O та/або S. Переважно, гетероцикліл являє собою оксазолідиніл. Переважно, атом кисню в оксазолідинілі знаходиться в положенні 3 відносно азоту сечовини. Переважно, оксазолідиніл заміщений 1, 2 або 3 метильними або етильними групами. Більш переважно, оксазолідиніл заміщений 2 метильними або етильними групами. Ще більш переважно, оксазолідиніл заміщений 2 метильними групами при одному і тому ж атомі вуглецю. Більш переважно, оксазолідиніл являє собою 4,4-диметил-оксазолідин-3-іл.

В іншому переважному варіанті сполук Формули IIa, R1 та R2, разом з N, до якого вони приєднані, утворюють гетероциклільну групу, яка може бути заміщеною або незаміщеною. Переважно, гетероцикліл являє собою 5- або 6-членне моноциклічне кільце, більш переважно, 6-членне моноциклічне кільце. В деяких варіантах вказаний гетероцикліл містить 1 або 2,

переважно 1 додатковий гетероатом (тобто, на додаток до N). Вказані додаткові гетероатоми можуть являти собою, наприклад, N, O та/або S. В одному з варіантів гетероциклілі являє собою морфоліно. В альтернативному варіанті гетероциклілі являє собою піперазинілі. В інших варіантах вказаний гетероциклілі не містить додаткових гетероатомів (тобто, він містить 1 атом N). В одному з варіантів гетероциклілі являє собою піперадинілі. Якщо гетероциклілі заміщений, він переважно заміщений арилом, арил C₁₋₄ алкілом, C₅₋₆ циклоалкілом або C₅₋₆ циклоалкілі C₁₋₄ алкілом, де арил переважно є моноциклічним та, більш переважно, являє собою фенілі, та циклоалкілі переважно являє собою циклогексил. Алкілі переважно є лінійним. В одному з варіантів гетероциклілі заміщений арилом або арил C₁₋₄ алкілом (переважно, C₁₋₂ алкілом), де арил переважно є моноциклічним, та, більш переважно, являє собою фенілі. Арил необов'язково може бути заміщений одним або більше атомів галогену.

У сполуках Формули IIa, R5 переважно вибраний з H, C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₃₋₈ циклоалкілу, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, R5a, галогену, OH, OR5a, SH, SR5a, OCOR5a, SCOR5a, NH₂, NO₂, NHR5a, NR5aR5b, COR5a, CSR5a, CN, COOH, COOR5a, CONH₂, SO₂R5a, SO₃H, SO₂NH₂, CONR5aR5b, SO₂NR5aR5b, де R5a та R5b незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, і R5a та R5b, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероциклілі. Більш переважно, R5 вибраний з H, C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₃₋₈ циклоалкілу, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, галогену, OH, SH, NH₂, NO₂, CN, COOH, CONH₂, SO₃H, SO₂NH₂. Ще більш переважно, R5 вибраний з H, C₁₋₄ алкілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₅₋₈ циклоалкілу, C₁₋₄ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, галогену, OH, SH, NH₂, NO₂, CN, COOH, CONH₂, SO₃H, SO₂NH₂, де арильна, гетероарильна, гетероциклільна та C₅₋₈ циклоалкільна група є моноциклічними. Навіть більш переважно, R5 вибраний з H, C₁₋₃ алкілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₅₋₈ циклоалкілу, галогену, OH, NH₂, COOH та CONH₂, де арильна, гетероарильна, гетероциклільна та C₅₋₈ циклоалкільна група є моноциклічними. Ще більш переважно, R5 вибраний з H, C₁₋₂ алкілу та галогену. Навіть більш переважно, R5 вибраний з H та галогену, такого як F, Cl та Br. В одному з варіантів R5 являє собою H.

У сполуках Формули IIa, R6 переважно вибраний з арилу, гетероарилу, гетероциклілі та C₃₋₈ циклоалкілу, кожен з яких може бути заміщеним або незаміщеним. Більш переважно, R6 вибраний з арилу та гетероарилу, кожен з яких може бути заміщеним або незаміщеним. В одному з варіантів гетероарил містить 1 гетероатом, наприклад кисень або атом азоту. Переважно, арил або гетероарил є моноциклічним. Більш переважно, арил або гетероарил являє собою 6-членне моноциклічне кільце, наприклад, фенілі або піридил. В одному з варіантів гетероарил містить атом азоту, що заміщений атомом кисню, такий як оксидопіридил. В іншому варіанті R6 являє собою незаміщений моноциклічний арил, такий як фенілі, або моноциклічний арил, такий як фенілі, заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, C₁₋₂ алкокси (необов'язково заміщений одним або більше атомів галогену) або OH.

В одному з варіантів R6 являє собою незаміщений або заміщений 2-оксо-2,3-дигідро-1H-бензо[d]імідазолілі.

Якщо R6 заміщений, замісник переважно являє собою одну або більше груп, вибраних з галогену, C₁₋₄ алкокси, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, OH, CN, CONH₂, NH₂, гетероциклілі C₁₋₄ алкокси, арил C₁₋₄ алкокси, гетероарил C₁₋₄ алкокси, NO₂, SO₂NH₂, SO₃, C(NOH)NH₂, CONHOH, 2H-тетразол-5-ілу, диметиламіно, бензиламіно, метилсульфонілу, морфоліносульфонілу та піперидинілсульфонілу. Піперидинілсульфонілі необов'язково може бути заміщений арилметокси (переважно бензокси) або OH. Переважно, арил, гетероарил та гетероциклілі є моноциклічними. В одному з варіантів арил, гетероарил та гетероциклілі являють собою 6-членні моноциклічні кільця. В конкретному варіанті, в якому R6 являє собою моноциклічний арил, він необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, OH, C₁₋₃ алкокси (переважно C₁₋₂ алкокси), арилу (наприклад, моноциклічний арил, такий як фенілі), гетероарил (наприклад, моноциклічний гетероарил, що містить 1 або 2 атоми азоту, або 1 атом кисню), гетероциклілі (наприклад, піперазинілі, піперадинілі або морфоліно) C₁₋₃ алкокси (переважно, C₁₋₂ алкокси), арил (наприклад, моноциклічний арил, такий як фенілі) C₁₋₃ алкокси (переважно, C₁₋₂ алкокси), CONH₂, NH₂, NO₂, OCHF₂, SO₂NH₂, морфоліносульфонілі та C(NOH)NH₂.

В іншому варіанті, в якому R6 являє собою моноциклічний арил, він необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, OH, метокси, фенілу, піридилу, піразинілу, піранілу, піперазинілметокси, піперадинілметокси, морфолінометокси, бензилокси, CONH₂, NH₂, NO₂, OCHF₂, SO₂NH₂, морфоліносульфонілу та C(NOH)NH₂.

В одному з варіантів, якщо R6 являє собою моноциклічний арил, такий як фенілі, замісник в

R6 являє собою арил, переважно моноциклічний арил, такий як феніл, який може бути заміщеним або незаміщеним. Якщо він заміщений, переважно, він заміщений CONH_2 .

Якщо замісник в R6 являє собою C_{1-4} алкокси, арил, гетероарил, гетероцикліл, гетероцикліп C_{1-4} алкокси, арил C_{1-4} алкокси, гетероарил C_{1-4} алкокси або SO_3 , кожен із вказаних фрагментів

5 необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, OH, C_{1-3} алкокси (який може бути заміщений одним або більше атомів галогену), CONH_2 , CN, NCH_3CH_3 , NHCOCH_3 , метилгідроксибутилу та метилгідроксибутинілу.

У сполуках Формули IIa, R8 переважно вибраний з H, C_{1-6} алкілу, арилу, гетероарила, гетероциклілу, C_{3-8} циклоалкілу, C_{1-6} алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, R8a, галогену, OH, OR8a, SH, SR8a, OCOR8a, SCOR8a, NH_2 , NO_2 , NHR8a, NR8aR8b, COR8a, CSR8a, CN, COOH, COOR8a, CONH_2 , $\text{SO}_2\text{R8a}$, SO_3H , SO_2NH_2 , CONR8aR8b, $\text{SO}_2\text{NR8aR8b}$, де R8a та R8b незалежно вибрані з C_{1-6} алкілу, арилу, гетероарила, C_{3-8} циклоалкілу та гетероциклілу, і R8a та R8b, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл. Більш переважно, R8 вибраний з H, C_{1-6} алкілу, арилу, гетероарила, гетероциклілу, C_{3-8} циклоалкілу, C_{1-6} алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, галогену, OH, SH, NH_2 , NO_2 , CN, COOH, CONH_2 , SO_3H , SO_2NH_2 . Ще більш переважно, R8 вибраний з H, C_{1-4} алкілу, арилу, гетероарила, гетероциклілу, C_{5-8} циклоалкілу, C_{1-4} алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, галогену, OH, SH, NH_2 , NO_2 , CN, COOH, CONH_2 , SO_3H , SO_2NH_2 , де арильна, гетероарильна, гетероциклільна та C_{5-8} циклоалкільна група є моноциклічними. Навіть більш

20 переважно, R8 вибраний з H, C_{1-3} алкілу, арилу, гетероарила, гетероциклілу, C_{5-8} циклоалкілу, галогену, OH, NH_2 , COOH та CONH_2 , де арильна, гетероарильна, гетероциклільна та C_{5-8} циклоалкільна група є моноциклічними. Ще більш переважно, R8 вибраний з H, C_{1-2} алкілу, галогену та моноциклічного арилу, такого як феніл. Навіть більш переважно, R8 вибраний з H, C_{1-2} алкілу та галогену, такого як F, Cl та Br. Ще більш переважно, R8 вибраний з H та галогену, такого як F, Cl та Br. В одному з варіантів R8 являє собою H.

В одному з варіантів сполук Формули IIa, R1 вибраний з H та C_{1-4} алкілу, R2 вибраний з арилу, гетероарила, гетероциклілу, C_{3-10} циклоалкілу, арил C_{1-6} алкілу, гетероарил C_{1-6} алкілу, гетероцикліп C_{1-6} алкілу та C_{3-10} циклоалкіл C_{1-6} алкілу, кожен з яких необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з R2a, галогену, OH, OR2a, OCOR2a, SH, SR2a, SCOR2a, NH_2 , NHR2a, NHSO_2NH_2 , $\text{NHSO}_2\text{R2a}$, NR2aCOR2b, $\text{NHC}(\text{NH})\text{NH}_2$, NHCOR2a , NR2aR2b, COR2a, CSR2a, CN, COOH, COOR2a, CONH_2 , CONHOH, CONHR2a, CONHOR2a, $\text{C}(\text{NOH})\text{NH}_2$, $\text{SO}_2\text{R2a}$, SO_3H , SO_2NH_2 , CONR2aR2b, $\text{SO}_2\text{NR2aR2b}$, де R2a та R2b незалежно вибрані з C_{1-6} алкілу, заміщеного C_{1-6} алкілом, арилом, гетероарилом, C_{3-8} циклоалкілом та гетероциклілом, або R2a та R2b, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл,

35 де, якщо замісник в R2 являє собою C_{1-6} алкіл, заміщений C_{1-6} алкіл, арил, гетероарил, C_{3-8} циклоалкіл, гетероцикліл або групи що містить один або більше із вказаних фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з R2c, галогену, OH, OR2c, OCOR2c, SH, SR2c, SCOR2c, NH_2 , NHR2c, NHSO_2NH_2 , $\text{NHSO}_2\text{R2c}$, NR2cCOR2d, $\text{NHC}(\text{NH})\text{NH}_2$, NHCOR2c , NR2cR2d, COR2c, CSR2c, CN, COOH, COOR2c, CONH_2 , CONHOH, CONHR2c, CONHOR2c, $\text{C}(\text{NOH})\text{NH}_2$, $\text{SO}_2\text{R2c}$, SO_3H , SO_2NH_2 , CONR2cR2d, $\text{SO}_2\text{NR2cR2d}$, де R2c та R2d незалежно вибрані з C_{1-6} алкілу, заміщеного C_{1-6} алкілу, арилу, гетероарила, C_{3-8} циклоалкілу та гетероциклілу, або R2c та R2d, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл,

45 R5 вибраний з H, R5a, галогену, OH, OR5a, OCOR5a, SH, SR5a, SCOR5a, NH_2 , NHR5a, NHSO_2NH_2 , $\text{NHSO}_2\text{R5a}$, NR5aCOR5b, $\text{NHC}(\text{NH})\text{NH}_2$, NHCOR5a , NR5aR5b, COR5a, CSR5a, CN, COOH, COOR5a, CONH_2 , CONHOH, CONHR5a, CONHOR5a, $\text{C}(\text{NOH})\text{NH}_2$, $\text{SO}_2\text{R5a}$, SO_3H , SO_2NH_2 , CONR5aR5b, $\text{SO}_2\text{NR5aR5b}$, де R5a та R5b незалежно вибрані з C_{1-6} алкілу, заміщеного C_{1-6} алкілу, арилу, гетероарила, C_{3-8} циклоалкілу та гетероциклілу, або R5a та R5b, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл,

50 R6 вибраний з арилу, гетероарила, гетероциклілу, C_{3-10} циклоалкілу, кожен з яких необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з R6a, галогену, OH, OR6a, OCOR6a, SH, SR6a, SCOR6a, NH_2 , NHR6a, NHSO_2NH_2 , $\text{NHSO}_2\text{R6a}$, NR6aCOR6b, $\text{NHC}(\text{NH})\text{NH}_2$, NHCOR6a , NR6aR6b, COR6a, CSR6a, CN, COOH, COOR6a, CONH_2 , CONHOH, CONHR6a, CONHOR6a, $\text{C}(\text{NOH})\text{NH}_2$, $\text{SO}_2\text{R6a}$, SO_3H , SO_2NH_2 , CONR6aR6b, $\text{SO}_2\text{NR6aR6b}$, де R6a та R6b незалежно вибрані з C_{1-6} алкілу, заміщеного C_{1-6} алкілу, арилу, гетероарила, C_{3-8} циклоалкілу та гетероциклілу, або R6a та R6b, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл, та де, якщо R6 являє собою гетероарил або гетероцикліл, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений одним або більше атомів

де, якщо замісник в R6 являє собою C₁₋₆ алкіл, заміщений C₁₋₆ алкіл, арил, гетероарил, C₃₋₈ циклоалкіл, гетероцикліл або групи що містить один або більше із вказаних фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з R6c, галогену, OH, OR6c, OCOR6c, SH, SR6c, SCOR6c, NH₂, NHR6c, NHSO₂NH₂, NHSO₂R6c, NR6cCOR6d, NHC(NH)NH₂, NHCOR6c, NR6cR6d, COR6c, CSR6c, CN, COOH, COOR6c, CONH₂, CONHOH, CONHR6c, CONHOR6c, C(NOH)NH₂, SO₂R6c, SO₃H, SO₂NH₂, CONR6cR6d, SO₂NR6cR6d, де R6c та R6d незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, або R2c та R2d, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл, та де, якщо замісник в R6 являє собою гетероарил або гетероцикліл, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений одним або більше атомів кисню, та

R8 вибраний з H, R5a, галогену, OH, OR5a, OCOR5a, SH, SR5a, SCOR5a, NH₂, NHR5a, NHSO₂NH₂, NHSO₂R5a, NR5aCOR5b, NHC(NH)NH₂, NHCOR5a, NR5aR5b, COR5a, CSR5a, CN, COOH, COOR5a, CONH₂, CONHOH, CONHR5a, CONHOR5a, C(NOH)NH₂, SO₂R5a, SO₃H, SO₂NH₂, CONR5aR5b, SO₂NR5aR5b, де R5a та R5b незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщений C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкіл та гетероциклілу, або R5a та R5b, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл.

В описаному вище варіанті, переважно, R1 вибраний з H, метилу та етилу, і R2 вибраний з арилу, гетероарилу, гетероциклілу та C₃₋₁₀ циклоалкілу, кожен з яких може бути заміщеним або незаміщеним. Більш переважно, R1 являє собою метил. Більш переважно, R2 вибраний з арилу, гетероарилу, гетероциклілу та C₅₋₈ циклоалкілу, кожен з яких є моноциклічним і може бути заміщеним або незаміщеним. Ще більш переважно, R2 вибраний з гетероциклілу та C₅₋₈ циклоалкілу, кожен з яких є моноциклічним і може бути заміщеним або незаміщеним. Переважно, гетероцикліл є повністю насиченим. Якщо R2 являє собою моноциклічний C₅₋₈ циклоалкіл (тобто, циклопентил, циклогексил, циклогептил або циклооктил), він переважно є незаміщеним. В одному з варіантів R2 являє собою циклопентил або циклогексил, такий як незаміщений циклопентил або незаміщений циклогексил. Якщо R2 являє собою моноциклічний насичений гетероцикліл, гетероциклільне кільце переважно містить один гетероатом, такий як азот або кисень. Переважно, гетероцикліл є 6-членним, таким як піперидинільна або тетрагідропіранільна група. Переважно, гетероатом у вказаній гетероциклільній групі знаходиться в положенні 4 відносно положення приєднання гетероциклільної групи R2 до азоту сечовини. В одному з варіантів гетероатом являє собою гетероатом азоту який може бути заміщеним або незаміщеним.

В конкретному варіанті атом азоту заміщений групою, вибраною з CN, CONH₂, C(NOH)NH₂, SO₂-C₁₋₄ алкіл, SO₂-арил (необов'язково заміщений C₁₋₄ алкілом або C₁₋₄ галогеналкілом, таким як трифторметил), СО-гетероарил (необов'язково заміщений гетероарилом або галогеном), СО-C₁₋₄ алкіл, СОО-C₁₋₄ алкіл, C₁₋₄ алкіл (необов'язково заміщений OH, CN, COOH), арил C₁₋₃ алкіл, гетероарил C₁₋₃ алкіл, такий як піперидиніл C₁₋₃ алкіл (необов'язково заміщений СОО-C₁₋₃ алкілом), гетероцикліл C₁₋₃ алкіл, арил, гетероарил (необов'язково заміщений одним або більше атомів галогену, таких як хлор) та гетероцикліл. Переважно, атом азоту заміщений групою, вибраною з CN, CONH₂, C(NOH)NH₂, SO₂-C₁₋₄ алкілу, SO₂-моноциклічного арилу (необов'язково заміщеного C₁₋₄ галогеналкілом, таким як трифторметил), СО-моноциклічного гетероарилу (необов'язково заміщений моноциклічним гетероарилом або галогеном), СО-C₁₋₄ алкілу, СОО-C₁₋₄ алкілу, C₁₋₄ алкілу (необов'язково заміщений OH, CN, COOH), моноциклічного арил C₁₋₃ алкілу, моноциклічного гетероарил C₁₋₃ алкілу, такого як піперидиніл C₁₋₃ алкіл (необов'язково заміщений СОО-C₁₋₃ алкілом), моноциклічного гетероцикліл C₁₋₃ алкілу, моноциклічного арилу, моноциклічного гетероарилу (необов'язково заміщений одним або більше атомів галогену, таким як хлор) та моноциклічного гетероциклілу. Більш переважно, атом азоту заміщений групою, вибраною з CN, C₁₋₄ алкілу (необов'язково заміщеного OH, CN, COOH), моноциклічного арил C₁₋₃ алкілу та моноциклічного гетероарил C₁₋₃ алкілу (переважно, піперидиніл C₁₋₃ алкіл). Ще більш переважно, атом азоту заміщений групою, вибраною з C₁₋₄ алкілу (необов'язково заміщений OH, CN, COOH), моноциклічного арил C₁₋₃ алкілу та моноциклічного гетероарил C₁₋₃ алкілу (переважно, піперидиніл C₁₋₃ алкіл).

В одному з варіантів атом азоту заміщений моноциклічним арил (переважно, фенілом) C₁₋₃ алкілом; переважно, атом азоту заміщений бензилом або фенілетилом; та, більш переважно, атом азоту заміщений бензилом.

В одному з варіантів R5 являє собою H, галоген, OH або C₁₋₄ алкіл. Переважно, R5 являє собою H.

В іншому варіанті R6 вибраний з арилу, гетероарилу та гетероциклілу, кожен з яких може бути заміщеним або незаміщеним. Переважно, R6 вибраний з моноциклічного арилу (такого як

феніл), моноциклічного гетероарилу (такого як піридил) та гетероциклілу, кожен з яких може бути заміщеним або незаміщеним. В одному з варіантів R6 являє собою незаміщений арил. Якщо R6 являє собою заміщений арил, він переважно заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, R6a, OH, OR6a, NH₂, NO₂, NHC(NH)NH₂, NHR6a, NR6aR6b, C(NOH)NH₂, COR6a, COOH, COOR6a, CONH₂, CONHOH, SO₂R6a, SO₂NR6aR6b, де R6a та R6b незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, де R6a та R6b незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу,

де, якщо замісник в R6 являє собою C₁₋₆ алкіл, заміщений C₁₋₆ алкіл, арил, гетероарил, C₃₋₈ циклоалкіл, гетероцикліл або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з OR6c, OH та CONH₂, де R6c та R6d незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, заміщеного C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, та де, якщо замісник в R6 являє собою гетероарил або гетероцикліл, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений одним або більше атомів кисню.

Переважно, якщо R6 являє собою заміщений арил, він заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, OH, C₁₋₄ алкокси, CONH₂, C(NOH)NH₂, CONHOH, SO₂-C₁₋₄ алкілу, гетероциклілу (необов'язково заміщеного атомом кисню) та арилу (необов'язково заміщеного з CONH₂). В одному з варіантів R6 може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з 5-оксо-4,5-дигідро-1,2,4-оксадіазол-3-іл, 3-карбамоїлфенілу, 2H-тетразол-5-іл, C₁₋₄ алкокси, галогену, OH, CONHOH.

Якщо R6 являє собою гетероцикліл, він переважно заміщений атомом кисню. Замісник в R6 може являти собою 2-оксо-2,3-дигідро-1H-бензо[d]імідазол-5-іл або 2-оксо-2,3-дигідробензо[d]оксазол-5-іл.

Якщо R6 являє собою гетероарил, він переважно є незаміщеним або заміщений атомом кисню. Наприклад, гетероцикліл може містити N-оксид. В одному з варіантів R6 являє собою піридил або оксид піридилу.

В іншому варіанті R8 являє собою H, галоген, OH або C₁₋₄ алкіл. Переважно, R8 являє собою H.

Формула IIb

В переважному варіанті сполук Формули IIb, R1 вибраний з H та C₁₋₄ алкілу, і R2 вибраний з арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₃₋₁₀ циклоалкілу, арил C₁₋₆ алкілу, гетероарил C₁₋₆ алкілу, гетероцикліл C₁₋₆ алкілу та C₃₋₁₀ циклоалкіл C₁₋₆ алкілу, кожен з яких може бути заміщеним або незаміщеним. Більш переважно, R1 вибраний з H, метилу та етилу, і R2 вибраний з арилу, гетероарилу, гетероциклілу та C₃₋₁₀ циклоалкілу, кожен з яких може бути заміщеним або незаміщеним. Більш переважно, R1 являє собою метил. Більш переважно, R2 вибраний з арилу, гетероарилу, гетероциклілу та C₅₋₈ циклоалкілу, кожен з яких є моноциклічним і може бути заміщеним або незаміщеним. Ще більш переважно, R2 являє собою моноциклічний арил, такий як феніл, та може бути заміщеним або незаміщеним. Якщо R2 заміщений, замісник може являти собою арил, C₁₋₄ алкокси, арил C₁₋₄ алкокси або арилокси. Переважно, замісник в R2 являє собою арил, C₁₋₃ алкокси, арил C₁₋₃ алкокси або арилокси, де арил є моноциклічним та, більш переважно, являє собою феніл.

Якщо R2 являє собою моноциклічний C₅₋₈ циклоалкіл або арил, він переважно є незаміщеним. Переважно, R2 являє собою циклогексил, такий як незаміщений циклогексил. Якщо R2 являє собою моноциклічний насичений гетероцикліл, гетероциклільне кільце переважно містить один гетероатом, такий як азот або кисень. Більш переважно, гетероцикліл є 6-членним, таким як піперидинільна або тетрагідропіранільна група. В одному з варіантів гетероатом являє собою гетероатом азоту який може бути заміщеним або незаміщеним. Переважно, гетероатом у вказаній гетероциклільній групі знаходиться в положенні 4 відносно положення приєднання гетероциклільної групи R2 до азоту сечовини. В одному з варіантів атом азоту заміщений моноциклічним арил (переважно, фенілом) C₁₋₃ алкілом.

В альтернативному переважному варіанті сполук Формули IIb, R1 та R2, разом з N, до якого вони приєднані, утворюють гетероциклільну групу, яка може бути заміщеною або незаміщеною. Переважно, гетероцикліл являє собою 5- або 6-членне моноциклічне кільце та, більш переважно, 5-членне моноциклічне кільце. В деяких варіантах вказаний гетероцикліл містить 1 або 2, переважно 1 додатковий гетероатом (тобто, на додаток до N). Вказані додаткові гетероатоми можуть являти собою, наприклад, N, O та/або S. Переважно, гетероцикліл являє собою оксазолідиніл. Переважно, атом кисню в оксазолідинілі знаходиться в положенні 3 відносно азоту сечовини. Переважно, оксазолідиніл заміщений 1, 2 або 3 метильними або етильними групами. Більш переважно, оксазолідиніл заміщений 2 метильними або етильними

групами. Ще більш переважно, оксазолідиніл заміщений 2 метильними групами при одному і тому ж атомі вуглецю. Більш переважно, оксазолідиніл являє собою 4,4-диметилוקсазолідин-3-іл.

В іншому переважному варіанті сполук Формули IIb, R1 та R2, разом з N, до якого вони приєднані, утворюють гетероциклічну групу, яка може бути заміщеною або незаміщеною. Переважно, гетероцикліл являє собою 5- або 6-членне моноциклічне кільце, більш переважно, 6-членне моноциклічне кільце. В деяких варіантах вказаний гетероцикліл містить 1 або 2, переважно 1 додатковий гетероатом (тобто, на додаток до N). Вказані додаткові гетероатоми можуть являти собою, наприклад, N, O та/або S. В одному з варіантів гетероцикліл являє собою морфоліно. В альтернативному варіанті гетероцикліл являє собою піперазиніл. В інших варіантах вказаний гетероцикліл не містить додаткових гетероатомів (тобто, він містить 1 атом N). В одному з варіантів гетероцикліл являє собою піперадиніл. Якщо гетероцикліл заміщений, він переважно заміщений арилом, арил C₁₋₄ алкілом, C₅₋₆ циклоалкілом або C₅₋₆ циклоалкіл C₁₋₄ алкілом, де арил переважно є моноциклічним, та, більш переважно, являє собою феніл, та циклоалкіл переважно являє собою циклогексил. Алкіл переважно є лінійним. В одному з варіантів гетероцикліл заміщений арилом або арил C₁₋₄ алкілом (переважно, C₁₋₂ алкілом), де арил переважно є моноциклічним та, більш переважно, являє собою феніл. Арил необов'язково може бути заміщений одним або більше атомів галогену.

У сполуках Формули IIb, R5 переважно вибраний з H, C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₃₋₈ циклоалкілу, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, R5a, галогену, OH, OR5a, SH, SR5a, OCOR5a, SCOR5a, NH₂, NO₂, NHR5a, NR5aR5b, COR5a, CSR5a, CN, COOH, COOR5a, CONH₂, SO₂R5a, SO₃H, SO₂NH₂, CONR5aR5b, SO₂NR5aR5b, де R5a та R5b незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, і R5a та R5b, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл. Більш переважно, R5 вибраний з H, C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₃₋₈ циклоалкілу, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, галогену, OH, SH, NH₂, NO₂, CN, COOH, CONH₂, SO₃H, SO₂NH₂. Ще більш переважно, R5 вибраний з H, C₁₋₄ алкілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₅₋₈ циклоалкілу, C₁₋₄ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, галогену, OH, SH, NH₂, NO₂, CN, COOH, CONH₂, SO₃H, SO₂NH₂, де арильна, гетероарильна, гетероциклільна та C₅₋₈ циклоалкільна група є моноциклічними. Навіть більш переважно, R5 вибраний з H, C₁₋₃ алкілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₅₋₈ циклоалкілу, галогену, OH, NH₂, COOH та CONH₂, де арильна, гетероарильна, гетероциклільна та C₅₋₈ циклоалкільна група є моноциклічними. Ще більш переважно, R5 вибраний з H, C₁₋₂ алкілу та галогену. Навіть більш переважно, R5 вибраний з H та галогену, такого як F, Cl та Br. В одному з варіантів R5 являє собою H.

У сполуках Формули IIb, R6 переважно вибраний з H, C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₃₋₈ циклоалкілу, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, R6a, галогену, OH, OR6a, SH, SR6a, OCOR6a, SCOR6a, NH₂, NO₂, NHR6a, NR6aR6b, COR6a, CSR6a, CN, COOH, COOR6a, CONH₂, SO₂R6a, SO₃H, SO₂NH₂, CONR6aR6b, SO₂NR6aR6b, де R6a та R6b незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, і R6a та R6b, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл. Більш переважно, R6 вибраний з H, C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₃₋₈ циклоалкілу, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, галогену, OH, SH, NH₂, NO₂, CN, COOH, CONH₂, SO₃H, SO₂NH₂. Ще більш переважно, R6 вибраний з H, C₁₋₄ алкілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₅₋₈ циклоалкілу, C₁₋₄ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, галогену, OH, SH, NH₂, NO₂, CN, COOH, CONH₂, SO₃H, SO₂NH₂, де арильна, гетероарильна, гетероциклільна та C₅₋₈ циклоалкільна група є моноциклічними. Навіть більш переважно, R6 вибраний з H, C₁₋₃ алкілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₅₋₈ циклоалкілу, галоген, OH, NH₂, COOH та CONH₂, де арильна, гетероарильна, гетероциклільна та C₅₋₈ циклоалкільна група є моноциклічними. Ще більш переважно, R6 вибраний з H, C₁₋₂ алкілу та галогену. Навіть більш переважно, R6 вибраний з H та галогену, такого як F, Cl та Br. В одному з варіантів R6 являє собою H.

У сполуках Формули IIb, R7 переважно вибраний з арилу, гетероарилу, гетероциклілу та C₃₋₈ циклоалкілу, кожен з яких може бути заміщеним або незаміщеним. Більш переважно, R7 вибраний з арилу та гетероарилу, кожен з яких може бути заміщеним або незаміщеним. В одному з варіантів гетероарил містить один гетероатом, наприклад кисень або атом азоту. Переважно, арил або гетероарил є моноциклічним. Більш переважно, арил або гетероарил являє собою 6-членне моноциклічне кільце. В одному з варіантів гетероарил містить атом азоту, що заміщений атомом кисню, наприклад, в оксидопіридилі. В іншому варіанті R7 являє собою незаміщений моноциклічний арил, такий як феніл, або моноциклічний арил, такий як

феніл, заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, C₁₋₂ алкокси (необов'язково заміщений одним або більше атомів галогену), або OH. В конкретному варіанті R7 являє собою незаміщений моноциклічний арил, такий як феніл.

Якщо R7 заміщений, замісник переважно являє собою одну або більше груп, вибраних з галогену, C₁₋₄ алкокси, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, OH, CONH₂, NH₂, гетероцикліл C₁₋₄ алкокси, арил C₁₋₄ алкокси, гетероарил C₁₋₄ алкокси, NO₂, SO₂NH₂, SO₃, C(NO₂)NH₂ та морфоліносультонілу. Переважно, арил, гетероарил та гетероцикліл є моноциклічними. В одному з варіантів арил, гетероарил та гетероцикліл являють собою 6-членне моноциклічне кільце. В конкретному варіанті, в якому R7 являє собою моноциклічний арил, він необов'язково може бути заміщений арилом або гетероарилом, кожен з яких є моноциклічним.

Формула IIc

В переважному варіанті сполук Формули IIc, R1 вибраний з H та C₁₋₄ алкілу, і R2 вибраний з арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₃₋₁₀ циклоалкілу, арил C₁₋₆ алкілу, гетероарил C₁₋₆ алкілу, гетероцикліл C₁₋₆ алкілу та C₃₋₁₀ циклоалкіл C₁₋₆ алкілу, кожен з яких може бути заміщеним або незаміщеним. Більш переважно, R1 вибраний з H, метилу та етилу, і R2 вибраний з арилу, гетероарилу, гетероциклілу та C₃₋₁₀ циклоалкілу, кожен з яких може бути заміщеним або незаміщеним. Більш переважно, R1 являє собою метил. Більш переважно, R2 вибраний з арилу, гетероарилу, гетероциклілу та C₅₋₈ циклоалкілу, кожен з яких є моноциклічним і може бути заміщеним або незаміщеним. Ще більш переважно, R2 вибраний з арилу, такого як феніл, насичений гетероцикліл та C₅₋₈ циклоалкіл, кожен з яких є моноциклічним і може бути заміщеним або незаміщеним. Якщо R2 є моноциклічним C₅₋₈ циклоалкіл або арил, він переважно є незаміщеним. Переважно, R2 являє собою циклогексил, такий як незаміщений циклогексил. Якщо R2 являє собою моноциклічний насичений гетероцикліл, гетероциклільне кільце переважно містить один гетероатом, такий як азот або кисень. Більш переважно, гетероцикліл є 6-членним, таким як піперидинільна або тетрагідропіранільна група. В одному з варіантів гетероатом являє собою гетероатом азоту який може бути заміщеним або незаміщеним. Переважно, гетероатом у вказаній гетероциклільній групі знаходиться в положенні 4 відносно положення приєднання гетероциклільної групи R2 до азоту сечовини. В одному з варіантів атом азоту заміщений моноциклічним арил (переважно, феніл) C₁₋₃ алкілом.

В альтернативному переважному варіанті сполук Формули IIc, R1 та R2, разом з N, до якого вони приєднані, утворюють гетероциклільну групу, яка може бути заміщеною або незаміщеною. Переважно, гетероцикліл являє собою 5- або 6-членне моноциклічне кільце та, більш переважно, 5-членне моноциклічне кільце. В деяких варіантах вказаний гетероцикліл містить 1 або 2, переважно 1 додатковий гетероатом (тобто, на додаток до N). Вказані додаткові гетероатоми можуть являти собою, наприклад, N, O та/або S. Переважно, гетероцикліл являє собою оксазолідиніл. Переважно, атом кисню в оксазолідинілі знаходиться в положенні 3 відносно азоту сечовини. Переважно, оксазолідиніл заміщений 1, 2 або 3 метильними або етильними групами. Більш переважно, оксазолідиніл заміщений 2 метильними або етильними групами. Ще більш переважно, оксазолідиніл заміщений 2 метильними групами при одному і тому ж атомі вуглецю. Більш переважно, оксазолідиніл являє собою 4,4-диметилוקсазолідин-3-іл.

В іншому переважному варіанті сполук Формули IIc, R1 та R2, разом з N, до якого вони приєднані, утворюють гетероциклільну групу, яка може бути заміщеною або незаміщеною. Переважно, гетероцикліл являє собою 5- або 6-членне моноциклічне кільце, більш переважно, 6-членне моноциклічне кільце. В деяких варіантах вказані гетероцикліл містить 1 або 2, переважно 1 додатковий гетероатом (тобто, на додаток до N). Вказані додаткові гетероатоми можуть являти собою, наприклад, N, O та/або S. В одному з варіантів гетероцикліл являє собою морфоліно. В альтернативному варіанті гетероцикліл являє собою піперазиніл. В інших варіантах вказаний гетероцикліл не містить додаткових гетероатомів (тобто, він містить 1 атом N). В одному з варіантів гетероцикліл являє собою піперадиніл. Якщо гетероцикліл заміщений, він переважно заміщений арилом, арил C₁₋₄ алкілом, C₅₋₆ циклоалкілом або C₅₋₆ циклоалкіл C₁₋₄ алкілом, де арил переважно є моноциклічним та, більш переважно, являє собою феніл, та циклоалкіл переважно являє собою циклогексил. Алкіл переважно є лінійним. В одному з варіантів гетероцикліл заміщений арилом або арил C₁₋₄ алкілом (переважно, C₁₋₂ алкілом), де арил переважно є моноциклічним та, більш переважно, являє собою феніл. Арил необов'язково може бути заміщений одним або більше атомів галогену.

У сполуках Формули IIc, R5 переважно вибраний з H, C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₃₋₈ циклоалкілу, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, R5a, галогену, OH, OR5a, SH, SR5a, OCOR5a, SCOR5a, NH₂, NO₂, NHR5a, NR5aR5b, COR5a, CSR5a, CN, COOH, COOR5a, CONH₂, SO₂R5a, SO₃H, SO₂NH₂, CONR5aR5b, SO₂NR5aR5b, де R5a та

R5b незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, і R5a та R5b, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл. Більш переважно, R5 вибраний з H, C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₃₋₈ циклоалкілу, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, галогену, OH, SH, NH₂, NO₂, CN, COOH, CONH₂, SO₃H, SO₂NH₂. Ще більш переважно, R5 вибраний з H, C₁₋₄ алкілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₅₋₈ циклоалкілу, C₁₋₄ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, галогену, OH, SH, NH₂, NO₂, CN, COOH, CONH₂, SO₃H, SO₂NH₂, де арильна, гетероарильна, гетероциклільна та C₅₋₈ циклоалкільна група є моноциклічними. Навіть більш переважно, R5 вибраний з H, C₁₋₃ алкілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₅₋₈ циклоалкілу, галогену, OH, NH₂, COOH та CONH₂, де арильна, гетероарильна, гетероциклільна та C₅₋₈ циклоалкільна група є моноциклічними. Ще більш переважно, R5 вибраний з H, C₁₋₂ алкілу та галогену. Навіть більш переважно, R5 вибраний з H та галогену, такого як F, Cl та Br. В одному з варіантів R5 являє собою H.

У сполуках Формули IIc, R6 переважно вибраний з арилу, гетероарилу, гетероциклілу та C₃₋₈ циклоалкілу, кожен з яких може бути заміщеним або незаміщеним. Більш переважно, R6 вибраний з арилу та гетероарилу, кожен з яких може бути заміщеним або незаміщеним. В одному з варіантів гетероарил містить один гетероатом, наприклад, кисень або атом азоту. Переважно, арил або гетероарил є моноциклічним. Більш переважно, арил або гетероарил являє собою 6-членне моноциклічне кільце. В одному з варіантів гетероарил містить атом азоту, заміщений атомом кисню, такий як оксидопіридил. В іншому варіанті R6 являє собою незаміщений моноциклічний арил, такий як феніл, або моноциклічний арил, такий як феніл, заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, C₁₋₂ алкокси (необов'язково заміщеного одним або більше атомів галогену) або OH. В переважному варіанті R6 являє собою незаміщений арил та, переважно, моноциклічний арил, такий як феніл.

Якщо R6 заміщений, замісник переважно являє собою одну або більше груп, вибраних з галогену, C₁₋₄ алкокси, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, OH, CONH₂, NH₂, гетероциклілу C₁₋₄ алкокси, арил C₁₋₄ алкокси, гетероарил C₁₋₄ алкокси, NO₂, SO₂NH₂, SO₃, C(NO₂)NH₂ та морфоліносультонілу. Переважно, арил, гетероарил та гетероцикліл є моноциклічними. В одному з варіантів арил, гетероарил та гетероцикліл являють собою 6-членні моноциклічні кільця. В конкретному варіанті, в якому R6 являє собою моноциклічний арил, він необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, OH, C₁₋₃ алкокси, арилу (наприклад, моноциклічного арилу, такого як феніл), гетероарилу (наприклад, моноциклічного гетероарилу, що містить 1 або 2 атоми азоту, або 1 атом кисню), гетероциклілу (наприклад, піперазинілу, піперадинілу або морфоліно) C₁₋₃ алкокси, арилу (наприклад, моноциклічного арилу, такого як феніл) C₁₋₃ алкокси, CONH₂, NH₂, NO₂, OCHF₂, SO₂NH₂, морфоліносультонілу та C(NO₂)NH₂.

В одному з варіантів якщо R6 являє собою моноциклічний арил, такий як феніл, замісник в R6 являє собою арил, переважно моноциклічний арил, такий як феніл, який може бути заміщеним або незаміщеним. Якщо він заміщений, переважно він заміщений CONH₂.

Якщо замісник в R6 являє собою C₁₋₄ алкокси, арил, гетероарил, гетероцикліл, гетероцикліл C₁₋₄ алкокси, арил C₁₋₄ алкокси, гетероарил C₁₋₄ алкокси або SO₃, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, OH, C₁₋₃ алкокси (який може бути заміщений одним або більше атомів галогену), CONH₂, CN, NCH₃CH₃, NHCOCH₃, метилгідроксибутилу та метилгідроксибутинілу.

Формула II d

В переважному варіанті сполук Формули II d, R1 вибраний з H та C₁₋₄ алкілу, і R2 вибраний з арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₃₋₁₀ циклоалкілу, арил C₁₋₆ алкілу, гетероарил C₁₋₆ алкілу, гетероцикліл C₁₋₆ алкілу та C₃₋₁₀ циклоалкіл C₁₋₆ алкілу, кожен з яких може бути заміщеним або незаміщеним. Більш переважно, R1 вибраний з H, метилу та етилу, і R2 вибраний з арилу, гетероарилу, гетероциклілу та C₃₋₁₀ циклоалкілу, кожен з яких може бути заміщеним або незаміщеним. Більш переважно, R1 являє собою метил. Більш переважно, R2 вибраний з арилу, гетероарилу, гетероциклілу та C₅₋₈ циклоалкілу, кожен з яких є моноциклічним і може бути заміщеним або незаміщеним. Ще більш переважно, R2 вибраний з арилу, такого як феніл, насиченого гетероциклілу та C₅₋₈ циклоалкілу, кожен з яких є моноциклічним і може бути заміщеним або незаміщеним. Навіть більш переважно, R2 являє собою арил, такий як феніл, що є моноциклічним та може бути заміщеним або незаміщеним. Якщо R2 заміщений, замісник переважно являє собою один або більше атомів галогену.

В одному з варіантів R2 являє собою циклогексил, такий як незаміщений циклогексил. Якщо R2 являє собою моноциклічний насичений гетероцикліл, гетероциклільне кільце переважно містить один гетероатом, такий як азот або кисень. Більш переважно, гетероцикліл є 6-членним,

таким як піперидинільна або тетрагідропіранільна група. В одному з варіантів гетероатом являє собою гетероатом азоту, який може бути заміщеним або незаміщеним. Переважно, гетероатом у вказаній гетероциклічній групі знаходиться в положенні 4 відносно положення приєднання гетероциклічної групи R2 до азоту сечовини. В одному з варіантів атом азоту заміщений

5 моноциклічним арилом (переважно феніл) C₁₋₃ алкілом.

В альтернативному переважному варіанті сполук Формули IId, R1 та R2, разом з N, до якого вони приєднані, утворюють гетероциклічну групу, яка може бути заміщеною або незаміщеною. Переважно, гетероциклічній групі належить бути 5- або 6-членним моноциклічним кільцем та, більш переважно, 5-членним моноциклічним кільцем. В деяких варіантах вказаний гетероциклічній групі належить містити 1

10 або 2, переважно 1 додатковий гетероатом (тобто, на додаток до N). Вказані додаткові гетероатоми можуть являти собою, наприклад, N, O та/або S. Переважно, гетероциклічній групі належить бути оксазолідинілом. Переважно, атом кисню в оксазолідинілі знаходиться в положенні 3 відносно азоту сечовини. Переважно, оксазолідиніл заміщений 1, 2 або 3 метильними або етильними групами. Більш переважно, оксазолідиніл заміщений 2 метильними або етильними групами. Ще більш переважно, оксазолідиніл заміщений 2 метильними групами при одному і

15 тому ж атомі вуглецю. Більш переважно, оксазолідиніл являє собою 4,4-диметил-оксазолідин-3-іл.

В іншому переважному варіанті сполук Формули IId, R1 та R2, разом з N, до якого вони приєднані, утворюють гетероциклічну групу, яка може бути заміщеною або незаміщеною. Переважно, гетероциклічній групі належить бути 5- або 6-членним моноциклічним кільцем, більш переважно, 6-членним моноциклічним кільцем. В деяких варіантах вказаний гетероциклічній групі належить містити 1 або 2, переважно 1 додатковий гетероатом (тобто, на додаток до N). Вказані додаткові гетероатоми можуть являти собою, наприклад, N, O та/або S. В одному з варіантів гетероциклічній групі належить бути морфоліном. В альтернативному варіанті гетероциклічній групі належить бути піперазинілом. В інших

25 варіантах вказаний гетероциклічній групі належить не містити додаткових гетероатомів (тобто, він містить 1 атом N). В одному з варіантів гетероциклічній групі належить бути піперадинілом. Якщо гетероциклічній групі належить бути заміщеною, він переважно заміщений арилом, арилом C₁₋₄ алкілом, C₅₋₆ циклоалкілом, або C₅₋₆ циклоалкілом C₁₋₄ алкілом, де арил переважно є моноциклічним та, більш переважно, являє собою феніл, і циклоалкіл переважно являє собою циклогексил. Алкіл переважно є лінійним. В одному з

30 варіантів гетероциклічній групі належить бути заміщеною арилом або арилом C₁₋₄ алкілом (переважно, C₁₋₂ алкіл), де арил переважно є моноциклічним та, більш переважно, являє собою феніл. Арил необов'язково може бути заміщений одним або більше атомів галогену.

У сполуках Формули IId, R5 переважно вибраний з H, C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₃₋₈ циклоалкілу, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, R5a, галогену, OH, OR5a, SH, SR5a, OCOR5a, SCOR5a, NH₂, NO₂, NHR5a, NR5aR5b, COR5a, CSR5a, CN, COOH, COOR5a, CONH₂, SO₂R5a, SO₃H, SO₂NH₂, CONR5aR5b, SO₂NR5aR5b, де R5a та R5b незалежно вибрані з C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈ циклоалкілу та гетероциклілу, і R5a та R5b, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероциклічній групі.

Більш переважно, R5 вибраний з H, C₁₋₆ алкілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₃₋₈ циклоалкілу, C₁₋₆ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, галогену, OH, SH, NH₂, NO₂, CN, COOH, CONH₂, SO₃H, SO₂NH₂. Ще більш переважно, R5 вибраний з H, C₁₋₄ алкілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₅₋₈ циклоалкілу, C₁₋₄ алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, галогену, OH, SH, NH₂, NO₂, CN, COOH, CONH₂, SO₃H, SO₂NH₂, де арильна, гетероарильна, гетероциклічній групі належить бути моноциклічними. Навіть більш

45 переважно, R5 вибраний з H, C₁₋₃ алкілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₅₋₈ циклоалкілу, галогену, OH, NH₂, COOH та CONH₂, де арильна, гетероарильна, гетероциклічній групі належить бути моноциклічними. Ще більш переважно, R5 вибраний з H, C₁₋₂ алкілу та галогену. Навіть більш переважно, R5 вибраний з H та галогену, такого як F, Cl та Br. В одному з варіантів R5 являє собою H.

У сполуках Формули IId, R7 переважно вибраний з арилу, гетероарилу, гетероциклілу та C₃₋₈ циклоалкілу, кожен з яких може бути заміщеним або незаміщеним. Більш переважно, R7 вибраний з арилу та гетероарилу, кожен з яких може бути заміщеним або незаміщеним. В одному з варіантів гетероарил містить один гетероатом, наприклад, кисень або атом азоту. Переважно, арил або гетероарил є моноциклічним. Більш переважно, арил або гетероарил

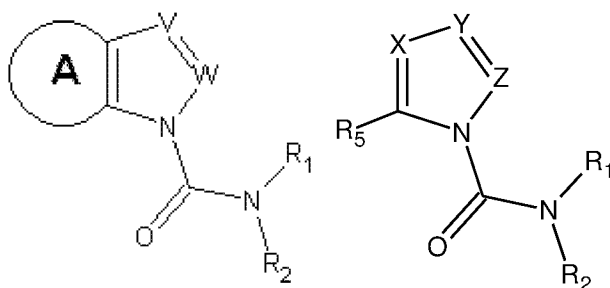
55 являє собою 6-членним моноциклічним кільцем. В одному з варіантів гетероарил містить атом азоту, що заміщений атомом кисню, такий як оксидопіридил. В іншому варіанті R7 являє собою незаміщений моноциклічний арил, такий як феніл, або моноциклічний арил, такий як феніл, заміщений однією або більше групами, вибраними з галогену, C₁₋₂ алкокси (необов'язково заміщений одним або більше атомів галогену) або OH.

60 Якщо R7 заміщений, замісник переважно являє собою одну або більше груп, вибраних з

галогену, C₁₋₄ алкокси, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, OH, CONH₂, NH₂, гетероциклілу C₁₋₄ алкокси, арил C₁₋₄ алкокси, гетероарил C₁₋₄ алкокси, NO₂, SO₂NH₂, SO₃, C(NOH)NH₂ та морфоліносультонілу. Переважно, арил, гетероарил та гетероциклілу є моноциклічними. В одному з варіантів арил, гетероарил та гетероциклілу являють собою 6-членні моноциклічні кільця. В конкретному варіанті, в якому R7 являє собою моноциклічний арил, він необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, OH, C₁₋₃ алкокси, арилу (наприклад, моноциклічного арилу, такого як феніл), гетероарилу (наприклад, моноциклічного гетероарилу, що містить один або два атома азоту, або один атом кисню), гетероциклілу (наприклад, піперазиніл, піперадиніл або морфоліно) C₁₋₃ алкокси, арил (наприклад, моноциклічний арил, такий як феніл) C₁₋₃ алкокси, CONH₂, NH₂, NO₂, OCHF₂, SO₂NH₂, морфоліносультонілу та C(NOH)NH₂. В одному з варіантів якщо R7 являє собою моноциклічний арил, такий як феніл, замісник в R7 являє собою арил (наприклад, моноциклічний арил, такий як феніл) C₁₋₃ алкокси.

Якщо замісник в R7 являє собою C₁₋₄ алкокси, арил, гетероарил, гетероциклілу, гетероциклілу C₁₋₄ алкокси, арил C₁₋₄ алкокси, гетероарил C₁₋₄ алкокси або SO₃, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше груп, вибраних з галогену, OH, C₁₋₃ алкокси (який може бути заміщений одним або більше атомів галогену), CONH₂, CN, NCH₃CH₃, NHCOCH₃, метилгідроксибутилу та метилгідроксибутинілу.

В альтернативному варіанті винаходу запропонована сполука Формули I або Формули II:



Формула I Формула II

де R1, R2, R5, кільце A, V, W, X, Y та Z є такими, як визначено вище;

або її фармацевтично прийнятна сіль або естер;

за умови, що кільце A в сполуках Формули I не утворює піридину, піримідину, заміщеного піридину або заміщеного піримідину, якщо R1 та R2, разом з N, до якого вони приєднані, утворюють піперидиніл, піперазиніл, заміщений піперидиніл або заміщений піперазиніл,

за умови, що кільце A не являє собою незаміщений бензо, гідроксибензо, феноксibenзо, фторхлорбензо, хлорбензо, бромбензо, нітробензо, амінобензо, ціанобензо, метилбензо, трифторметилбензо, трифторметилхлорбензо, фенілкетобензо, фенілгідроксиметилбензо, циклогексилтіобензо, метоксикарбонілбензо або метоксибензо,

за умови, що якщо R1 або R2 являє собою метил, інший з R1 або R2 не являє собою 4-хлорбутил, 4-азидобутил або 4-ізотіоціанатобутил, та

за умови, що сполука не являє собою (4-феніл-1H-імідазол-1-іл)(4-(хінолін-2-ілметил)піперазин-1-іл)метанон.

Відповідно до другого аспекту винаходу запропонована фармацевтична композиція, що містить сполуку у відповідності до першого аспекту винаходу, разом з однією або більше фармацевтично прийнятних допоміжних речовин.

Фармацевтичні композиції за даним винаходом містять будь-яку із сполук у відповідності до першого аспекту даного винаходу з будь-яким фармацевтично прийнятним носієм, допоміжною речовиною або розчинником. Фармацевтично прийнятні носії, допоміжні речовини і розчинники, які можуть бути використані у фармацевтичних композиціях за даним винаходом являють собою широко використовувані у сфері фармацевтичних препаратів і включають, не обмежуючись ними, цукор, цукрові спирти, крохмалі, іонообмінні речовини, кремнію діоксид, алюмінію стеарат, лецитин, білки сироватки, такі як альбумін людської сироватки, буферні субстанції, такі як фосфати, гліцерин, сорбінова кислота, калію сорбат, суміші часткових гліцеридів насичених жирних кислот рослинного походження, вода, солі або електроліти, такі як протаміну сульфат, динатрію гідрофосфат, калію гідрофосфат, натрію хлорид, солі цинку, колоїдний кремнію діоксид, магнію трисилікат, полівінілпіролідон, субстанції на базі целюлози, поліетиленгліколь, натрій карбоксиметилцелюлоза, поліакрилати, віск, блоку-полімери

поліетилен-поліоксипропілен, поліетиленгліколь і вовняний жир.

Фармацевтичні композиції за даним винаходом можна вводити перорально, парентерально, інгаляцією спрею, ректально, назально, букально, вагінально або через імплантований резервуар. Пероральне введення є переважним. Фармацевтичні композиції за даним винаходом можуть містити будь-які традиційні нетоксичні фармацевтично прийнятні носії, допоміжні речовини або розчинники. Термін "парентеральний" в даному описі включає підшкірний, внутрішньошкірний, внутрішньовенний, внутрішньом'язовий, внутрішньосуглобовий, інтрасиновіальний, інтрастернальний, інтратекальний, в ураження та інтракраніальний методи ін'єкції або інфузії.

Фармацевтичні композиції можуть набувати форми стерильного ін'єкційного препарату, наприклад, стерильної водної або масляної суспензії для ін'єкцій. Така суспензія може бути утворена за методами, відомими фахівцю в даній галузі, з використанням придатних диспергувальних або зволожувальних засобів (наприклад, Твіну 80) і суспендувальних засобів. Стерильний ін'єкційний препарат також може являти собою стерильний ін'єкційний розчин або суспензією в нетоксичному, прийнятному для парентерального введення розбавлювачі або розчиннику, наприклад, у формі розчину в 1,3-бутандіолі. Серед прийнятних носіїв і розчинників, які можуть бути використані, — маніт, вода, розчин Рінгера та ізотонічний розчин натрію хлориду. Крім того, стерильні, нелеткі масла широко використовуються як розчинник або середовище для суспендування. Для цієї мети, будь-яке легке нелетке масло може бути використане, в тому числі, синтетичні моно- або дигліцериди. Жирні кислоти, такі як олеїнова кислота та її гліцеридні похідні, придатні для виготовлення ін'єкційних форм, як і природні фармацевтично прийнятні олії, такі як оливкова олія або рицинова олія, особливо в поліоксиетильованих формах. Вказані масляні розчини або суспензії також можуть містити розбавлювач у формі спирту з довгим ланцюгом або диспергувальний засіб, наприклад, такий, як описано у Швейцарській Фармакопеї, або подібний спирт.

Фармацевтичні композиції за даним винаходом для перорального застосування можна вводити в будь-якій прийнятній для прийому всередину лікарської формі, в тому числі, не обмежуючись ними, капсули, таблетки, порошки, гранули, а також водні суспензії і розчини. Вказані лікарські форми одержані за методами, відомими з рівня техніки в галузі фармацевтичних препаратів. У разі таблеток для перорального введення, носії, які звичайно використовуються, включають лактозу і кукурудзяний крохмаль. Також звичайно додають змащувальні засоби, такі як стеарат магнію. Для перорального введення у формі капсули придатні розбавлювачі включають лактозу і сухий кукурудзяний крохмаль. Якщо водні суспензії вводять перорально, активний інгредієнт поєднують з емульгаторами і суспендувальними засобами. За бажанням, можуть бути додані деякі підсолоджувачі та/або ароматизатори та/або барвники.

Фармацевтичні композиції за даним винаходом можна також вводити у формі супозиторію для ректального введення. Вказані композиції можуть бути одержані шляхом змішування сполуки за даним винаходом з придатною не подразнюючою допоміжною речовиною, яка є твердою при кімнатній температурі, але рідкою при температурі прямої кишки і, таким чином, плавиться в прямій кишці з вивільненням активних компонентів. Такі матеріали включають, не обмежуючись ними, масло какао, віск і поліетиленгліколі.

Фармацевтичні композиції за даним винаходом можна вводити у формі назального аерозолю або інгаляції. Такі композиції одержують за методами, відомими з рівня техніки в галузі фармацевтичних препаратів, і вони можуть бути одержані у формі розчинів в розчинах солі, з використанням бензилового спирту або інших придатних консервантів, засобів, що сприяють абсорбції для збільшення біодоступності, похідних фторвуглецю та/або інших солюбілізаторів або диспергувальних засобів, відомих з рівня техніки.

Сполуки за даним винаходом можна вводити в дозі від приблизно 1 до приблизно 20 000 мкг/кг на дозу, в залежності від стану, який підлягає лікуванню або попередженню, і характеристик суб'єкта, якому вводять сполуку. У багатьох випадках, доза, може становити від приблизно 1 до приблизно 1500 мг/кг/дозу. Схема лікування для конкретної сполуки може бути легко визначена фахівцем, що має доступ до даного опису.

В одному з конкретних варіантів, фармацевтична композиція за винаходом додатково містить один або більше додаткових активних фармацевтичних інгредієнтів. Сполуку за винаходом можна вводити з одним або більше додаткових активних фармацевтичних інгредієнтів. Це може бути здійснено у формі єдиної композиції, що містить сполуку за винаходом і один або більше додаткових активних фармацевтичних інгредієнтів. Альтернативно, це може бути здійснено у формі двох або більше окремих композицій, де сполука за винаходом міститься в одній композиції, та один або більше додаткових активних

фармацевтичних інгредієнтів містяться в одній або більше окремих композицій.

У третьому аспекті даного винаходу пропонується сполука у відповідності до першого аспекту винаходу або композиція у відповідності до другого аспекту для застосування в терапії.

У четвертому аспекті винаходу пропонується сполука у відповідності до першого аспекту
 5 винаходу або композиція у відповідності до другого аспекту для застосування в лікуванні або профілактиці стану, розвиток або симптоми яких пов'язані із субстратом ферменту ГАЖК, де єдині умови першого аспекту, які застосовують, — це i) що кільце А в сполуках Формули I не утворює піридин, піримідин, заміщений піридин або заміщений піримідин, якщо R1 і R2, разом з N, до якого вони приєднані, утворюють пиперидиніл, піперазиніл, заміщений пиперидиніл або
 10 заміщений піперазиніл, ii) якщо R1 або R2 являє собою метил, інший R1 або R2 не є 4-хлорбутилом, 4-азидобутилом або 4-ізотіоціанатобутилом, і iii) сполука не являє собою (4-феніл-1Н-імідазол-1-іл)(4-(хінолін-2-ілметил) піперазин-1-іл)метанон.

У винаході також запропоноване застосування сполуки у відповідності до першого аспекту винаходу або композиції у відповідності до другого аспекту у виробництві лікарського засобу
 15 для лікування або профілактики стану, розвиток або симптоми яких пов'язані із субстратом ферменту ГАЖК, де єдині умови першого аспекту, які застосовують, — це i) що кільце А в сполуках Формули I не утворює піридин, піримідин, заміщений піридин або заміщений піримідин, якщо R1 і R2, разом з N, до якого вони приєднані, утворюють пиперидиніл, піперазиніл, заміщений пиперидиніл або заміщений піперазиніл, ii) якщо R1 або R2 являє собою
 20 метил, інший R1 або R2 не є 4-хлорбутилом, 4-азидобутилом або 4-ізотіоціанатобутилом, і iii) сполука не являє собою (4-феніл-1Н-імідазол-1-іл)(4-(хінолін-2-ілметил) піперазин-1-іл)метанон.

Цілий ряд станів, розвиток або симптоми яких пов'язані із субстратом ферменту ГАЖК, відомі фахівцю. Вище обговорені деяких з них.

У п'ятому аспекті винаходу також пропонується спосіб лікування або профілактики стану,
 25 розвиток або симптоми якого пов'язані із субстратом ферменту ГАЖК, де спосіб включає введення суб'єкту, який потребує такого лікування або профілактики, терапевтично ефективної кількості сполуки у відповідності до першого аспекту винаходу або композиції у відповідності до другого аспекту, де єдині умови першого аспекту, які застосовують, — це i) що кільце А в сполуках Формули I не утворює піридин, піримідин, заміщений піридин або заміщений
 30 піримідин, якщо R1 і R2, разом з N, до якого вони приєднані, утворюють пиперидиніл, піперазиніл, заміщений пиперидиніл або заміщений піперазиніл, ii) якщо R1 або R2 являє собою метил, інший R1 або R2 не є 4-хлорбутилом, 4-азидобутилом або 4-ізотіоціанатобутилом, і iii) сполука не являє собою (4-феніл-1Н-імідазол-1-іл)(4-(хінолін-2-ілметил)піперазин-1-іл)метанон.

Сполука у відповідності до четвертого аспекту або спосіб у відповідності до п'ятого аспекту,
 35 де стан являє собою розлад, пов'язаний з ендоканабіноїдною системою.

У деяких варіантах, вид стану, який підлягає лікуванню, може бути вибраний з:

(i) болю, зокрема гострого або хронічного нейрогенного болю, такого як мігрень і невропатичний біль (наприклад, діабетичний невропатичний біль, постгерпетична невралгія, тригемінальна невралгія); гострого або хронічного болю, пов'язаного із запальними
 40 захворюваннями, такими як артрит, ревматоїдний артрит, остеоартрит, спондиліт, подагра, васкуліт, хвороба Крона і синдром подразненого кишечника; гострого або хронічного периферичного болю;

(ii) запаморочення, блювання і нудота, зокрема, внаслідок хіміотерапії;

(iii) розлади харчування, зокрема анорексія і кахексія різноманітної природи;

45 (iv) неврологічні і психіатричні патології, такі як струси, дискінезії, дистонії, спастичність, обсессивно-компульсивна поведінка, синдром Туретта, всі форми депресії і занепокоєння будь-якої природи і походження, розлади настрою і психози;

(v) гострі і хронічні нейродегенеративні захворювання, такі як хвороба Паркінсона, хвороба Альцгеймера, стареча деменція, хорея Хантінгтона, пошкодження, пов'язані з ішемією мозку та
 50 черепно-мозковою травмою;

(vi) епілепсія;

(vii) розлади сну, в тому числі апное сну;

(viii) серцево-судинні захворювання, такі як серцева недостатність, гіпертензія, серцеві аритмії, артеріосклероз, серцевий напад, ішемія серця та ішемія нирок;

55 (ix) різні види раку, наприклад, доброякісні пухлини шкіри, пухлини мозку і папіломи, пухлини передміхурової залози і мозкові пухлини (гліобластоми, медулоепітеліоми, медулобластоми, нейробластоми, пухлини ембріонального походження, астроцити, астробластоми, епендиміоми, олігодендрогліоми, пухлина плексусу, нейроепітеліоми, пухлина епіфізу, епендімобластоми, злоякісні менінгіоми, саркоматоз, злоякісні меланоми і шваноми);

60 (x) розлади імунної системи, зокрема, аутоімунні захворювання, такі як псоріаз, червоний

вовчак, захворювання сполучної тканини або захворювання колагену, синдром Сьоргена, анкілозивний спондиліт, недиференційований спондиліт, хвороба Бехчета, аутоімунна гемолітична анемія, множинний склероз, аміотрофний латеральний склероз, амілоїдоз, відторгнення трансплантату, захворювання, що впливають на плазмацитарну лінію, алергічні захворювання; негайна або затримана гіперчутливість, алергічний риніт або кон'юнктивіт, контактний дерматит;

(xi) паразитарні, вірусні або бактеріальні інфекційні захворювання, такі як СНІД і менінгіт;

(xii) запальні захворювання, зокрема, захворювання суглобів, такі як артрит, ревматоїдний артрит, остеоартрит, спондиліт, подагра, васкуліт, хвороба Крона, синдром подразненого кишечника;

(xiii) остеопороз;

(xiv) офтальмологічні стани, такі як підвищений очний тиск і глаукома;

(xv) легеневі стани, в тому числі захворювань дихальних шляхів, бронхоспазм, кашель, астма, хронічний бронхіт, хронічна обструкція дихальних шляхів та емфізема;

(xvi) шлунково-кишкові захворювання, такі як синдром подразненого кишечника, запальні розлади кишечника, виразки, діарея, нетримання сечі і запалення сечового міхура.

У шостому аспекті даного винаходу пропонується застосування сполуки у відповідності до першого аспекту винаходу у виготовленні лікарського засобу для лікування або профілактики стану, розвиток або симптоми якого пов'язані із субстратом ферменту ГАЖК, де єдина умова першого аспекту, яку застосовують, — це те, що кільце А в сполуках Формули I не утворює піридин, піримідин, заміщений піридин або заміщений піримідин, якщо R1 і R2, разом з N, до якого вони приєднані, утворюють пиперидиніл, піперазиніл, заміщений пиперидиніл або заміщений піперазиніл.

Вище наведені приклади станів, що відповідають шостому аспекту.

У деяких варіантах четвертого, п'ятого або шостого аспектів також застосовуються одна або обидві інші умови першого аспекту.

Далі винахід буде описаний детальніше тільки за допомогою прикладів.

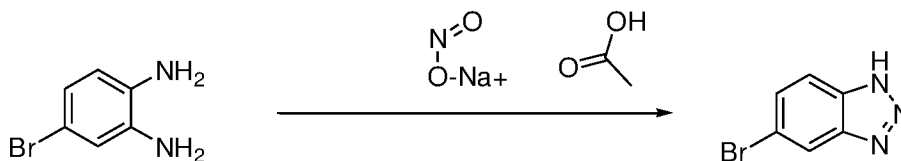
1. Методологія синтезу

Способи, які застосовуються для синтезу сполук за винаходом, проілюстровані загальними схемами нижче і наступними препаративними прикладами. Всі сполуки і проміжні сполуки охарактеризовані даними ядерного магнітного резонансу (ЯМР). Початкові матеріали і реактиви, використані для одержання вказаних сполук, доступні від комерційних постачальників або можуть бути одержані за способами, очевидними для фахівців в даній галузі. Вказані загальні схеми являють собою тільки ілюстрації способів, якими сполуки за даним винаходом можуть бути синтезовані, і різноманітні модифікації вказаних схем можуть бути здійснені і будуть спадати на думку фахівцю в даній галузі на базі даного опису.

Кімнатна температура на наступних схемах позначає температуру в інтервалі від 20°C до 25°C.

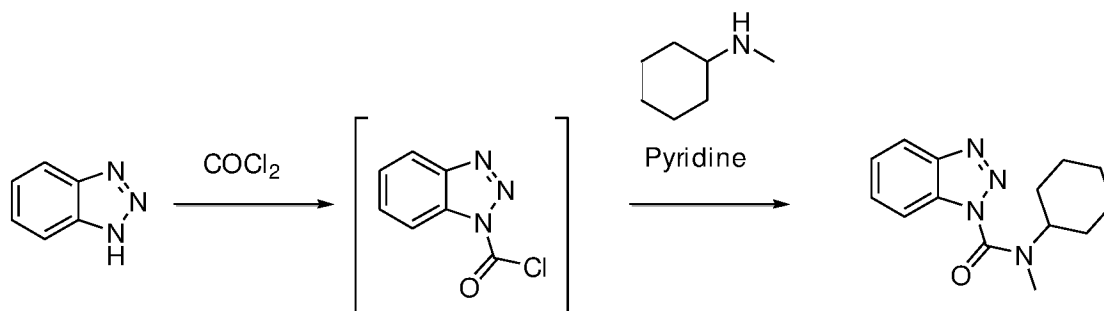
БЕНЗОТРИАЗОЛИ

5-Бром-1Н-бензо[d][1,2,3]триазол (утворення похідного 1Н-бензо[d][1,2,3]триазолу).



До розчину 4-бромбензол-1,2-діаміну (10 г, 53,5 ммоль) в суміші оцтової кислоти (20 мл, 349 ммоль) та води (100 мл) при 0–5°C по краплях додають розчин натрію нітриту (4,06 г, 58,8 ммоль) у воді (10 мл). Після перемішування на льодяній бані протягом 1 год., додають додаткову кількість оцтової кислоти (20 мл, 349 ммоль), нагрівають при перемішуванні до 80–85°C, витримуючи при цій температурі протягом 1 год., розчин фільтрують в гарячому вигляді для видалення нерозчинного матеріалу чорного кольору, охолоджують до 0–5°C, витримують протягом 30 хв, осад збирають, промивають водою, сушать під вакуумом при температурі 45°C. Вихід: 9,48 г (90 %).

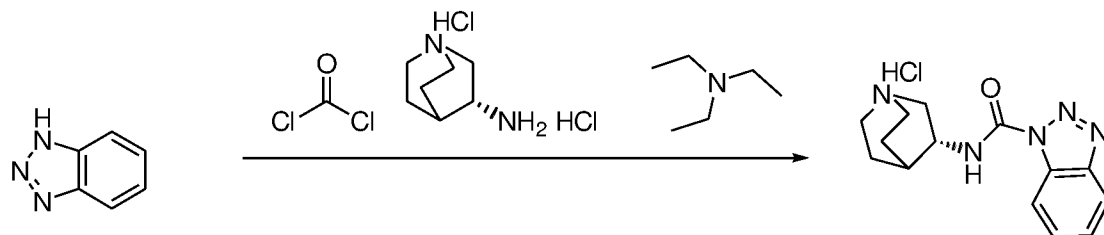
N-Циклогексил-N-метил-1Н-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід (утворення дизаміщеного триазол-1-карбоксаміду)



Pyridine = Піридин

Розчин 1H-бензо[d][1,2,3]триазолу (0,5 г, 4,20 ммоль) в тетрагідрофурані (25 мл) додають по краплях при перемішуванні до 20 % розчину фосгену (5,30 мл, 10,1 ммоль) в толуолі при 0–5°C. Реакційну суміш перемішують при температурі 20–25°C протягом 2 год. (по даним ТШХ реакція завершується). Аргон пропускають крізь розчин протягом 15 хв. Далі розчинник випарюють під вакуумом з одержанням 1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбонілхлориду (0,763 г, 4,20 ммоль) у вигляді прозорого масла. Продукт використовують без подальшого очищення. Піридин (0,357 мл, 4,41 ммоль) додають по краплях при перемішуванні до розчину масла в тетрагідрофурані (25 мл) при 0–5°C. Далі додають по краплях N-метилциклогексанамін (0,499 г, 4,41 ммоль) при 0–5°C. Реакційну суміш перемішують протягом ночі при 20–25°C. Додають воду та EtOAc, і органічну фракцію відокремлюють, промивають 1 М HCl, водою і розчином солі. Органічну фракцію сушать (MgSO₄) та упарюють під вакуумом з одержанням прозорого масла. Масло перекристалізують з суміші 2-пропанол/ДХМ, тверду речовину збирають, сушать під вакуумом при 40–45°C. Вихід: 230 мг (21 %).

(R)-N-(Хінуклідин-3-іл)-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксаміду гідрохлорид (утворення монозаміщеного триазол-1-карбоксаміду)

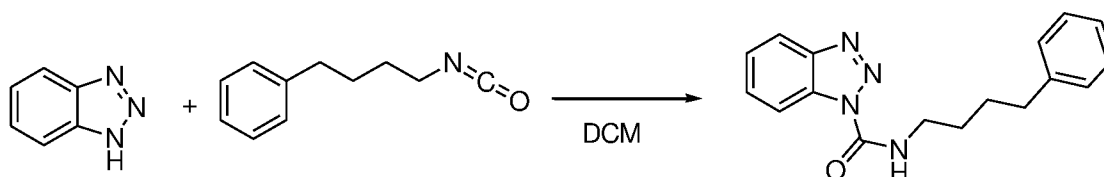


20

До розчину 1H-бензо[d][1,2,3]триазолу (0,238 г, 2 ммоль) в сухому ДХМ (5 мл) додають при 0–5°C 20 % розчин фосгену (1,052 мл, 2,000 ммоль) в толуолі. Суміш перемішують протягом 30 хв при 20–25°C, охолоджують до 0–5°C, і додають триетиламін (0,279 мл, 2,000 ммоль) при перемішуванні. Суспензію розбавляють сухим ДХМ (5 мл), додають твердий (R)-хінуклідин-3-аміну дигідрохлорид (0,398 г, 2,000 ммоль) і триетиламін (0,836 мл, 6,00 ммоль) при 0–5°C. Суміші дозволяють нагрітися до 20–25°C протягом 30 хв, розбавляють 2-пропанолом, упарюють до сухого стану. Залишок розподіляють між водою (15 мл) та ДХМ (15 мл), органічну фракцію сушать (MgSO₄), упарюють, розділяють на колонці (ДХМ/MeOH, 9:1), фракції збирають з одержанням масла. Масло розчиняють в ефірі з мінімальною кількістю дихлорметану, розчин підкислюють 2 М HCl в ефірі до pH 1–2, осад збирають, промивають ефіром, сушать під вакуумом при 45°C. Вихід: 0,12 г (19,5 %).

N-(4-Фенілбутил)-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід (утворення монозаміщеного триазол-1-карбоксаміду)

35



DCM = ДХМ

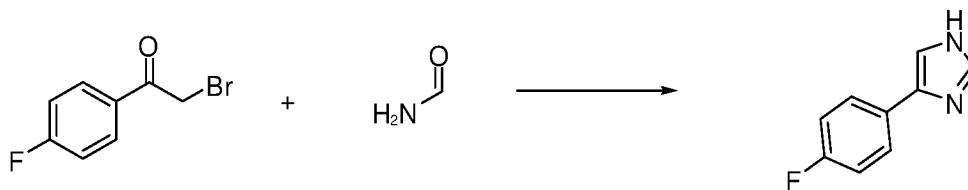
(4-Ізоціанатобутил)бензол (463 мг, 2,64 ммоль) додають по краплях при перемішуванні до розчину 1H-бензо[d][1,2,3]триазолу (300 мг, 2,52 ммоль) в ДХМ (18 мл) при 0–5°C. Прозору

40

реакційну суміш перемішують при 20–25°C, витримуючи при цій температурі протягом ночі. Розчинник видаляють під вакуумом з одержанням прозорого масла. Масло затвердіває при стоянні з утворенням безбарвної твердої речовини. Продукт перекристалізують з 2-пропанолу, тверду речовину збирають, сушать під вакуумом при 45°C. Вихід: 477 мг (64 %).

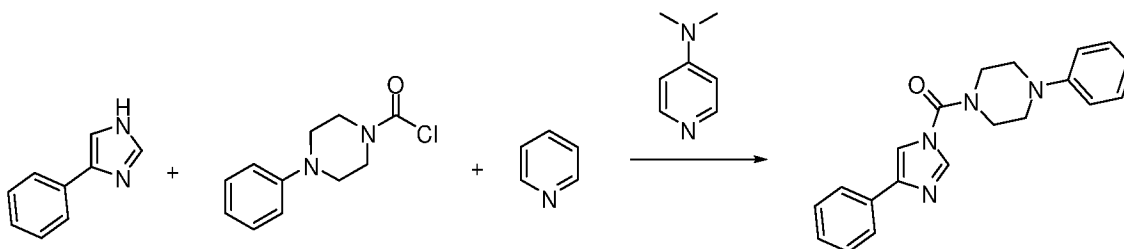
5 ІМІДАЗОЛИ:

4-(4-Фторфеніл)-1H-імідазол (синтез імідазолу)



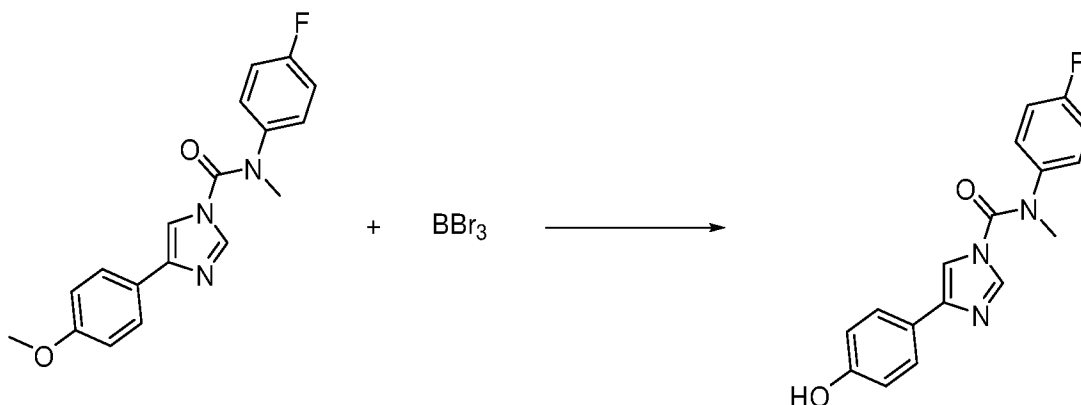
10 До грушоподібної колби місткістю 50 мл вмішують 2-бром-1-(4-фторфеніл)етанон (5,93 г, 27,31 ммоль), формамід (13,45 мл, 339 ммоль) і воду (1 мл). Реакційну суміш нагрівають до 140 °C, витримуючи при цій температурі протягом 4 год. Далі її охолоджують до кімнатної температури та виливають у 150 мл води. Залишок відфільтровують, промивають водою. рН фільтрату доводять до 12 шляхом додавання 10 % розчину NaOH. Одержаний осад

15 відфільтровують, промивають водою та сушать під вакуумом. (Вихід: 2,02 г, 45 %).
(4-Феніл-1H-імідазол-1-іл)(4-фенілпіперазин-1-іл)метанон (ацилювання)



20 При перемішуванні до розчину 4-феніл-1H-імідазолу (577 мг, 4 ммоль) в тетрагідрофурані (20 мл) додають піридин (0,489 мл, 6,00 ммоль) та ДМАП (48,9 мг, 0,400 ммоль). Розчин блідо-жовтого кольору обробляють 4-фенілпіперазин-1-карбонілхлоридом (944 мг, 4,20 ммоль) та нагрівають до 90 °C, витримуючи при цій температурі протягом 20 год. Далі ТГФ видаляють під вакуумом, залишок розподіляють між сумішшю ДХМ та ІПС (70:30) і водою. Органічну фракцію

25 сушать над магнію сульфатом та фільтрують. Після упарювання неочищений продукт перекристалізують з гарячого ІПС, фільтрують та сушать під вакуумом. (Вихід: 777 мг, 58 %).
N-(4-Фторфеніл)-4-(4-гідроксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід (видалення захисної групи)



30

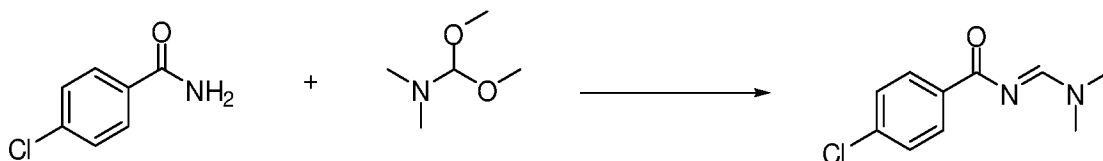
До охолодженого на бані, що містить метанол і сухий лід, розчину N-(4-фторфеніл)-4-(4-метоксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксаміду (0,283 г, 0,870 ммоль) в дихлорметані (8 мл) додають бору трибромід (0,164 мл, 1,740 ммоль). Реакційній суміші темного кольору дозволяють нагрітися до кімнатної температури та перемішують протягом 2 год. Дані ТШХ показують завершення реакції, після чого реакційну суміш виливають у суміші води з льодом та

35

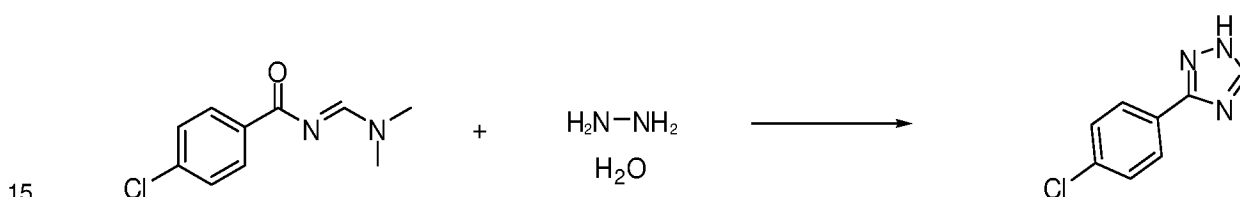
перемішують протягом 30 хв. Осад не утворюється. Суміш екстрагують ДХМ /ІПС (70:30), органічну фракцію сушать над магнію сульфатом та фільтрують. ДХМ видаляють під вакуумом, і продукт осаджують з ІПС, фільтрують та сушать під вакуумом. (Вихід: 210 мг, 78 %).

1,2,4-ТРИАЗОЛИ:

5 3-(4-Хлорфеніл)-1Н-1,2,4-триазол (синтез кільця)

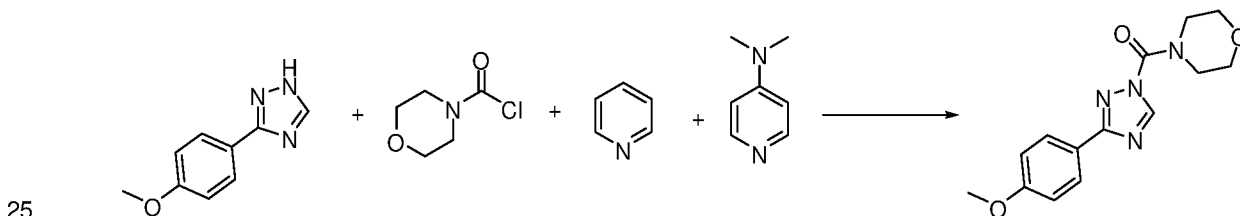


10 4-Хлорбензамід (7,371 г, 47,4 ммоль) суспендують в 1,1-диметокси-N, N-диметилметанаміні (15,73 мл, 118 ммоль). Реакційну суміш нагрівають до 80 °С, витримуючи при цій температурі протягом 1 год. Далі охолоджують до кімнатної температури, і надлишок 1,1-диметокси-N, N-диметилметанаміну видаляють під вакуумом. Одержану тверду речовину розтирають з петролейним ефіром, фільтрують та сушать під вакуумом. (Вихід: 9,44 г, 95 %).



20 При перемішуванні до розчину (Е)-4-хлор-N-((диметиламіно)метилєн)бензаміду (9,4 г, 44,6 ммоль) в оцтовій кислоті (13,5 мл) додають гідразингідрат (1,524 мл, 49,1 ммоль). Реакційну суміш негайно затвердіває, та її нагрівають до 120 °С, витримуючи при цій температурі протягом 2 год. Далі охолоджують до кімнатної температури та здійснюють азеотропну перегонку з толуолом. Кристалічний залишок перемішують з водою протягом деякого часу. Залишок відфільтровують, промивають водою та сушать під вакуумом. (Вихід: 7,27 г, 91 %).

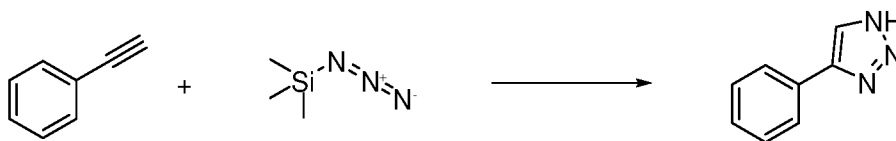
(3-(4-Метоксифеніл)-1Н-1,2,4-триазол-1-іл)(морфоліно) метанон (ацилування)



30 При перемішуванні до розчину 3-(4-метоксифеніл)-1Н-1,2,4-триазолу (701 мг, 4 ммоль) в тетрагідрофурані (20 мл) додають піридин (0,489 мл, 6,00 ммоль) і ДМАП (48,9 мг, 0,400 ммоль) Розчин обробляють морфолін-4-карбонілхлоридом (0,490 мл, 4,20 ммоль). та нагрівають до 90 °С, витримуючи при цій температурі протягом 20 год. Дані ТШХ показують, що реакція практично завершилася. ТГФ видаляють під вакуумом, залишок розподіляють між ДХМ та водою. Органічну фракцію сушать над магнію сульфатом, фільтрують та упарюють. Перекристалізація з гарячого ІПС дає 749 мг білих кристалів (Вихід: 65 %).

1,2,3-ТРИАЗОЛИ:

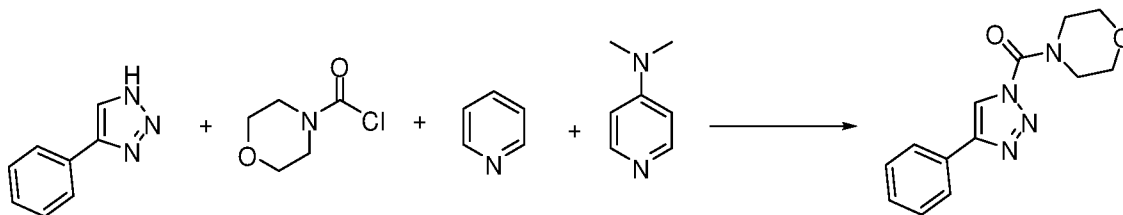
35 4-Феніл-1Н-1,2,3-триазол (синтез кільця)



40 При перемішуванні до розчину фенілацетилєну (1,098 мл, 10 ммоль) в абсолютному толуолі (10 мл) додають азидотриметилсилан (2,65 мл, 20,00 ммоль) у вигляді однієї порції. Реакційну суміш нагрівають до 100 °С, витримуючи при цій температурі протягом 3 днів, після чого

охолоджують до кімнатної температури, і толуол видаляють під вакуумом. Залишок розподіляють між ДХМ та водою. Органічну фракцію сушать над магнію сульфатом та фільтрують. Після упарювання неочищений продукт хроматографують в петролейному ефірі: EtOAc=2:1. (Вихід: 355 мг, 24 %).

5 Морфоліно(4-феніл-1H-1,2,3-триазол-1-іл)метанон (ацилування)

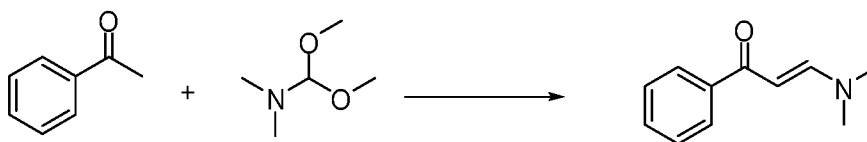


10 При перемішуванні до розчину 4-феніл-1H-1,2,3-триазолу (0,340 г, 2,342 ммоль) в тетрагідрофурані (12 мл) додають піридин (0,286 мл, 3,51 ммоль), ДМАП (0,029 г, 0,234 ммоль). Розчин обробляють морфолін-4-карбонілхлоридом (0,287 мл, 2,459 ммоль). Реакційну суміш нагрівають до 90 °С, витримуючи при цій температурі протягом 20 год. Далі ТГФ видаляють під вакуумом, залишок розподіляють між ДХМ та водою. Органічну фракцію сушать над магнію сульфатом та фільтрують. Після упарювання неочищений продукт перекристалізують з

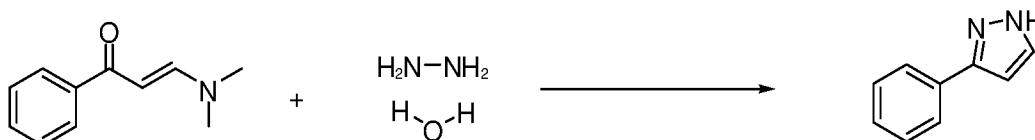
15 гарячого ІПС, фільтрують та сушать під вакуумом. (Вихід: 193 мг, 29 %).

ПІРАЗОЛИ:

3-феніл-1H-піразол (СИНТЕЗ КІЛЬЦЯ)



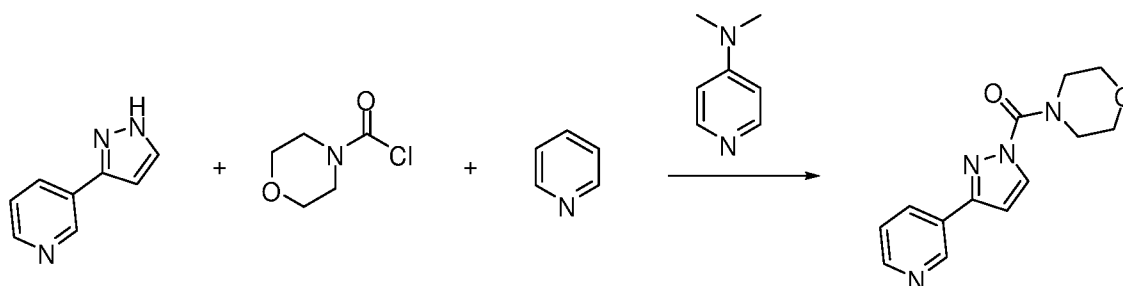
20 Ацетофенон (5,89 мл, 50 ммоль) розчиняють в 1,1-диметокси-N, N-диметилметанаміні (13,39 мл, 100 ммоль). Реакційну суміш нагрівають до 120 °С, витримуючи при цій температурі протягом 24 год. Розчин темно-червоного кольору охолоджують до кімнатної температури, і надлишок 1,1-диметокси-N, N-диметилметанаміну видаляють під вакуумом. Одержану тверду речовину розтирають з петролейним ефіром, фільтрують та сушать під вакуумом. (Вихід: 6,78 г, 77 %).



30 При перемішуванні до розчину (E)-3-(диметиламіно)-1-фенілпроп-2-ен-1-ону (2,63 г, 15 ммоль) в етанолі (40 мл) додають гідразингідрат (1,459 мл, 30,0 ммоль). Реакційну суміш нагрівають до 100 °С, витримуючи при цій температурі протягом 2 год. Далі охолоджують до кімнатної температури, та етанол видаляють під вакуумом. Залишок розподіляють між ДХМ та водою. Органічну фракцію сушать над магнію сульфатом та фільтрують. Після упарювання неочищений продукт очищують розтиранням з сумішшю петролейного ефіру та етилацетату

35 (Вихід: 1,59 г, 73 %).

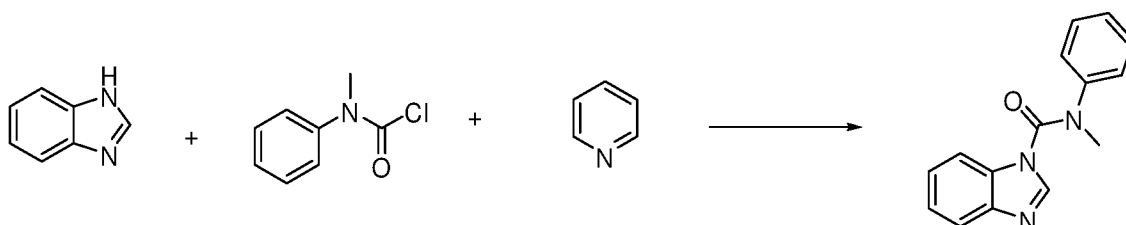
Морфоліно(3-(піридин-3-іл)-1H-піразол-1-іл)метанон (ацилування)



При перемішуванні до розчину 3-(1H-піразол-3-іл)піридину (0,435 г, 3 ммоль) в тетрагідрофурані (15 мл) додають піридин (0,367 мл, 4,50 ммоль), ДМАП (18,33 мг, 0,150 ммоль). Розчин обробляють 4-морфолінкарбонілхлоридом (0,368 мл, 3,15 ммоль). Реакційну суміш нагрівають до 80 °С, витримуючи при цій температурі протягом 20 год. ТГФ видаляють під вакуумом, і залишок розподіляють між ДХМ та водою. Органічну фракцію сушать над магнію сульфатом та фільтрують. Після упарювання неочищений продукт хроматографують в петролейному ефірі: EtOAc=2:1. (Вихід: 174 мг, 21 %).

БЕНЗИМІДАЗОЛИ:

N-Метил-N-феніл-1H-бензо[d]імідазол-1-карбоксамід (ацилування)



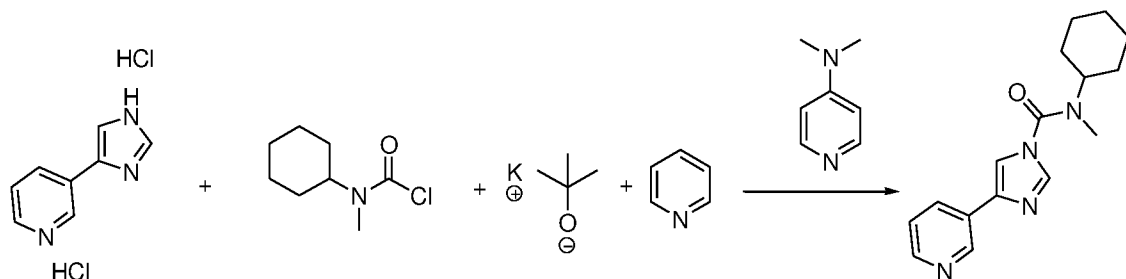
При перемішуванні до розчину 1H-бензо[d]імідазолу (354 мг, 3 ммоль) в тетрагідрофурані (15 мл) додають піридин (0,367 мл, 4,50 ммоль), з наступним додаванням метил(феніл)карбамоїлхлориду (534 мг, 3,15 ммоль). Реакційну суміш нагрівають до 80 °С, витримуючи при цій температурі протягом 20 год. ТГФ видаляють під вакуумом, залишок розподіляють між ДХМ та водою. Органічну фракцію сушать над магнію сульфатом та фільтрують. Після упарювання неочищений продукт хроматографують в суміші петролейний ефір/EtOAc=2:1.

(Вихід: 365 мг, 46 %).

В наступному розділі наведені додаткові приклади синтезу для конкретних сполук.

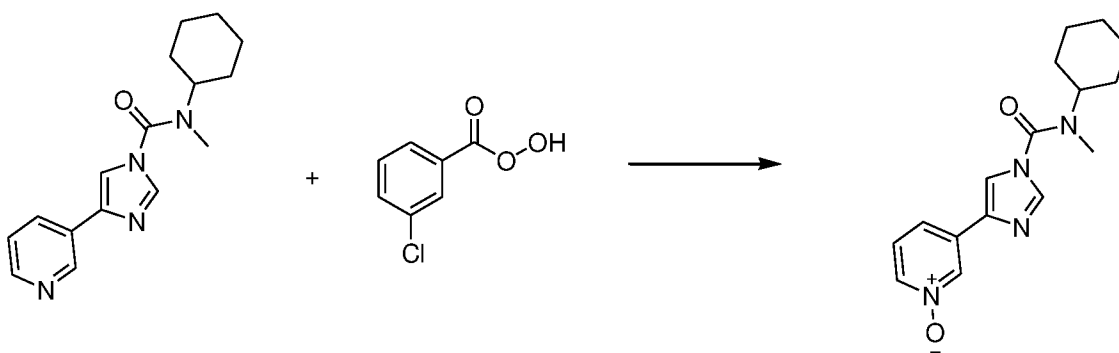
Одержання сполуки 362

а) N-Циклогексил-N-метил-4-(піридин-3-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід



При перемішуванні до суспензії 3-(1H-імідазол-4-іл)піридин дигідрохлориду (1,745 г, 8 ммоль) в суміші тетрагідрофурану (29 мл) та ДМФА (2,90 мл) додають калію 2-метилпропан-2-олят (1,795 г, 16,0 ммоль) і суміш кип'ятять із зворотним холодильником протягом 30 хв. Одержану суспензію коричневого кольору охолоджують до кімнатної температури та обробляють піридином (0,979 мл, 12 ммоль) і N, N-диметилпіридин-4-аміном (0,098 г, 0,8 ммоль), з наступним додаванням циклогексил(метил)карбамоїлхлориду (1,476 г, 8,4 ммоль). Реакційну суміш нагрівають до 90 °С, витримуючи при цій температурі протягом ночі, після чого суміш розбавляють водою та екстрагують етилацетатом. Органічну фракцію сушать (MgSO₄) та фільтрують. Після упарювання неочищений продукт хроматографують на силікагелі з використанням суміші дихлорметан/метанол (9:1). Гомогенні фракції об'єднують та упарюють з одержанням білого порошку (160 мг, 7 %).

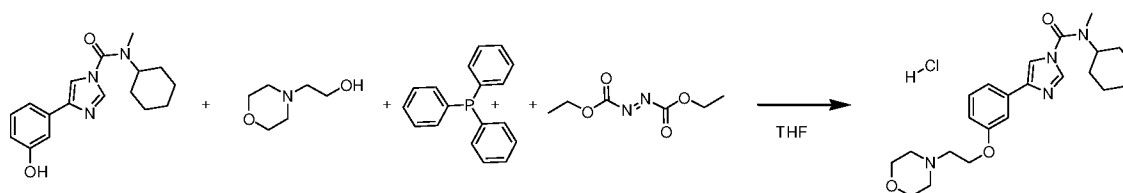
б) 3-(1-(Циклогексил(метил)карбамоїл)-1H-імідазол-4-іл) піридину 1-оксид



При перемішуванні до розчину N-циклогексил-N-метил-4-(піридин-3-іл)-1H-імідазол-1-карбоксаміду (90 мг, 0,317 ммоль) в хлороформ (5 мл) додають 3-хлорбензопероксонієву кислоту (149 мг, 0,475 ммоль) у вигляді однієї порції. Реакційну суміш перемішують при кімнатній температурі протягом 20 год. Дані ТШХ показують завершення реакції, і суміш випарюють до сухого стану. Залишок розтирають з ефіром, одержані білі кристали відфільтровують та сушать у повітрі. Перекристалізація з гарячого ізопропанолу дає білий порошок (46 мг, 46 %).

Одержання сполуки 408

N-Циклогексил-N-метил-4-(3-(2-морфоліноетокси)феніл)-1H-імідазол-1-карбоксамід гідро хлорид



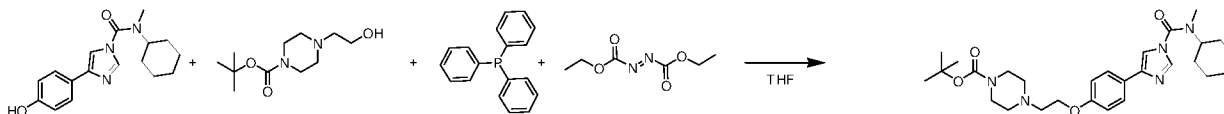
THF = ТГФ

N-Циклогексил-4-(3-гідроксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід (170 мг, 0,568 ммоль) переносять в безводний тетрагідрофуран (10 мл) в атмосфері азоту з одержанням безбарвного розчину. Додають N-бета-гідроксиетилморфолін (0,068 мл, 0,568 ммоль) та розчин охолоджують до 0 °C. Додають трифенілфосфін (179 мг, 0,681 ммоль) з наступним додаванням ДЕАД (0,108 мл, 0,68 ммоль) по краплях, дозволяючи жовтому кольору, що утворюється після додавання кожної краплі, зникнути перед додаванням кожної краплі. Одержаному розчину блідо-жовтого кольору дозволяють нагрітися до кімнатної температури та перемішують протягом 18 год. Реакційну суміш далі охолоджують до 0 °C, і додають іншу порцію трифенілфосфін (179 мг, 0,681 ммоль) та ДЕАД (0,108 мл, 0,68 ммоль). Розчин перемішують ще протягом 6 год. Розчинник випарюють, і жовте масло очищують хроматографією (силикагель Н; 9/1, 8/2, 6/4, 5/5, 4/6 толуол/ацетон). Фракцію, що містить чистий продукт, упарюють, і масло блідо-жовтого кольору розчиняють в етилацетаті, який далі осаджується. Суспензію нагрівають до розчинення твердої речовини, і далі розчин охолоджують до 0 °C. Надлишок 2 н HCl розчин в ефірі додають по краплях. Одержану суміш перемішують при 0 °C, витримуючи при цій температурі протягом 10 хв, і потім дозволяють нагрітися до кімнатної температури та перемішують ще протягом 15 хв. Залишок фільтрують, промивають

ефіром та сушать. Перекристалізація з етилацетату дає тверду речовину світло-кремового кольору, (39 мг, 14 %).

Одержання сполуки 397

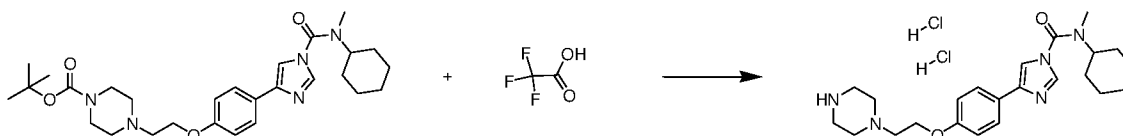
- а) трет-Бутил-4-(2-(4-(1-(циклогексил(метил)карбамоїл)-1H-імідазол-4-іл)фенокси)етил)піперазин-1-карбоксилат



10 THF = ТГФ

До грушоподібної колби місткістю 50 мл<autotext key="0A0B6F5C" name="[VESSEL]" type="lookup" length="10"/> вміщують N-циклогексил-4-(4-гідроксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід (200 мг, 0,668 ммоль)<autotext key="0A0B6F5D" name="[Reactants]" index="1" field="Reactants" type="field" length="89"/> в тетрагідрофурані (10 мл)<autotext key="0A0B6F5E" name="[SOLVENTS1]" index="1" field="Solvents" type="field" length="23"/> в атмосфері азоту з одержанням блідо-рожевого розчину<autotext key="0A0B6F60" name="[SOLN/SUSP]" type="lookup" length="8"/>. Додають трет-бутил-4-(2-гідроксиетил)піперазин-1-карбоксилат (184 мг, 0,8 ммоль)<autotext key="0A0B6F61" name="[Reactants]" index="2" field="Reactants" type="field" length="74"/> і розчин охолоджують до 0 °С. Трифенілфосфін (210 мг, 0,801 ммоль)<autotext key="0A0B6F62" name="[Reactants]" index="3" field="Reactants" type="field" length="39"/> додають, з наступним додаванням по краплях ДЕАД (0,127 мл, 0,8 ммоль)<autotext key="0A0B6F63" name="[Reactants]" index="4" field="Reactants" type="field" length="27"/>, дозволяючи жовтому кольору, який утворюється після додавання кожної краплі, зникнути перед додаванням наступної краплі. Одержаному розчину блідо-жовтого кольору дозволяють нагрітися до кімнатної температури та перемішують протягом 24 год. Розчинник випарюють, і блідо-жовте масло очищують хроматографією (сілікагель Н; 10 %, 20 %, 30 %, 40 %, 50 %, 60 % ацетон/толуол). Фракції, що містять чистий продукт, упарюють, і тверду речовину бежевого кольору (167 мг) використовують на наступній стадії без подальшого очищення.

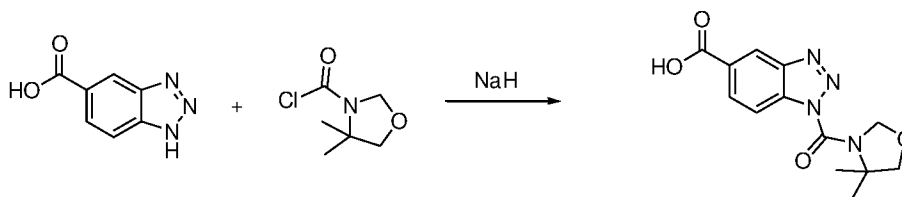
- б) N-Циклогексил-N-метил-4-(4-(2-(піперазин-1-іл)етокси)феніл)-1H-імідазол-1-карбоксаміду дигідрохлорид



До грушоподібної колби місткістю 50 мл <autotext key="0A0DFF5C" name="[VESSEL]" type="lookup" length="10"/> вміщують трет-бутил-4-(2-(4-(1-(циклогексил(метил)карбамоїл)-1H-імідазол-4-іл)фенокси)етил)піперазин-1-карбоксилат (167 мг, 0,326 ммоль)<autotext key="0A0DFF5D" name="[Reactants]" index="1" field="Reactants" type="field" length="128"/>. Додають трифтороцтову кислоту (3 мл, 38,9 ммоль)<autotext key="0A0DFF61" name="[Reactants]" index="2" field="Reactants" type="field" length="38"/> з утворенням блідо-жовтого<autotext key="0A0DFF5F" name="[COLOR]" type="lookup" length="6"/> розчину<autotext key="0A0DFF60" name="[SOLN/SUSP]" type="lookup" length="8"/>, який перемішують при кімнатній температурі протягом 1 год. Розчинник випарюють, залишок масла жовтого кольору розчиняють в етилацетаті та охолоджують до 0 °С. Далі додають надлишок 2 н НСІ розчину в ефірі. Суміш перемішують при 0 °С, витримуючи при цій температурі протягом 10 хв, і далі дозволяють нагрітися до кімнатної температури та перемішують протягом 15 хв. Суміш випарюють, і залишок перекристалізують з гарячого ізопропанолу. Кристали відфільтровують, промивають ізопропанолом та сушать з одержанням продукту у вигляді білої твердої речовини, (115 мг, 69 %).

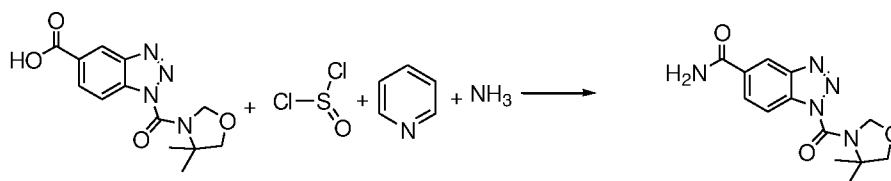
Одержання сполуки 389

- а) 1-(4,4-Диметиллоксазолідин-3-карбоніл)-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-5-карбонова кислота



Розчин 1H-бензо[d][1,2,3]триазол-5-карбонової кислоти (3 г, 18,39 ммоль) в суміші тетрагідрофурану (90 мл), та диметилформамід (50 мл) додають по краплях при перемішуванні до суспензії натрію гідриду (1,839 г, 46 ммоль) в тетрагідрофурані (30 мл) при 0 °С. Суспензію перемішують при кімнатній температурі протягом 30 хв, після чого додають по краплях при 0 °С, розчин 4,4-диметилоксазолідин-3-карбонілхлориду (3,16 г, 19,31 ммоль) в тетрагідрофурані (10 мл). Реакційну суміш перемішують при кімнатній температурі протягом 4 год. Додають воду при 0 °С, і розчинник випарюють. Додають суміш дихлорметан/ізопропанол (7:3), та органічну фракцію відокремлюють. Водну фракцію знову екстрагують дихлорметаном, об'єднані органічні фракції сушать (MgSO₄), фільтрують та упарюють. Залишок оранжевого кольору перекристалізують з ізопропанолу з одержанням твердої речовини бежевого кольору (840 мг), яку використовують на наступній стадії без подальшого очищення.

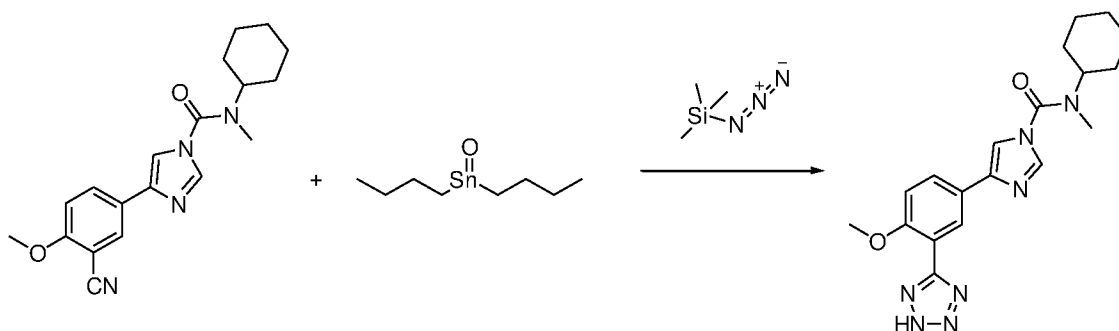
б) 1-(4,4-Диметилоксазолідин-3-карбоніл)-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-5-карбоксамід



Тіонілхлорид (0,633 мл, 8,67 ммоль) додають по краплях при перемішуванні до розчину 1-(4,4-диметилоксазолідин-3-карбоніл)-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-6-карбонової кислоти (0,763 г, 2,63 ммоль) та піридину (0,702 мл, 8,67 ммоль) в дихлорметані (17 мл) при кімнатній температурі. Розчин жовтого кольору перемішують при кімнатній температурі протягом 15 хв. Далі одержаний розчин додають по краплях до 1,75 н розчину аміаку (15,02 мл, 26,3 ммоль) в етанолі при 0 °С, після чого утворюється біла суспензія. Реакційну суміш перемішують при кімнатній температурі ще протягом 30 хв. Додають воду, та етанол випарюють. Далі залишок розбавляють дихлорметаном, органічну фракцію відокремлюють і промивають 1 н розчином HCl. Органічну фракцію сушать (MgSO₄), фільтрують та упарюють з одержанням твердої речовини жовтого кольору. Тверду речовину перекристалізують із суміші дихлорметан/етанол з одержанням продукту у вигляді твердої речовини бежевого кольору (151 мг, 20 %).

Одержання сполуки 438

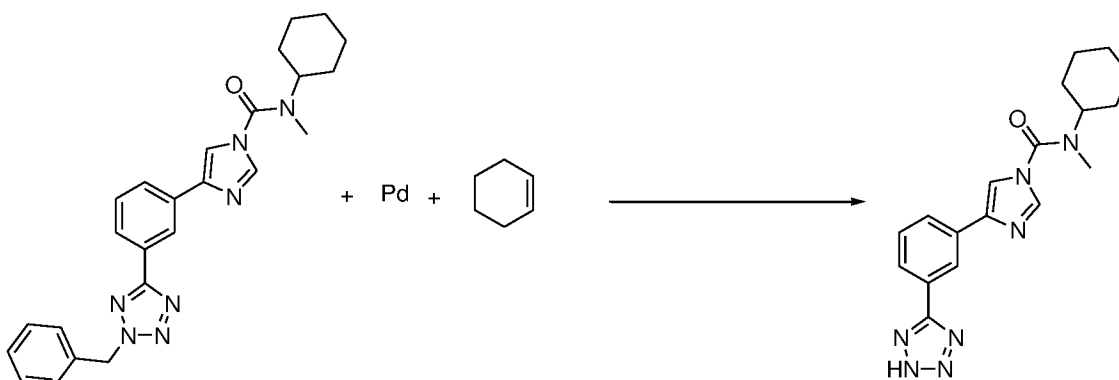
N-Циклогексил-4-(4-метокси-3-(2H-тетразол-5-іл)феніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід



Суміш 4-(3-ціано-4-метоксифеніл)-N-циклогексил-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксаміду (305 мг, 0,901 ммоль) <autotext key="0A728618" name="[Reactants]" index="1" field="Reactants" type="field" length="97"/>, дибутилстананону (28,0 мг, 0,113 ммоль) <autotext key="0A728619" name="[Reactants]" index="2" field="Reactants" type="field" length="39"/> та азидотриметилсилану (0,239 мл, 1,803 ммоль) <autotext key="0A72861A" name="[Reactants]" index="3" field="Reactants" type="field" length="43"/> нагрівають в толуолі (8 мл) <autotext key="0A72861B" name="[Solvents]" index="1" field="Solvents" type="field" length="14"/> при 115 °С, витримуючи при цій температурі протягом 20 год. Потім суміш охолоджують до кімнатної температури та упарюють до сухого стану. Сирий продукт хроматографують на кремнію діоксиді з використанням суміші дихлорметан/метанол (95:5). Після упарювання гомогенних фракцій, залишковий продукт розтирають з діетиловим ефіром, фільтрують та сушать з одержанням продукту у вигляді практично білих кристалів (196 мг, 54 %).

Одержання сполуки 576

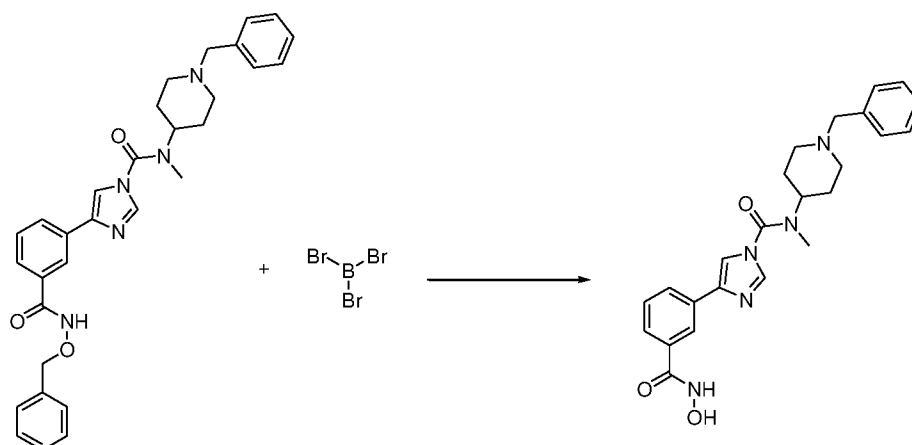
4-(3-(2H-Тетразол-5-іл)феніл)-N-циклогексил-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід



При перемішуванні суміш 4-(3-(2-бензил-2H-тетразол-5-іл)феніл)-N-циклогексил-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксаміду (256 мг, 0,58 ммоль) <autotext key="0B2EDAE8" name="[Reactants]" index="1" field="Reactants" type="field" length="109"/>, 10 % паладію на вугіллі (30,9 мг, 0,029 ммоль) <autotext key="0B2EDAE9" name="[Reactants]" index="2" field="Reactants" type="field" length="31"/> та циклогексену (1,175 мл, 11,6 ммоль) <autotext key="0B2EDAEA" name="[Reactants]" index="3" field="Reactants" type="field" length="34"/> нагрівають до 80 °С в закупореній пробірці. Далі реакційну суміш охолоджують до кімнатної температури, фільтрують крізь шар бромімериту та упарюють до сухого стану. Залишок масла очищують хроматографією на кремнію діоксиді з використанням суміші дихлорметан/метанол (90:10). Гомогенні фракції об'єднують та упарюють, і залишок масла кристалізують з діетилового ефіру з одержанням продукту у вигляді практично білого порошку (45 мг, 21 %).

Одержання сполуки 423

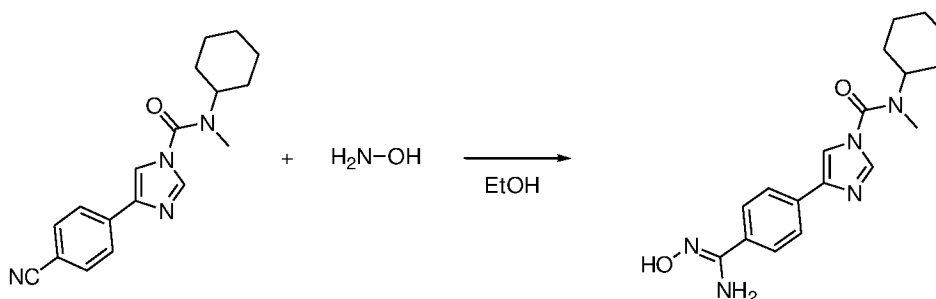
N-(1-Бензилпіперидин-4-іл)-4-(3-(гідроксикарбамоїл)феніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід



При перемішуванні до суспензії 4-(3-(бензилоксикарбамоїл)феніл)-N-(1-бензилпіперидин-4-іл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксаміду (120 мг, 0,229 ммоль) в дихлорметані (5 мл) при - 78 °С додають трибромборан (0,022 мл, 0,229 ммоль). Реакційну суміш перемішують в холодному стані протягом 5 хв, і потім дозволяють нагрітися до кімнатної температури протягом 1 год. Суміш охолоджують до -20 °С та обережно гасять метанолом. Далі, розчинник випарюють, і залишок переносять в суміш дихлорметан/ізопропанол (7:3), промивають насиченим розчином NaHCO_3 , і потім сушать (MgSO_4). Після фільтрації дихлорметан випарюють до невеликого об'єму, одержаний осад відфільтровують, промивають ізопропанолом та сушать з одержанням продукту у вигляді практично білого порошку (58 мг, 55 %).

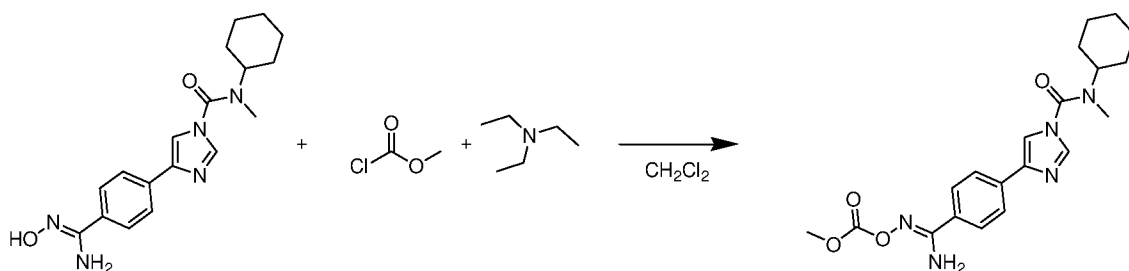
Одержання сполуки 551

а) (Z)-N-Циклогексил-4-(4-(N'-гідроксикарбамімідоїл) феніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід



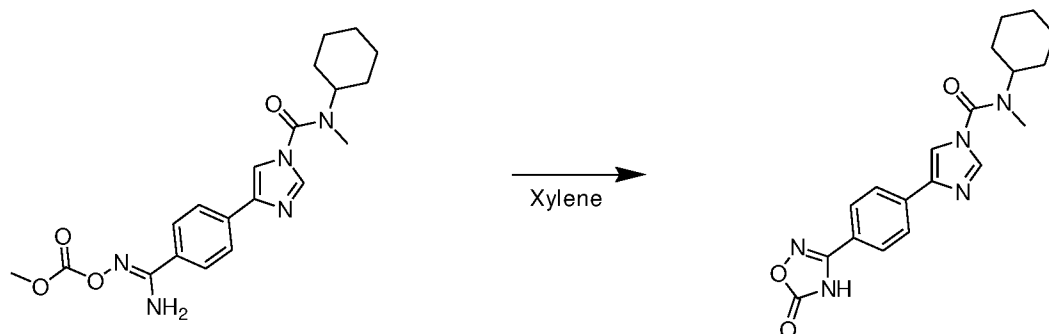
В круглодонну колбу місткістю 25 мл вміщують 4-(4-ціанофеніл)-N-циклогексил-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід (600 мг, 1,946 ммоль) в етанолі (9 мл) при кімнатній температурі, з одержанням суспензії білого кольору. 50 % Розчин гідроксиламіну у воді (0,298 мл, 4,86 ммоль) додають по краплях, та одержану суміш нагрівають до 90 °С, витримуючи при цій температурі протягом 90 хв. Потім суміш охолоджують до кімнатної температури з утворенням деякої кількості осаду, який відфільтровують і промивають етанолом. Одержану тверду речовину перекристалізують з гарячої суміші етилацетату (~70 мл) та петролейного ефіру (~150 мл). Кристали відфільтровують, промивають петролейним ефіром та сушать з одержанням твердої речовини білого кольору (230 мг, 29 %).

б) (Z)-N-Циклогексил-4-(4-(N'-(метоксикарбонілокси) карбамімідоїл) феніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід



До грушоподібної колби місткістю 25 мл<autotext key="0AEE3F59" name="[VOLUME]" type="lookup" length="5"/> <autotext key="0AEE3F5A" name="[VESSEL]" type="lookup" length="10"/> вміщують (Z)-N-циклогексил-4-(4-(N'-гідроксикарбамімідоїл)феніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід (228 мг, 0,668 ммоль)<autotext key="0AEE3F5B" name="[Reactants]" index="1" field="Reactants" type="field" length="111"/> в безводному дихлорметан (3 мл)<autotext key="0AEE3F5C" name="[SOLVENTS1]" index="1" field="Solvents" type="field" length="34"/> в атмосфері азоту з одержанням суспензії білого кольору<autotext key="0AEE3F5D" name="[COLOR]" type="lookup" length="5"/> <autotext key="0AEE3F5E" name="[SOLN/SUSP]" type="lookup" length="10"/>. Додають триетиламін (0,102 мл, 0,735 ммоль)<autotext key="0AEE3F5F" name="[Reactants]" index="3" field="Reactants" type="field" length="36"/> суспензію охолоджують до 0 °C та перемішують протягом 30 хв. Далі, метиловий естер хлормурашиної кислоти (0,065 мл, 0,835 ммоль)<autotext key="0AEE3F60" name="[Reactants]" index="2" field="Reactants" type="field" length="54"/> додають по краплях, і суміш перемішують при 0 °C, витримуючи при цій температурі протягом 30 хв, після чого дозволяють нагрітися до кімнатної температури та перемішують ще протягом 30 хв. Залишок відфільтровують та розчиняють в суміші ізопропанолу і дихлорметану (3:7). Одержаний розчин поєднують одержаним вище з фільтратом і промивають 1 н HCl, водою і розчином солі, потім сушать (MgSO₄), фільтрують та упарюють з одержанням твердої речовини білого кольору (228 мг, 82 %).

Б) N-Циклогексил-N-метил-4-(4-(5-оксо-4,5-дигідро-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)-1H-імідазол-1-карбоксамід



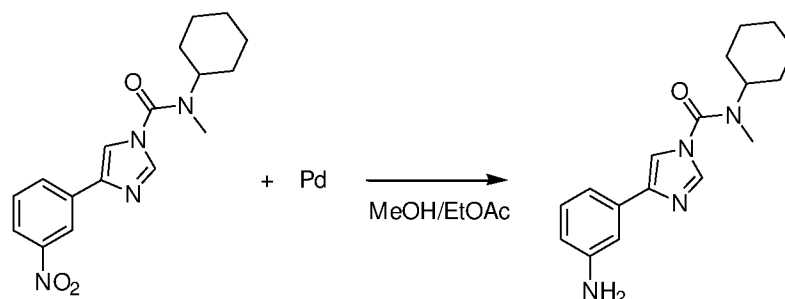
25

Xylene = Ксилен

До грушоподібної колби місткістю 50 мл<autotext key="0AF2033F" name="[VOLUME]" type="lookup" length="5"/> <autotext key="0AF20340" name="[VESSEL]" type="lookup" length="10"/> вміщують (Z)-N-циклогексил-4-(4-(N'-(метоксикарбонілокси)карбамімідоїл)феніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід (200 мг, 0,501 ммоль)<autotext key="0AF20341" name="[REACTANTS1]" index="1" field="Reactants" type="field" length="124"/> в ксилені (10 мл)<autotext key="0AF20342" name="[SOLVENTS1]" index="1" field="Solvents" type="field" length="14"/> в атмосфері азоту, з одержанням суспензії білого кольору<autotext key="0AF20343" name="[COLOR]" type="lookup" length="5"/> <autotext key="0AF20344" name="[SOLN/SUSP]" type="lookup" length="10"/>. Суміш нагрівають до 140 °C, витримуючи при цій температурі протягом 4 год., і потім охолоджують до кімнатної температури. Утворений залишок відфільтровують, і залишок на фільтрі промивають ксиленом. Після висушування одержану тверду речовину розчиняють в суміші дихлорметану та ізопропанолу. Після упарювання до невеликого об'єму, розчин охолоджують до кімнатної температури, утворений осад відфільтровують та сушать з одержанням продукту у вигляді твердої речовини блідо-рожевого (134 мг, 69 %).

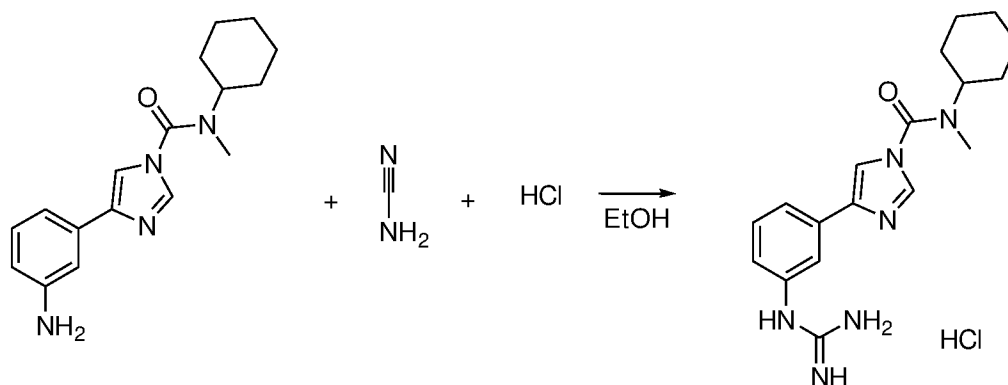
Одержання сполуки 553

а) 4-(3-Амінофеніл)-N-циклогексил-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід



10 % Паладій на вугіллі (0,122 г, 0,115 ммоль) додають при перемішуванні до розчину N-циклогексил-N-метил-4-(3-нітрофеніл)-1H-імідазол-1-карбоксаміду (0,755 г, 2,299 ммоль) в суміші етилацетату (46 мл) та метанолу (46 мл) в атмосфері аргону при кімнатній температурі. Далі суміш перемішують при кімнатній температурі в атмосфері водню протягом 50 хв. Суміш фільтрують крізь броунмілерит, і шар броунмілериту промивають метанолом. Об'єднані фільтрати випарюють з одержанням прозорого масла/піни (691 мг, 100 %), яке використовують на наступній стадії без подальшого очищення.

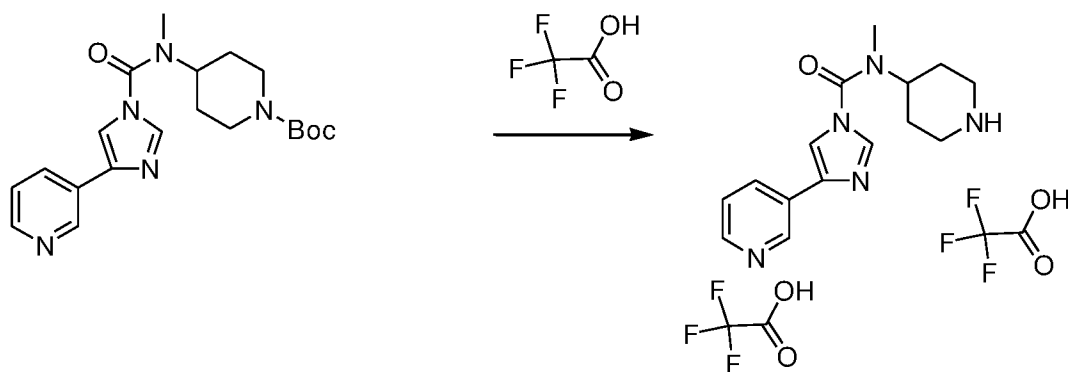
б) N-Циклогексил-4-(3-гуанідинофеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксаміду гідро хлорид



Газоподібний безводний хлороводень (0,096 мл, 1,156 ммоль) додають при перемішуванні до суспензії 4-(3-амінофеніл)-N-циклогексил-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксаміду (0,345 г, 1,156 ммоль) та ціанаміду (0,135 мл, 1,734 ммоль) в етанолі (1,2 мл) при кімнатній температурі. Прозорий розчин перемішують при кип'ятінні із зворотним холодильником протягом 1 год. з утворенням безбарвної твердої речовини. Реакційну суміш перемішують при кип'ятінні із зворотним холодильником ще протягом 7 год., після чого суміші дозволяють охолонути. Тверду речовину відокремлюють фільтрацією і промивають етанолом з одержанням продукту у вигляді безбарвної твердої речовини (298 мг, 68 %).

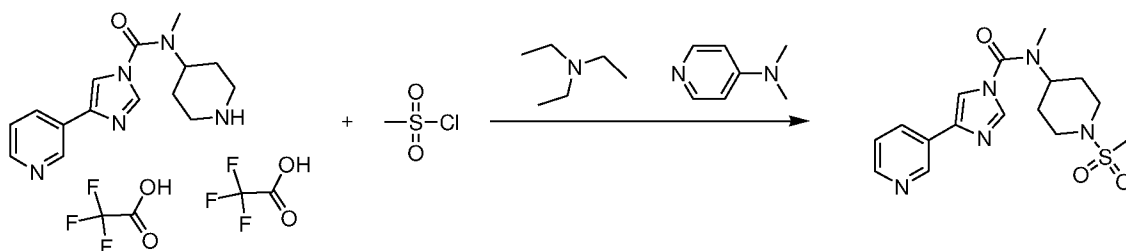
Одержання сполуки BIA 533

а) N-Метил-N-(піперидин-4-іл)-4-(піридин-3-іл)-1H-імідазол-1-карбоксаміду біс(2,2,2-трифторацетат)



До трет-бутил-4-(N-метил-4-(піридин-3-іл)-1H-імідазол-1-карбохамідо)піперидин-1-карбоксилату (500 мг, 1,297 ммоль) <autotext key="0AE240EB" name="[Reactants]" index="1" field="Reactants" type="field" length="112"/> додають трифтороцтову кислоту (4 мл, 51,9 ммоль) <autotext key="0AE24104" name="[Reactants]" index="2" field="Reactants" type="field" length="24"/> з одержанням мутного розчину. Суміш перемішують при кімнатній температурі протягом 1 год., після чого розчинник видаляють випарюванням. Масляний залишок розтирають з ефіром, та одержану тверду речовину білого кольору відфільтровують з одержанням твердої речовини білого кольору (653,2 мг, вихід 88 %) <autotext key="0AE3A80D" name="[Products]" index="1" field="Products" type="field" length="134"/>.

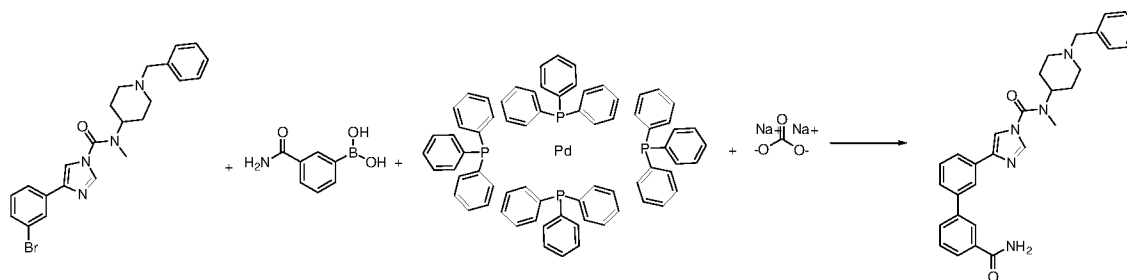
b) N-Метил-N-(1-(метилсульфоніл)піперидин-4-іл)-4-(піридин-3-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід



До охолодженої сумішшю льоду та води суспензії N-метил-N-(піперидин-4-іл)-4-(піридин-3-іл)-1H-імідазол-1-карбоксаміду біс(2,2,2-трифторацетат) (300 мг, 0,584 ммоль) <autotext key="0AE4CA9C" name="[Reactants]" index="1" field="Reactants" type="field" length="120"/> в дихлорметані (10 мл) <autotext key="0AE4CA9D" name="[Solvents]" index="1" field="Solvents" type="field" length="23"/> додають ДМАП (35,7 мг, 0,292 ммоль) <autotext key="0AE4CA9E" name="[Reactants]" index="4" field="Reactants" type="field" length="26"/>, з наступним додаванням по краплях триетиламіну (0,326 мл, 2,337 ммоль) <autotext key="0AE4CA9F" name="[Reactants]" index="3" field="Reactants" type="field" length="26"/>, з наступним додаванням метансульфонілхлориду (0,072 мл, 0,934 ммоль) <autotext key="0AE4CAA0" name="[Reactants]" index="2" field="Reactants" type="field" length="47"/>. Розчин перемішують при кімнатній температурі протягом ночі, після чого реакцію гасять додаванням метанолу та дозволяють перемішуватися при кімнатній температурі. Осад білого кольору відокремлюють фільтрацією, промивають метанолом та ефіром, і далі сушать з одержанням продукту у вигляді білої твердої речовини, (158 мг, 74 %).

Одержання сполуки 550

N-(1-Бензилпіперидин-4-іл)-4-(3'-карбамоїлбіфеніл-3-іл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід



Тетракис(трифенілфосфін)паладієвий комплекс (0,076 г, 0,066 ммоль) <autotext key="0AE93DB1" name="[Reactants]" index="3" field="Reactants" type="field" length="32"/> додають при перемішуванні до дисперсії N-(1-бензилпіперидин-4-іл)-4-(3-бромфеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксаміду (0,600 г, 1,323 ммоль) <autotext key="0AE93DB2" name="[Reactants]" index="1" field="Reactants" type="field" length="102"/>, 3-карбамоілфенілборної кислоти (0,229 г, 1,390 ммоль) <autotext key="0AE93DB3" name="[Reactants]" index="2" field="Reactants" type="field" length="51"/> та 2 М розчину натрію карбонату (0,794 мл, 1,588 ммоль) <autotext key="0AE93DB4" name="[Reactants]" index="4" field="Reactants" type="field" length="39"/> в суміші 1-пропанолу (5 мл) <autotext key="0AE93DB5" name="[Solvents]" index="1" field="Solvents" type="field" length="17"/> та води (1 мл) <autotext key="0AE93DB6" name="[Solvents]" index="2" field="Solvents" type="field" length="16"/> при кімнатній температурі. Реакційну суміш перемішують при 90 °С, витримуючи при цій температурі протягом 1 год. Додають воду, та органічну фракцію розбавляють сумішшю дихлорметан/ізопропанол (7:3). Органічну фракцію відокремлюють, сушать (MgSO₄), фільтрують та упарюють з одержанням масла оранжевого кольору. Хроматографія на колонці (кремнію діоксид, дихлорметан/метанол 5 %) дає продукт у вигляді оранжевого масла. Масло розтирають з сумішшю петролейний ефір/етилацетат/ефір з одержанням продукту у вигляді твердої речовини бежевого кольору (123 мг, 17 %).

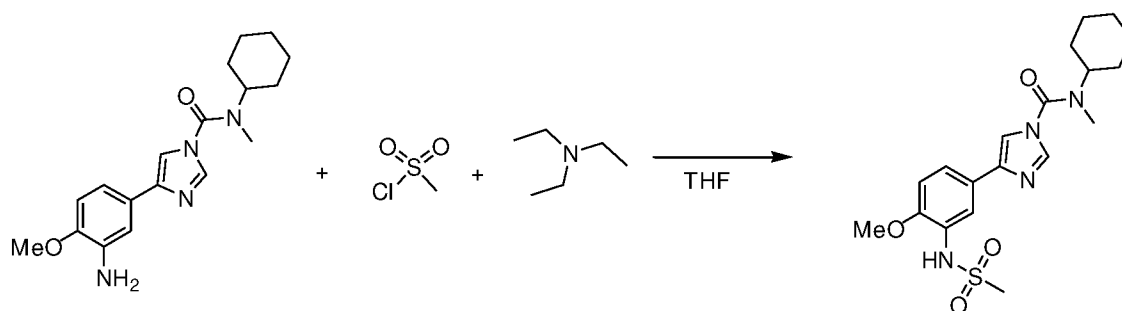
Одержання сполуки 485

а) 4-(3-Аміно-4-метоксифеніл)-N-циклогексил-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід



10 % Паладій на вугіллі (0,16 г, 0,15 ммоль) додають при перемішуванні до розчину N-циклогексил-4-(4-метокси-3-нітрофеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксаміду (1,075 г, 3 ммоль) в суміші етилацетату (50 мл) та метанолу (50 мл) при кімнатній температурі в атмосфері аргону. Водень пропускають крізь розчин протягом 1 год. Далі розчин фільтрують крізь броунмілерит, та шар броунмілериту промивають етилацетатом. Об'єднані фільтрати упарюють з одержанням маслянистої твердої речовини коричневого кольору, яку використовують на наступній стадії без подальшого очищення.

б) N-Циклогексил-4-(4-метокси-3-(метилсульфонамідо)феніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід



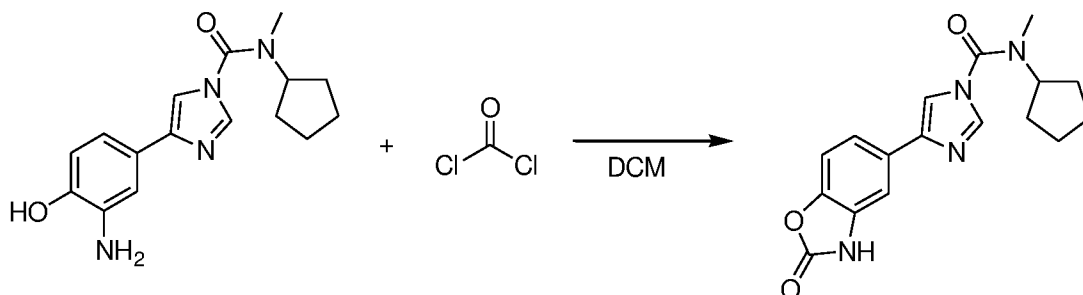
THF = ТГФ

Мезилхлорид (0,247 мл, 3,17 ммоль) <autotext key="0AA446E6" name="[Reactants]" index="2" field="Reactants" type="field" length="30"/> додають при перемішуванні до розчину 4-(3-аміно-4-метоксифеніл)-N-циклогексил-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксаміду (1,04 г, 3,17 ммоль) <autotext key="0AA446E7" name="[Reactants]" index="1" field="Reactants" type="field" length="96"/> і триетиламіну (0,441 мл, 3,17 ммоль) <autotext key="0AA446E8" name="[Reactants]" index="3" field="Reactants" type="field" length="35"/> в тетрагідрофурані (6 мл) <autotext key="0AA446E9" name="[Solvents]" index="1" field="Solvents" type="field" length="35"/>

при кімнатній температурі. Суміш коричневого кольору перемішують при кімнатній температурі протягом уїк-енду. Додають воду, і розчинник випарюють. Далі водну фракцію підкислюють, і залишок екстрагують етилацетатом. Водну фракцію екстрагують двічі сумішшю дихлорметан/ізопропанол (7:3). Органічну фракцію відокремлюють, сушать (MgSO_4), фільтрують та упарюють з одержанням твердої речовини майже білого кольору. Тверду речовину перекристалізують з суміші етанол/дихлорметан з одержанням продукту у вигляді твердої речовини майже білого кольору (434 мг, 34 %).

Одержання сполуки 564

N-Циклопентил-N-метил-4-(2-оксо-2,3-дигідробензо[d]оксазол-5-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід

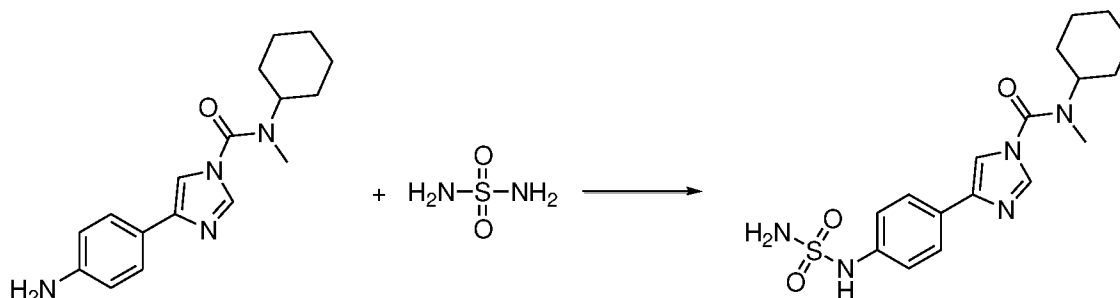


DCM = ДХМ

20 % Розчин фосгену в толуолі (0,590 мл, 1,121 ммоль) додають по краплях при кімнатній температурі та перемішуванні до розчин 4-(3-аміно-4-гідроксифеніл)-N-циклопентил-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксаміду (0,259 г, 0,862 ммоль) в дихлорметані (5 мл), і практично білу суспензію перемішують протягом 5 год. Додають воду, та органічну фракцію розбавляють сумішшю дихлорметан/ізопропанол (7:3). Органічну фракцію відокремлюють, сушать (MgSO_4), фільтрують та упарюють з одержанням твердої речовини майже білого кольору, яку розтирають з гарячим метанолом. Фільтрація та сушіння дає продукт у вигляді твердої речовини майже білого кольору (90 мг, 30 %).

Одержання сполуки 580

N-Циклогексил-N-метил-4-(4-(сульфаміно)феніл)-1H-імідазол-1-карбоксамід



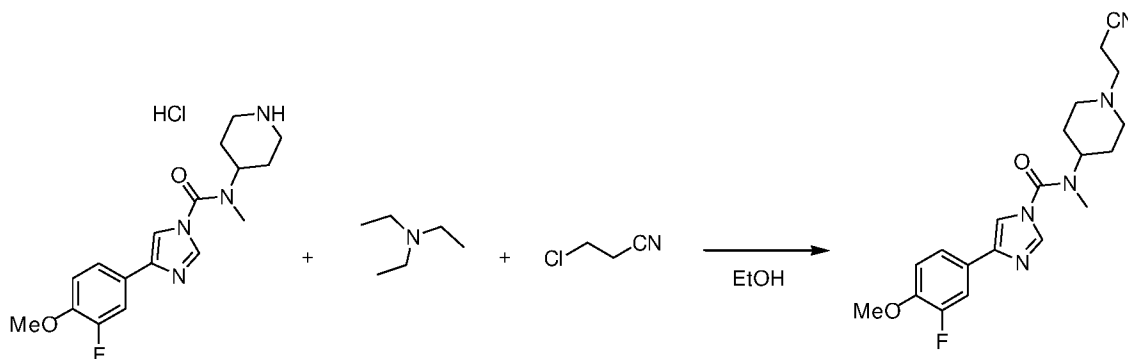
Сульфамід (0,089 г, 0,922 ммоль) додають при перемішуванні до суспензії 4-(4-амінофеніл)-N-циклогексил-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксаміду (0,250 г, 0,838 ммоль) в діоксані (2 мл) при кімнатній температурі. Суспензію кип'яють із зворотним холодильником протягом 4 год. з одержанням прозорого розчину, після чого додають додаткову кількість сульфаміду (0,089 г, 0,922 ммоль), і суміш кип'яють із зворотним холодильником ще протягом 2,5 год. Розчинник видаляють, і залишок коричневого кольору очищують хроматографією (кремнію діоксид, дихлорметан/метанол, 1 %, 2 %, 5 %). Гомогенні фракції об'єднують та упарюють. Залишок розтирають з етилацетатом, і безбарвну тверду речовину,

яка утворюється, видаляють фільтрацією. Фільтрат випарюють та очищують знову препаративною ТШХ (кремнію діоксид, дихлорметан/10 % метанолу). Продукт елюють з кремнію діоксиду сумішшю 10 % метанолу/етилацетат. Випарювання розчинника дає прозоре масло, яке розтирають з сумішшю етилацетату та метанолу з одержанням продукту у вигляді

5 твердої речовини майже білого кольору (19 мг, 6 %).

Одержання сполуки 541

N-(1-(2-Ціаноетил)піперидин-4-іл)-4-(3-фтор-4-метоксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід



10

Триетиламін (0,159 мл, 1,139 ммоль) додають при перемішуванні до суспензії 4-(3-фтор-4-метоксифеніл)-N-метил-N-(піперидин-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксаміду гідрохлориду (0,200 г, 0,542 ммоль) і 3-хлорпропаннітрилу (0,058 г, 0,651 ммоль) при кімнатній температурі. Прозорий розчин перемішують при кип'ятінні із зворотним холодильником протягом 2 год., в ході чого утворюється суспензія білого кольору. Суміші дозволяють охолонути до кімнатної температури, розбавляють сумішшю дихлорметан/ізопропанол (7:3), і потім промивають водою. Органічну фракцію сушать (MgSO_4), фільтрують та упарюють з одержанням безбарвної твердої речовини, яку розтирають етанолом з одержанням продукту (142 мг, 64 %).

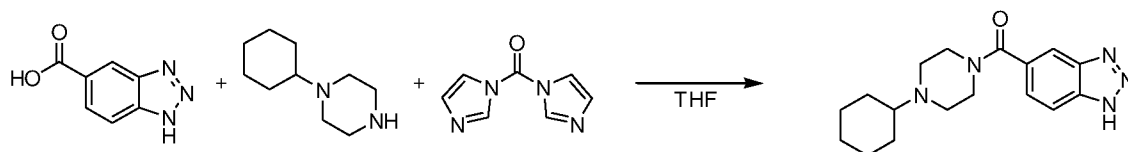
15

20

Одержання сполуки 505

25

а) (1H-Бензо[d][1,2,3]триазол-5-іл)(4-циклогексилпіперазин-1-іл)метанон



THF = ТГФ

30

До круглодонної колби об'ємом 100 мл вміщують 1H-бензо[d][1,2,3]триазол-5-карбонову кислоту (510 мг, 3,126 ммоль) в безводному тетрагідрофурані (10 мл) в атмосфері азоту, з одержанням суспензії коричневого кольору. КДІ (558 мг, 3,439 ммоль) додають порціями, і суміш перемішують при кімнатній температурі протягом 1,5 год. Далі 1-циклогексилпіперазин (658 мг, 3,908 ммоль) додають порціями, та одержаний розчин коричневого кольору перемішують при кімнатній температурі ще протягом 30 хв. Розчинник випарюють, і коричневе масло розподіляють в суміші 30 % ізопропанолу/дихлорметан/вода. Фракції розділяють, органічну фракцію промивають водою і розчином солі, потім сушать (MgSO_4), фільтрують та упарюють. Одержану піну бежевого кольору очищують хроматографією (сілікагель Н; дихлорметан, 2 %, 3 %, 5 % метанолу/дихлорметан). Фракції, що містять чистий продукт, упарюють, і піну блідо-оранжевого

35

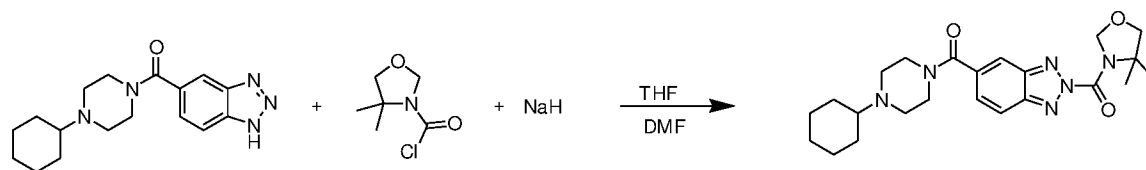
40

45

кольору розтирають з гептаном. Тверду речовину відфільтровують та сушать з одержанням твердої речовини бежевого кольору, (605 мг, 54 %).

б) (4-Циклогексилпіперазин-1-іл)(2-(4,4-диметилотсазолідин-3-карбоніл)-2Н-бензо[d][1,2,3]триазол-5-іл)метанону оксалат

5



THF = ТГФ, DMF = ДМФА

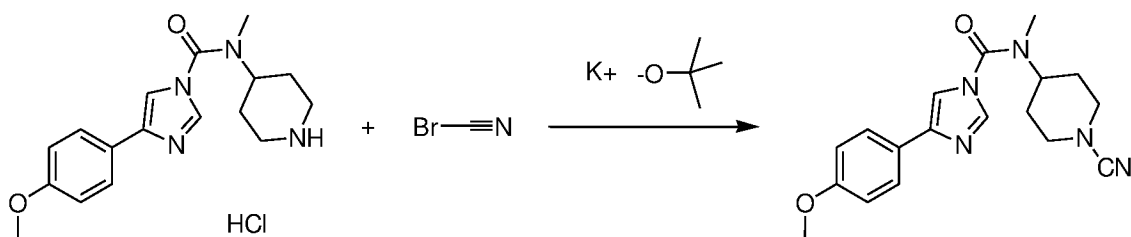
До круглодонної колби об'ємом 100 мл <autotext key="0AB1CCF3" name="[VESSEL]" type="lookup" length="20"/> вміщують (1Н-бензо[d][1,2,3]триазол-5-іл)(4-циклогексилпіперазин-1-іл)метанон (612 мг, 1,953 ммоль)<autotext key="0AB1CCF4" name="[Reactants]" index="1" field="Reactants" type="field" length="90"/> в суміші тетрагідрофурану (15 мл)<autotext key="0AB1CCF5" name="[Solvents]" index="1" field="Solvents" type="field" length="23"/> та N, N-диметилформаміду (3 мл)<autotext key="0AB1CCF8" name="[Solvents]" index="3" field="Solvents" type="field" length="28"/> з одержанням <autotext key="0AB1CCF6" name="[COLOR]" type="lookup" length="6"/> розчину блідо-жовтого кольору<autotext key="0AB1CCF7" name="[SOLN/SUSP]" type="lookup" length="8"/>. Одержаний розчин охолоджують до 0 °С, та додають 60 % дисперсію натрію гідриду в мінеральному маслі (70,3 мг, 2,93 ммоль)<autotext key="0AB1CCF9" name="[Reactants]" index="3" field="Reactants" type="field" length="35"/>. Одержаному розчину блідо-рожевого кольору дозволяють нагрітися до кімнатної температури та перемішують протягом 45 хв. Далі суміш охолоджують знову до 0 °С, та додають по краплях розчин 4,4-диметилотсазолідин-3-карбоніл хлорид (351 мг, 2,148 ммоль)<autotext key="0AB1DC02" name="[Reactants]" index="2" field="Reactants" type="field" length="64"/> в тетрагідрофурані (2,5 мл)<autotext key="0AB1DC03" name="[Solvents]" index="2" field="Solvents" type="field" length="24"/>. Одержаному розчину блідо-жовтого кольору дозволяють нагрітися до кімнатної температури та перемішують протягом 4 год. Розчинник випарюють, і воду додають до залишку, який екстрагують толуолом. Органічну фракцію промивають водою<autotext key="0AB1CCFA" name="[WKUP SOLNS]" type="lookup" length="3"/> і розчином солі, <autotext key="0AB1CCFC" name="[WKUP SOLNS]" type="lookup" length="8"/> потім сушать (MgSO₄)<autotext key="0AB1CCFE" name="[DRYING AGENT]" type="lookup" length="5"/>, фільтрують та упарюють. Одержане масло жовтого кольору очищують хроматографією (сілікагель Н; дихлорметан, 2 % метанолу/дихлорметан. Фракції, що містять чистий продукт, об'єднують та упарюють з одержанням піни блідо-жовтого кольору (690 мг, 80 %).

До грушоподібної колби місткістю 50 мл<autotext key="0AB5A59B" name="[VOLUME]" type="lookup" length="5"/> <autotext key="0AB5A59C" name="[VESSEL]" type="lookup" length="10"/> вміщують (4-циклогексилпіперазин-1-іл)(2-(4,4-диметилотсазолідин-3-карбоніл)-2Н-бензо[d][1,2,3]триазол-5-іл)метанон (300 мг, 0,681 ммоль)<autotext key="0AB5A59D" name="[Reactants]" index="1" field="Reactants" type="field" length="129"/> в метанолі (5 мл)<autotext key="0AB5A59E" name="[SOLVENTS1]" index="1" field="Solvents" type="field" length="15"/> при кімнатній температурі, з одержанням жовтого<autotext key="0AB5A59F" name="[COLOR]" type="lookup" length="6"/> розчину<autotext key="0AB5A5A0" name="[SOLN/SUSP]" type="lookup" length="8"/>. Щавлевої кислоти дигідрат (86 мг, 0,681 ммоль)<autotext key="0AB5A5A1" name="[Reactants]" index="2" field="Reactants" type="field" length="41"/> додають у вигляді однієї порції, та розчин перемішують при кімнатній температурі протягом 2 год. Розчинник випарюють, та одержану піну блідо-жовтого кольору кристалізують з ізопропанолу. Після фільтрації та сушіння одержують продукт у вигляді білої твердої речовини, (150 мг, 39 %).

Одержання сполуки 595

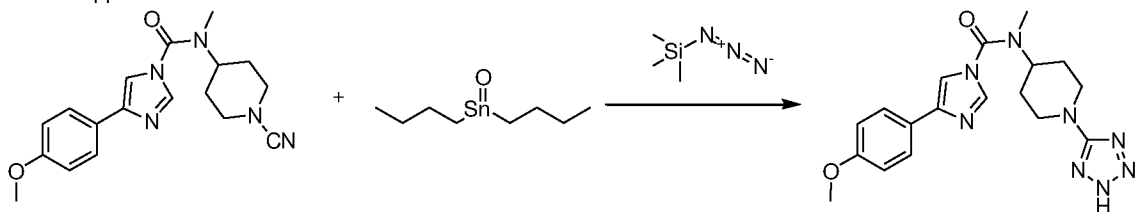
а) N-(1-Ціанопіперидин-4-іл)-4-(4-метоксифеніл)-N-метил-1Н-імідазол-1-карбоксамід

50



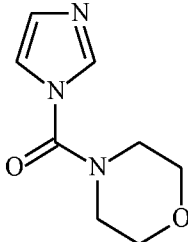
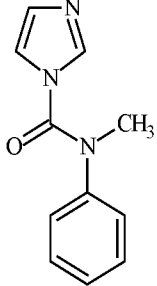
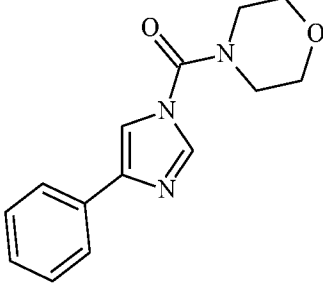
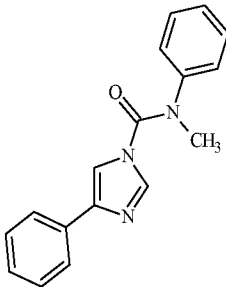
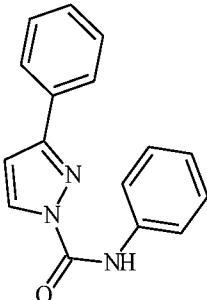
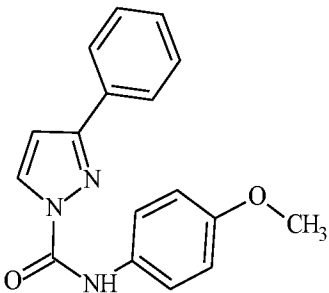
До розчину 4-(4-метоксифеніл)-N-метил-N-(піперидин-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксаміду гідрохлориду (287 мг, 0,818 ммоль) в ДМФА (5 мл) додають калію трет-бутоксид (184 мг, 1,636 ммоль) і суміш перемішують при кімнатній температурі протягом 30 хв, після чого охолоджують на бані, що містить воду з льодом, та ціаногену бромід (0,818 мл, 2,454 ммоль, 3 н розчин в дихлорметані) додають по краплях протягом 10–15 хв. Реакційній суміші дозволяють повільно нагрітися до кімнатної температури протягом 1 год., після чого розподіляють між водою та сумішшю дихлорметан/ізопропанол (7:3). Фракції розділяють, органічну фракцію додатково промивають водою і розчином солі, потім сушать (Na₂SO₄), фільтрують і розчинник видаляють при зниженому тиску. Залишок розчиняють в мінімальному об'ємі хлороформу, і нерозчинний матеріал видаляють фільтрацією. Фільтрат упарюють з одержанням твердої речовини майже білого кольору, (345 мг, 67 %).

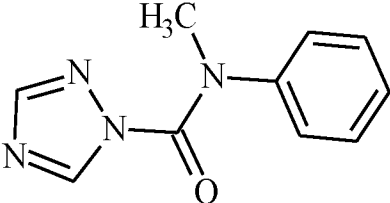
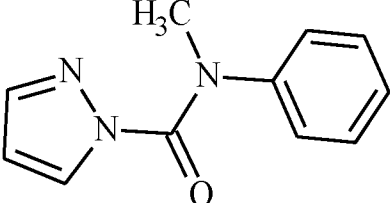
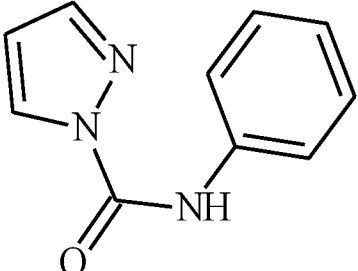
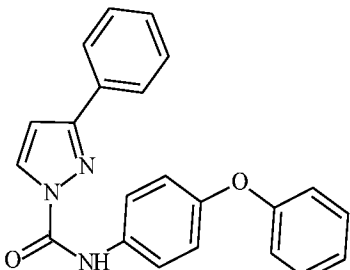
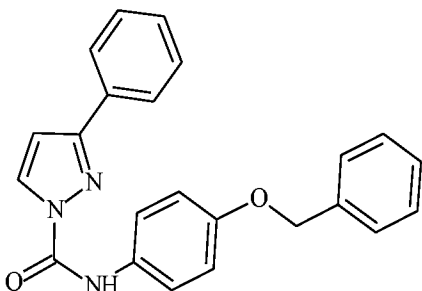
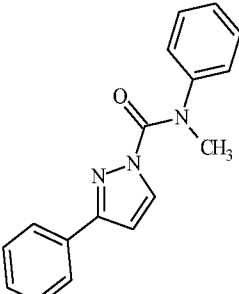
б) N-(1-(2H-Тетразол-5-іл)піперидин-4-іл)-4-(4-метоксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід

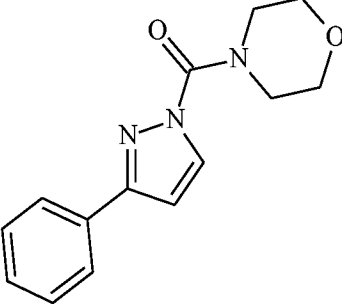
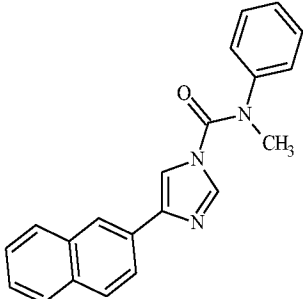
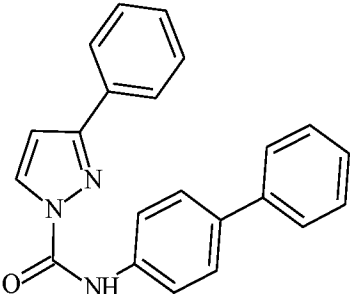
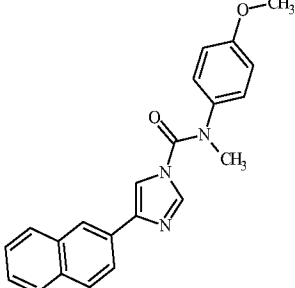
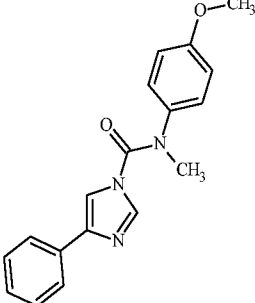


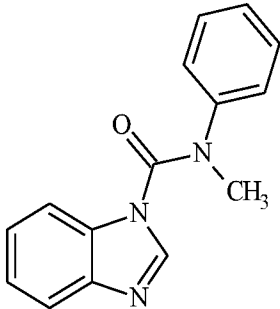
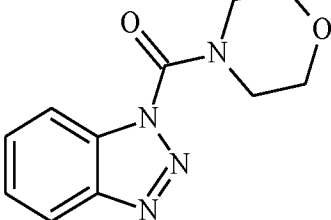
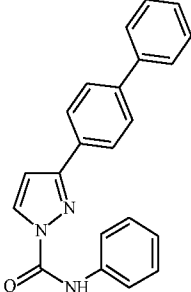
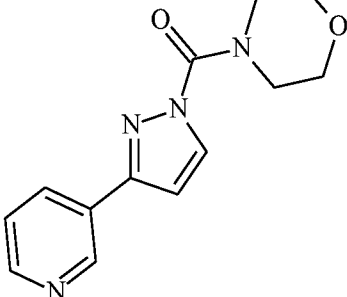
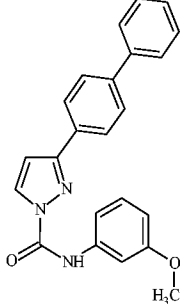
До суспензії N-(1-ціанопіперидин-4-іл)-4-(4-метоксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксаміду (151 мг, 0,445 ммоль) в толуолі (10 мл) додають дибутилстананон (13,84 мг, 0,056 ммоль) з наступним додаванням азидотриметилсилану (0,207 мл, 1,557 ммоль). Реакційну суміш кип'ятять із зворотним холодильником протягом 5 год., після чого фільтрують в гарячому вигляді, та одержану тверду речовину рожевого кольору промивають послідовно толуолом, дихлорметаном, і в кінці ефіром. Тверду речовину перекристалізують з метанолу з одержанням продукту у вигляді світло-рожевої твердої речовини (100 мг, 56 %).

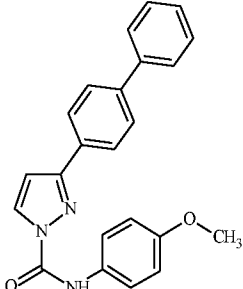
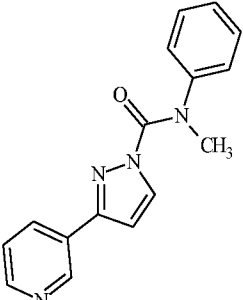
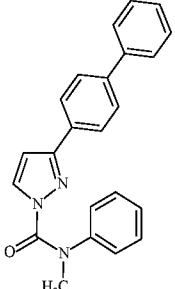
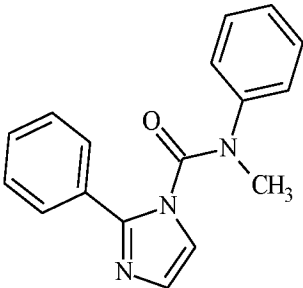
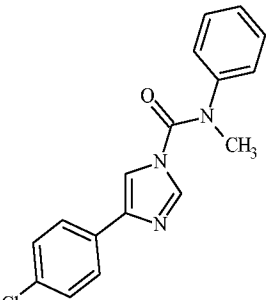
2. Приклади сполук

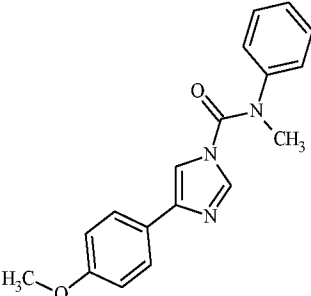
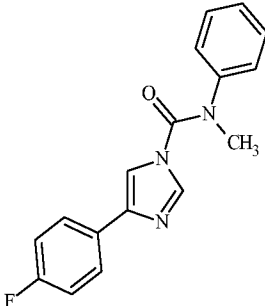
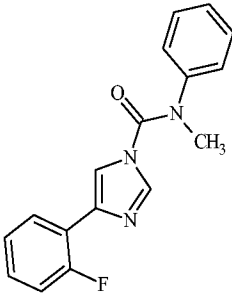
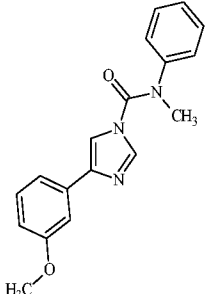
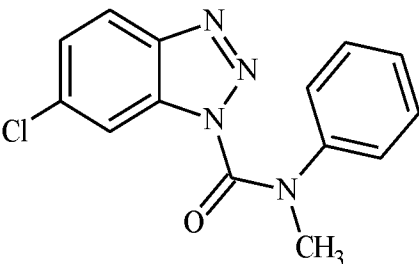
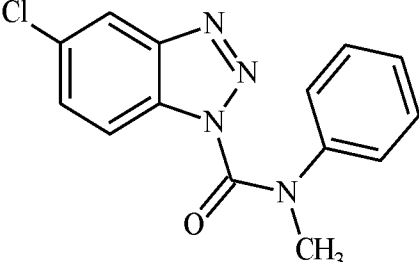
No.	Формула
1	 <chem>O=C1CN(C1)c2ccncc2</chem>
2	 <chem>CN(C1=CC=CC=C1)C(=O)N2C=CN=C2</chem>
3	 <chem>O=C1CN(C1C2=CC=CC=C2)c3ccncc3</chem>
4	 <chem>CN(C1=CC=CC=C1)C(=O)N2C=CC(=C2)C3=CC=CC=C3</chem>
5	 <chem>O=C1N(C1C2=CC=CC=C2)NC3=CC=CC=C3</chem>
6	 <chem>COC1=CC=C(C=C1)NC(=O)N2C=CC(=C2)C3=CC=CC=C3</chem>

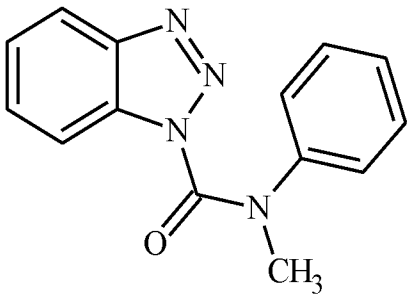
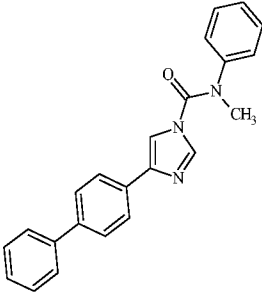
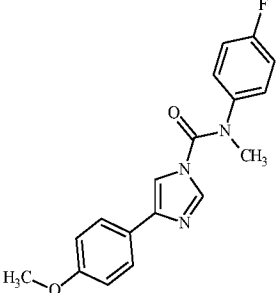
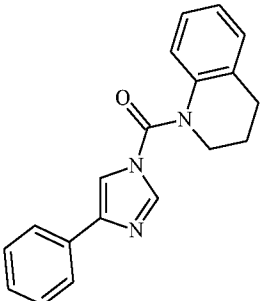
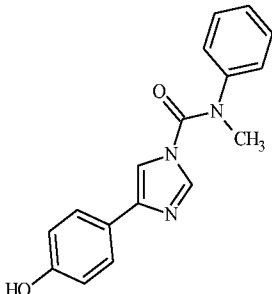
No.	Формула
7	 <chem>CN1C=NC(=C1)C(=O)Nc2ccccc2</chem>
8	 <chem>CN1C=CC=C1C(=O)Nc2ccccc2</chem>
9	 <chem>c1cc[nH]c1C(=O)Nc2ccccc2</chem>
10	 <chem>O=C(Nc1ccc(Oc2ccccc2)cc1)c2nc3ccccc3n2</chem>
11	 <chem>O=C(Nc1ccc(OCC2=CC=CC=C2)cc1)c2nc3ccccc3n2</chem>
12	 <chem>CN(C(=O)c1ccccc1)c2nc3ccccc3n2</chem>

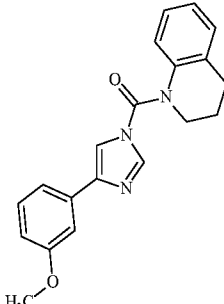
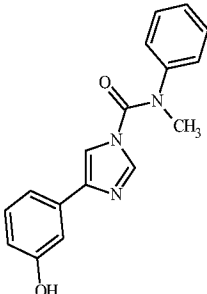
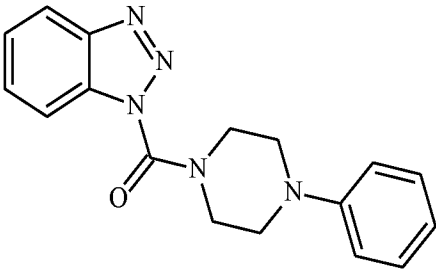
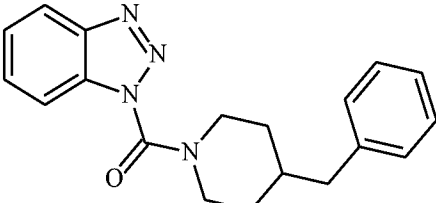
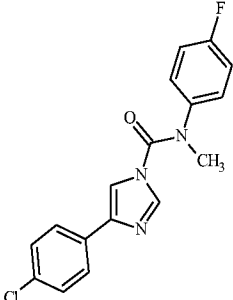
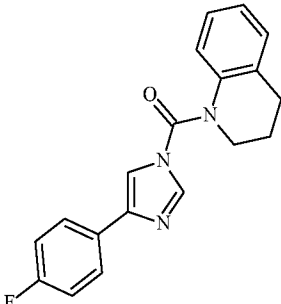
No.	Формула
13	
14	
15	
16	
17	

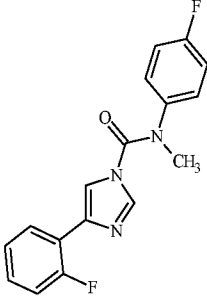
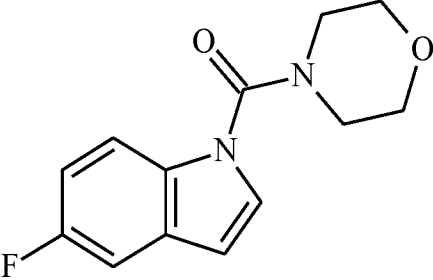
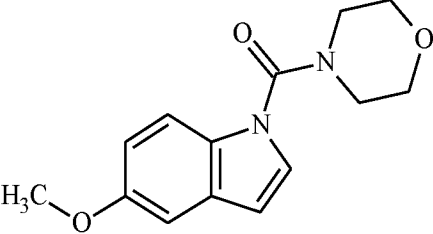
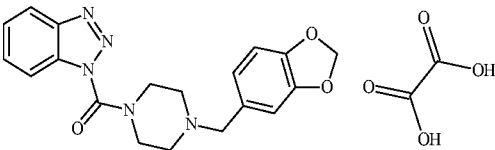
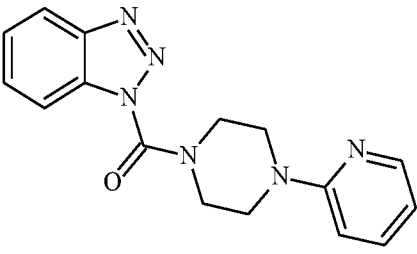
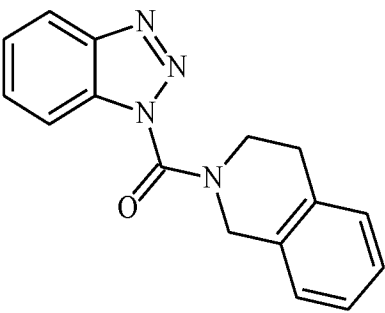
No.	Формула
18	
19	
20	
21	
22	

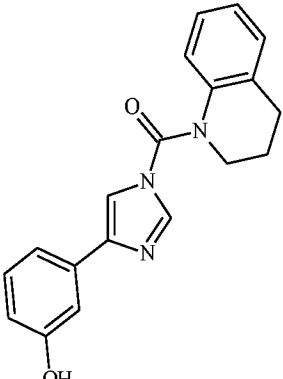
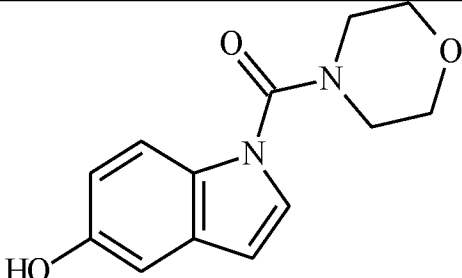
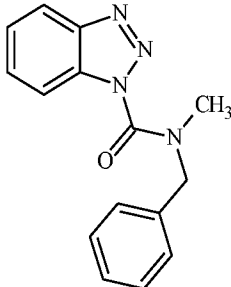
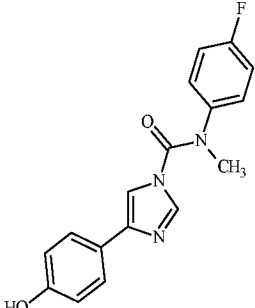
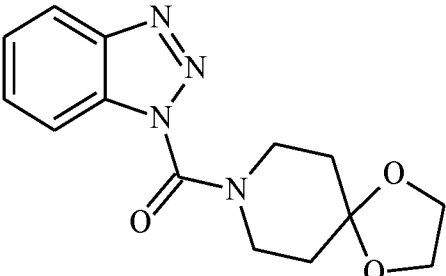
No.	Формула
23	
24	
25	
26	
27	

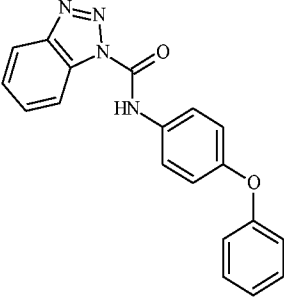
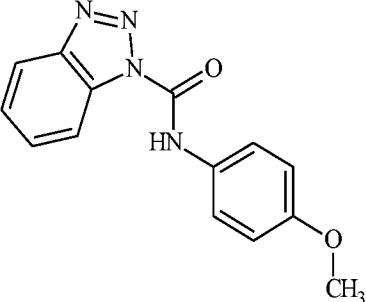
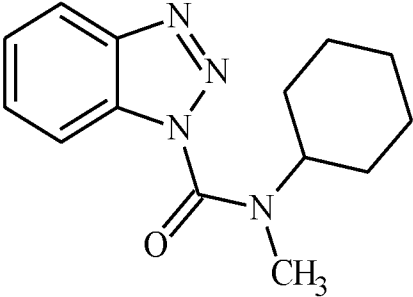
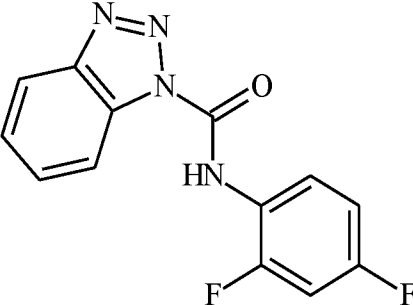
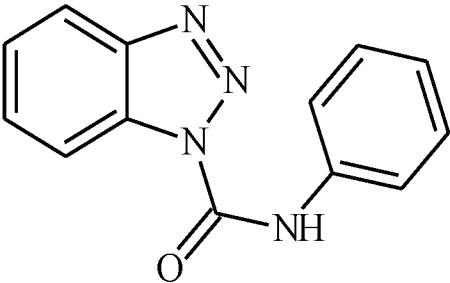
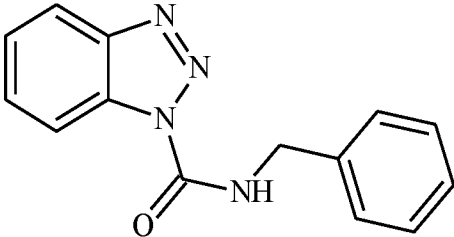
No.	Формула
28	 <chem>CN(C(=O)c1cn(C2=CC=C(OC)C=C2)c1)c3ccccc3</chem>
29	 <chem>CN(C(=O)c1cn(C2=CC=C(F)C=C2)c1)c3ccccc3</chem>
30	 <chem>CN(C(=O)c1cn(C2=CC=C(F)C=C2)c1)c3ccccc3</chem>
31	 <chem>CN(C(=O)c1cn(C2=CC=C(OC)C=C2)c1)c3ccccc3</chem>
32	 <chem>CN(C(=O)c1nn(C2=CC=C(Cl)C=C2)nn1)c3ccccc3</chem>
33	 <chem>CN(C(=O)c1nn(C2=CC=C(Cl)C=C2)nn1)c3ccccc3</chem>

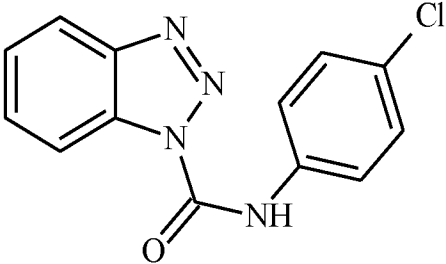
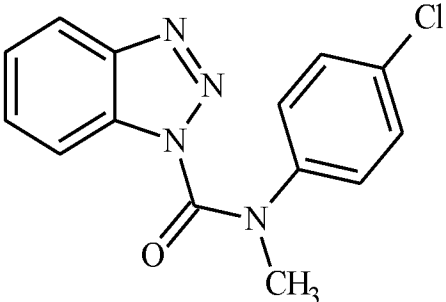
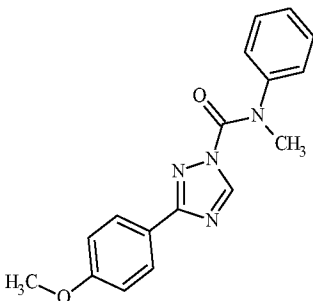
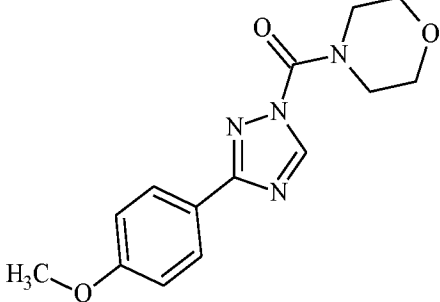
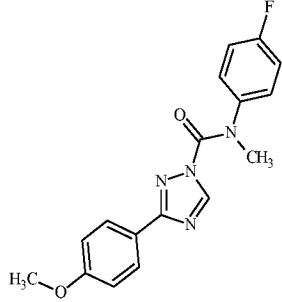
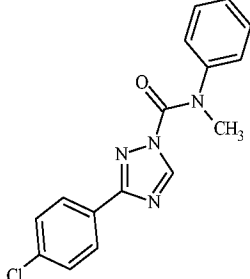
No.	Формула
34	 <chem>CN(C(=O)N1C=NC2=CC=CC=C12)c3ccccc3</chem>
35	 <chem>CN(C(=O)N1C=CN(C1=CC=C2C(=CC(=CC=C2)C3=CC=CC=C3))C4=CC=CC=C4)C5=CC=CC=C5</chem>
36	 <chem>CN(C(=O)N1C=CN(C1=CC=C2C(=CC(=CC=C2)C3=CC(=CC=C3)OC)C4=CC(=CC=C4)F)C5=CC=CC=C5)C6=CC=CC=C6</chem>
37	 <chem>CN(C(=O)N1C=CN(C1=CC=C2C(=CC(=CC=C2)C3=CC=CC=C3))C4=CC=CC=C4)C5=CC=CC=C5</chem>
38	 <chem>CN(C(=O)N1C=CN(C1=CC=C2C(=CC(=CC=C2)C3=CC(=CC=C3)O)C4=CC=CC=C4)C5=CC=CC=C5)C6=CC=CC=C6</chem>

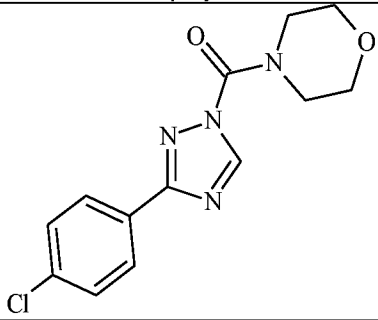
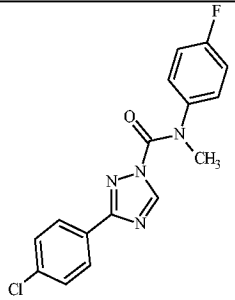
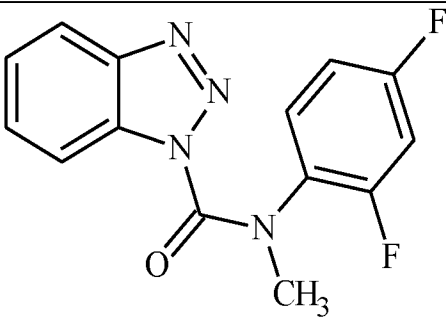
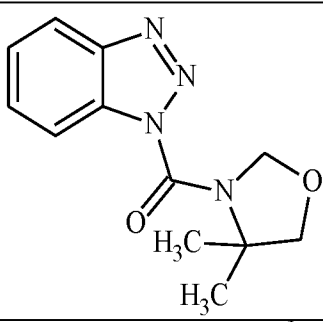
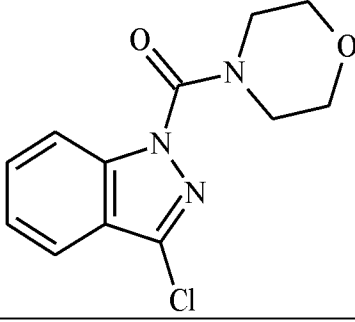
No.	Формула
39	
40	
41	
42	
43	
44	

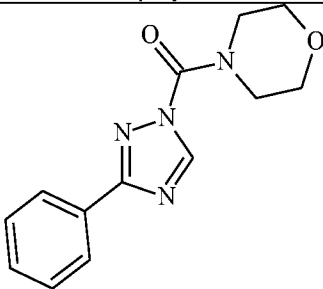
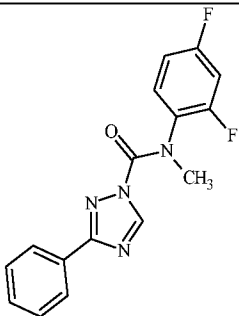
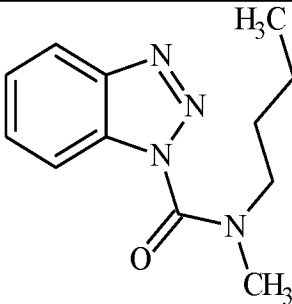
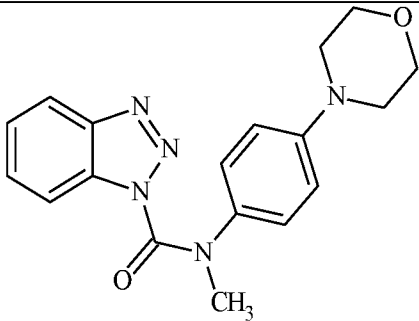
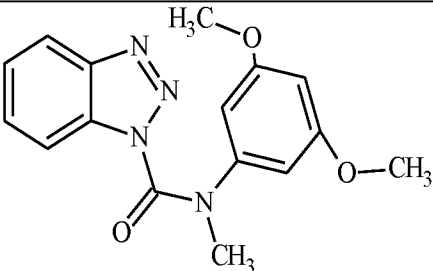
No.	Формула
45	 <chem>CN(C(=O)c1cn(C2=CC=CC=C2F)c2ccccc2F)c3ccc(F)cc3</chem>
46	 <chem>C1CCN(C1)C(=O)c2c[nH]c3ccc(F)cc32</chem>
47	 <chem>COC1=CC=C2C(=C1)C(=CN2)C(=O)N3CCOC3</chem>
48	 <chem>C1CCN(C1)C(=O)c2nn3ccccc3n2C4CCN(C4)Cc5ccc6c(c5)OCO6CC(=O)O</chem>
49	 <chem>C1CCN(C1)C(=O)c2nn3ccccc3n2C4CCN(C4)Cc5cccnc5</chem>
50	 <chem>C1CCN(C1)C(=O)c2nn3ccccc3n2C4CCc5ccccc45</chem>

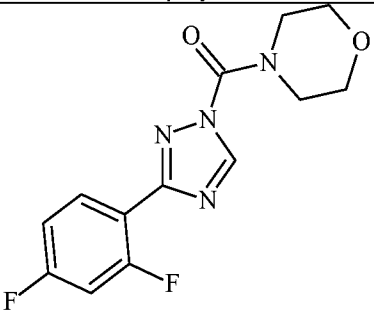
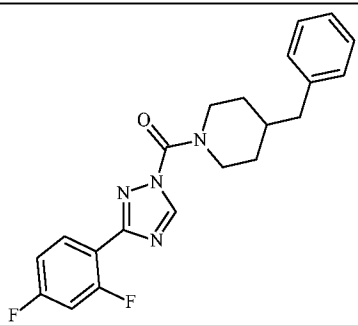
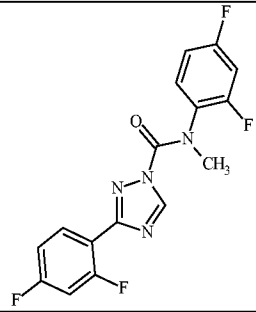
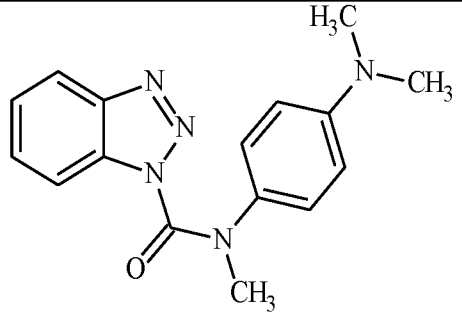
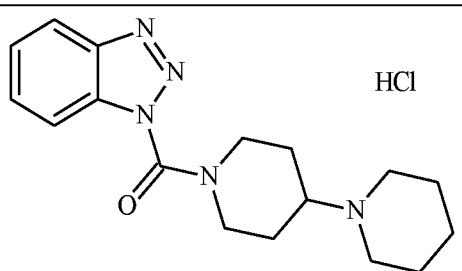
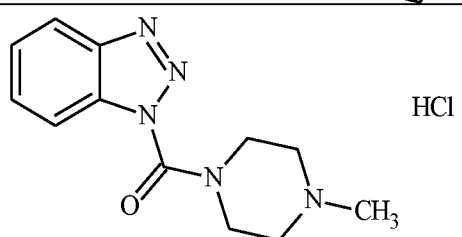
No.	Формула
51	
52	
53	
54	
55	

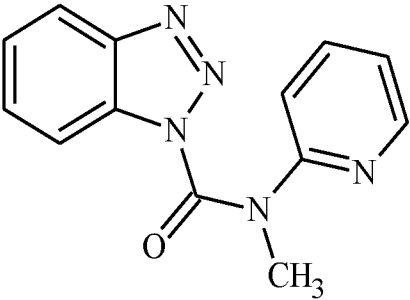
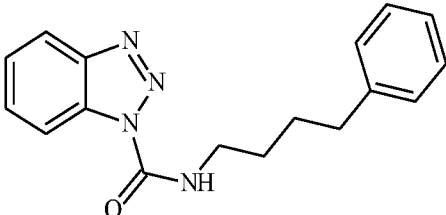
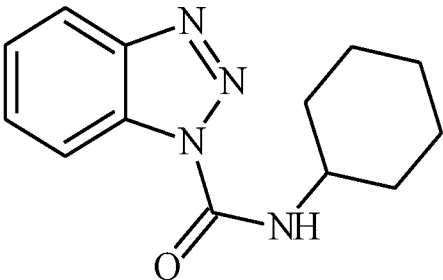
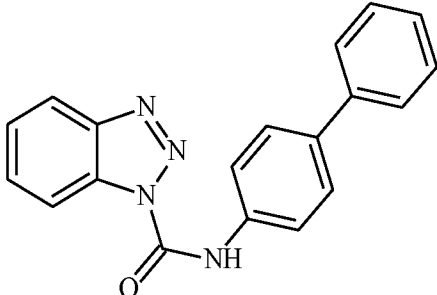
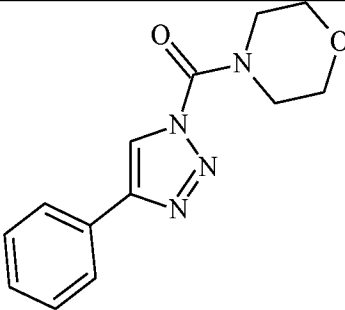
No.	Формула
56	 <chem>O=C(Nc1ccc(Oc2ccccc2)cc1)c1nc2ccccc2n1</chem>
57	 <chem>COC1=CC=C(NC(=O)c2nc3ccccc3nn2)C=C1</chem>
58	 <chem>CN(C(=O)N(C1CCCCC1)c2nc3ccccc3nn2)c3ccccc3</chem>
59	 <chem>Fc1cc(F)ccc1NC(=O)c2nc3ccccc3nn2</chem>
60	 <chem>Nc1ccccc1C(=O)Nc2nc3ccccc3nn2</chem>
61	 <chem>c1ccccc1CNc2nc3ccccc3nn2C=O</chem>

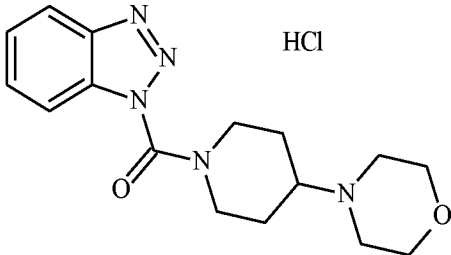
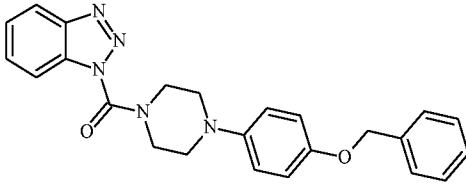
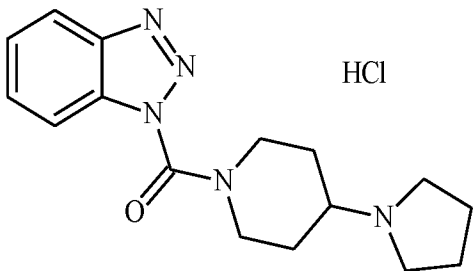
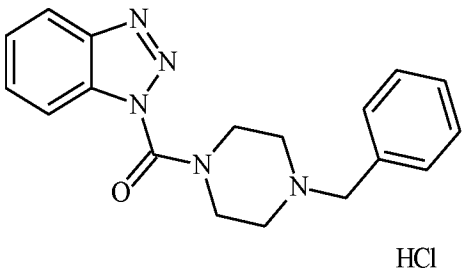
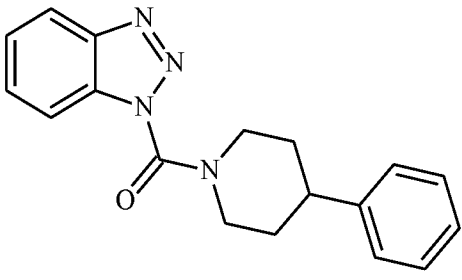
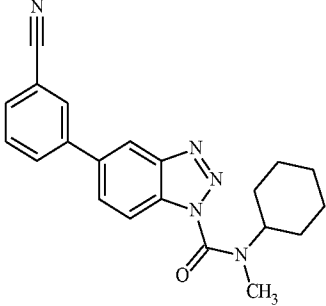
No.	Формула
62	
63	
64	
65	
66	
67	

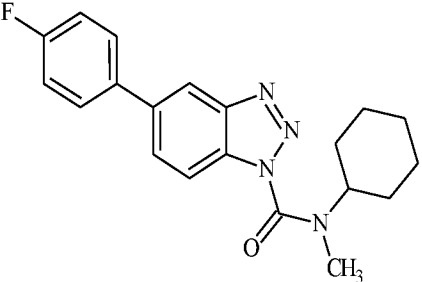
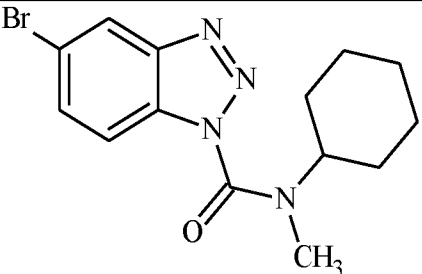
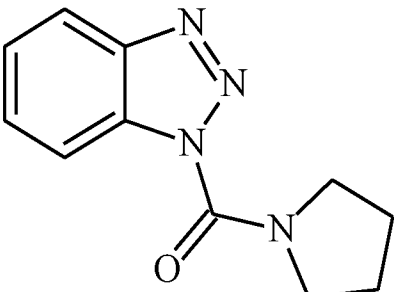
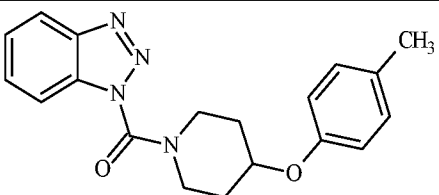
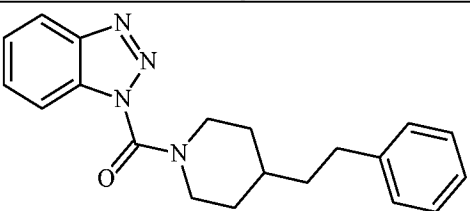
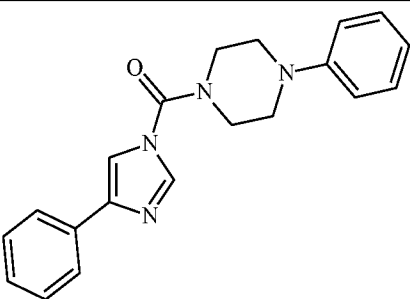
No.	Формула
68	 <chem>Clc1ccc(cc1)-c2nn[nH]2C(=O)N3CCOCC3</chem>
69	 <chem>Clc1ccc(cc1)-c2nn[nH]2C(=O)N(C)c3cc(F)ccc3</chem>
70	 <chem>CN(C(=O)N1C2=CC=CC=C2N1C3=NC=NC=C3)c4cc(F)c(F)cc4</chem>
71	 <chem>CN(C(=O)N1C2=CC=CC=C2N1C3=NC=NC=C3)c4cc(F)c(F)cc4</chem>
72	 <chem>Clc1ccc(cc1)-c2nn[nH]2C(=O)N3CCOCC3</chem>

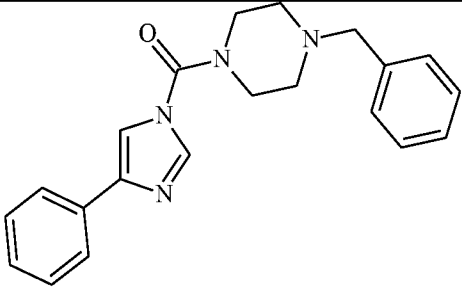
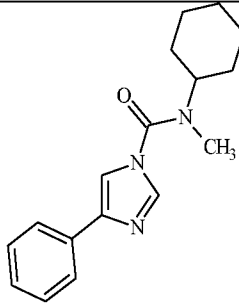
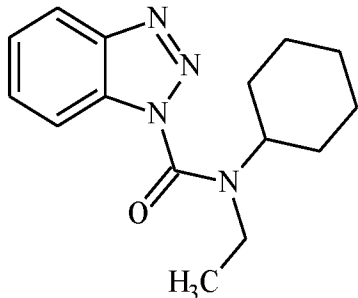
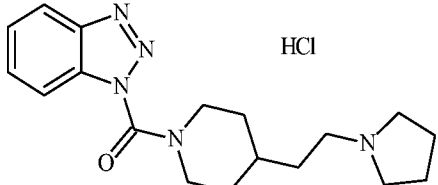
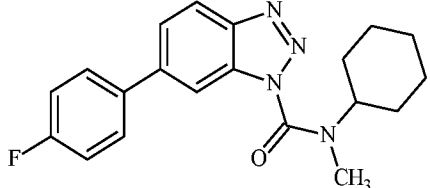
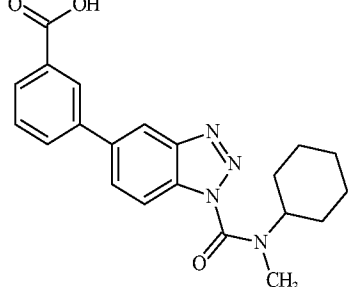
No.	Формула
73	
74	
75	
76	
77	

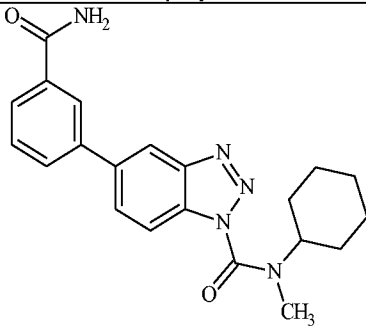
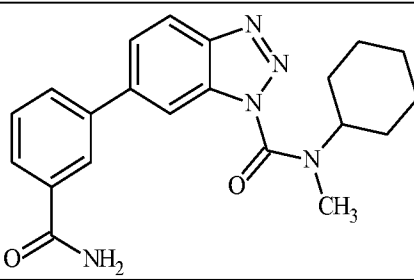
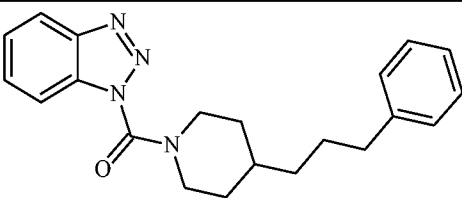
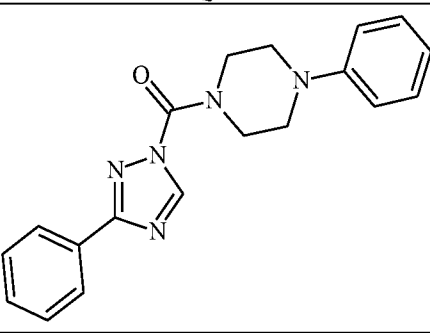
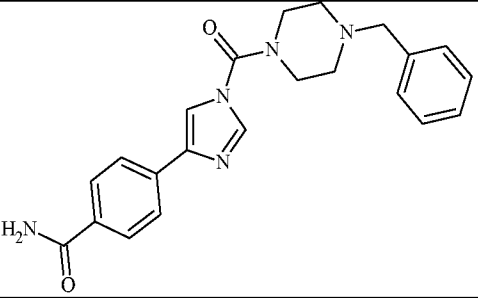
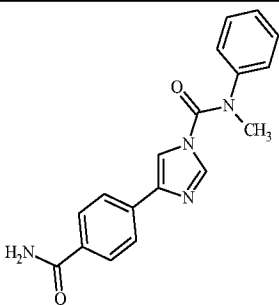
No.	Формула
78	
79	
80	
81	
82	 HCl
83	 HCl

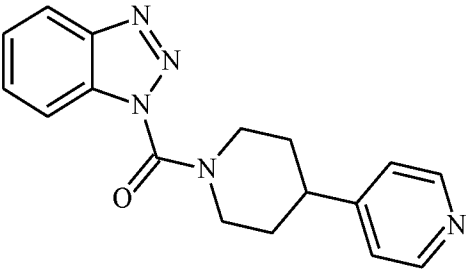
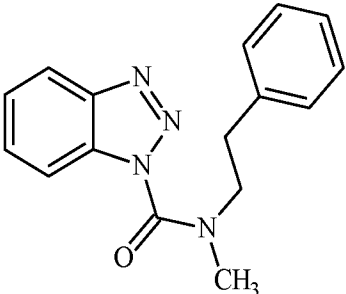
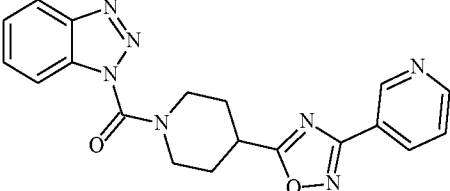
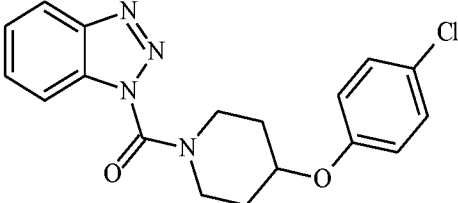
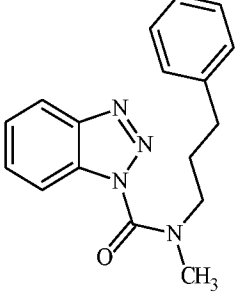
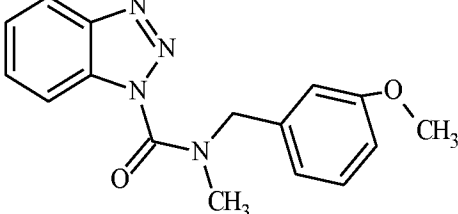
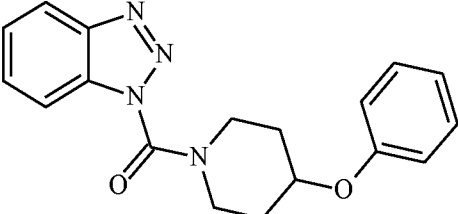
No.	Формула
84	
85	
86	
87	
88	
89	

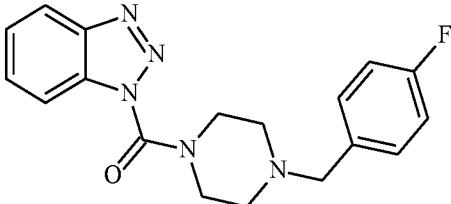
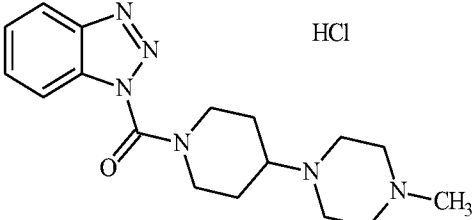
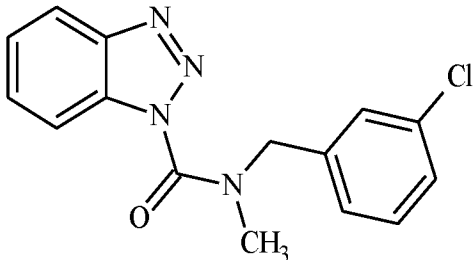
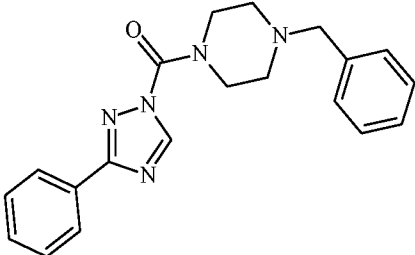
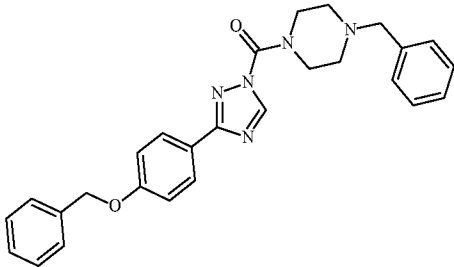
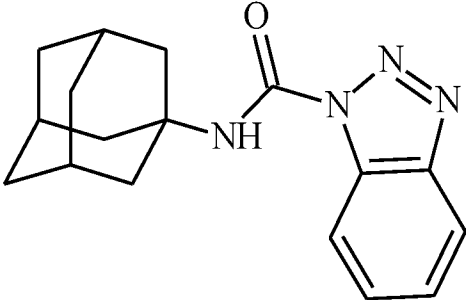
No.	Формула
90	
91	
92	
93	
94	
95	

No.	Формула
96	 <chem>CN(C1CCCCC1)C(=O)N2C=NC=C(C3=CC=CC=C3F)N2</chem>
97	 <chem>CN(C1CCCCC1)C(=O)N2C=NC=C(C3=CC=C(Br)C=C3)N2</chem>
98	 <chem>C1CCCN(C1)C(=O)N2C=NC=C3C=CC=CC23</chem>
99	 <chem>CN1CCCCC1C(=O)N2C=NC=C(C3=CC=C(OC)C=C3)N2</chem>
100	 <chem>C1CCCN(C1)C(=O)N2C=NC=C(C3=CC=CC=C3CCCN2)C3=CC=CC=C3</chem>
101	 <chem>CN(C1CCN(C1)C(=O)N2C=NC=C(C3=NC=CC=C3)N2)C4=CN=CN(C5=CC=CC=C5)N4</chem>

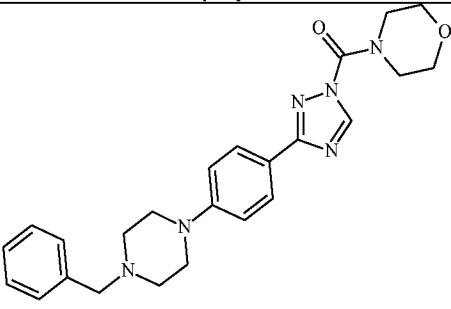
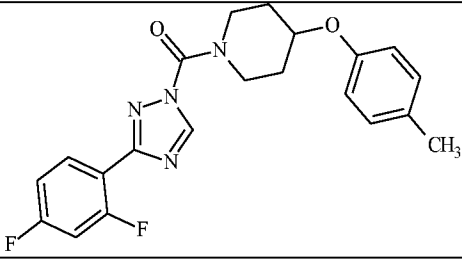
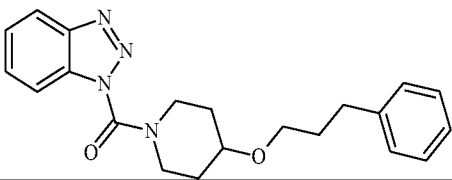
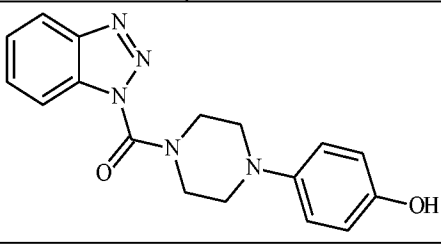
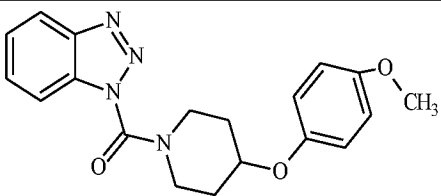
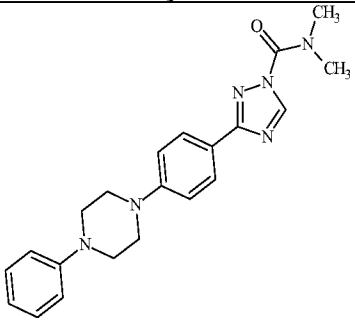
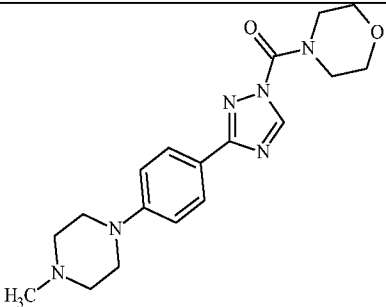
No.	Формула
102	
103	
104	
105	 HCl
106	
107	

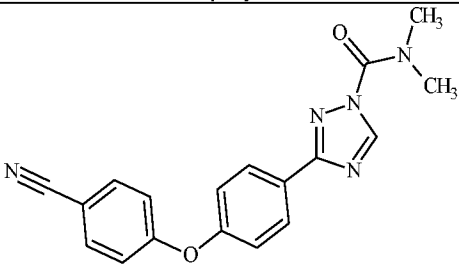
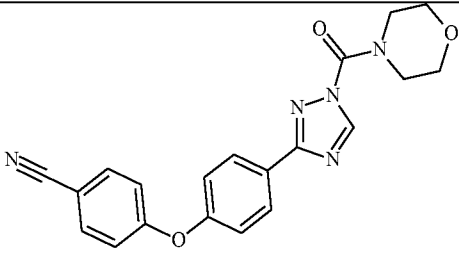
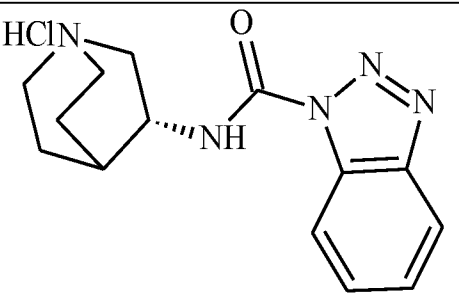
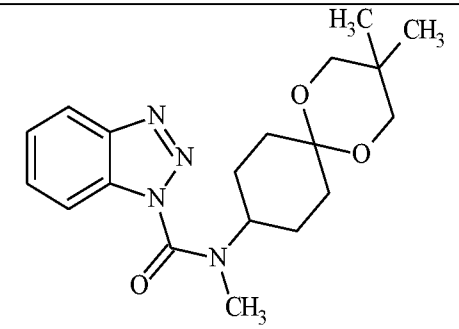
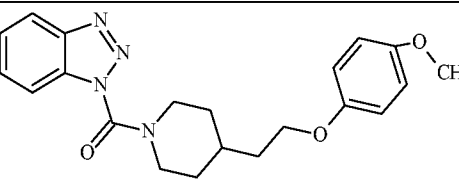
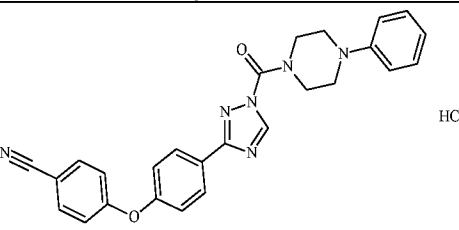
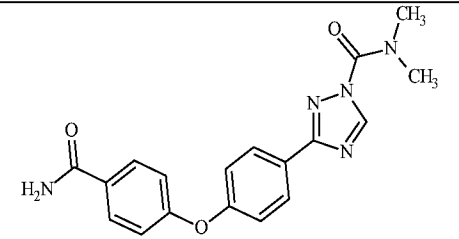
No.	Формула
108	
109	
110	
111	
112	
113	

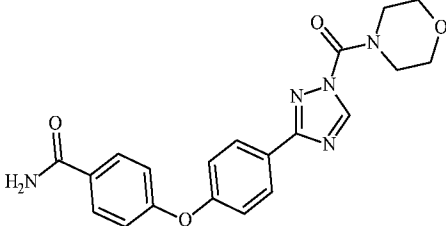
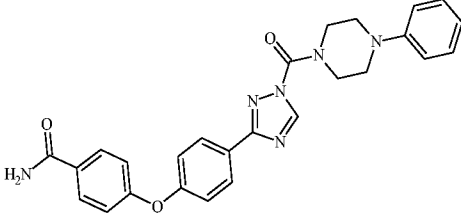
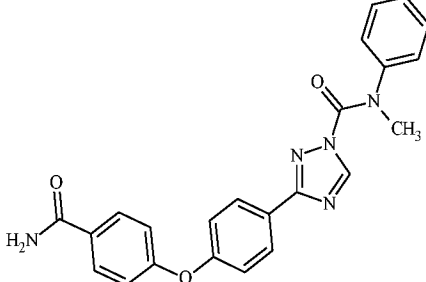
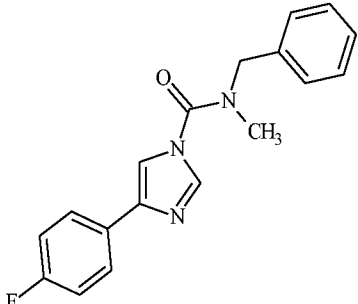
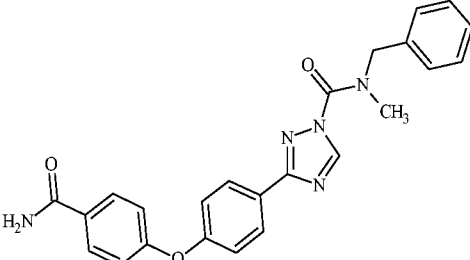
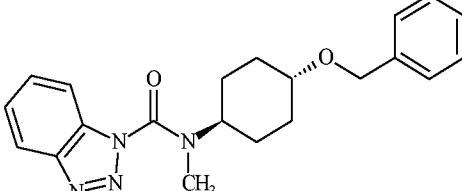
No.	Формула
114	 <chem>Nc1ccc(cc1)C2CCCN(C2)C(=O)N3C4=CC=CC=C4N5C(=N3)N=CN5</chem>
115	 <chem>CN(CCCc1ccccc1)C(=O)N2C3=CC=CC=C3N4C(=N2)N=CN4</chem>
116	 <chem>Nc1ccc(cc1)/N=N/O=C2N(C2)C3CCN(C3)C(=O)N4C5=CC=CC=C5N6C(=N4)N=CN6</chem>
117	 <chem>Clc1ccc(Oc2ccccc2N3CCN(C3)C(=O)N4C5=CC=CC=C5N6C(=N4)N=CN6)cc1</chem>
118	 <chem>CN(CCCc1ccccc1)C(=O)N2C3=CC=CC=C3N4C(=N2)N=CN4</chem>
119	 <chem>COC1=CC=C(C=C1)CN(C)C(=O)N2C3=CC=CC=C3N4C(=N2)N=CN4</chem>
120	 <chem>c1ccc(Oc2ccccc2N3CCN(C3)C(=O)N4C5=CC=CC=C5N6C(=N4)N=CN6)cc1</chem>

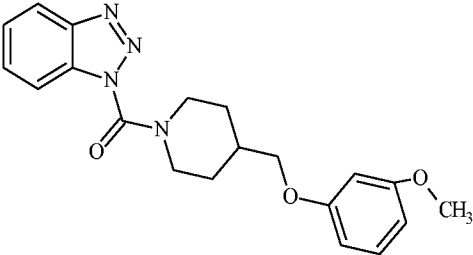
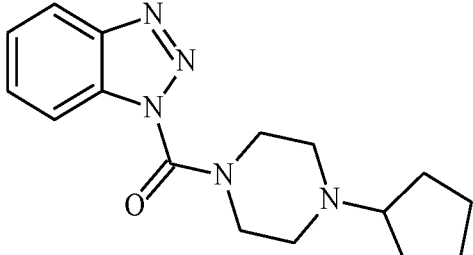
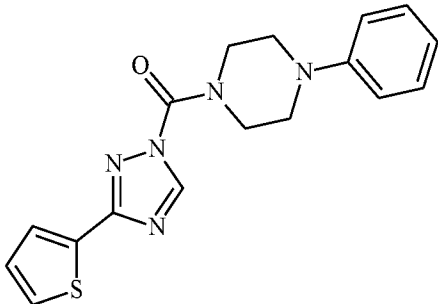
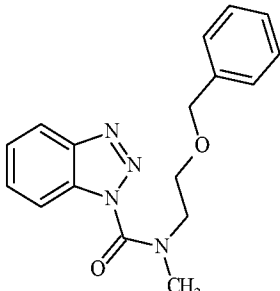
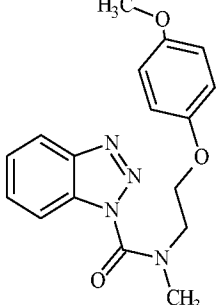
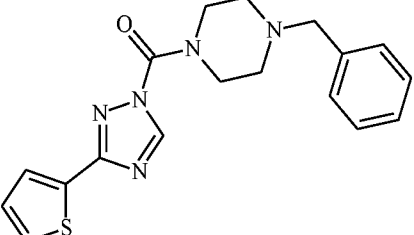
No.	Формула
121	
122	
123	
124	
125	
126	

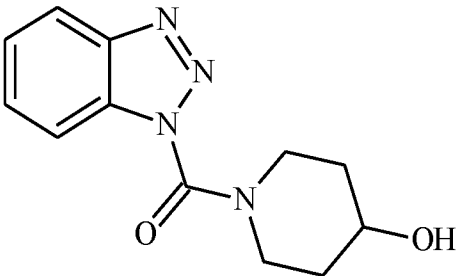
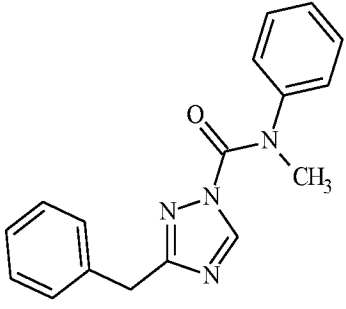
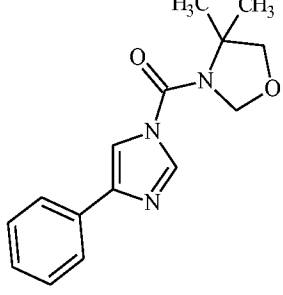
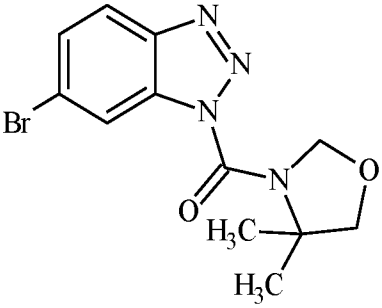
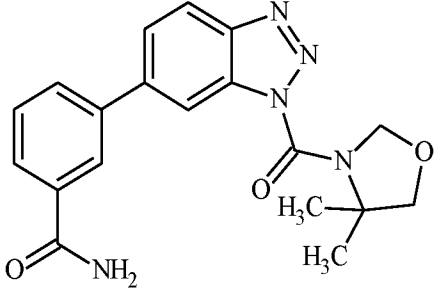
No.	Формула
127	<chem>C1CCN(C1)C(=O)N2C3=NC=CC=C3N=N2</chem>
128	<chem>C1CCN(C1)C(=O)N2C3=NC=CC=C3N=N2COc4ccccc4</chem>
129	<chem>C1CCN(C1)C(=O)N2C3=NC=CC=C3N=N2CCCCc4ccccc4</chem>
130	<chem>C1CCN(C1)C(=O)N2C3=NC=CC=C3N=N2CCc4ccc(F)cc4</chem>
131	<chem>C1CCN(C1)C(=O)N2C3=NC=CC=C3N=N2Cc4c5ccccc5ccc4</chem>
132	 <chem>C1CCN(C1)C(=O)N2C3=NC=CC=C3N=N2C(=O)N4CCN(C4)Oc5ccc(cc5)Oc6cc7c(cc6)nn[nH]7C</chem> HCl

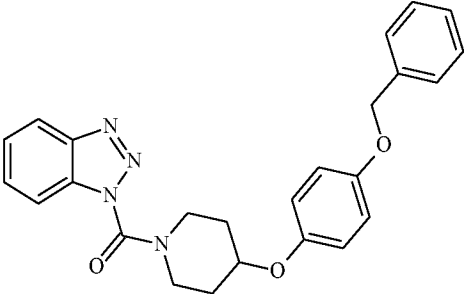
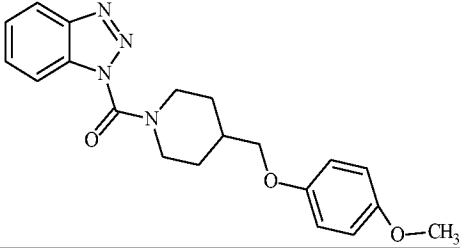
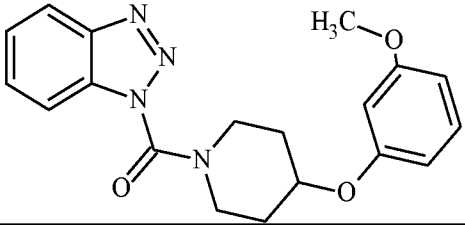
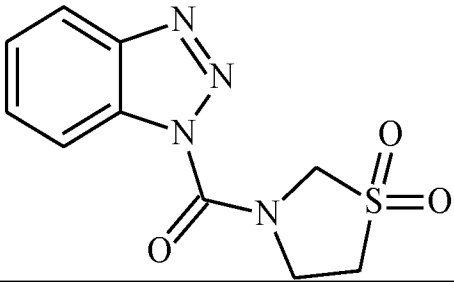
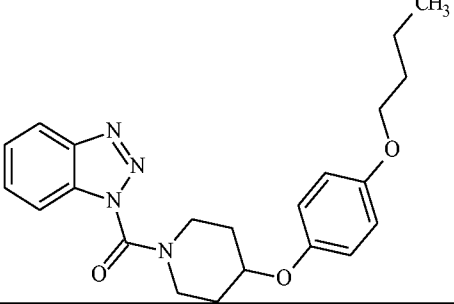
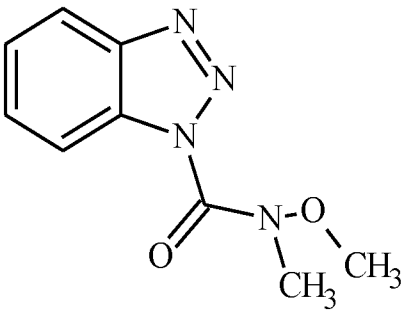
No.	Формула
133	
134	
135	
136	
137	
138	
139	

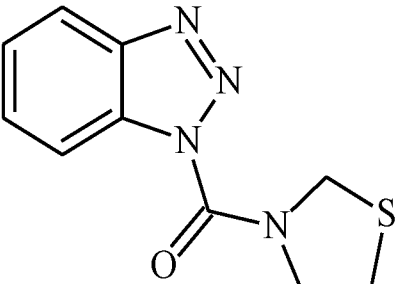
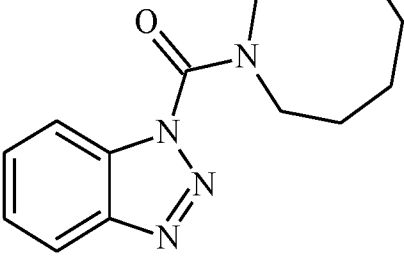
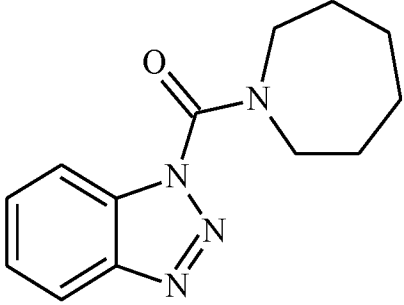
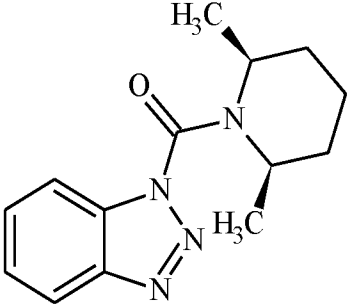
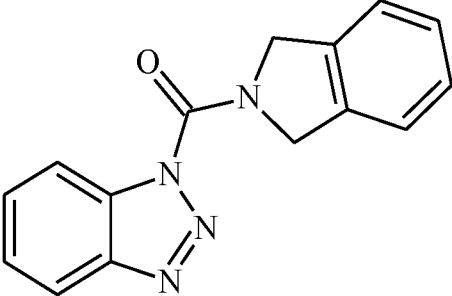
No.	Формула
140	
141	
142	
143	
144	
145	
146	

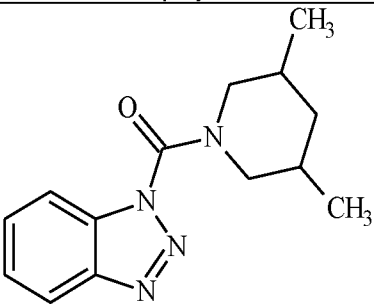
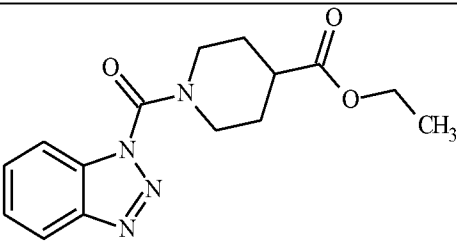
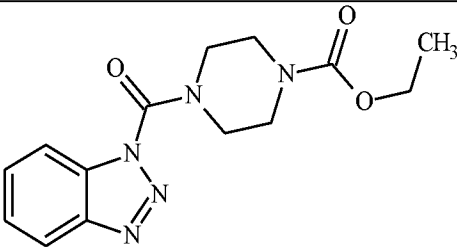
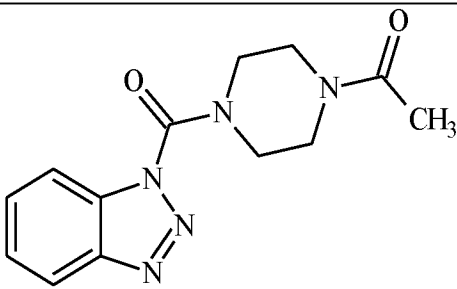
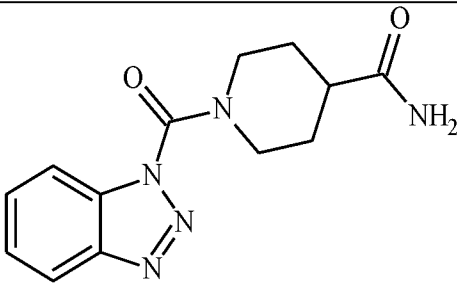
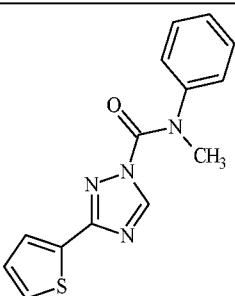
No.	Формула
147	
148	
149	
150	
151	
152	

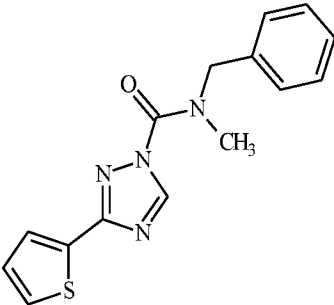
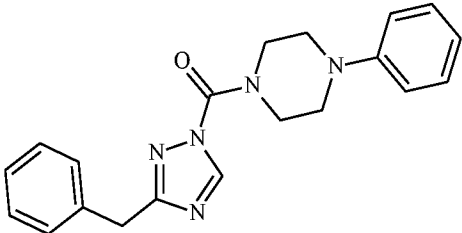
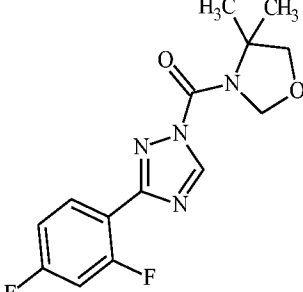
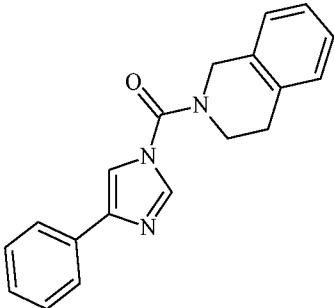
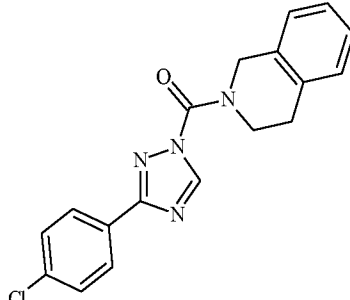
No.	Формула
153	
154	
155	
156	
157	
158	

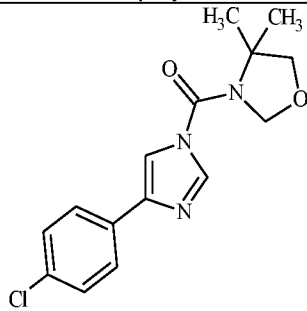
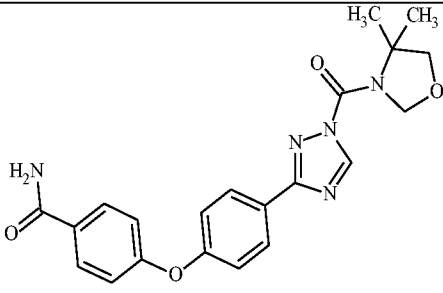
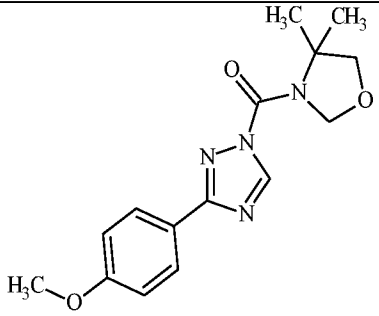
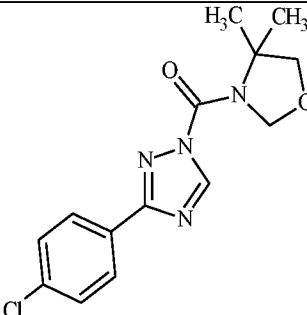
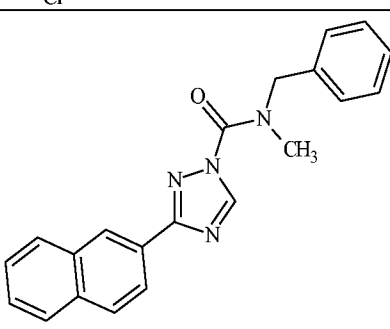
No.	Формула
159	
160	
161	
162	
163	

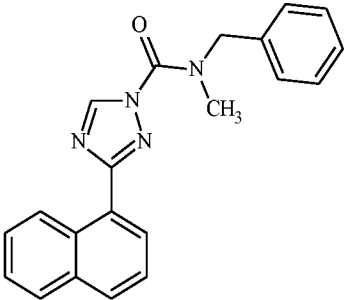
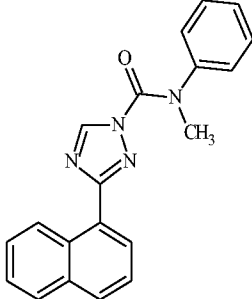
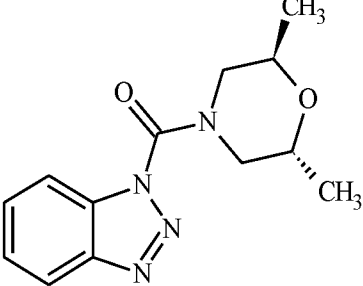
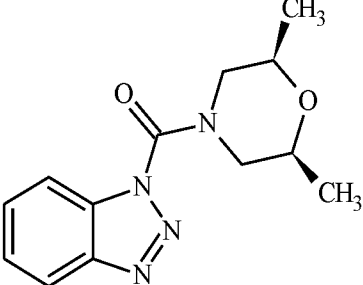
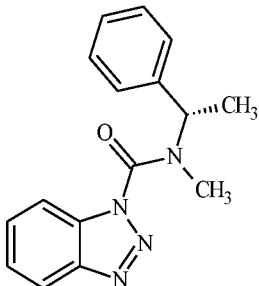
No.	Формула
164	 <chem>O=C(N1CCN(C1)Oc2ccc(OCC3=CC=CC=C3)cc2)c4nc5ccccc5n4</chem>
165	 <chem>COc1ccc(OCC2CCN(C2)C(=O)N3C4=CC=CC=C4N=N3)cc1</chem>
166	 <chem>COc1cccc(Oc2ccccc2C(=O)N3CCN(C3)N4C5=CC=CC=C5N=N4)c1</chem>
167	 <chem>O=C(N1CCN(C1)c2nc3ccccc3n2)c4nc5ccccc5n4S(=O)(=O)C6CCN6</chem>
168	 <chem>CCCCOc1ccc(Oc2ccccc2C(=O)N3CCN(C3)N4C5=CC=CC=C5N=N4)cc1</chem>
169	 <chem>COC1OC(N1C(=O)N2C3=CC=CC=C3N=N2)c4nc5ccccc5n4</chem>

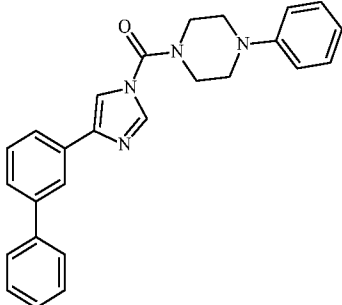
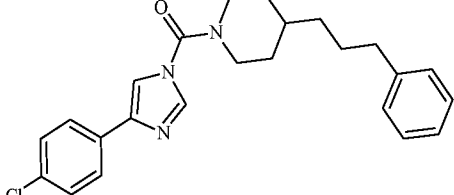
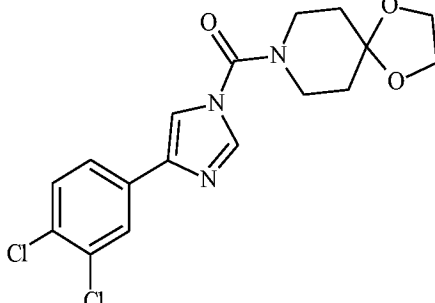
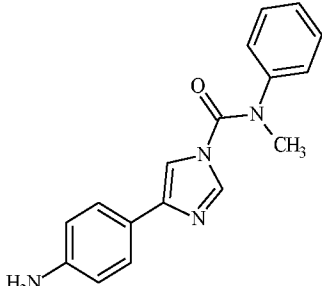
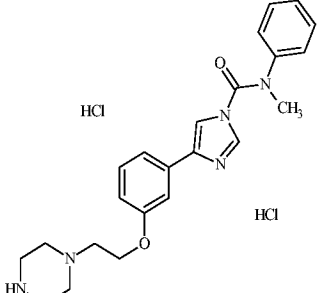
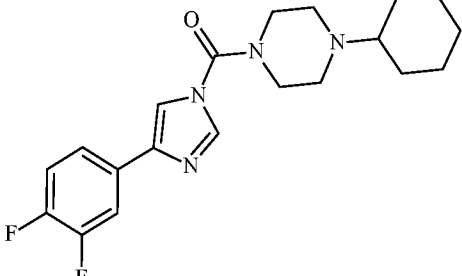
No.	Формула
170	
171	
172	
173	
174	

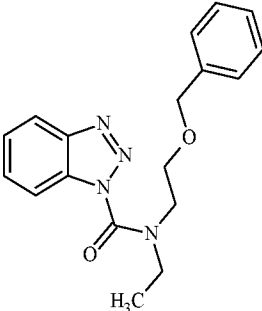
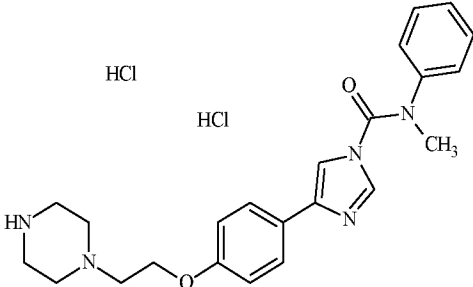
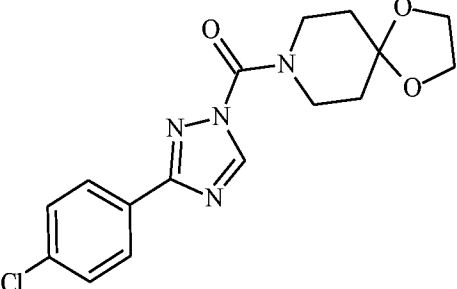
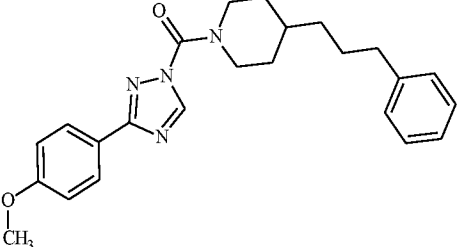
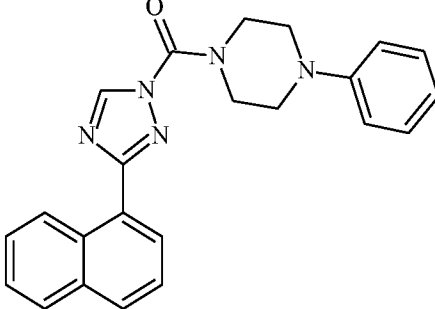
No.	Формула
175	
176	
177	
178	
179	
180	

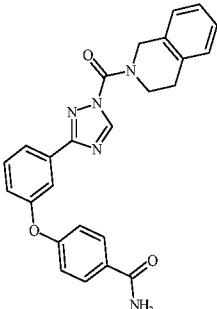
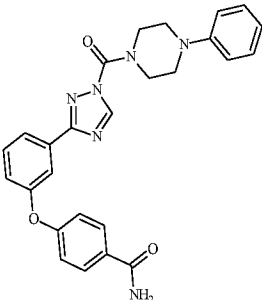
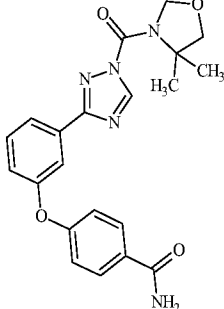
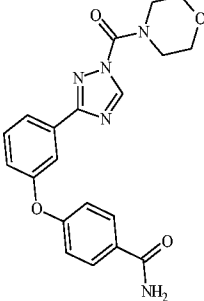
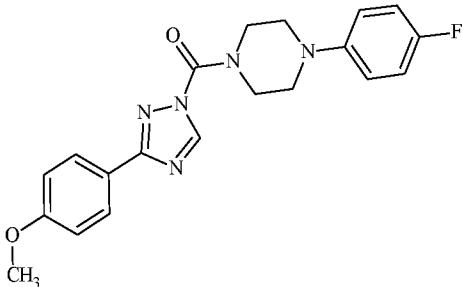
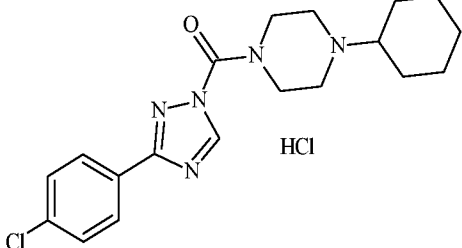
No.	Формула
181	
182	
183	
184	
185	

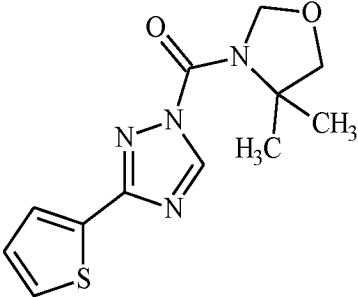
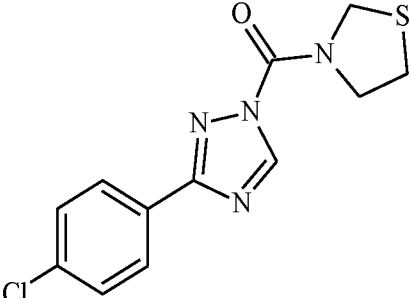
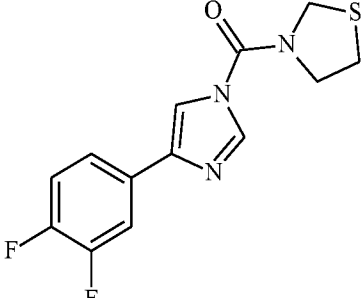
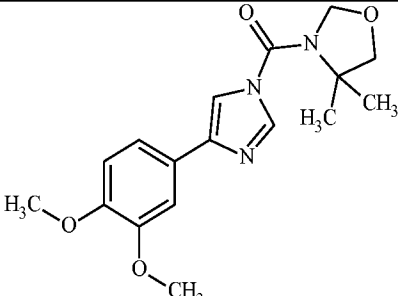
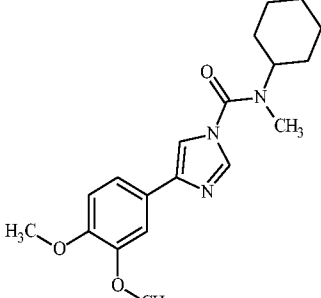
No.	Формула
186	
187	
188	
189	
190	

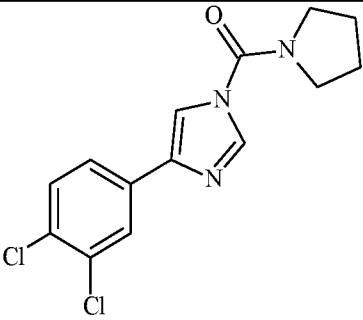
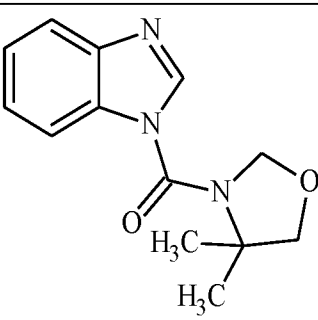
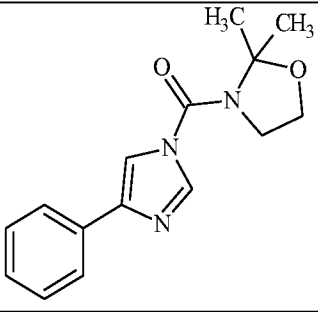
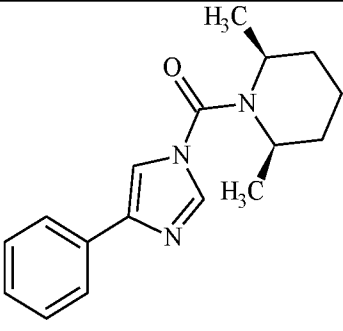
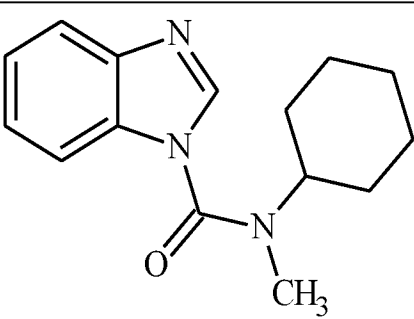
No.	Формула
191	
192	
193	
194	
195	

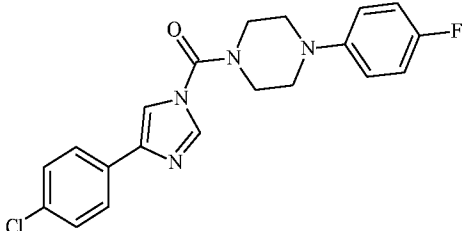
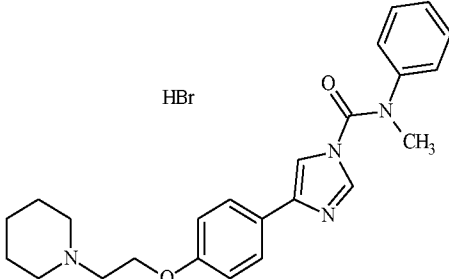
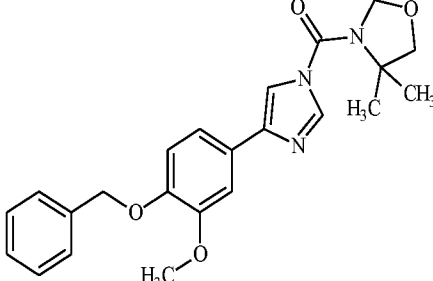
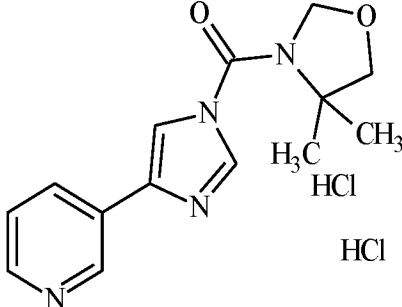
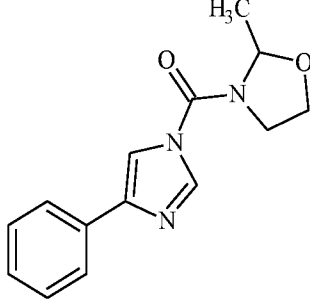
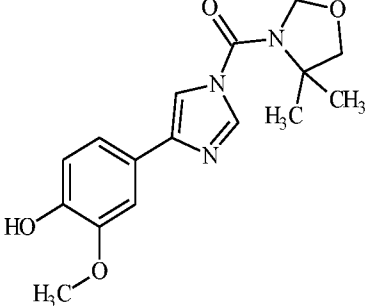
No.	Формула
196	
197	
198	
199	
200	
201	

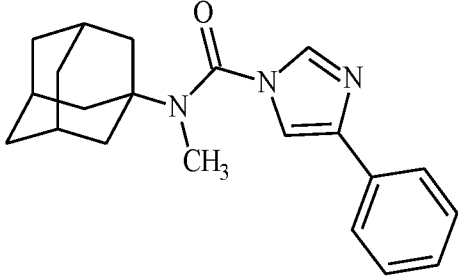
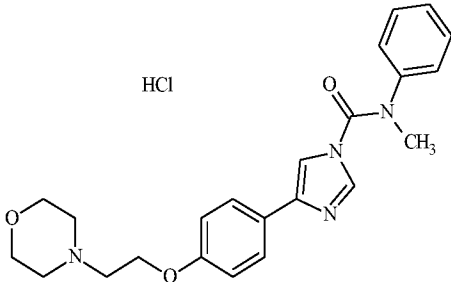
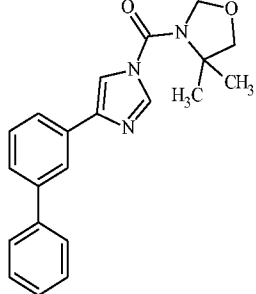
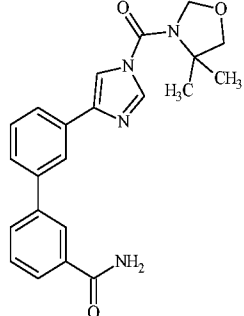
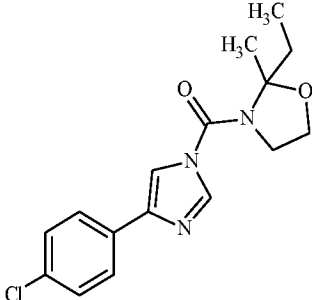
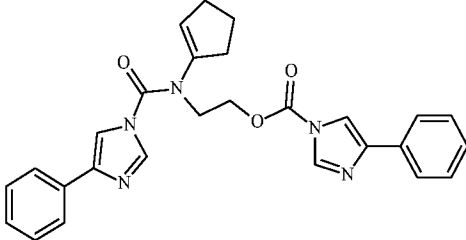
No.	Формула
202	
203	
204	
205	
206	

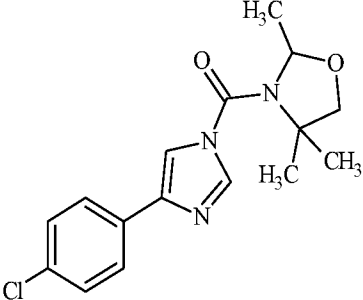
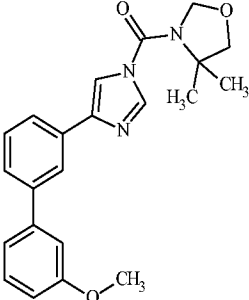
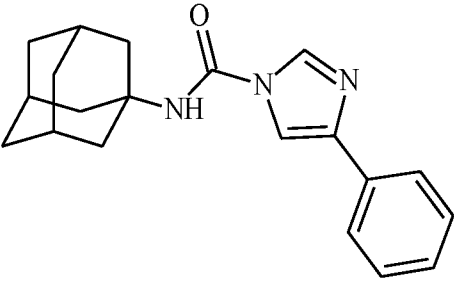
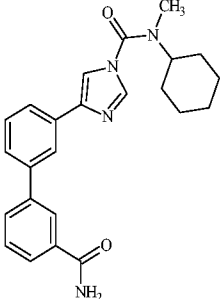
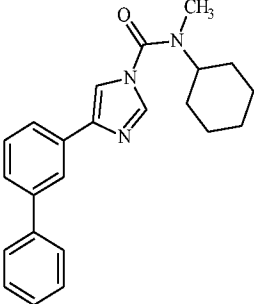
No.	Формула
207	
208	
209	
210	
211	
212	

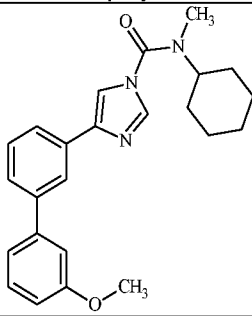
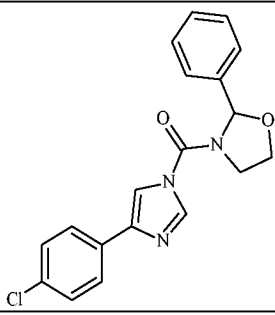
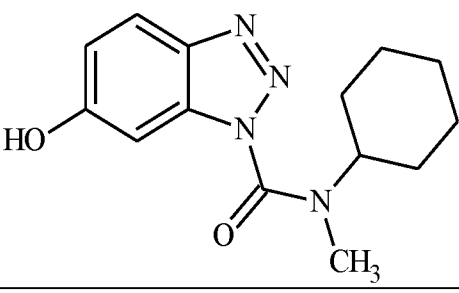
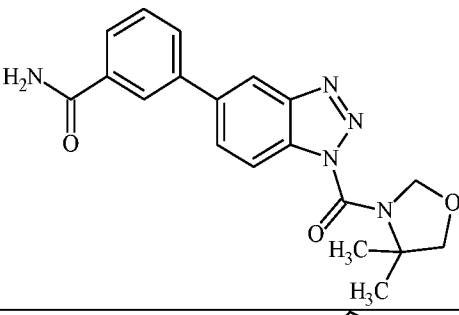
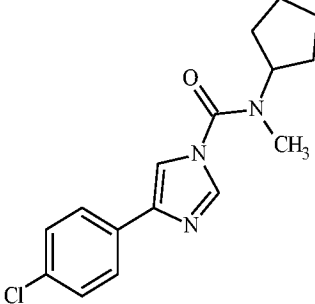
No.	Формула
213	
214	
215	
216	
217	

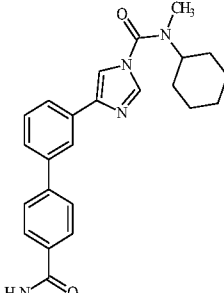
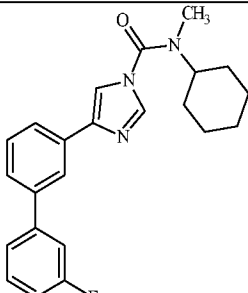
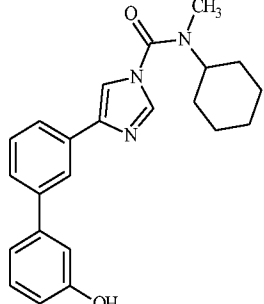
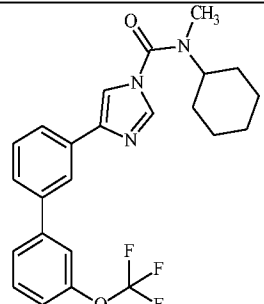
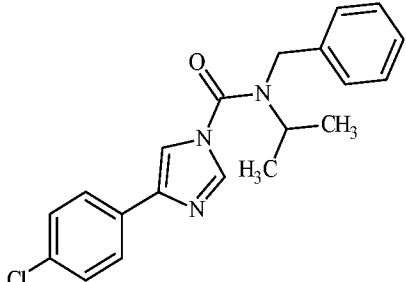
No.	Формула
218	
219	
220	
221	
222	

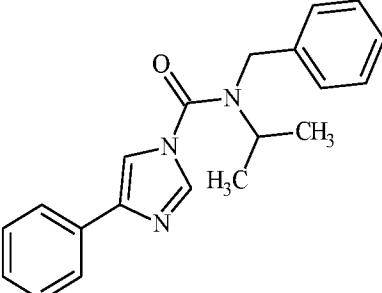
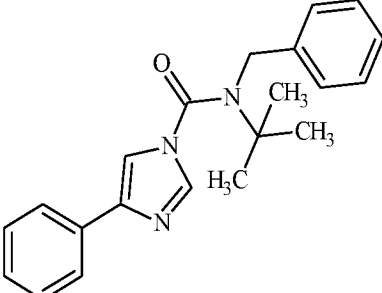
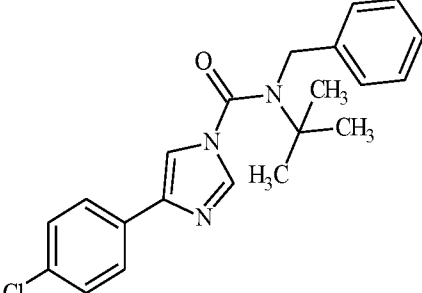
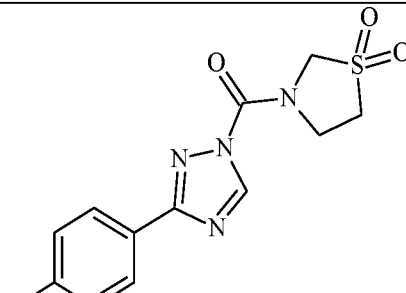
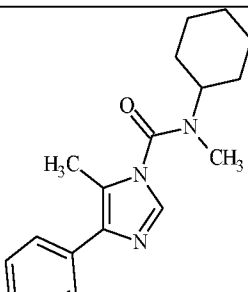
No.	Формула
223	
224	
225	
226	
227	
228	

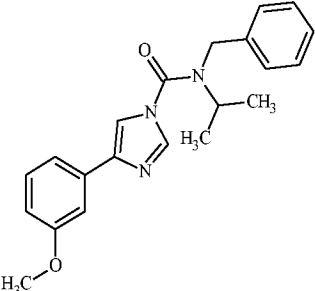
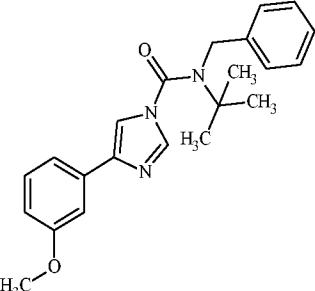
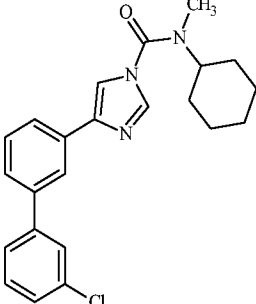
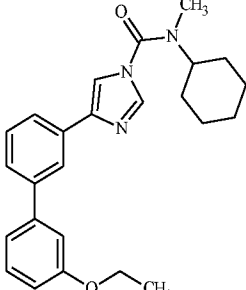
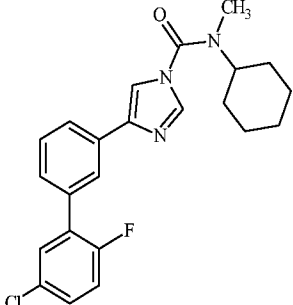
No.	Формула
229	
230	 HCl
231	
232	
233	
234	

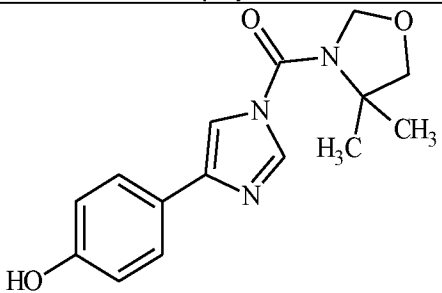
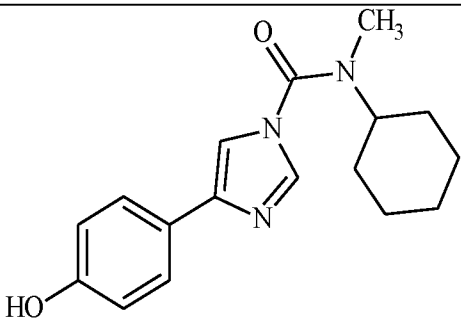
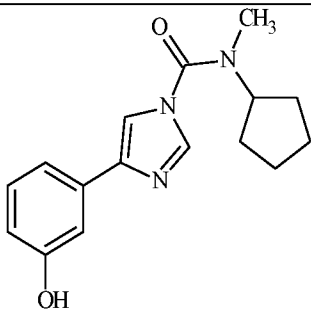
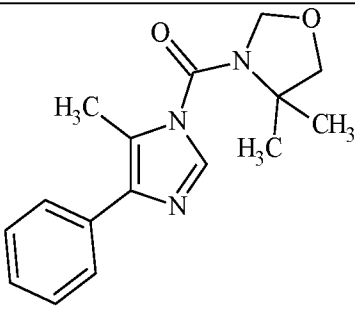
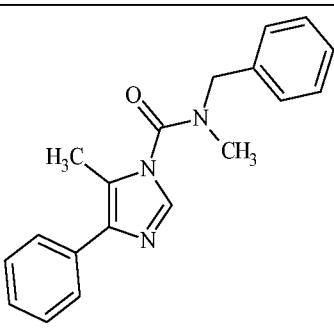
No.	Формула
235	
236	
237	
238	
239	

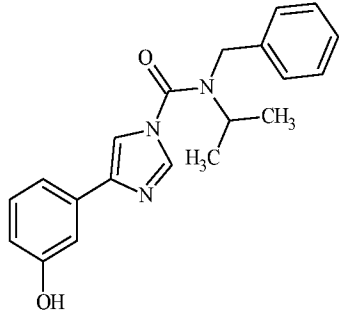
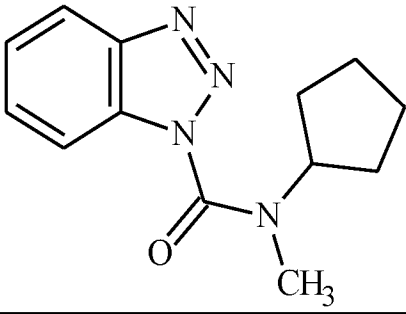
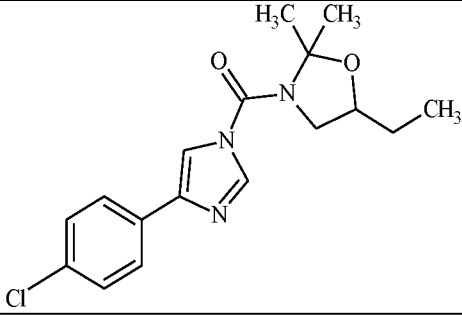
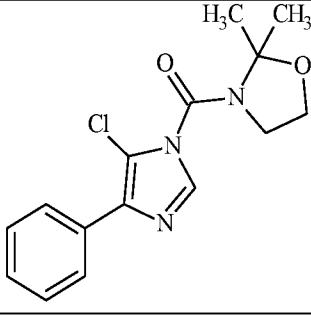
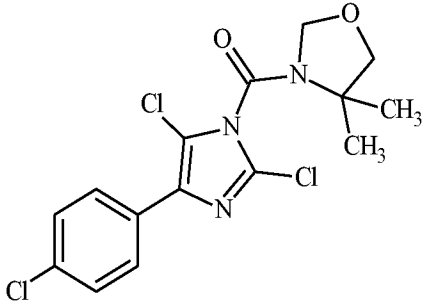
No.	Формула
240	
241	
242	
243	
244	

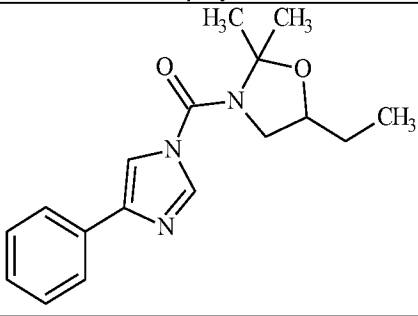
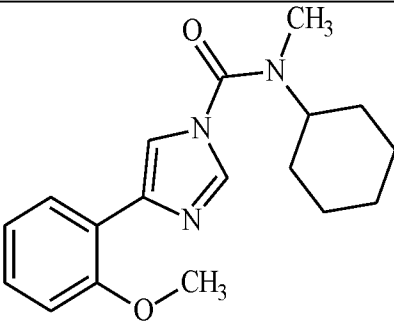
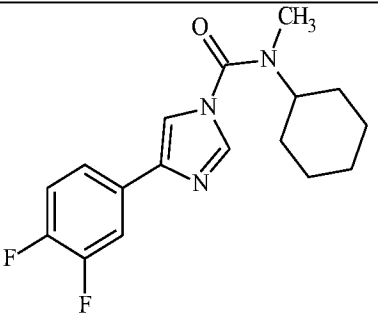
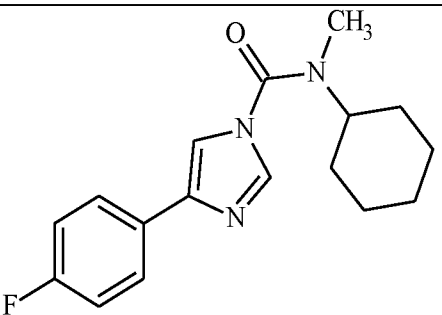
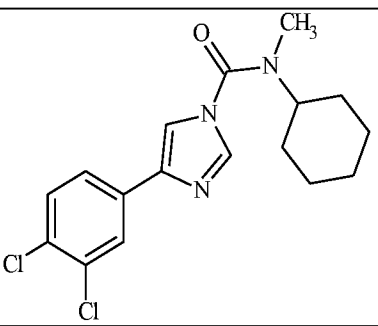
No.	Формула
245	
246	
247	
248	
249	

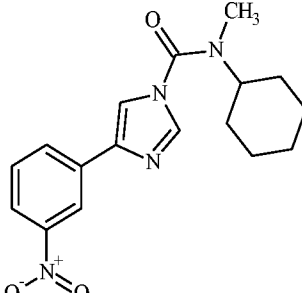
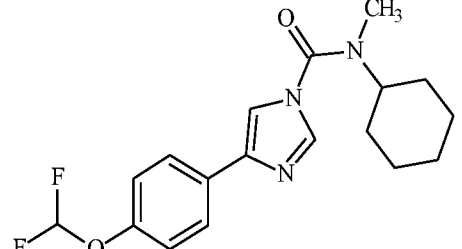
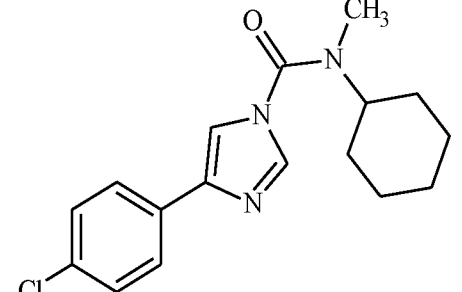
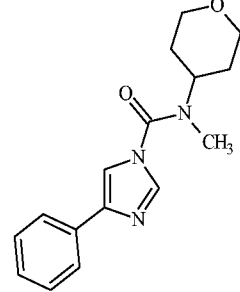
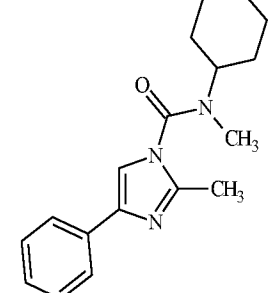
No.	Формула
250	
251	
252	
253	
254	

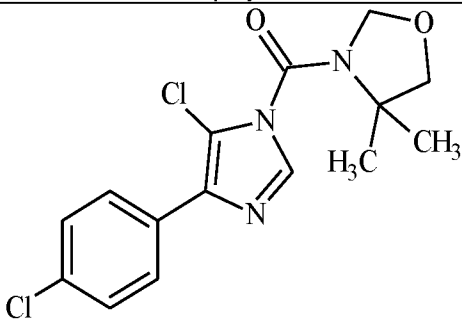
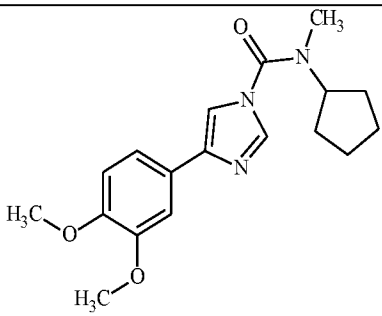
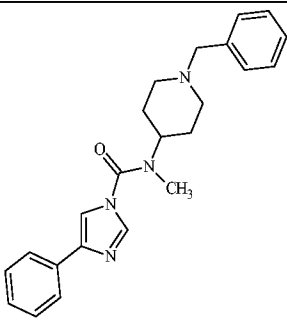
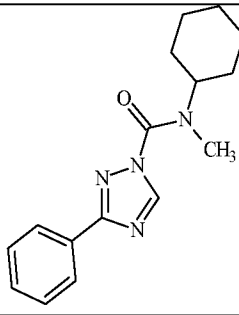
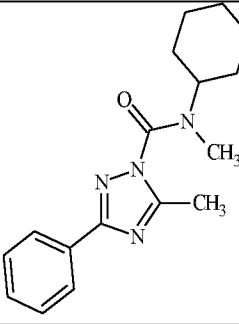
No.	Формула
255	
256	
257	
258	
259	

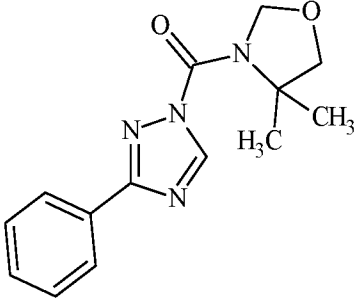
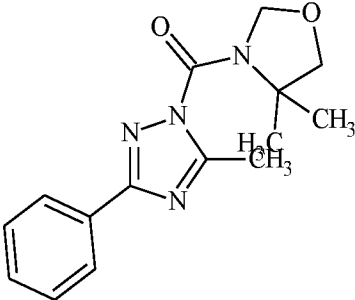
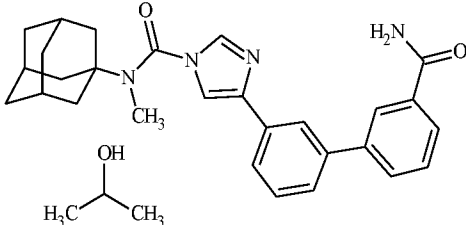
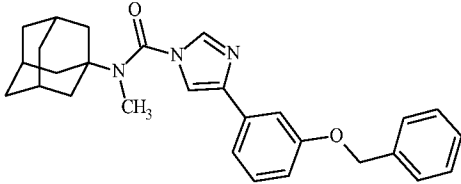
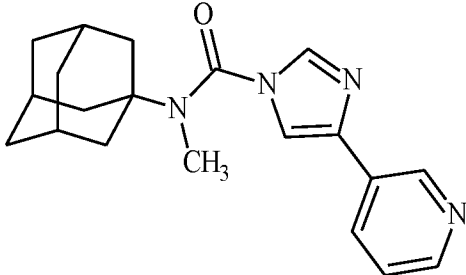
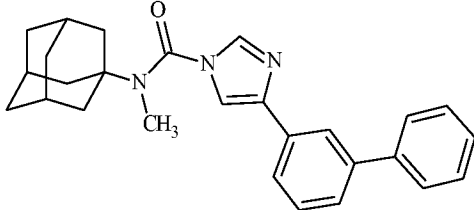
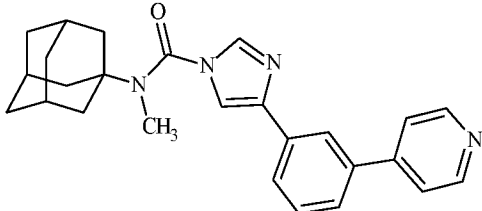
No.	Формула
260	 <chem>CC1(C)OCCN1C(=O)c2cc(Cc3ccc(O)cc3)nn2</chem>
261	 <chem>CC1(CCCCC1)N(C)C(=O)c2cc(Cc3ccc(O)cc3)nn2</chem>
262	 <chem>CC1(CCCC1)N(C)C(=O)c2cc(Cc3cc(O)ccc3)nn2</chem>
263	 <chem>CC1(C)OCCN1C(=O)c2cc(Cc3ccccc3)c(C)n2</chem>
264	 <chem>CN(C)Cc1ccccc1C(=O)c2cc(Cc3ccccc3)c(C)n2</chem>

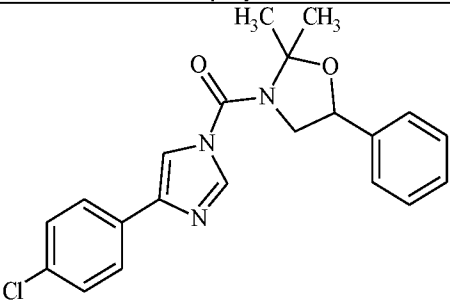
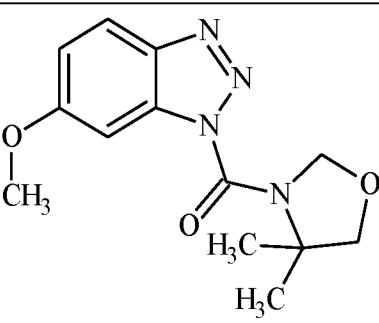
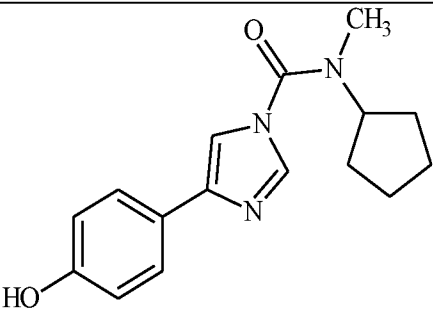
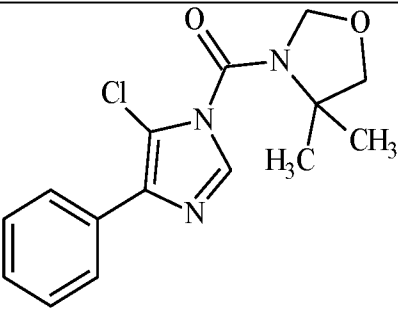
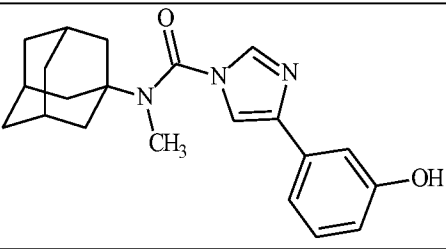
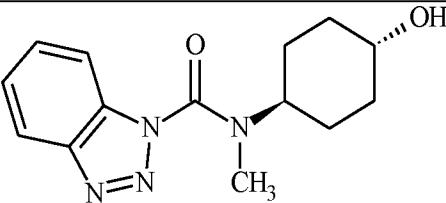
No.	Формула
265	
266	
267	
268	
269	

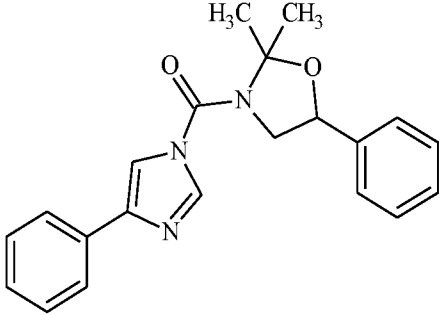
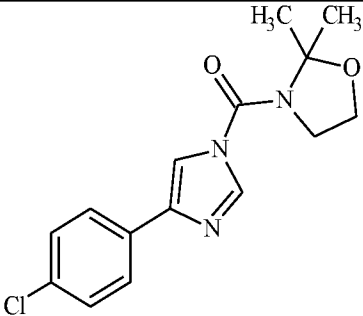
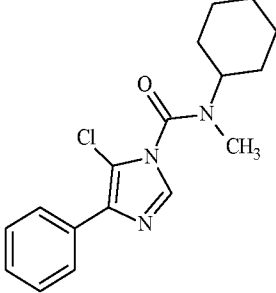
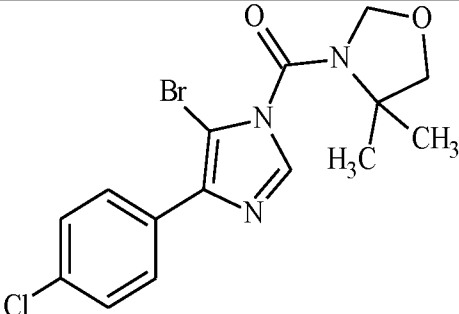
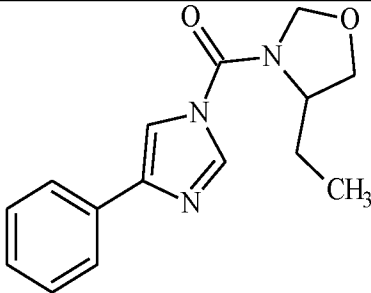
No.	Формула
270	
271	
272	
273	
274	

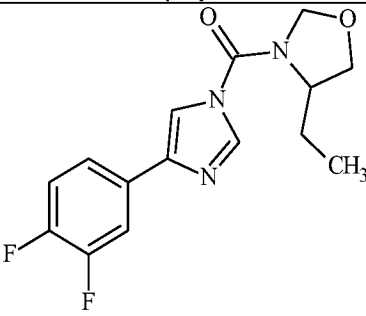
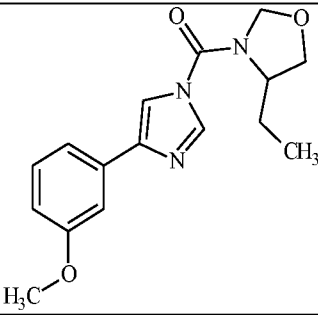
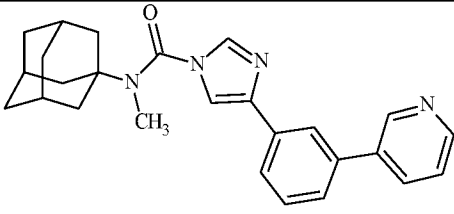
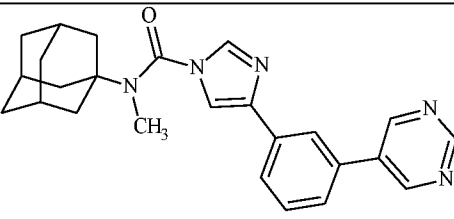
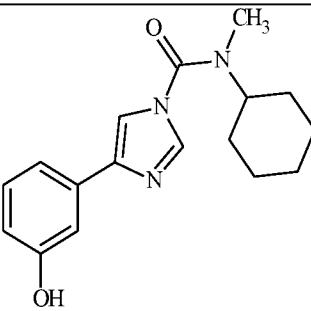
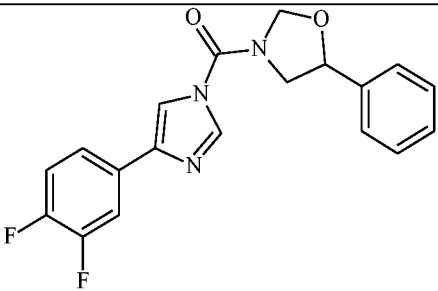
No.	Формула
275	 <chem>CN(C1CCCCC1)C(=O)c2nc(C3=CC=C(C=C3)[N+](=O)[O-])cn2</chem>
276	 <chem>CN(C1CCCCC1)C(=O)c2nc(C3=CC=C(C=C3)OCC(F)F)cn2</chem>
277	 <chem>CN(C1CCCCC1)C(=O)c2nc(C3=CC=C(C=C3)Cl)cn2</chem>
278	 <chem>CN(C1OCCCCO1)C(=O)c2nc(C3=CC=CC=C3)cn2</chem>
279	 <chem>CN(C1CCCCC1)C(=O)c2nc(C3=CC=CC=C3)n(C)c3ncn3</chem>

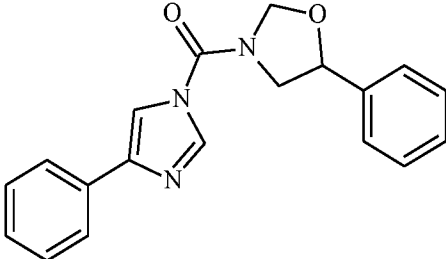
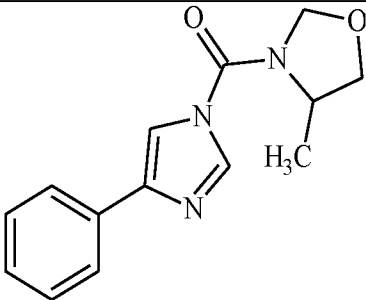
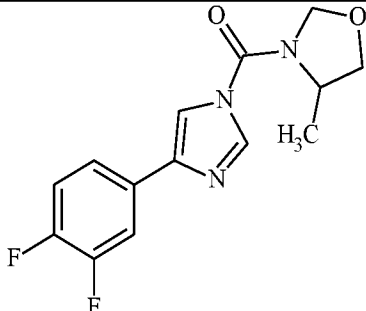
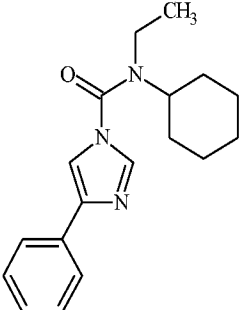
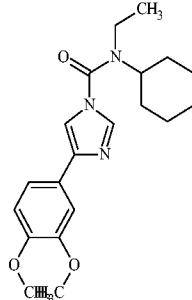
No.	Формула
280	
281	
282	
283	
284	

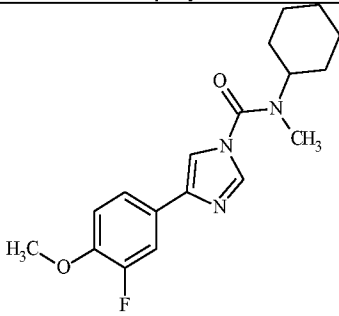
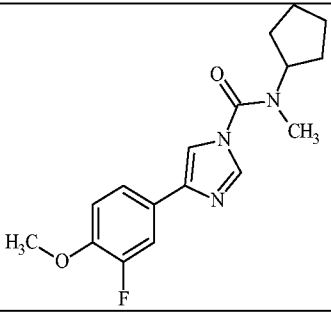
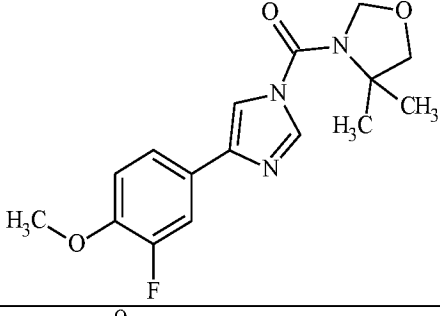
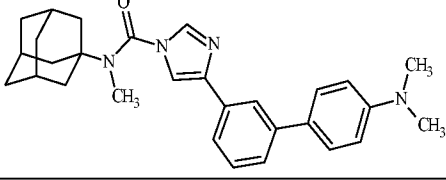
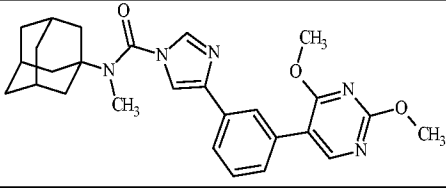
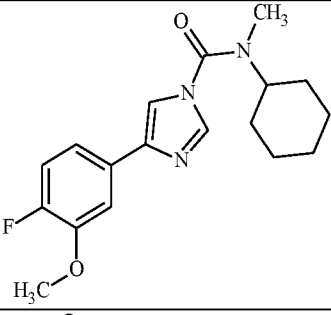
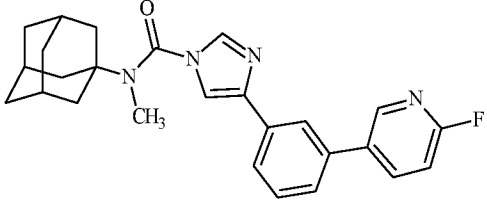
No.	Формула
285	
286	
287	
288	
289	
290	
291	

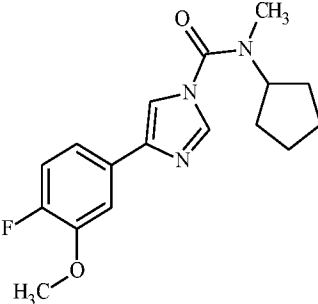
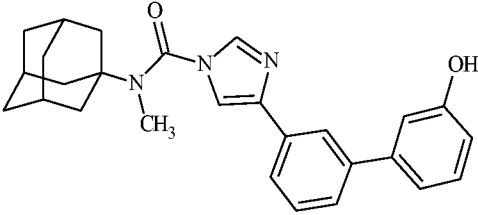
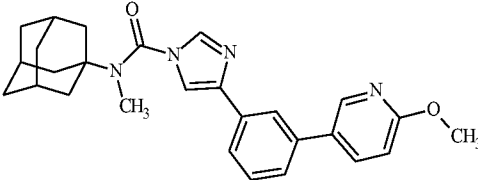
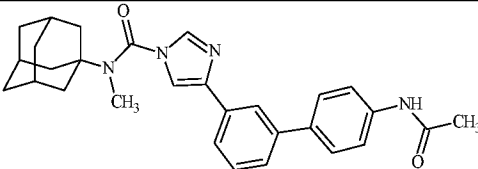
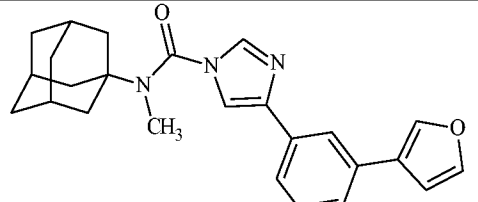
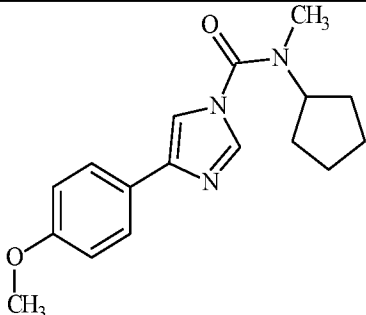
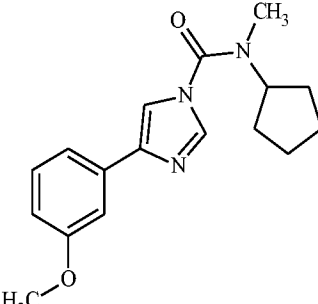
No.	Формула
292	
293	
294	
295	
296	
297	

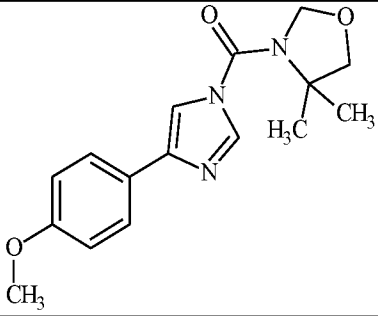
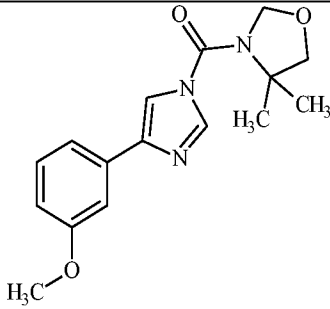
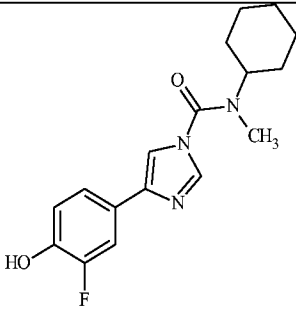
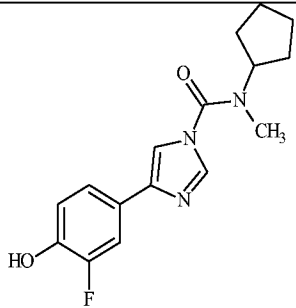
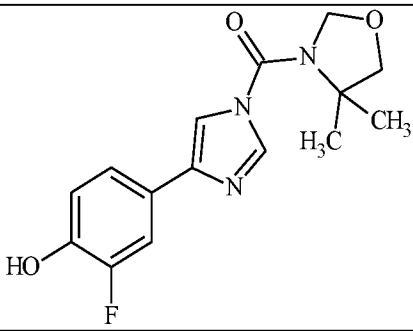
No.	Формула
298	
299	
300	
301	
302	

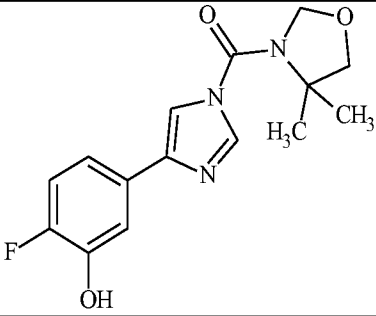
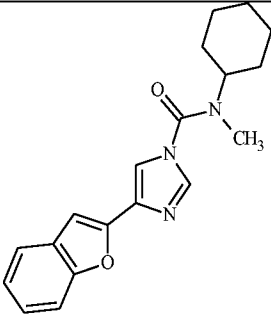
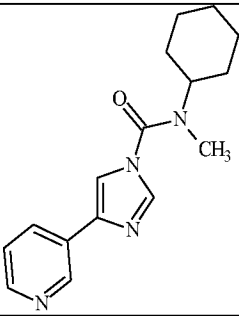
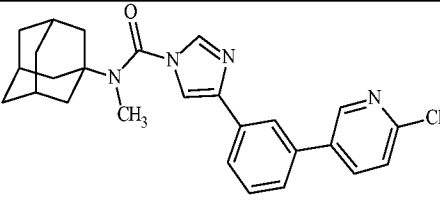
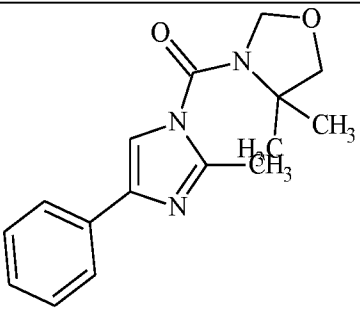
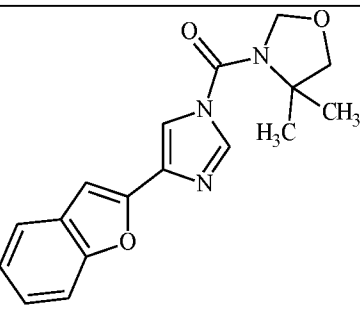
No.	Формула
303	
304	
305	
306	
307	
308	

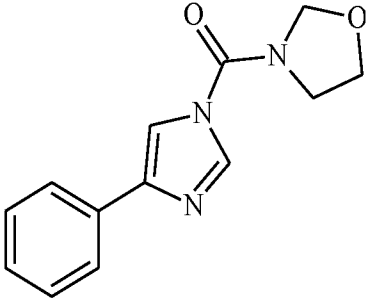
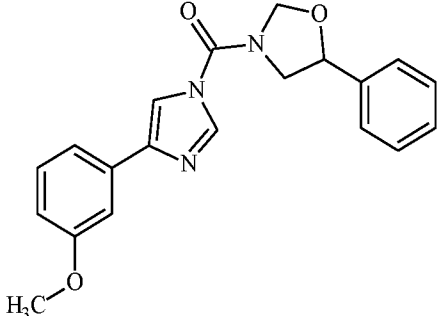
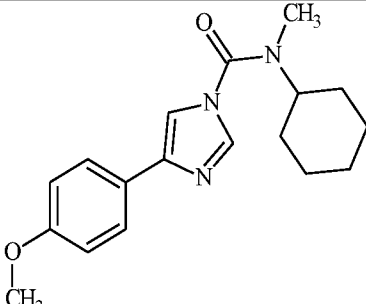
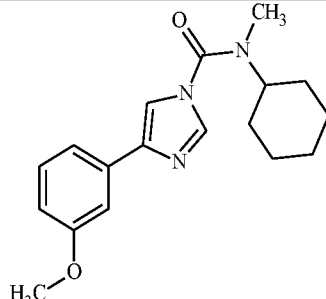
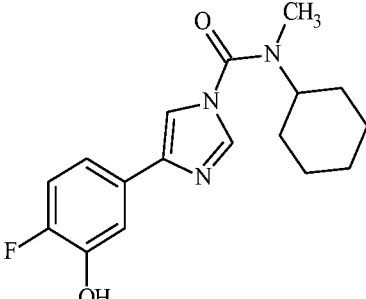
No.	Формула
309	
310	
311	
312	
313	

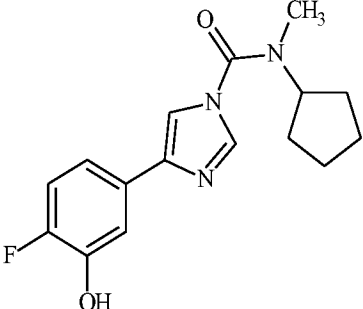
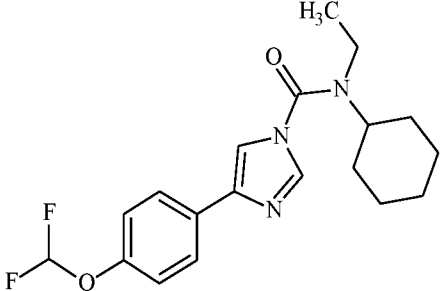
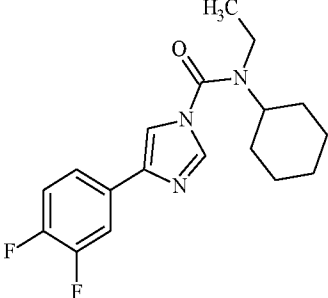
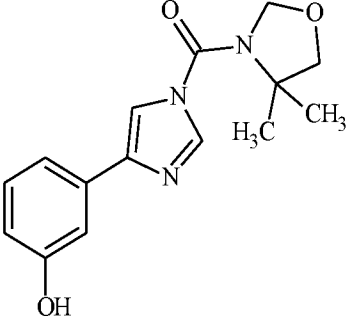
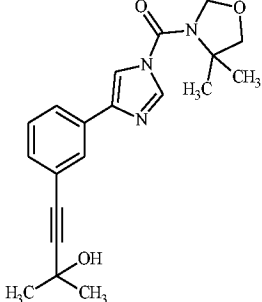
No.	Формула
314	
315	
316	
317	
318	
319	
320	

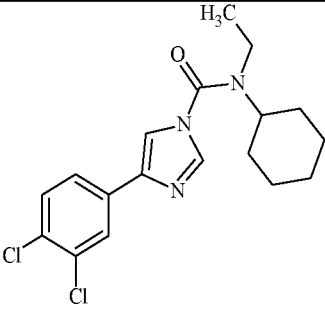
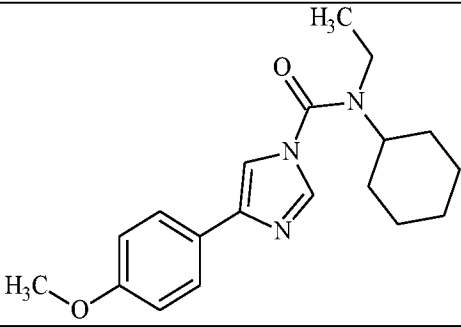
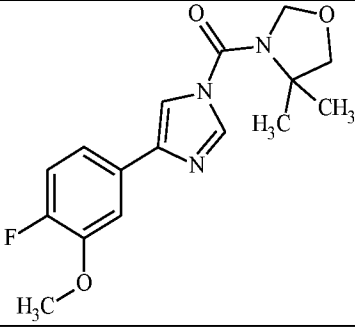
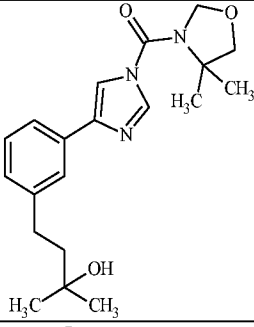
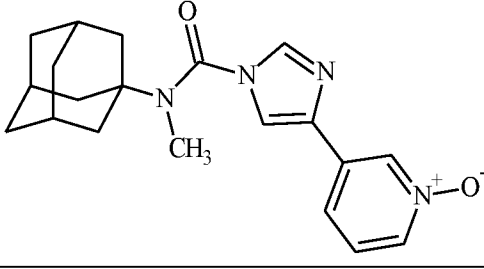
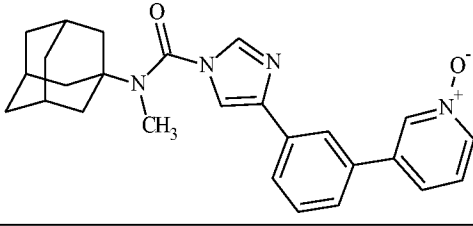
No.	Формула
321	
322	
323	
324	
325	
326	
327	

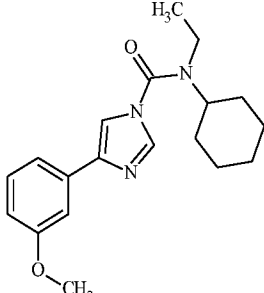
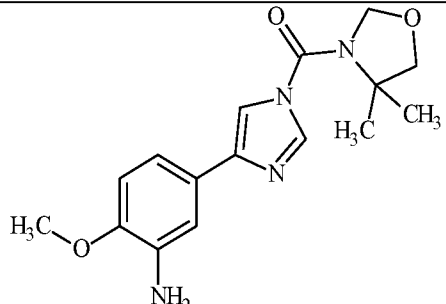
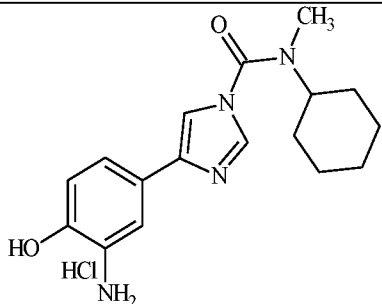
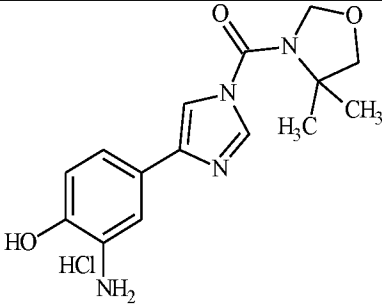
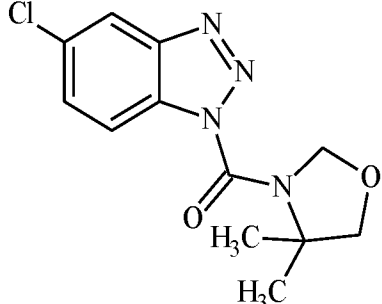
No.	Формула
328	
329	
330	
331	
332	

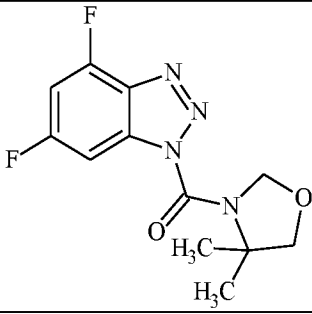
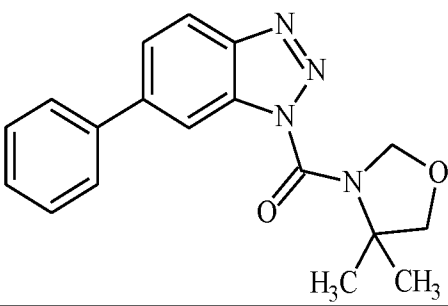
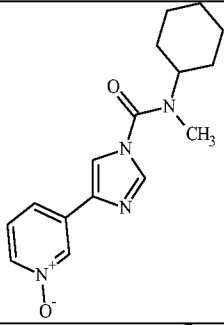
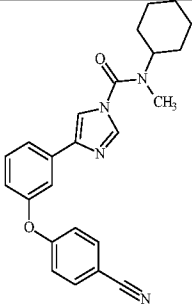
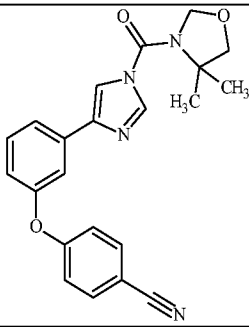
No.	Формула
333	
334	
335	
336	
337	
338	

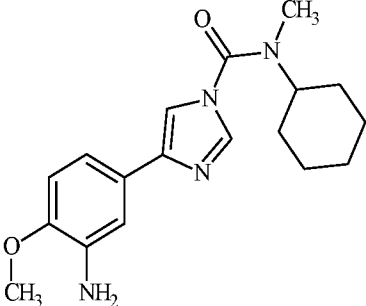
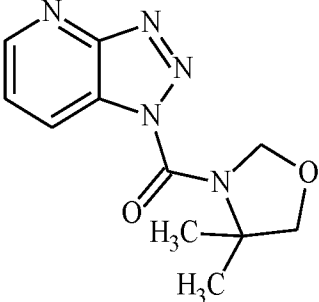
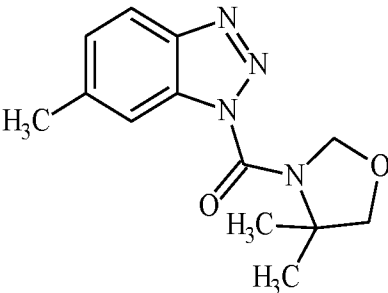
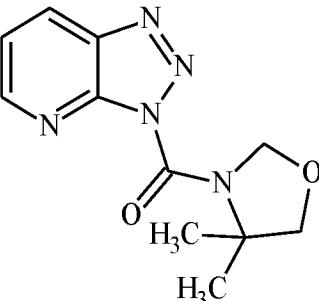
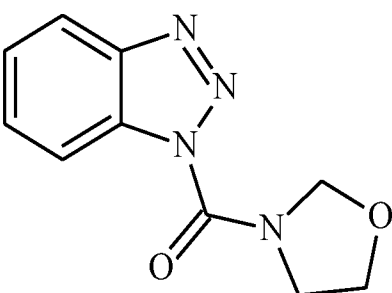
No.	Формула
339	
340	
341	
342	
343	

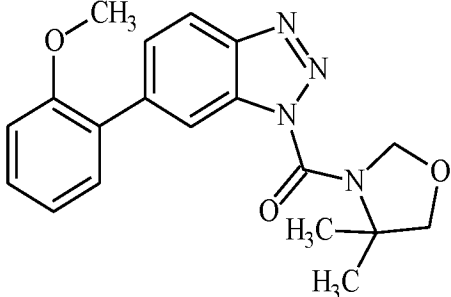
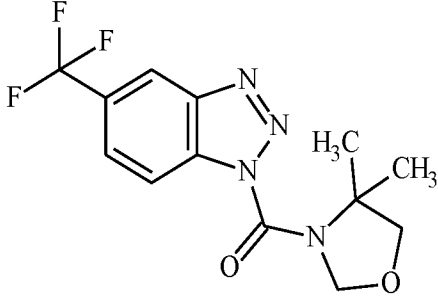
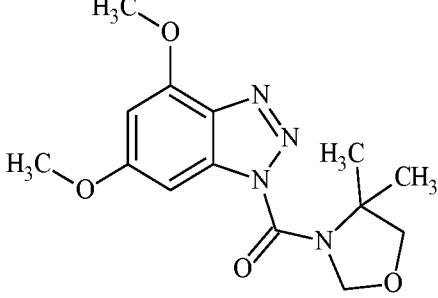
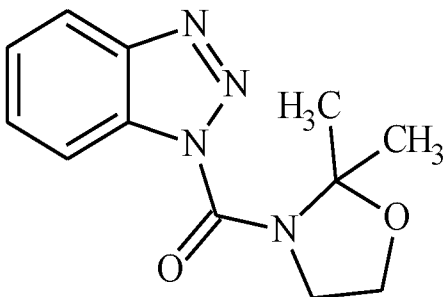
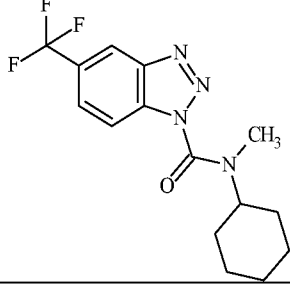
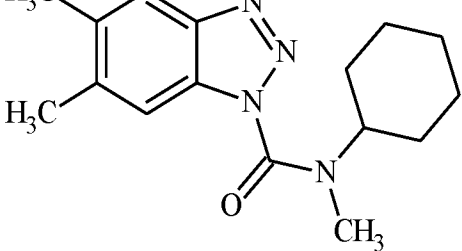
No.	Формула
344	
345	
346	
347	
348	

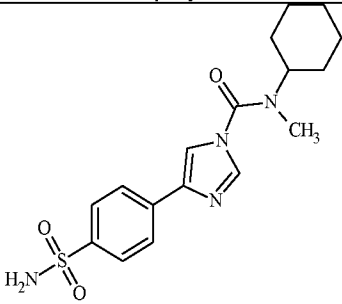
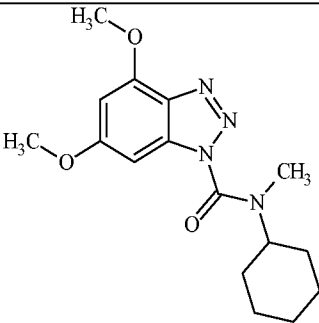
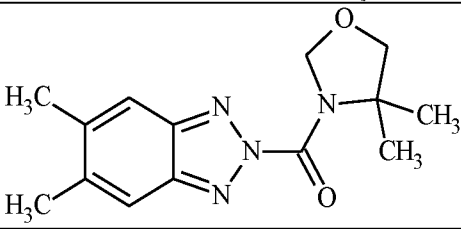
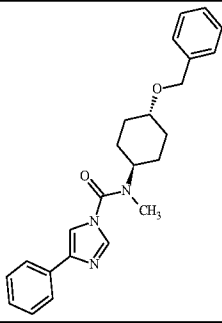
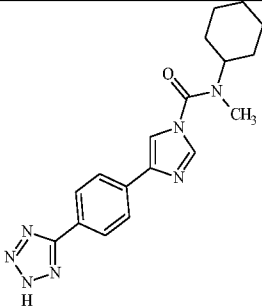
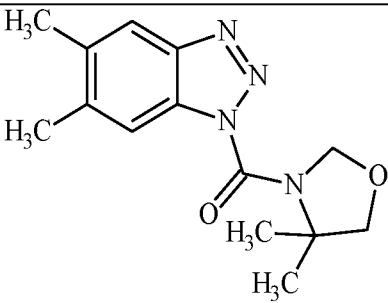
No.	Формула
349	
350	
351	
352	
353	
354	

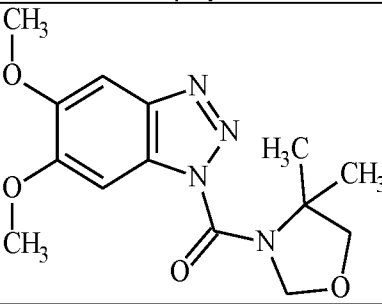
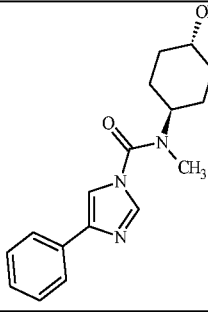
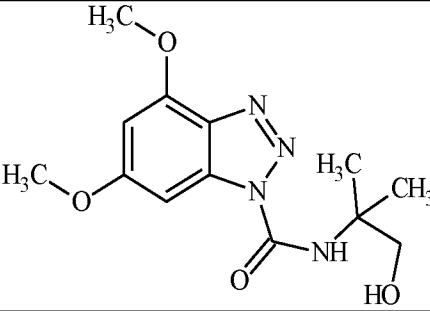
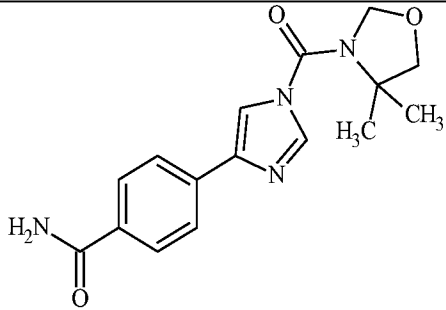
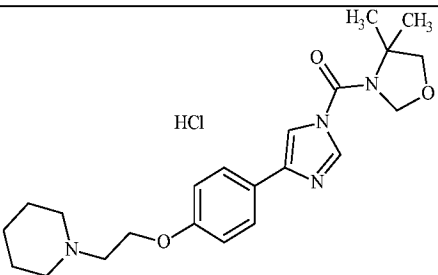
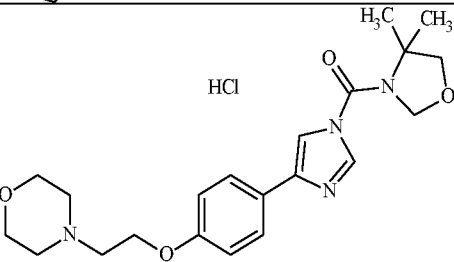
No.	Формула
355	
356	
357	
358	
359	

No.	Формула
360	
361	
362	
363	
364	

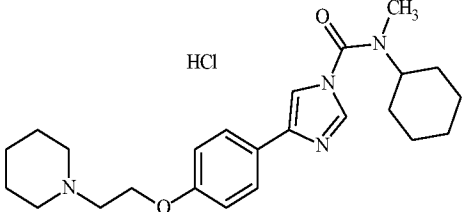
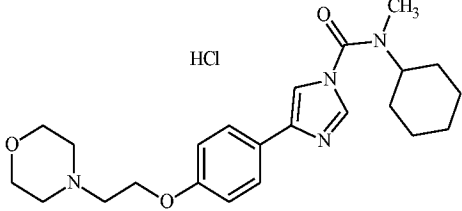
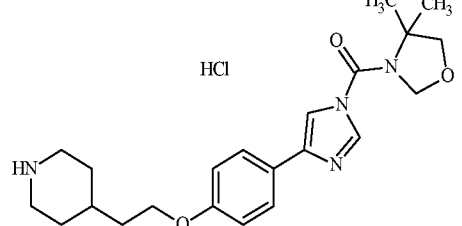
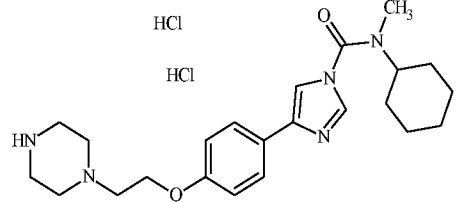
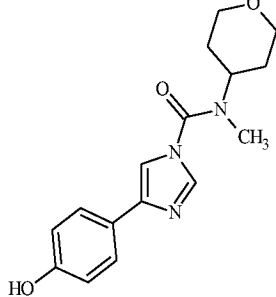
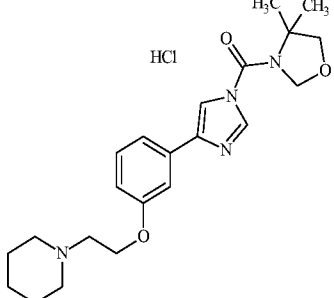
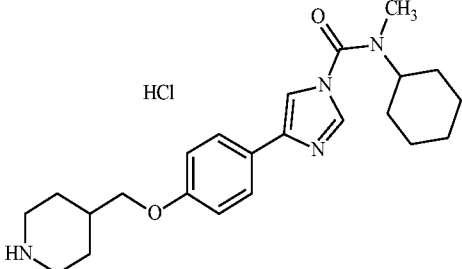
No.	Формула
365	
366	
367	
368	
369	

No.	Формула
370	
371	
372	
373	
374	
375	

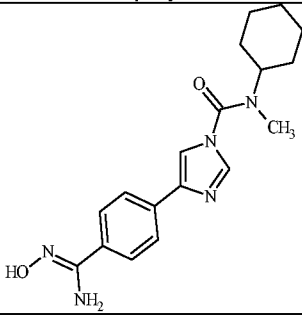
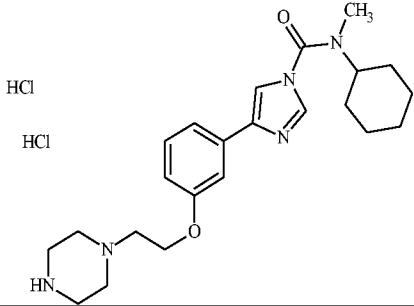
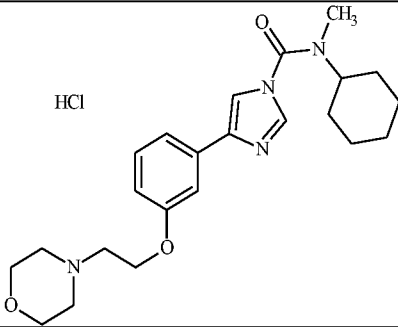
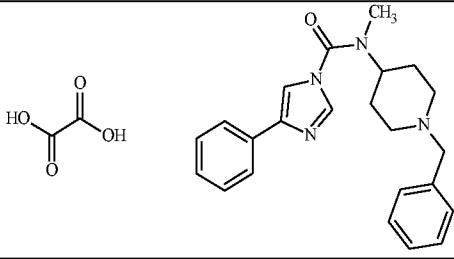
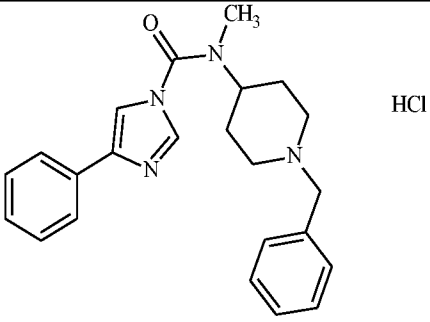
No.	Формула
376	
377	
378	
379	
380	
381	

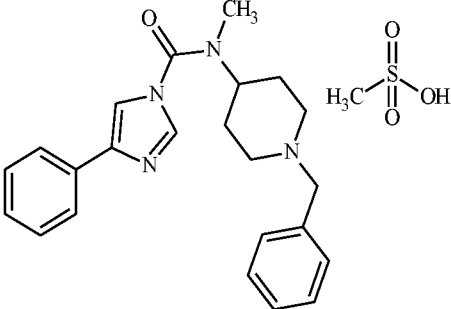
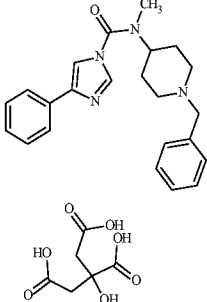
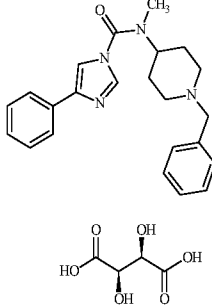
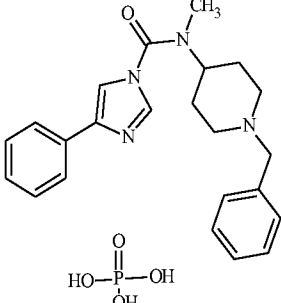
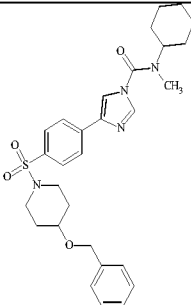
No.	Формула
382	
383	
384	
385	
386	
387	

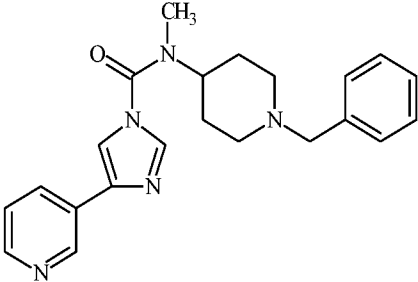
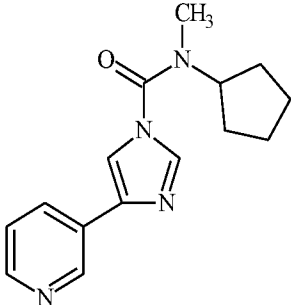
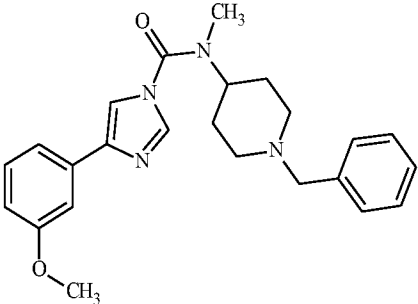
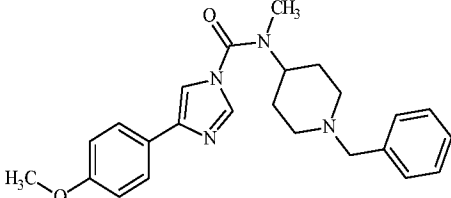
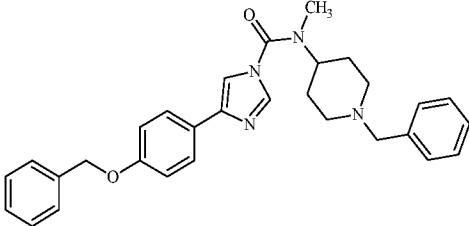
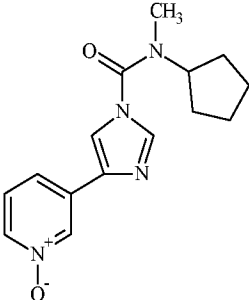
No.	Формула
388	
389	
390	
391	
392	
393	

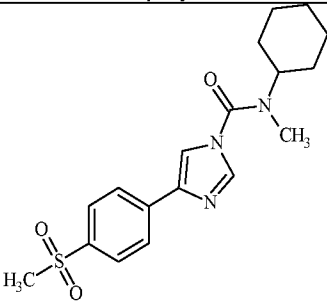
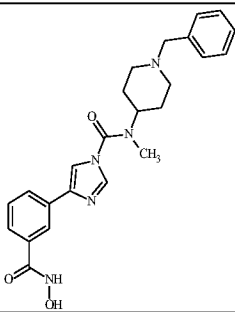
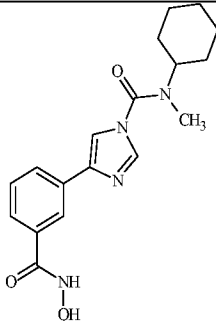
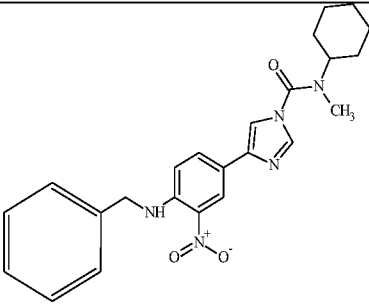
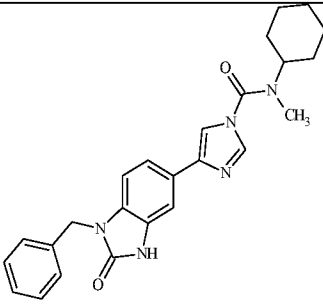
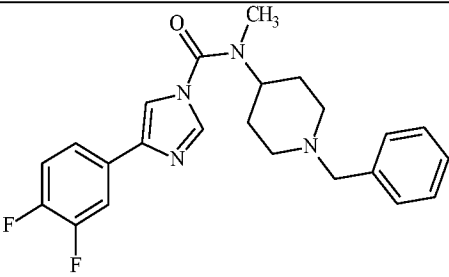
No.	Формула
394	
395	
396	
397	
398	
399	
400	

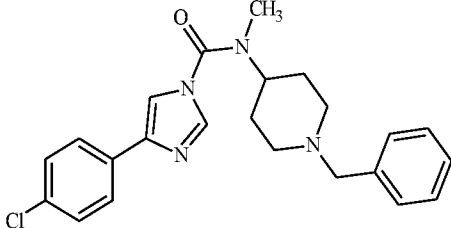
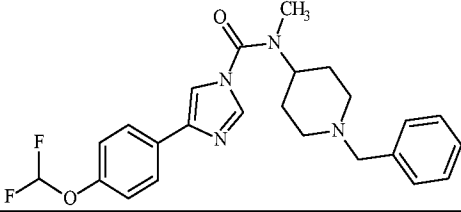
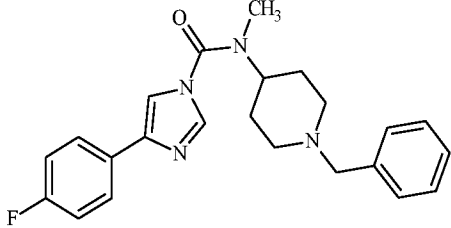
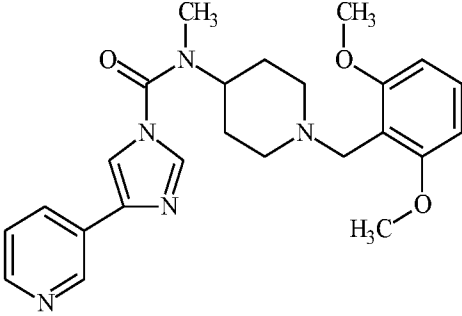
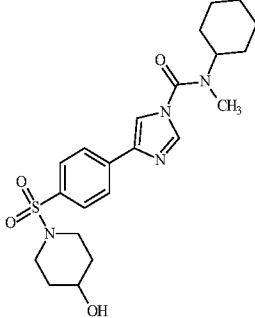
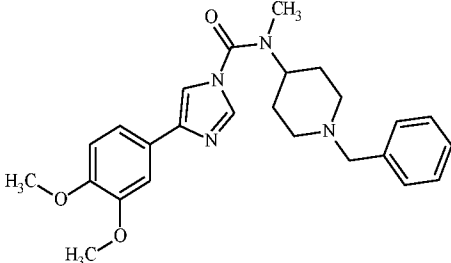
[illegible]

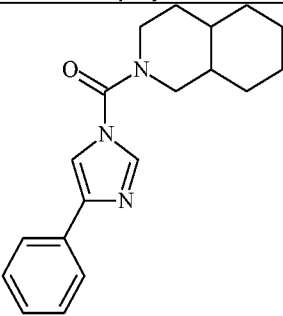
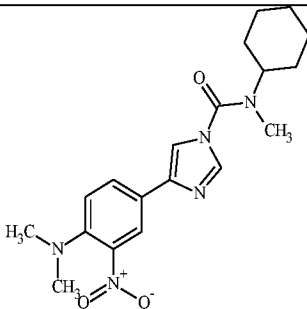
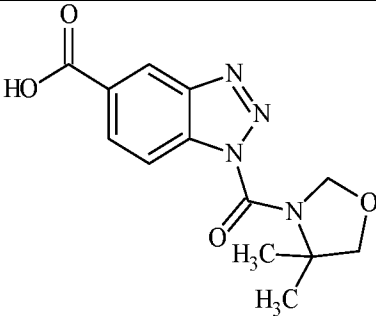
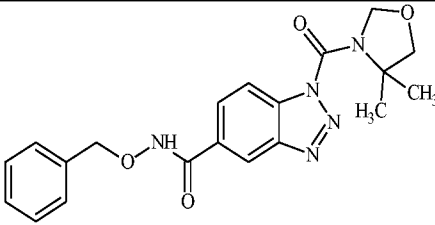
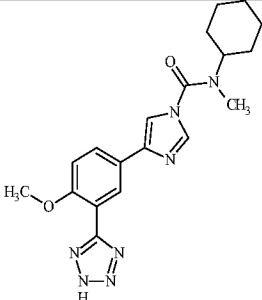
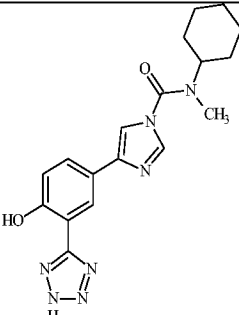
No.	Формула
406	
407	
408	
409	
410	

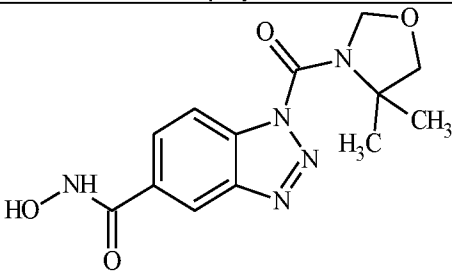
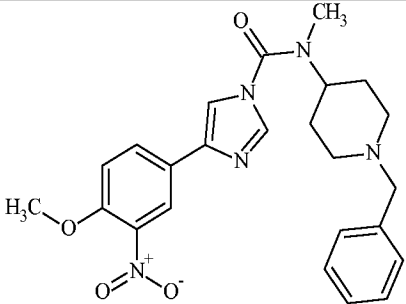
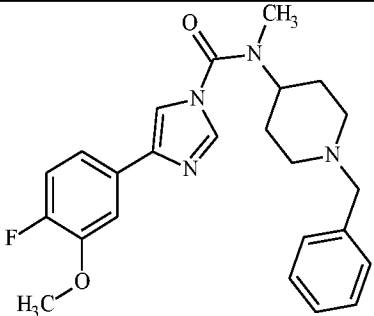
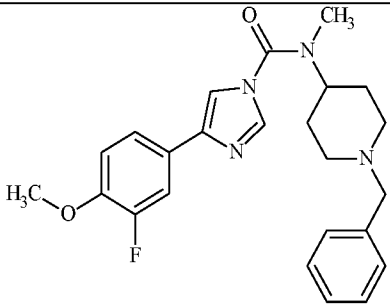
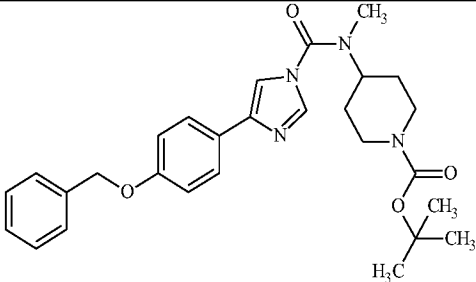
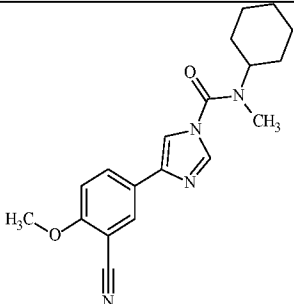
No.	Формула
411	
412	
413	
414	
415	

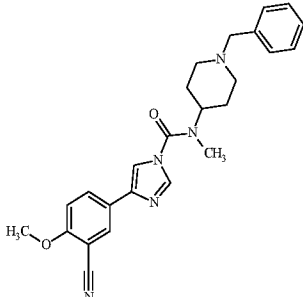
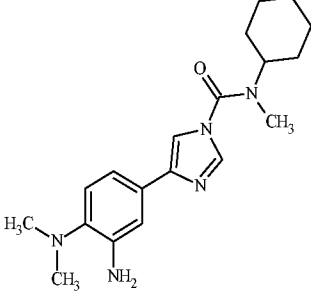
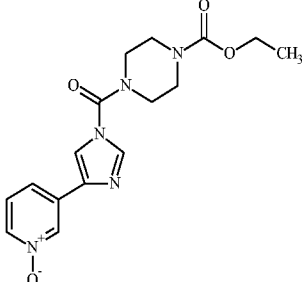
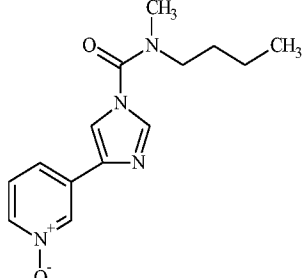
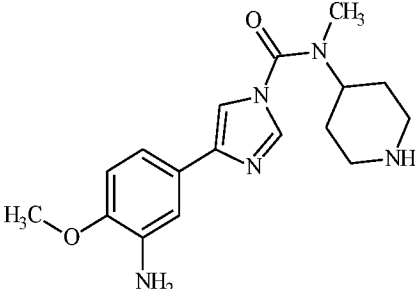
No.	Формула
416	
417	
418	
419	
420	
421	

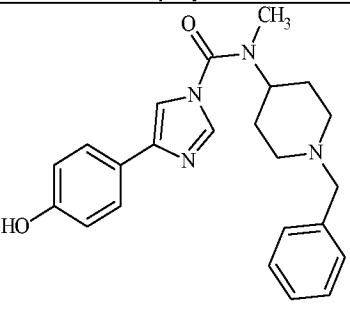
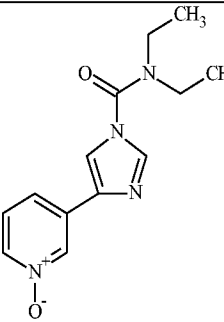
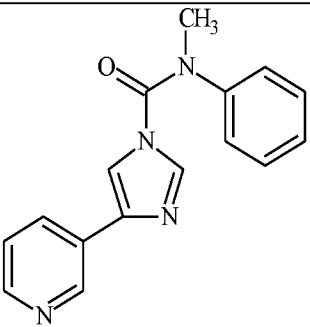
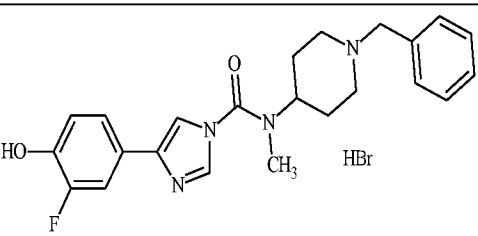
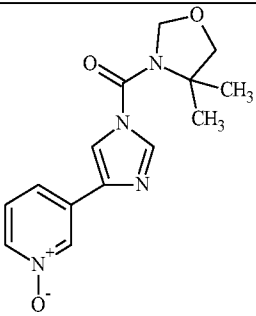
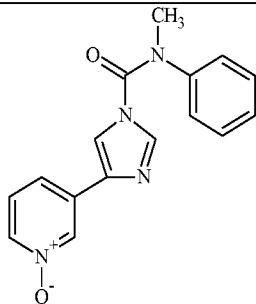
No.	Формула
422	 <chem>CS(=O)(=O)c1ccc(cc1)-c2cc(C3=NN(C3=O)N(C)C4CCCCC4)nn2</chem>
423	 <chem>O=C(O)Nc1ccc(cc1)-c2cc(C3=NN(C3=O)N(C)C4CCN(CC4Cc5ccccc5)C)nn2</chem>
424	 <chem>O=C(O)Nc1ccc(cc1)-c2cc(C3=NN(C3=O)N(C)C4CCCCC4)nn2</chem>
425	 <chem>O=[N+]([O-])c1ccc(cc1Nc2ccccc2)-c3cc(C4=NN(C4=O)N(C)C5CCCCC5)nn3</chem>
426	 <chem>O=C1Nc2cc(C3=NN(C3=O)N(C)C4CCCCC4)nn2-c5ccc(cc5)N1Cc6ccccc6</chem>
427	 <chem>CN(C)C(=O)N1C=CC(=C1)-c2cc(F)c(F)cc2C3CCN(CC3Cc4ccccc4)C</chem>

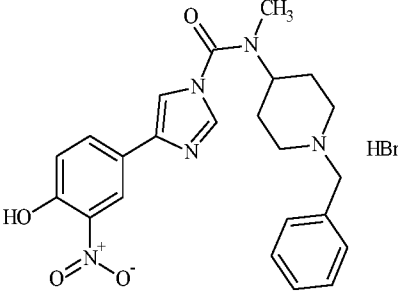
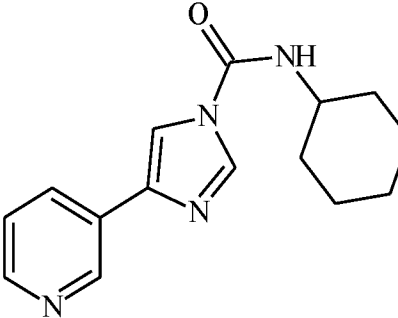
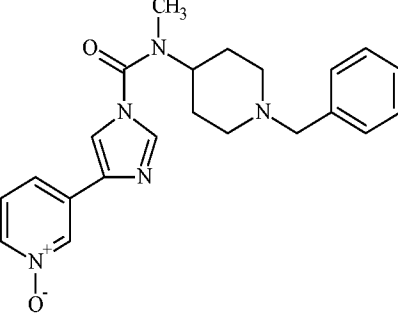
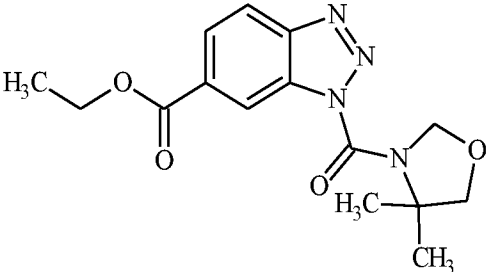
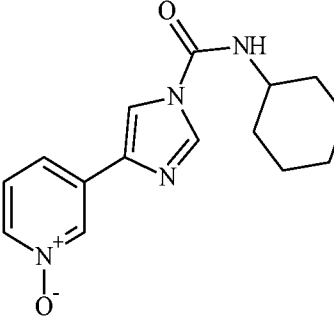
No.	Формула
428	
429	
430	
431	
432	
433	

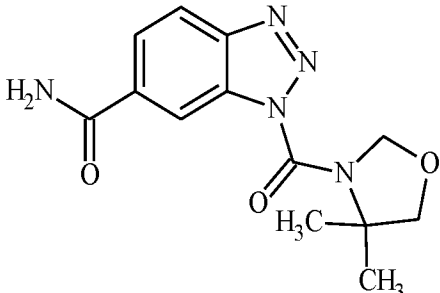
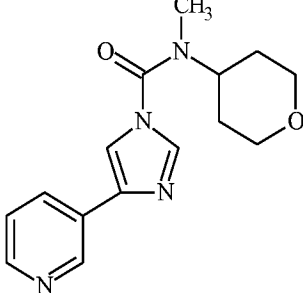
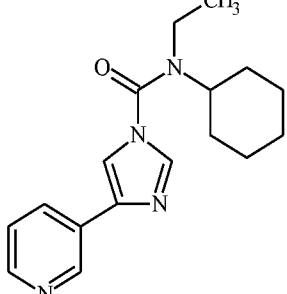
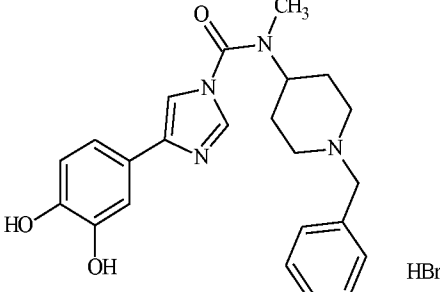
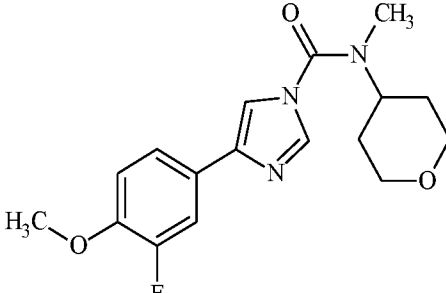
No.	Формула
434	
435	
436	
437	
438	
439	

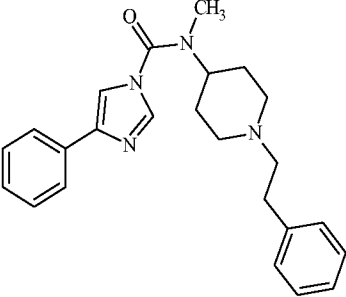
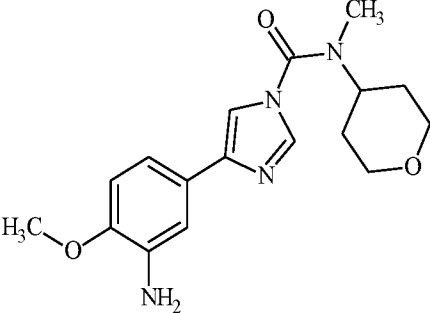
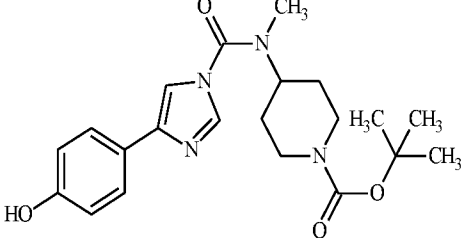
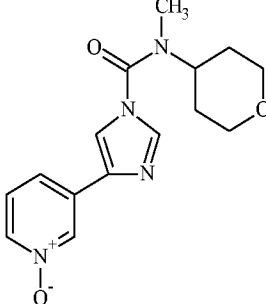
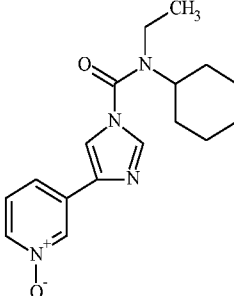
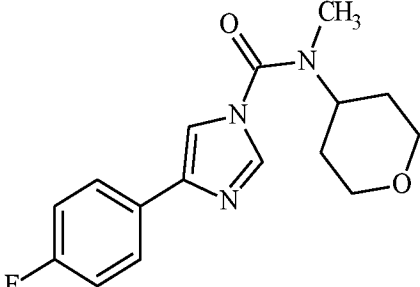
No.	Формула
440	
441	
442	
443	
444	
445	

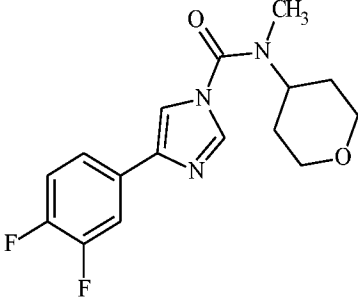
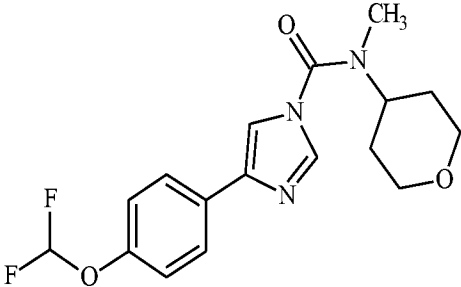
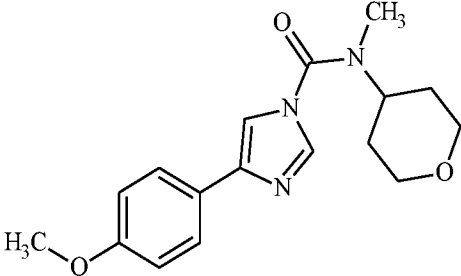
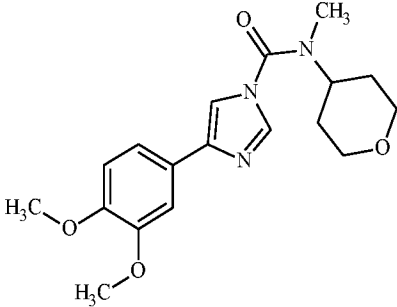
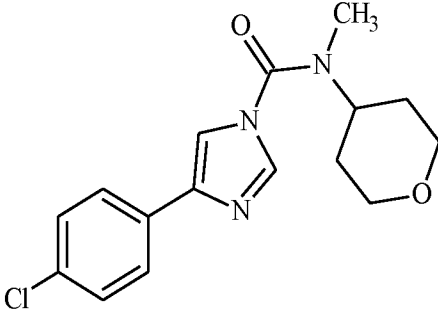
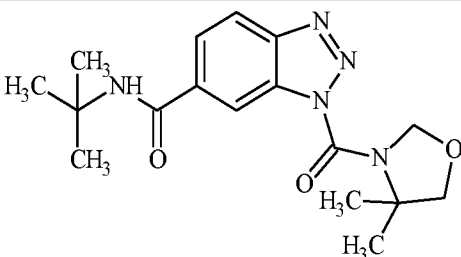
No.	Формула
446	
447	
448	
449	
450	

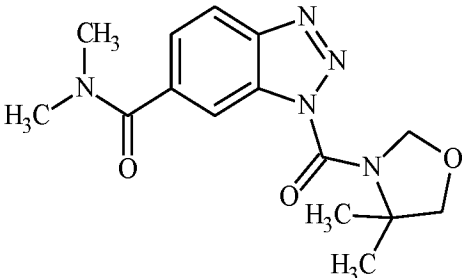
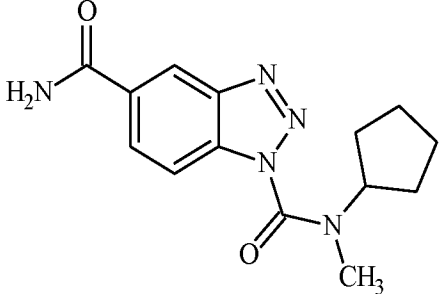
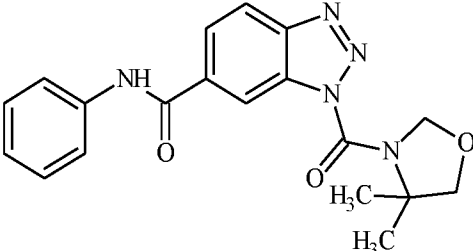
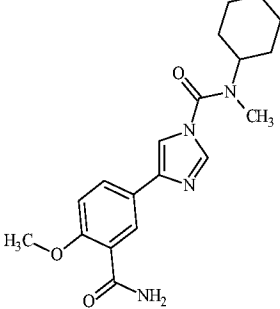
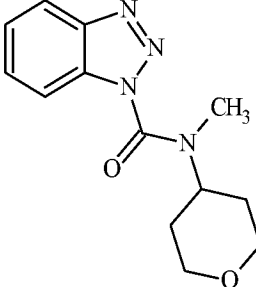
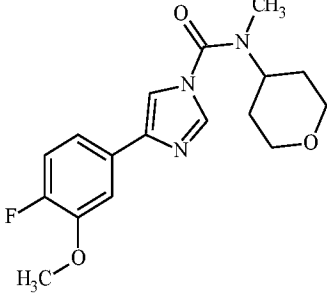
No.	Формула
451	
452	
453	
454	
455	
456	

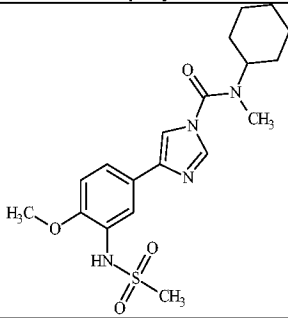
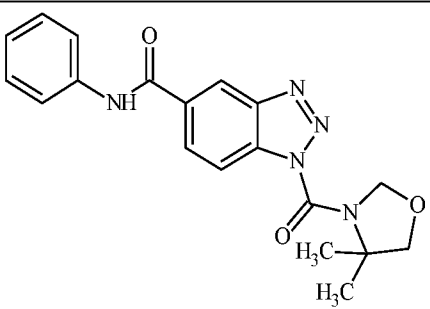
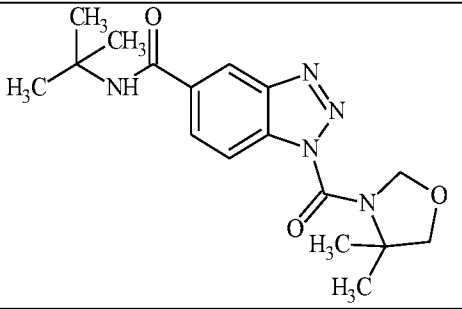
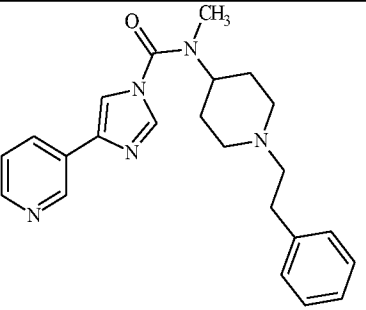
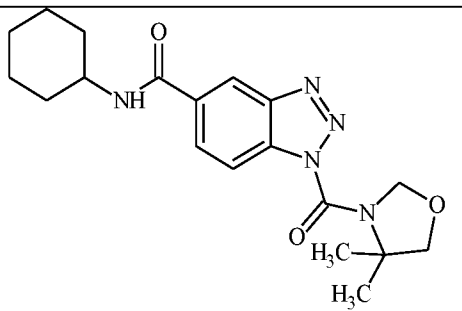
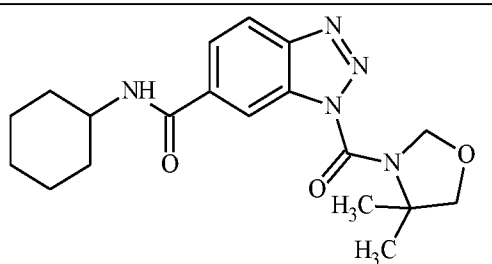
No.	Формула
457	
458	
459	
460	
461	

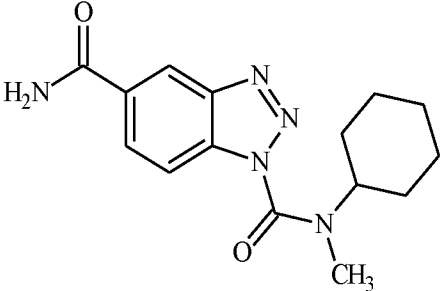
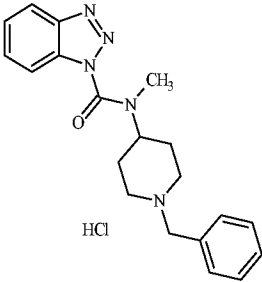
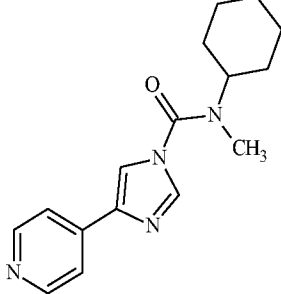
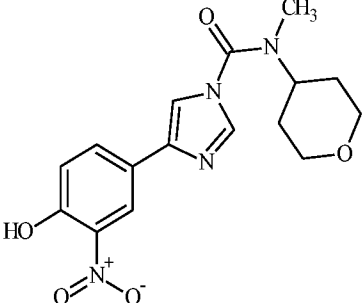
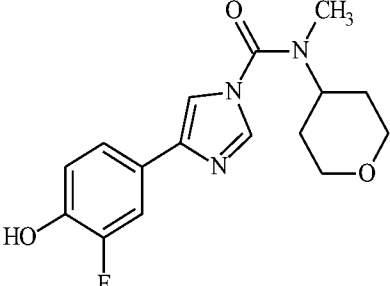
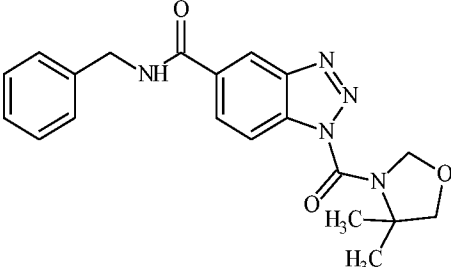
No.	Формула
462	
463	
464	
465	
466	

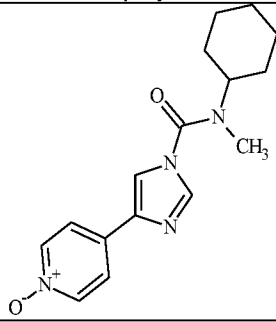
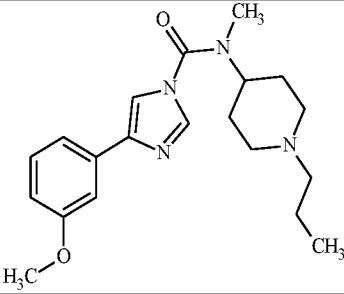
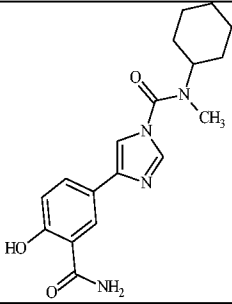
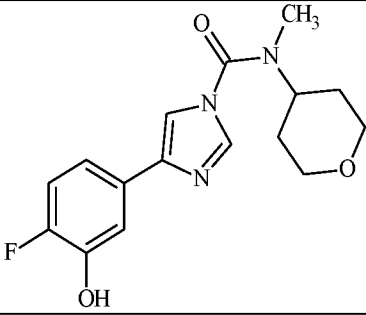
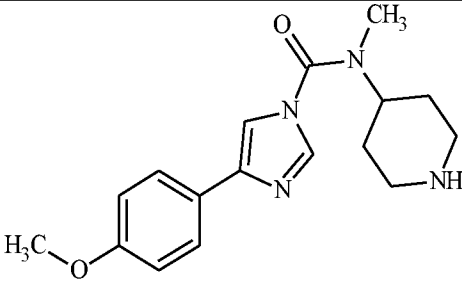
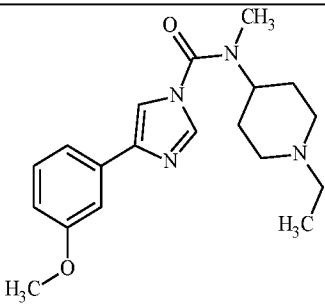
No.	Формула
467	
468	
469	
470	
471	
472	

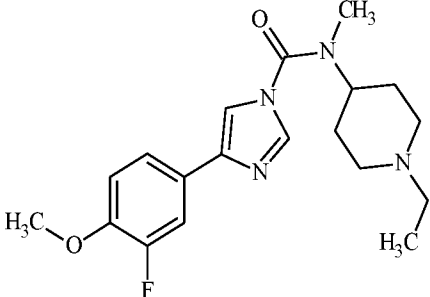
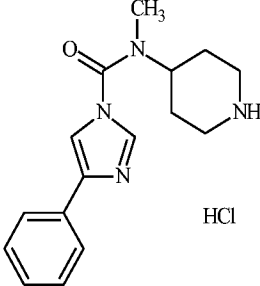
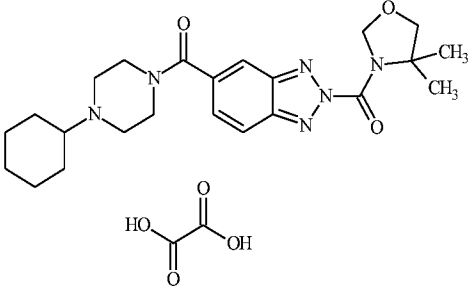
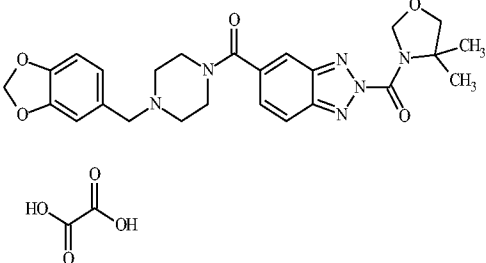
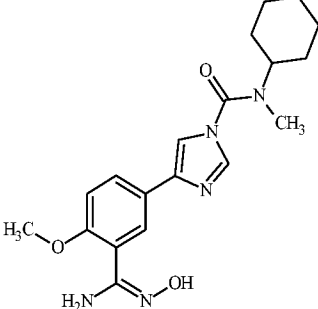
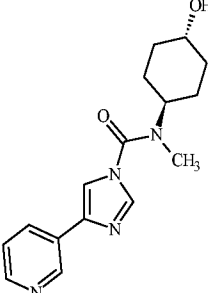
No.	Формула
473	 <chem>CN(C(=O)c1cn(C2=CC=C(C=C2)F)nn1)C3CCOCC3</chem>
474	 <chem>CN(C(=O)c1cn(C2=CC=C(C=C2)COF)nn1)C3CCOCC3</chem>
475	 <chem>CN(C(=O)c1cn(C2=CC=C(C=C2)OC)nn1)C3CCOCC3</chem>
476	 <chem>CN(C(=O)c1cn(C2=CC(OC)=C(OC)C=C2)nn1)C3CCOCC3</chem>
477	 <chem>CN(C(=O)c1cn(C2=CC=C(C=C2)Cl)nn1)C3CCOCC3</chem>
478	 <chem>CN(C(=O)c1ccc(cc1)C(=O)NC(C)C)N2C(=O)C3CC(C)(C)OC3O2</chem>

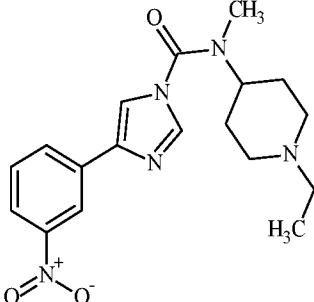
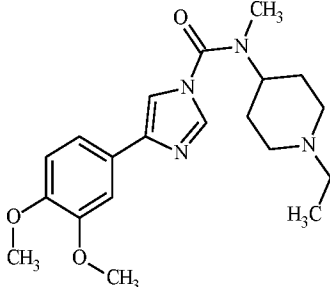
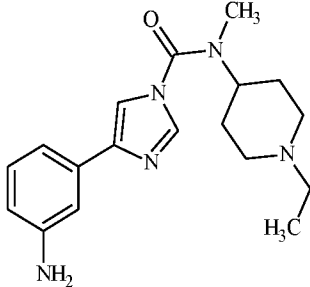
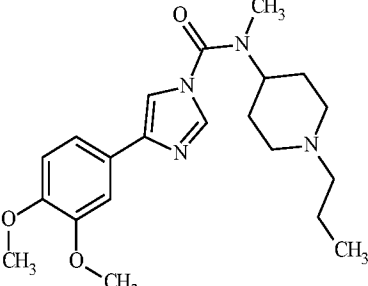
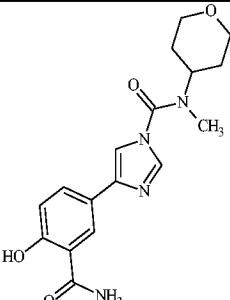
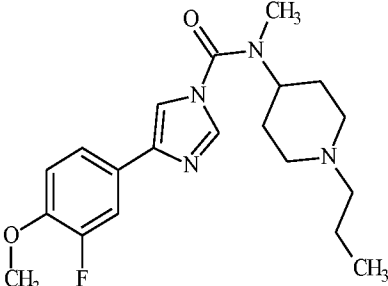
No.	Формула
479	
480	
481	
482	
483	
484	

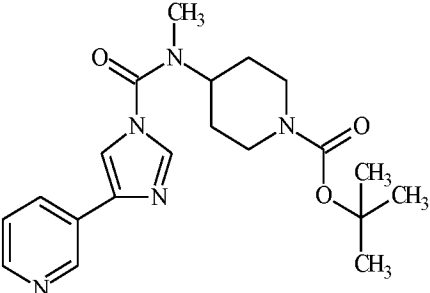
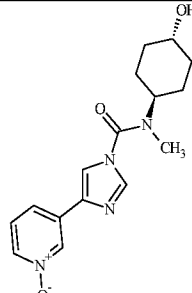
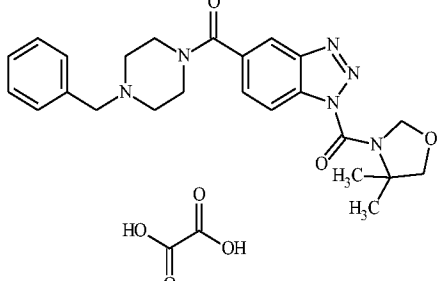
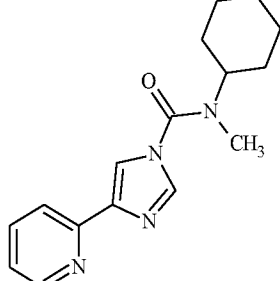
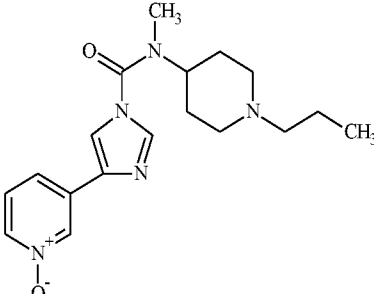
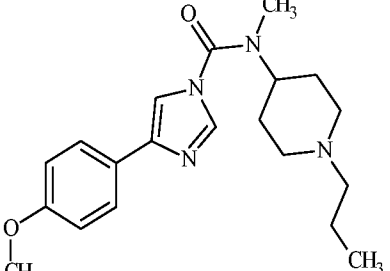
No.	Формула
485	
486	
487	
488	
489	
490	

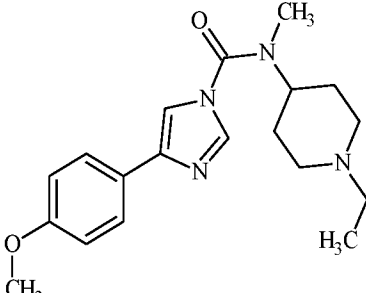
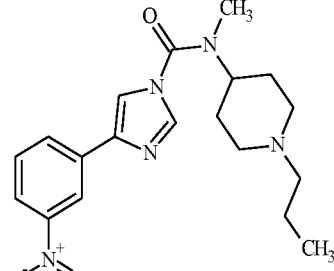
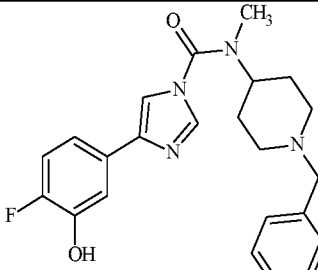
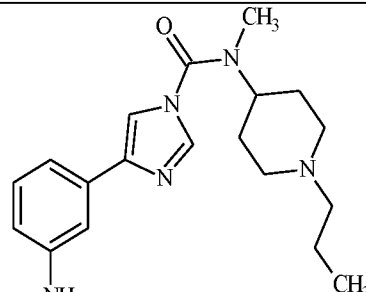
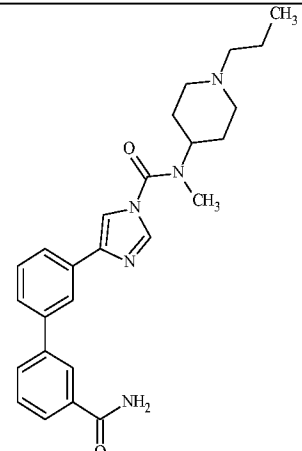
No.	Формула
491	
492	
493	
494	
495	
496	

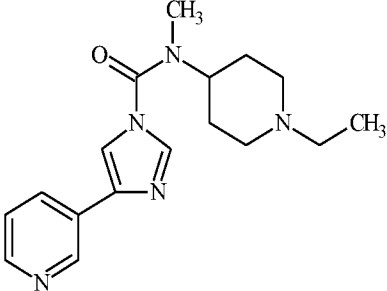
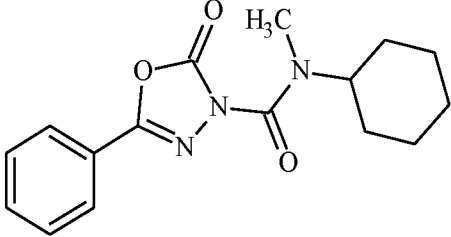
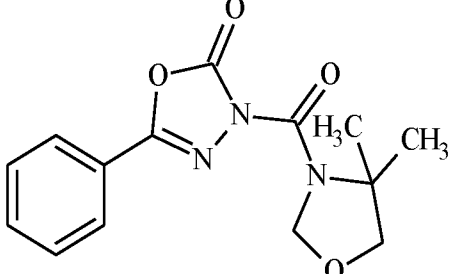
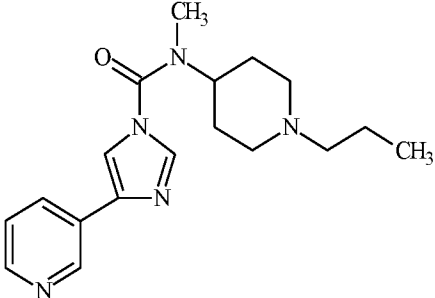
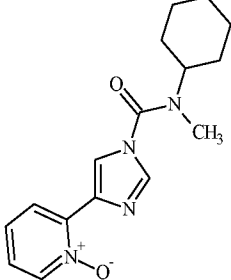
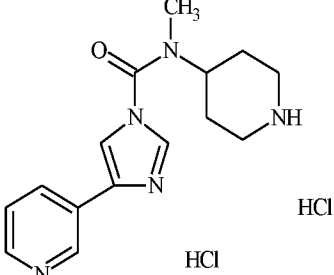
No.	Формула
497	
498	
499	
500	
501	
502	

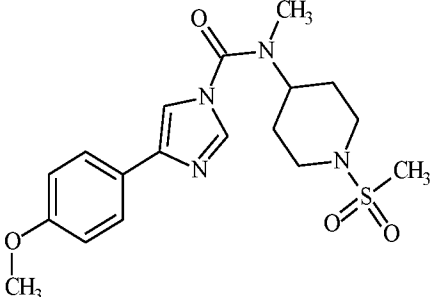
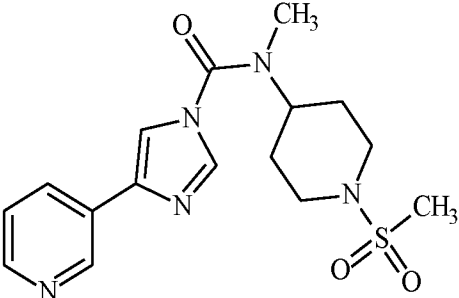
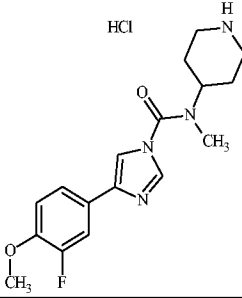
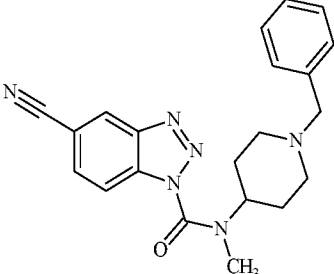
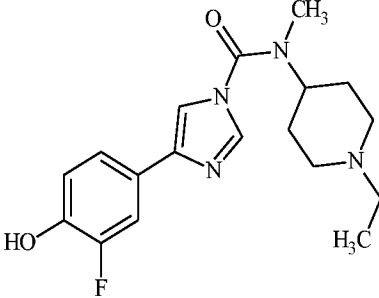
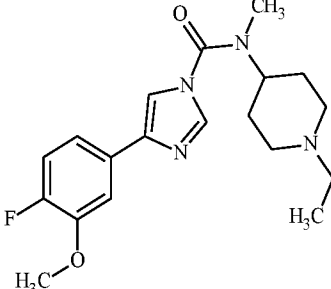
No.	Формула
503	
504	
505	
506	
507	
508	

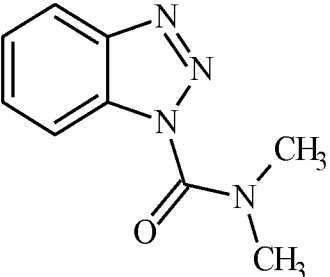
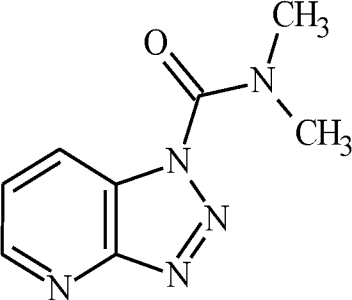
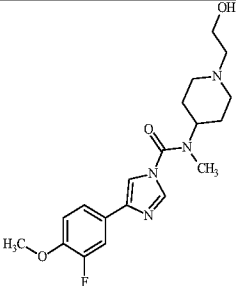
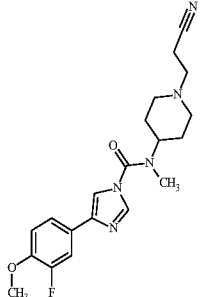
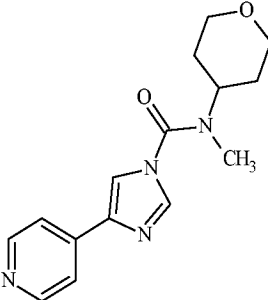
No.	Формула
509	
510	
511	
512	
513	
514	

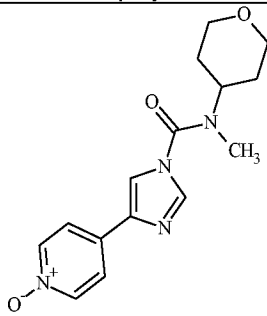
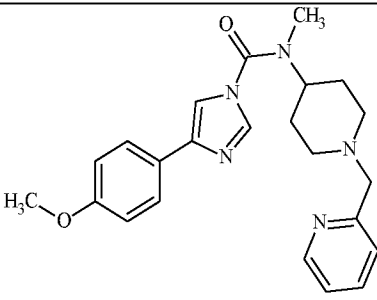
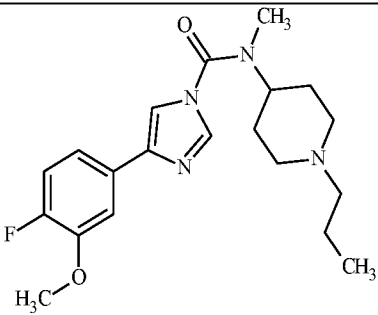
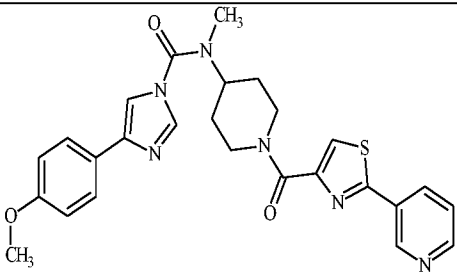
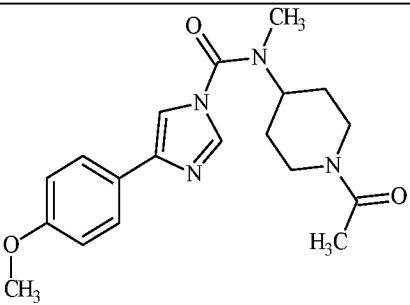
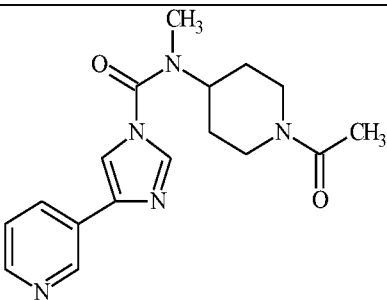
No.	Формула
515	
516	
517	
518	
519	
520	

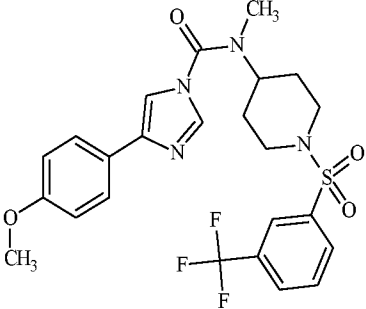
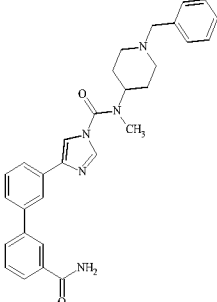
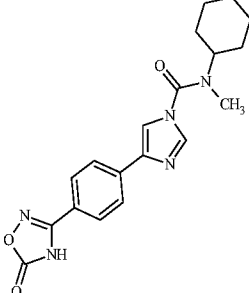
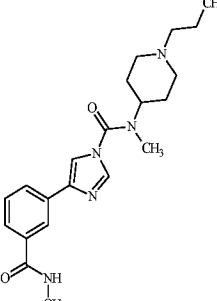
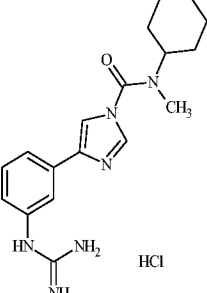
No.	Формула
521	 <chem>COc1ccc(cc1)-c2cc(C(=O)N(C)CCN)nn2</chem>
522	 <chem>[O-][N+](=O)c1ccc(cc1)-c2cc(C(=O)N(C)CCN)nn2</chem>
523	 <chem>Oc1cc(F)ccc1-c2cc(C(=O)N(C)CCNc3ccccc3)nn2</chem>
524	 <chem>Nc1ccc(cc1)-c2cc(C(=O)N(C)CCN)nn2</chem>
525	 <chem>NC(=O)c1ccc(cc1)-c2cc(C(=O)N(C)CCN)nn2</chem>

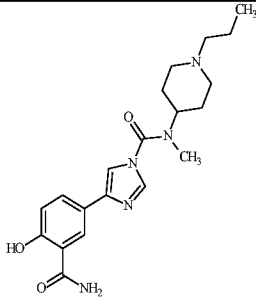
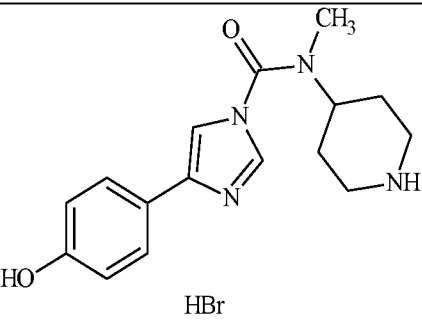
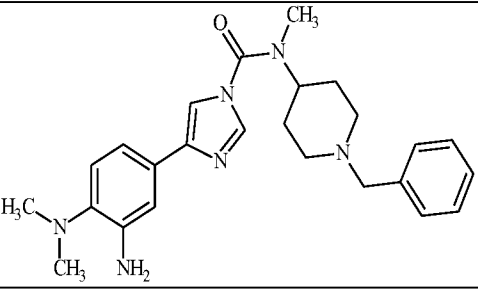
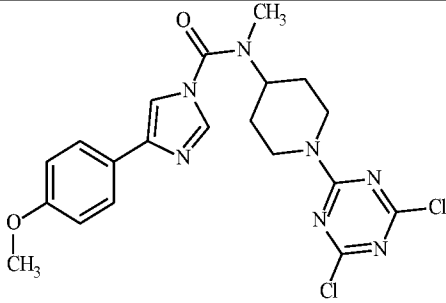
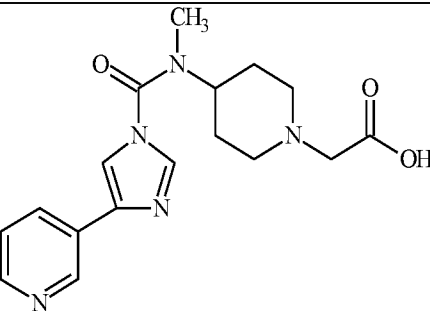
No.	Формула
526	
527	
528	
529	
530	
531	

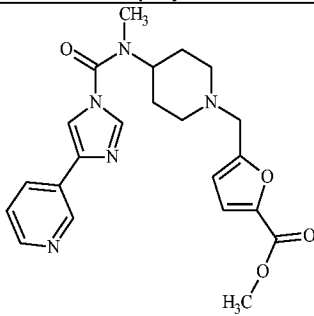
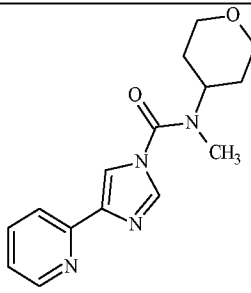
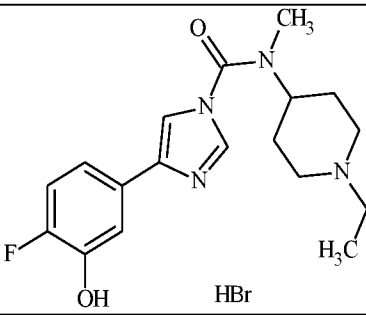
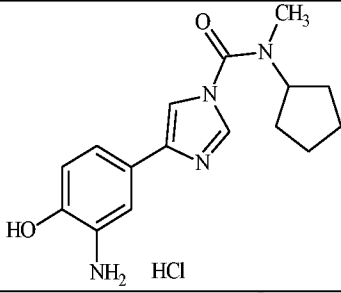
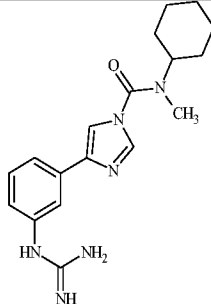
No.	Формула
532	
533	
534	
535	
536	
537	

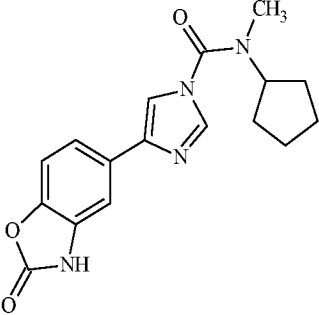
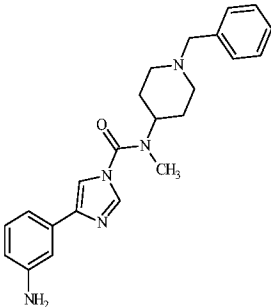
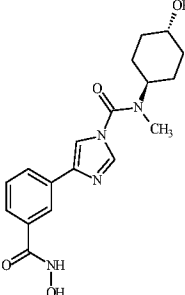
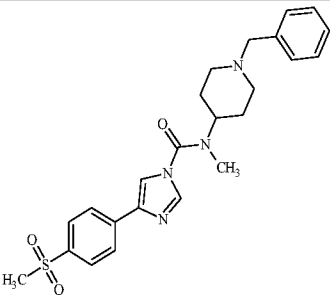
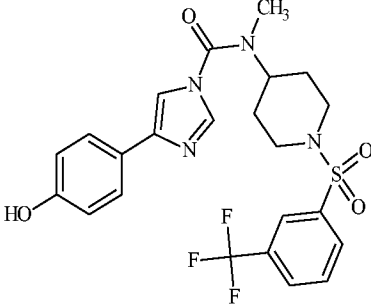
No.	Формула
538	 <chem>CN(C)C(=O)N1c2ccccc2n1</chem>
539	 <chem>CN(C)C(=O)N1c2ccncc2n1</chem>
540	 <chem>CN(C)C(=O)n1cc2cc(OC)ccc2n1</chem>
541	 <chem>CN(C)C(=O)n1cc2cc(OC)ccc2n1</chem>
542	 <chem>CN(C)C(=O)n1cc2ccncc2n1</chem>

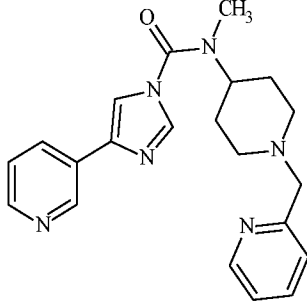
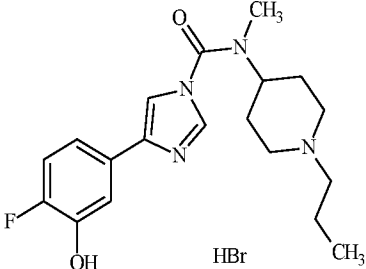
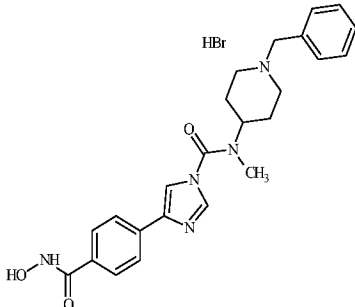
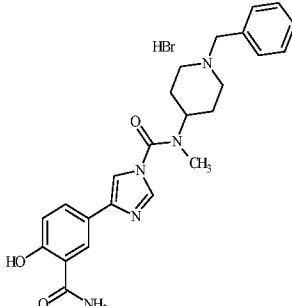
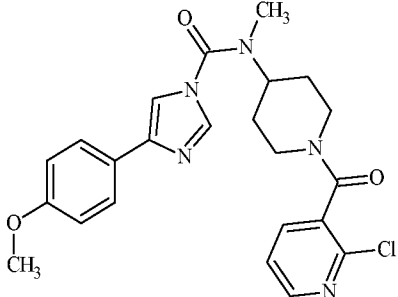
No.	Формула
543	
544	
545	
546	
547	
548	

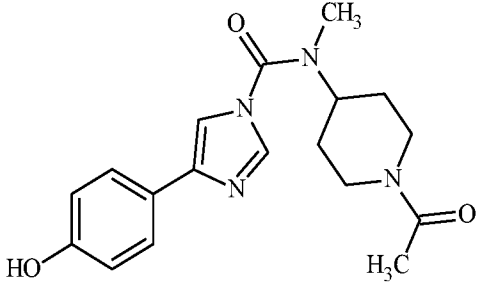
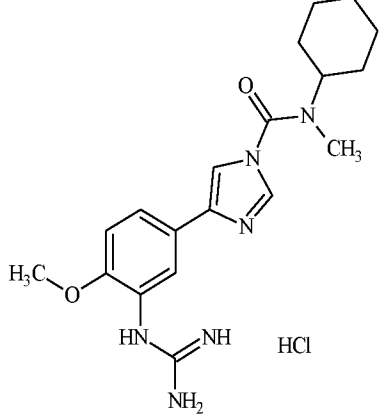
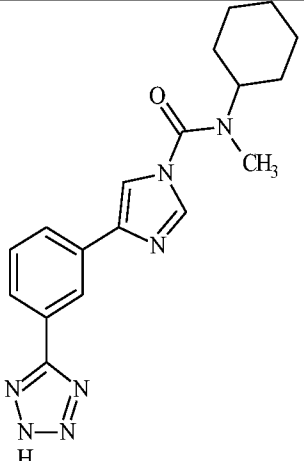
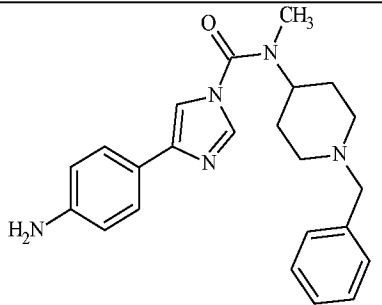
No.	Формула
549	
550	
551	
552	
553	

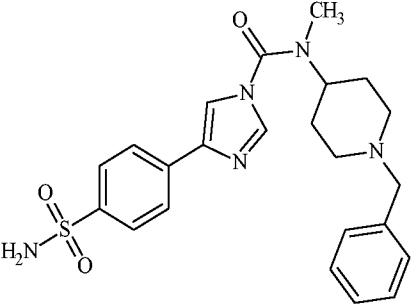
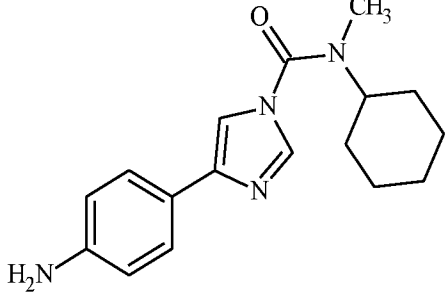
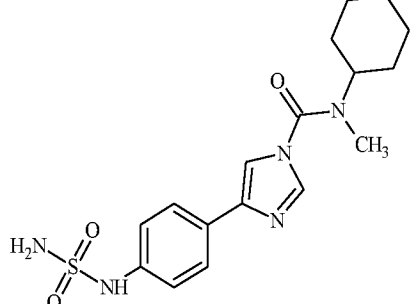
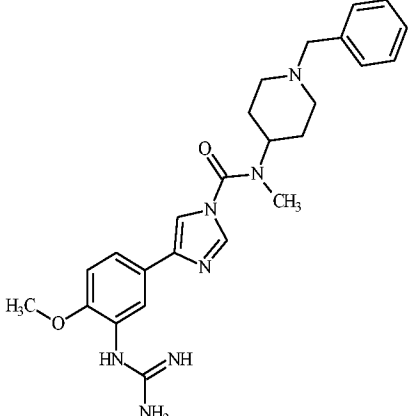
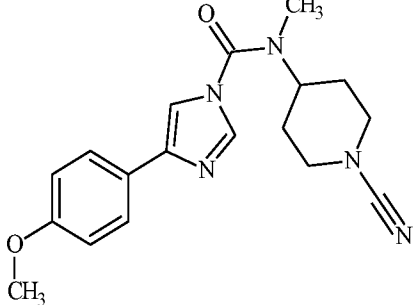
No.	Формула
554	
555	
556	
557	
558	

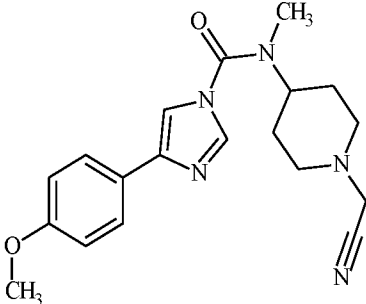
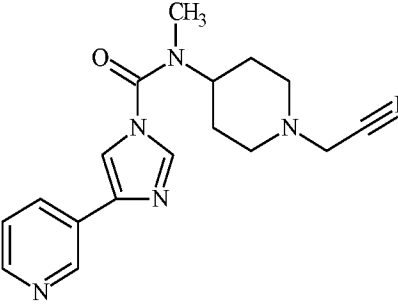
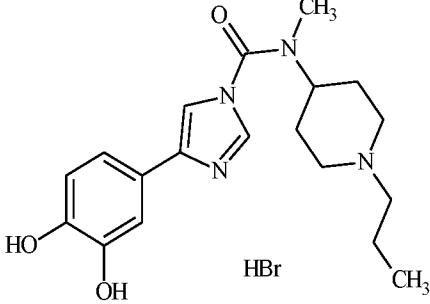
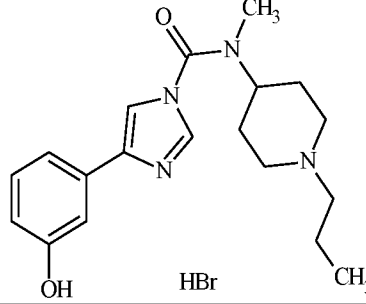
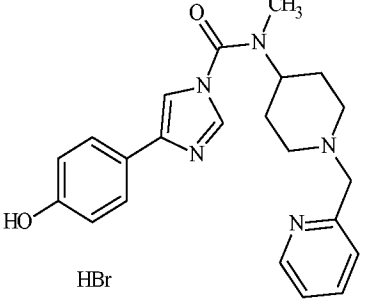
No.	Формула
559	
560	
561	 HBr
562	 HCl
563	

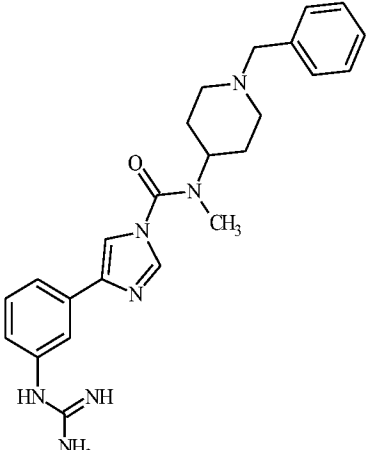
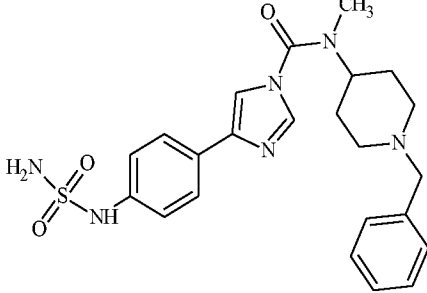
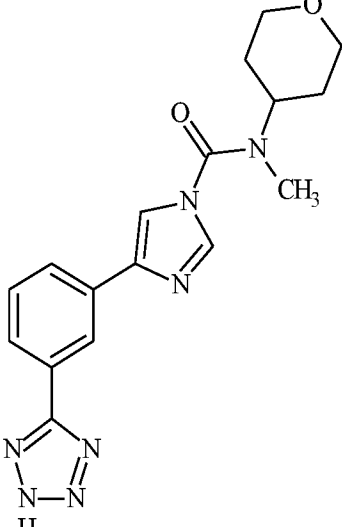
No.	Формула
564	
565	
566	
567	
568	

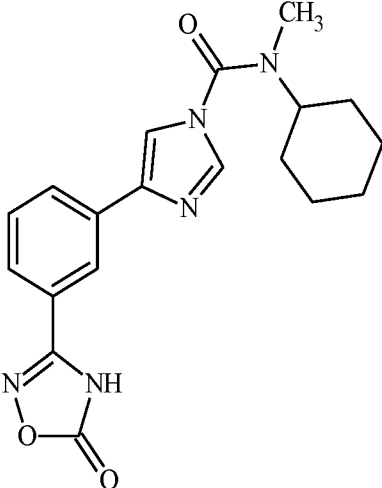
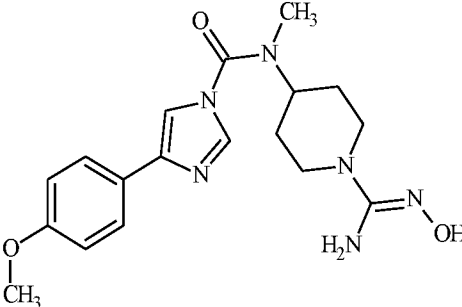
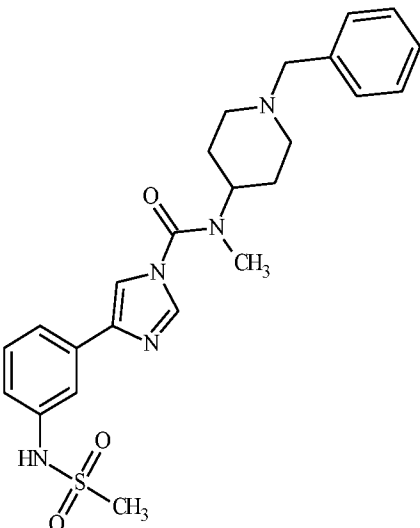
No.	Формула
569	
570	
571	
572	
573	

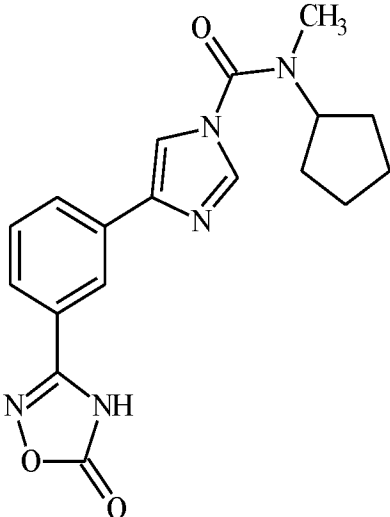
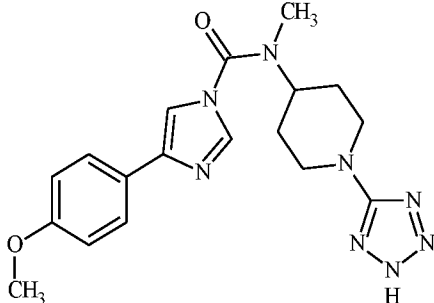
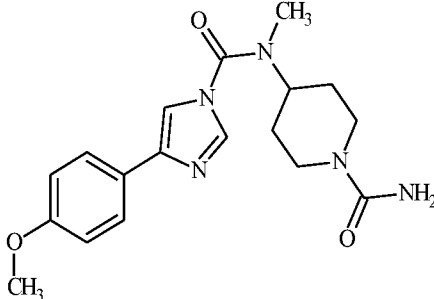
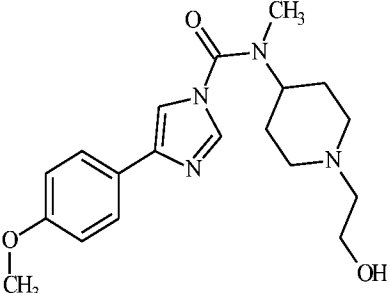
No.	Формула
574	
575	
576	
577	

No.	Формула
578	
579	
580	
581	
582	

No.	Формула
583	
584	
585	 HBr
586	 HBr
587	 HBr

No.	Формула
588	
589	
590	

No.	Формула
591	 <chem>CC1(CCCCC1)N(C)C(=O)c2cc(Cc3ccc(cc3)C4=NC(=O)ON4)nn2</chem>
592	 <chem>COc1ccc(cc1)C2=CN=C(C(=O)N3CCCCC3N4C(=[N+])=N[N-]4O)N2C</chem>
593	 <chem>CS(=O)(=O)Nc1ccc(cc1)C2=CN=C(C(=O)N3CCCCC3CNc4ccccc4)N2</chem>

No.	Формула
594	
595	
596	
597	

Сполуки за винаходом, описані вище, охарактеризовані даними температури плавлення та ЯМР-спектроскопії, як детально описано нижче. ЯМР-спектри реєстрували на спектрометрі Bruker Avance DPX400 з використанням розчинника як внутрішнього стандарту. Спектри ^{13}C реєстрували при 100 МГц, і спектри ^1H реєстрували при 400 МГц. Дані реєстрували в наступному порядку: хімічний зсув (проміле), кількість протонів, множинність (ш, уширений; d, дуплет; m, мультиплет; s, синглет; t, триплет) і константа сполучення (Гц).

Сполука номер 1 (MP: 89-91). ЯМР розчинник: DMSO

^{13}C : 150.4, 137.1, 128.9, 118.6, 65.7, 46.1

^1H : 8.04 (1H, s), 7.48 (1H, s), 7.03 (1H, s), 3.65 (4H, m, J = 5.0 Hz), 3.50 (4H, m, J = 5.0 Hz)

Сполука номер 2 (MP: 58). ЯМР розчинник: CDCl_3

^{13}C : 150.2, 142.9, 137.7, 130.3, 129, 128, 125.9, 118.4, 40.1

- 1H: 7.57 (1H, s), 7.39 (2H, t, J = 7.7 Hz), 7.32 (1H, t, J = 7.3 Hz), 7.13 (2H, d, J = 7.7 Hz), 6.85 (1H, s), 6.81 (1H, s), 3.50 (3H, s)
 Сполука номер 3 (MP: 97-99). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 150.8, 142.7, 136.9, 132.7, 128.7, 127.7, 125.2, 112.8, 66.5, 46.8
- 5 1H: 7.92 (1H, s), 7.79 (2H, d, J = 7.8 Hz), 7.47 (1H, s), 7.41 (2H, t, J = 7.6 Hz), 7.30 (1H, m, J = 7.6 Hz), 3.78 (4H, m), 3.68 (4H, m)
 Сполука номер 4 (MP: 104-105). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 150.1, 142.9, 141.4, 137.7, 132.8, 130.4, 128.5, 128.2, 127.4, 126, 125, 113.5, 40.2
 1H: 7.60 (2H, d, J = 7.7 Hz), 7.53 (1H, s), 7.40 (2H, t, J = 7.7 Hz), 7.34 (1H, m), 7.32 (2H, t, J = 7.6 Hz), 7.25 (1H, m), 7.19 (2H, m), 7.18 (1H, s), 3.52 (3H, s)
- 10 Сполука номер 5 (MP: 117). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 154.2, 146.9, 136.6, 131.7, 129.9, 129.2, 129.1, 128.8, 126.3, 124.7, 119.8, 106.7
 1H: 9.19 (1H, s), 8.36 (1H, d, J = 2.7 Hz), 7.91 (2H, d, J = 8.0 Hz), 7.67 (2H, d, J = 7.8 Hz), 7.49 (2H, m, J = 7.2 Hz), 7.43 (3H, m), 7.19 (1H, t, J = 7.4 Hz), 6.79 (1H, d, J = 2.7 Hz)
- 15 Сполука номер 6 (MP: 98-99). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 156.7, 154.1, 147.2, 131.8, 129.9, 129.5, 129.1, 128.8, 126.2, 121.7, 114.4, 106.5, 55.5
 1H: 9.05 (1H, s), 8.34 (1H, d, J = 2.8 Hz), 7.89 (2H, m, J = 8.4 Hz), 7.55 (2H, m, J = 8.8 Hz), 7.47 (2H, t, J = 7.7 Hz), 7.41 (1H, t, J = 7.3 Hz), 6.94 (2H, m, J = 8.8 Hz), 6.76 (1H, d, J = 2.8 Hz), 3.83 (3H, s)
- 20 Сполука номер 7 (MP: 62). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 151.7, 149.1, 145.7, 143.1, 129.6, 127.7, 125.8, 40.5
 1H: 8.64 (1H, s), 7.73 (1H, s), 7.37 (2H, t, J = 7.7 Hz), 7.30 (1H, t, J = 7.3 Hz), 7.13 (2H, d, J = 7.8 Hz), 3.56 (3H, s)
- 25 Сполука номер 8 (MP: 64-65). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 151.7, 144.6, 141.8, 131.1, 129.3, 126.6, 125.4, 107.3, 40.4
 1H: 8.01 (1H, d br, J = 2.7 Hz), 7.40 (1H, br), 7.33 (2H, m, J = 8.1 Hz), 7.23 (1H, m, J = 7.6 Hz), 7.11 (2H, m, J = 8.3 Hz), 6.25 (1H, d d, J = 1.7, 2.7 Hz), 3.55 (3H, s)
- 30 Сполука номер 9 (MP: 71-72). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 146.8, 142.3, 136.6, 129.2, 128.7, 124.7, 119.6, 109
 1H: 9.13 (1H, s), 8.33 (1H, d d, J = 0.6, 2.7 Hz), 7.69 (1H, d d, J = 0.6, 1.6 Hz), 7.63 (2H, m, J = 8.7 Hz), 7.40 (2H, m, J = 8.0 Hz), 7.18 (1H, m, J = 7.5 Hz), 6.47 (1H, d d, J = 1.6, 2.7 Hz)
- 35 Сполука номер 10 (MP: 125-126). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 157.4, 154.3, 154, 147.1, 132, 131.7, 130, 129.8, 129.2, 128.8, 126.3, 123.2, 121.6, 119.7, 118.6, 106.6
 1H: 9.14 (1H, s), 8.36 (1H, d, J = 2.8 Hz), 7.91 (2H, d, J = 8.0 Hz), 7.62 (2H, d, J = 9.0 Hz), 7.49 (2H, t, J = 7.6 Hz), 7.43 (1H, t, J = 7.2 Hz), 7.36 (2H, t, J = 8.0 Hz), 7.12 (1H, t, J = 7.5 Hz), 7.08 (2H, d, J = 9.0 Hz), 7.04 (2H, d, J = 8.2 Hz), 6.80 (1H, d, J = 2.8 Hz)
- 40 Сполука номер 11 (MP: 110). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 155.9, 154.1, 147.1, 136.8, 131.8, 129.9, 129.8, 129.1, 128.8, 128.6, 128, 127.5, 126.2, 121.7, 115.4, 106.5, 70.3
 1H: 9.06 (1H, s), 8.35 (1H, d, J = 2.7 Hz), 7.90 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.56 (2H, m, J = 9.0 Hz), 7.47 (2H, m), 7.45 (2H, m), 7.43 (1H, m), 7.40 (2H, m), 7.34 (1H, m), 7.03 (2H, m, J = 9.0 Hz), 6.78 (1H, d, J = 2.7 Hz), 5.09 (2H, s)
- 45 Сполука номер 12 (MP: 79). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 153, 151.3, 144.9, 132.3 (2 sig.), 129.2, 128.5 (2 sig.), 126.7, 125.9, 125.9, 104.7, 40.5
 1H: 8.11 (1H, d, J = 2.5 Hz), 7.40 (2H, m), 7.36 (2H, t, J = 7.5 Hz), 7.28 (4H, m), 7.17 (2H, d, J = 7.8 Hz), 6.55 (1H, d, J = 2.5 Hz), 3.59 (3H, s)
- 50 Сполука номер 13 (MP: 79-80). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 153.7, 151, 133.3, 132.1, 128.8, 128.7, 126, 104.9, 66.8, 47
 1H: 8.19 (1H, d, J = 2.8 Hz), 7.83 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.44 (2H, t, J = 7.7 Hz), 7.39 (1H, m, J = 7.2 Hz), 6.70 (1H, d, J = 2.8 Hz), 4.0 (4H, s br), 3.84 (4H, m)
- 55 Сполука номер 14 (MP: 132). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 150, 142.9, 141.4, 137.9, 133.5, 132.8, 130.4, 130.1, 128.2, 128.2, 128.1, 127.6, 126.2, 126, 125.7, 123.6, 123.3, 114, 40.2
 1H: 8.19 (1H, s), 7.85-7.77 (3H, m), 7.64 (1H, d d, J = 1.8, 8.7 Hz), 7.56 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.44 (4H, m), 7.36 (1H, m, J = 7.4 Hz), 7.34 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.21 (2H, m, J = 8.1 Hz), 3.54 (3H, s)
- Сполука номер 15 (MP: 134). ЯМР розчинник: Acetone
 13C: 154.8, 148.1, 141.2, 138, 137.9, 133, 131.1, 129.9, 129.8, 129.7, 128.2, 128.1, 127.6, 127.1, 121.5, 107.4

¹H: 10.05 (1H, s), 8.45 (1H, d, J = 3.0 Hz), 8.03 (2H, m, J = 8.7 Hz), 7.94 (2H, m, J = 8.6 Hz), 7.72 (2H, m, J = 8.6 Hz), 7.69 (2H, m, J = 8.3 Hz), 7.49 (2H, m), 7.47 (2H, m), 7.43 (1H, m), 7.36 (1H, m, J = 7.4 Hz), 7.06 (1H, d, J = 3.0 Hz)

Сполука номер 16 (MP: 119-120). ЯМР розчинник: CDCl₃

5 ¹³C: 159.2, 150.1, 141.2, 137.9, 135.5, 133.6, 132.8, 130.2, 128.2, 128.1, 127.6, 127.3, 126.2, 125.7, 123.6, 123.3, 115.5, 114.2, 55.5, 40.5

¹H: 8.21 (1H, m), 7.82-7.80 (3H, m), 7.67 (1H, d d, J = 1.7, 8.6 Hz), 7.49 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.45 (2H, m), 7.42 (1H, m), 7.14 (2H, m, J = 9.0 Hz), 6.93 (2H, m, J = 9.0 Hz), 3.81 (3H, s), 3.50 (3H, s)

Сполука номер 17 (MP: 138). ЯМР розчинник: CDCl₃

10 ¹³C: 159.1, 150.1, 141.2, 137.7, 135.5, 132.8, 128.6, 127.4, 127.3, 125, 115.5, 113.7, 55.5, 40.5

¹H: 7.64 (2H, d, J = 8.1 Hz), 7.47 (1H, s), 7.35 (2H, t, J = 7.2 Hz), 7.30 (1H, s), 7.25 (1H, m, J = 7.4 Hz), 7.11 (2H, s, J = 8.6 Hz), 6.91 (2H, d, J = 8.6 Hz), 3.81 (3H, s), 3.49 (3H, s)

Сполука номер 18 (MP: 123-124). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 150.9, 143.4, 142.7, 141.5, 132.4, 130.3, 127.6, 125.4, 124.8, 123.9, 120.2, 114, 39.7

15 ¹H: 7.95 (1H, d, J = 7.8 Hz), 7.69 (1H, d, J = 8.0 Hz), 7.54 (1H, s), 7.38 (1H, m), 7.33 (2H, m), 7.32 (1H, m), 7.25 (1H, m), 7.12 (2H, d, J = 7.8 Hz), 3.58 (3H, s)

Сполука номер 19 (MP: 104). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 149.4, 145.3, 133.1, 129.5, 125.4, 119.9, 113.6, 66.7, 48.2, 45.6

20 ¹H: 8.10 (1H, d, J = 8.3 Hz), 8.01 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.62 (1H, t, J = 7.9 Hz), 7.47 (1H, t, J = 7.6 Hz), 3.96 (4H, s br), 3.89 (4H, s br)

Сполука номер 20 (MP: 181-183). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 153, 147.4, 140.6, 139.5, 137.4, 130.8, 130.7, 129, 128.8, 127.8, 127, 126.8, 126.7, 124.4, 121, 106.8

25 ¹H: 10.36 (1H, s), 8.51 (1H, d, J = 2.6 Hz), 8.18 (2H, d, J = 8.1 Hz), 7.82 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.78 (2H, m), 7.76 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.50 (2H, t, J = 7.8 Hz), 7.41 (2H, m), 7.39 (1H, m), 7.19 (1H, d, J = 2.6 Hz), 7.19 (1H, m)

Сполука номер 21 (MP: 208-211). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 150, 147.8, 143.2, 140.7, 140, 134.5, 130.5, 126.8, 106.1, 66, 46.6

30 ¹H: 9.35 (1H, s), 8.86 (2H, m), 8.40 (1H, d, J = 2.5 Hz), 8.02 (1H, t br, J = 6.3 Hz), 7.31 (1H, d, J = 2.5 Hz), 3.77 (4H, br), 3.71 (4H, br)

Сполука номер 22 (MP: 168-170). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 159.6, 153, 147.3, 140.6, 139.5, 138.6, 130.8, 130.7, 129.6, 129, 127.8, 127, 126.9, 126.7, 113, 109.9, 106.9, 106.6, 55.2

35 ¹H: 10.32 (1H, s), 8.50 (1H, d, J = 3.0 Hz), 8.18 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.81 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.76 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.75 (1H, t, J = 2.3 Hz), 7.50 (2H, t, J = 7.8 Hz), 7.42 (1H, m), 7.39 (1H, m, J = 7.2 Hz), 7.31 (1H, t, J = 8.5 Hz), 7.19 (1H, d, J = 3.0 Hz), 6.76 (1H, m, J = 1.0, 2.4, 8.3 Hz), 3.76 (3H, s)

Сполука номер 23 (MP: 163). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 156.2, 152.9, 147.5, 140.5, 139.5, 130.8, 130.7, 130.2, 129, 127.8, 127, 126.8, 126.7, 122.9, 113.9, 106.6, 55.3

40 ¹H: 10.25 (1H, s), 8.49 (1H, d, J = 2.6 Hz), 8.18 (2H, d, J = 8.1 Hz), 7.82 (2H, d, J = 8.1 Hz), 7.77 (2H, d, J = 7.4 Hz), 7.66 (2H, d, J = 9.0 Hz), 7.50 (2H, t, J = 7.8 Hz), 7.40 (1H, t, J = 7.3 Hz), 7.16 (1H, d, J = 2.6 Hz), 6.98 (2H, d, J = 9.0 Hz), 3.77 (3H, s)

Сполука номер 24 (MP: 99). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 150.9, 150.1, 149.4, 147.4, 144.7, 133, 132.6, 129.3, 128.1, 126.9, 125.9, 123.4, 104.6, 40.5

45 ¹H: 8.61 (1H, s), 8.50 (1H, d, J = 4.9 Hz), 8.16 (1H, d, J = 2.6 Hz), 7.65 (1H, d, J = 7.9 Hz), 7.36 (2H, t, J = 7.6 Hz), 7.29 (1H, t, J = 7.5 Hz), 7.22 (1H, d d, J = 4.9, 7.9 Hz), 7.17 (2H, d, J = 7.8 Hz), 6.59 (1H, d, J = 2.6 Hz), 3.58 (3H, s)

Сполука номер 25 (MP: 137). ЯМР розчинник: DMSO

50 ¹³C: 151.6, 150.7, 144.5, 140.1, 139.5, 133, 131, 129.1, 129, 127.7, 126.8, 126.6, 126.5, 126.1, 125.8, 105.1, 40

¹H: 8.22 (1H, d, J = 2.5 Hz), 7.69 (2H, d, J = 7.8 Hz), 7.64 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.59 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.46 (2H, t, J = 7.6 Hz), 7.37 (3H, m), 7.26 (3H, m), 6.92 (1H, d, J = 2.5 Hz), 3.48 (3H, s)

Сполука номер 26 (MP: 123-125). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 151.9, 146.5, 141.4, 130.3, 129.3, 129, 128.9, 128.3, 127.3, 126.9, 124.1, 120, 38.9

55 ¹H: 7.43-7.24 (6H, m), 7.14-6.93 (4H, m), 6.33 (2H, br), 3.37 (3H, s br)

Сполука номер 27 (MP: 121). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 149.9, 142.8, 140.3, 137.8, 133, 131.3, 130.4, 128.7, 128.2, 126.2, 126, 113.7, 40.2

¹H: 7.54 (2H, m, J = 8.6 Hz), 7.50 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.42 (2H, m, J = 7.7 Hz), 7.35 (1H, m, J = 7.4 Hz), 7.29 (2H, m, J = 8.6 Hz), 7.19 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.18 (2H, m), 3.52 (3H, s)

60 Сполука номер 28 (MP: 127). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 159, 150.1, 142.9, 141.2, 137.6, 130.3, 128.1, 126.3, 125.9, 125.5, 113.9, 112.4, 55.2, 40.2
¹H: 7.53 (2H, m, J = 8.9 Hz), 7.51 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.41 (2H, m, J = 7.9 Hz), 7.34 (1H, m, J = 7.5 Hz), 7.19 (2H, m, J = 8.3 Hz), 7.09 (1H, d, J = 1.4 Hz), 6.87 (2H, m, J = 8.9 Hz), 3.80 (3H, s), 3.52 (3H, s)

5 Сполука номер 29 (MP: 127-129). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 162.2 (d, J = 246.0 Hz), 150.0, 142.9, 140.5, 137.8, 130.4, 129.0 (d, J = 3.3 Hz), 128.2, 126.7 (d, J = 8.0 Hz), 126.0, 111.5 (d, J = 21.5 Hz), 113.2, 40.2

¹H: 7.57 (2H, m, J = 5.4, 9.0 Hz), 7.50 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.43 (2H, t, J = 7.7 Hz), 7.35 (1H, m, J = 7.3 Hz), 7.18 (2H, m), 7.15 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.01 (2H, t, J = 8.7 Hz), 3.52 (3H, s)

10 Сполука номер 30 (MP: 126). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 159.5 (d, J = 249.0 Hz), 150.0, 142.8, 137.3, 135.1 (d, J = 2.6 Hz), 130.3, 128.3 (d, J = 8.6 Hz), 128.2, 127.7 (d, J = 4.0 Hz), 125.9, 124.2 (d, J = 3.2 Hz), 120.7 (d, J = 12.8 Hz), 117.7 (d, J = 16.0 Hz), 115.4 (d, J = 22.0 Hz), 40.2

15 ¹H: 8.02 (1H, d t, J = 2.0, 7.6 Hz), 7.65 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.41 (2H, m), 7.34 (1H, m), 7.31 (1H, d, J = 1.3, 3.6 Hz), 7.19 (2H, m), 7.16 (1H, m), 7.15 (1H, m, J = 1.6, 7.4), 7.03 (1H, m, J = 1.5, 7.8, 11.4 Hz), 3.53 (3H, s)

Сполука номер 31 (MP: 128-129). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 159.8, 150, 142.9, 141.2, 137.7, 134.2, 130.4, 129.6, 128.2, 126, 117.4, 113.8, 113.6, 109.9, 55.2, 40.2

20 ¹H: 7.52 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.41 (2H, m, J = 7.8 Hz), 7.34 (1H, m, J = 7.4 Hz), 7.23 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.21 (1H, m), 7.19 (3H, m), 7.16-7.13 (1H, m), 6.79 (1H, d d d, 1.0, 2.5, 8.0 Hz), 3.81 (3H, s), 3.52 (3H, s)

Сполука номер 32 (MP: 144-146). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 149.7, 143.5, 143.4, 136, 133.4, 129.6, 127.6, 126.4, 126, 120.7, 113.3, 40.4

25 ¹H: 8.10 (1H, d, J = 1.6 Hz), 7.91 (1H, d, J = 8.8 Hz), 7.40 (1H, d d, J = 1.6, 8.8 Hz), 7.34 (2H, m, J = 7.9 Hz), 7.27 (1H, m), 7.17 (2H, d, J = 7.6 Hz), 3.67 (3H, s)

Сполука номер 33 (MP: 112). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 149.7, 145.6, 143.4, 131.5, 131, 130.1, 129.6, 127.6, 125.9, 119.3, 114.2, 40.4

30 ¹H: 8.0 (1H, d, J = 8.9 Hz), 7.98 (1H, d, J = 1.6 Hz), 7.57 (1H, d d, J = 1.6, 8.9 Hz), 7.34 (2H, t, J = 8.1 Hz), 7.27 (1H, m), 7.17 (2H, d, J = 7.8 Hz), 3.67 (3H, s)

Сполука номер 34 (MP: 89-90). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 150.2, 145, 143.6, 132.8, 129.5, 129.3, 127.4, 125.9, 125.1, 119.9, 113.2, 40.3

35 ¹H: 8.06 (1H, d, J = 8.4 Hz), 8.0 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.61 (1H, m, J = 7.7 Hz), 7.43 (1H, m, J = 7.7 Hz), 7.32 (2H, t, J = 7.8 Hz), 7.25 (1H, t, J = 7.5 Hz), 7.18 (2H, d, J = 7.5 Hz), 3.68 (3H, s)

Сполука номер 35 (MP: 166-169). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 149.8, 142.9, 139.7, 139.7, 138.7, 137.9, 132.1, 129.9, 129, 127.7, 127.4, 126.9, 126.5, 126.2, 125.2, 114.5, 39.6

¹H: 7.73 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.69-7.61 (6H, m), 7.48-7.39 (4H, m), 7.39-7.30 (4H, m), 3.44 (3H, s)

Сполука номер 36 (MP: oil). ЯМР розчинник: DMSO

40 ¹³C: 160.8 (d, J = 245 Hz), 158.6, 149.9, 140.2, 139.3 (d, J = 3 Hz), 137.6, 128.6 (d, J = 9 Hz), 126.0, 125.6, 116.7 (d, J = 23.5 Hz), 114.1, 113.0, 55.1, 39.5

¹H: 7.69 (1H, s), 7.57 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.45 (1H, s), 7.41 (2H, m), 7.25 (2H, t, J = 8.7 Hz), 6.90 (2H, d, J = 8.7 Hz), 3.73 (3H, s), 3.40 (3H, s)

Сполука номер 37 (MP: 162-164). ЯМР розчинник: CDCl₃

45 ¹³C: 149.7, 142, 137.6, 137.4, 132.8, 131.7, 128.9, 128.6, 127.5, 127.1, 125.8, 125.1, 123, 113.1, 45.8, 26.6, 23.9

¹H: 7.68 (1H, s), 7.68 (2H, d, J = 7.7 Hz), 7.36 (2H, t, J = 7.7 Hz), 7.28 (1H, s), 7.26 (1H, m), 7.23 (1H, d, J = 7.5 Hz), 7.11 (1H, t, J = 7.6 Hz), 7.03 (1H, t, J = 7.7 Hz), 6.75 (1H, d, J = 8.0 Hz), 3.92 (2H, t, J = 6.6 Hz), 2.87 (2H, t, J = 6.6 Hz), 2.11 (2H, qt, J = 6.6 Hz)

50 Сполука номер 38 (MP: 232-233). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 158.3, 147.9, 141.9, 137.2, 135.4, 129.9, 128.2, 126.9, 126.3, 118.8, 115.8, 114, 39.9

¹H: 8.79 (1H, s), 8.78 (1H, s), 7.67 (1H, s), 7.43 (2H, m, J = 8.6 Hz), 7.41 (4H, m), 7.34 (1H, m), 6.80 (2H, m, J = 8.6 Hz), 3.74 (3H, s)

Сполука номер 39 (MP: 97-98). ЯМР розчинник: CDCl₃

55 ¹³C: 159.9, 149.6, 141.8, 137.6, 137.4, 134.2, 131.8, 129.6, 128.9, 127.1, 125.8, 123, 117.5, 113.7, 113.4, 110.1, 55.3, 45.8, 26.6, 23.9

¹H: 7.68 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.29 (1H, m), 7.28 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.24 (2H, m), 7.23 (1H, m), 7.12 (1H, d t, J = 1.2, 7.5 Hz), 7.04 (1H, d t, J = 1.5, 8.0 Hz), 6.83 (1H, d d d, 1.5, 2.5, 7.5 Hz), 6.75 (1H, d br, J = 8.0 Hz), 3.93 (2H, t, J = 6.7 Hz), 3.84 (3H, s), 2.88 (2H, t, J = 6.6 Hz), 2.12 (2H, qt, J = 6.6 Hz)

60

Сполука номер 40 (MP: 139-141). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 157.6, 149.7, 142.8, 139.9, 137.7, 133.9, 129.9, 129.7, 127.7, 126.2, 115.5, 114.3, 114.2, 111.5, 39.6

¹H: 9.43 (1H, s), 7.68 (1H, s), 7.43 (1H, s), 7.41 (2H, m), 7.35 (2H, m), 7.32 (1H, m), 7.11 (1H, t), 7.03 (1H, br), 7.02 (1H, m), 6.62 (1H, d, J = 8.0 Hz), 3.42 (3H, s)

Сполука номер 41 (MP: 152). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 150.6, 148.8, 144.7, 132.5, 129.6, 129.1, 125.5, 119.6, 119.5, 115.9, 113.4, 48.3, 47.1, 44.8

¹H: 8.21 (1H, d, J = 8.5 Hz), 7.97 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.71 (1H, m, J = 7.8 Hz), 7.55 (1H, m, J = 7.6 Hz), 7.25 (2H, t, J = 7.5 Hz), 7.0 (2H, d, J = 8.2 Hz), 6.83 (1H, t, J = 7.3 Hz), 3.92 (4H, m), 3.33 (4H, m)

Сполука номер 42 (MP: 79-80). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 148.6, 144.7, 140, 132.5, 129.4, 129.1, 128.3, 125.9, 125.4, 119.6, 113.1, 47.6, 45, 41.9, 37.1, 31.6

¹H: 8.18 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.90 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.68 (1H, m, J = 8.0 Hz), 7.53 (1H, m, J = 7.6 Hz), 7.29 (2H, t, J = 7.3 Hz), 7.20 (2H, d, J = 7.3 Hz), 7.19 (1H, t, J = 7.5 Hz), 4.20 (2H, s br), 3.13 (2H, s br), 2.58 (2H, d, J = 7.2 Hz), 1.88 (1H, m), 1.70 (2H, br), 1.34 (2H, m, J = 4.0, 12.5 Hz)

Сполука номер 43 (MP: 105). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 161.7 (d, J = 250.0 Hz), 149.8, 140.5, 138.8 (d, J = 3.6 Hz), 137.7, 133.1, 131.2, 128.8, 127.8 (d, J = 8.4 Hz), 126.3, 117.4 (d, J = 23.2 Hz), 113.6, 40.4

¹H: 7.56 (2H, m, J = 8.8 Hz), 7.49 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.31 (2H, m, J = 8.8 Hz), 7.23 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.17 (2H, m), 7.12 (2H, m), 3.50 (3H, s)

Сполука номер 44 (MP: 145). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 162.3 (d, J = 246.5 Hz), 149.6, 141.1, 137.6, 137.5, 131.8, 129.0 (d, J = 3.0 Hz), 129, 127.1, 126.8 (d, J = 8.0 Hz), 125.9, 123, 115.5 (d, J = 21.5 Hz), 112.8 (d, J = 1.6 Hz), 45.8, 26.6, 23.9

¹H: 7.65 (2H, m), 7.65 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.24 (1H, m), 7.23 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.12 (1H, m), 7.05 (2H, m, J = 8.9 Hz), 7.05 (1H, m, J = 1.2, 7.5 Hz), 6.75 (1H, m, J = 8.1 Hz), 3.92 (2H, t, J = 6.6 Hz), 2.88 (2H, t, J = 6.6 Hz), 2.12 (2H, qt, J = 6.6 Hz)

Сполука номер 45 (MP: 93-96). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 161.7 (d, J = 249.5 Hz), 159.6 (d, J = 249.0 Hz), 150.0, 138.9 (d, J = 3.5 Hz), 137.2, 135.3 (d, J = 2.0 Hz), 128.4 (d, J = 8.3 Hz), 127.8 (d, J = 8.3 Hz), 127.7 (d, J = 4.0 Hz), 124.3 (d, J = 3.2 Hz), 120.6 (d, J = 13.0 Hz), 117.5 (d, J = 16.0 Hz), 117.4 (d, J = 23.0 Hz), 115.5 (d, J = 22.0 Hz), 40.3

¹H: 8.03 (1H, d t, J = 2.0, 7.8 Hz), 7.68 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.30 (1H, d d, J = 1.4, 3.5 Hz), 7.19 (2H, m), 7.16 (1H, m), 7.15 (1H, m), 7.10 (2H, m), 7.04 (1H, d d d, J = 1.4, 7.9, 11.3 Hz), 3.50 (3H, s)

Сполука номер 46 (MP: 90-91). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 158.9 (d, J = 238.0 Hz), 154, 131.7, 130.2 (d, 10.0 Hz), 127.5, 114.2 (d, J = 9.5 Hz), 111.9 (d, J = 26.0 Hz), 106.3 (d, J = 27.5 Hz), 106.2, 66.6, 47.1

¹H: 7.66 (1H, d d, J = 4.5, 9.1 Hz), 7.34 (1H, d, J = 3.5 Hz), 7.25 (1H, d d, J = 2.5, 9.0 Hz), 7.05 (1H, d t, J = 2.5, 9.1 Hz), 6.58 (1H d d, J = 0.7, 3.5 Hz), 3.80 (4H, m, J = 5.0, 6.0 Hz), 3.62 (4H, m, J = 5.0, 6.0 Hz)

Сполука номер 47 (MP: 112-113). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 155.5, 154.4, 130.3, 130, 126.7, 114, 113.2, 106.1, 103.1, 66.7, 55.7, 47.1

¹H: 7.60 (1H, d, J = 8.9 Hz), 7.30 (1H, d, J = 3.5 Hz), 7.06 (1H, d br, J = 2.5 Hz), 6.95 (1H, d d, J = 2.5, 8.9 Hz), 6.55 (1H, d d, J = 0.7, 3.5 Hz), 3.86 (3H, s), 3.79 (4H, m, J = 5.0 Hz), 3.61 (4H, m, J = 5.0 Hz)

Сполука номер 48 (MP: 184). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 162.4, 148.7, 147.4, 147, 144.7, 132.5, 129.6, 128.6, 125.5, 123.3, 119.7, 113.4, 109.9, 108.1, 101.1, 60.5, 51.4, 46.5, 43.8

¹H: 8.20 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.93 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.71 (1H, t, J = 8.0 Hz), 7.54 (1H, t, J = 7.5 Hz), 6.97 (1H, s br), 6.91 (1H, d, J = 8.0 Hz), 6.85 (1H, d d, J = 1.5, 8.0 Hz), 6.02 (2H, s), 3.84 (4H, m), 3.75 (2H, s), 2.80 (4H, m)

Сполука номер 49 (MP: 89). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 158.6, 148.9, 147.6, 144.7, 137.8, 132.5, 129.6, 125.5, 119.6, 113.5, 113.4, 107.3, 46.9, 44.4

¹H: 8.21 (1H, d, J = 8.4 Hz), 8.15 (1H, d d, J = 1.5, 4.8 Hz), 7.97 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.71 (1H, m), 7.58 (1H, m), 7.55 (1H, m), 6.88 (1H, d, J = 8.7 Hz), 6.69 (1H, d d, J = 4.8, 7.1 Hz), 3.88 (4H, m), 3.71 (4H, m)

Сполука номер 50 (MP: 113-114). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 149.2, 144.7, 134.4, 132.6, 129.5, 128.6, 128.6, 126.8, 126.5, 126.3, 125.5, 119.6, 113.5, 48.6, 46.7, 45.5, 42.8, 28.8, 27.2

¹H: 8.21 (1H, d t, J = 0.8, 8.3 Hz), 7.95 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.70 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.54 (1H, d d, J = 1.0, 7.1, 8.3 Hz), 7.24 (4H, br), 4.94 (2H, br), 3.96 (2H, t, J = 6.0 Hz), 3.04 (2H, t, J = 6.0 Hz)

Сполука номер 51 (MP: 188). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 158.6, 150.8, 142.6, 138.8, 138.6, 134.8, 133.7, 130.8, 130, 127.8, 127, 124.1, 117.6, 115.8, 114.9, 113, 47.1, 27.5, 24.9

¹H: 7.76 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.36 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.28 (1H, d br, J = 7.7 Hz), 7.15 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.13 (1H, t), 7.09 (1H, m), 7.07 (1H, m), 7.04 (1H, d t, J = 1.5, 8.0 Hz), 6.79 (1H, d br, J = 8.2 Hz), 6.69 (1H, d d d, J = 1.1, 2.5, 8.0 Hz), 3.91 (2H, t, J = 6.5 Hz), 2.90 (2H, t, J = 6.5 Hz), 2.10 (2H, qt, J = 6.5 Hz)

Сполука номер 52 (MP: 174). ЯМР розчинник: DMSO

13C: 153.5, 152.6, 130.2, 129.1, 127.3, 113.8, 112.9, 105.1, 105, 65.9, 46.5

¹H: 9.09 (1H, s), 7.47 (1H, d, J = 9.0 Hz), 7.44 (1H, d, J = 3.5 Hz), 6.91 (1H, d, J = 2.0 Hz), 6.74 (1H, d d, J = 2.0, 9.0 Hz), 6.50 (1H, d, J = 3.5 Hz), 3.67 (4H, m), 3.47 (4H, m)

Сполука номер 53 (MP: oil). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 150.9, 145.3, 135.7, 133.2, 129.4, 128.8, 128.1 (br), 128.0, 125.2, 119.8, 113.7, 55.3, 53.8, 37.7

¹H: 8.11 (1H, d, J = 8.2 Hz), 8.06 (1H, d, J = 8.2 Hz), 7.63 (1H, t, J = 7.4 Hz), 7.48 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.40 (5H, br), 4.94 (2H, br), 3.31 (3H, br)

Сполука номер 54 (MP: 218-220). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 161.8 (d, J = 251.0 Hz), 159, 146.3, 136.7 (d, J = 4.0 Hz), 136, 134.3, 127.9 (d, J = 9.0 Hz), 127, 117.2 (d, J = 23.0 Hz), 115.9, 115.6, 113.6, 40.1

¹H: 8.89 (1H, m), 7.18 (2H, m), 7.09 (2H, m, J = 8.7 Hz), 7.05 (1H, m), 6.95 (2H, m, J = 8.6 Hz), 6.65 (2H, m, J = 8.7 Hz), 3.35 (3H, s)

Сполука номер 55 (MP: 116). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 149.3, 145.3, 133.2, 129.3, 125.2, 119.8, 113.5, 106.6, 64.6, 46.1, 43.6, 35.3

¹H: 8.09 (1H, d, J = 8.5 Hz), 7.99 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.61 (1H, t, J = 8.1 Hz), 7.46 (1H, t, J = 7.4 Hz), 4.03 (4H, s), 3.98 (4H, br), 1.93 (4H, t, J = 6.0 Hz)

Сполука номер 56 (MP: 134). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 157.1, 154.5, 146.6, 146.5, 131.6, 131.3, 130.3, 129.8, 125.7, 123.4, 121.9, 120.2, 119.7, 118.7, 114

¹H: 9.15 (1H, s), 8.35 (1H, d, J = 8.4 Hz), 8.15 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.69 (1H, t, J = 7.6 Hz), 7.65 (2H, m, J = 9.2 Hz), 7.52 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.37 (2H, t, J = 8.1 Hz), 7.14 (1H, t, J = 7.3 Hz), 7.10 (2H, m, J = 9.2 Hz), 7.05 (2H, m, J = 8.5 Hz)

Сполука номер 57 (MP: 156-157). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 157.2, 146.6, 146.4, 131.6, 130.2, 128.9, 125.6, 122, 120.2, 114.5, 114, 55.5

¹H: 9.06 (1H, s), 8.34 (1H, d, J = 8.5 Hz), 8.14 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.67 (1H, m, J = 7.5 Hz), 7.59 (2H, m, J = 9.1 Hz), 7.51 (1H, m, J = 7.8 Hz), 6.97 (2H, m, J = 9.1 Hz), 3.85 (3H, s)

Сполука номер 58 (MP: 101-102). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 150.4, 145.2, 133.2, 129.1, 125, 119.7, 113.5, 57.1, 32.4, 30.4, 29.7, 25.5, 25.3

¹H: 8.09 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.98 (1H, d, J = 8.5 Hz), 7.60 (1H, m, J = 7.8 Hz), 7.45 (1H, m, J = 7.6 Hz), 4.26 (1H, br), 3.18 (3H, s), 2.0 (2H, d br, J = 11.0 Hz), 1.87 (2H, br), 1.67 (1H, br), 1.63 (2H, m, J = 3.0, 12.3 Hz), 1.43 (2H, m), 1.16 (1H, m)

Сполука номер 59 (MP: 148-150). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 160.6 (d d, J = 11.5, 248.0 Hz), 153.4 (d d, J = 12.0, 249.0 Hz), 146.5, 146.4, 131.5, 130.5, 125.9, 122.7 (d d, J = 2.0, 9.3 Hz), 121.0 (d d, J = 3.7, 11.0 Hz), 120.4, 113.8, 111.6 (d d, J = 4.0, 22.5 Hz), 104.2 (d d, J = 22.5, 27.0 Hz)

¹H: 9.28 (1H, s), 8.32 (1H, m, J = 8.3 Hz), 8.27 (1H, m, J = 6.0, 8.9 Hz), 8.17 (1H, m, J = 8.3 Hz), 7.70 (1H, m, J = 8.2 Hz), 7.53 (1H, m, J = 8.1 Hz), 7.0 (2H, m)

Сполука номер 60 (MP: 142-143). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 146.5, 146.4, 136.1, 131.6, 130.3, 129.4, 125.7, 125.3, 120.2, 120, 114

¹H: 9.19 (1H, s), 8.35 (1H, d, J = 8.3 Hz), 8.15 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.70 (2H, d, J = 8.0 Hz), 7.69 (1H, m), 7.52 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.45 (2H, t, J = 8.0 Hz), 7.25 (1H, t, J = 7.4 Hz)

Сполука номер 61 (MP: 109). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 149.2, 146.3, 136.9, 131.6, 130, 128.9, 128, 127.8, 125.5, 120, 113.9, 44.4

¹H: 8.32 (1H, d, J = 8.4 Hz), 8.11 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.67 (1H, m), 7.65 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.49 (1H, t, J = 8.0 Hz), 7.43 (2H, m), 7.40 (2H, t, J = 7.7 Hz), 7.34 (1H, m), 4.75 (2H, d, J = 6.0 Hz)

Сполука номер 62 (MP: 195-197). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 146.5, 146.3, 134.7, 131.5, 130.4 (2 sig.), 129.4, 125.9, 121.2, 120.3, 113.9

¹H: 9.19 (1H, s), 8.34 (1H, d, J = 8.3 Hz), 8.16 (1H, d, J = 8.5 Hz), 7.70 (1H, t, J = 7.9 Hz), 7.66 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.53 (1H, t, J = 7.5 Hz), 7.42 (2H, d, J = 8.8 Hz)

- Сполука номер 63 (MP: 62). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 150, 145, 142.2, 133.1, 132.8, 129.7, 129.5, 127.3, 125.3, 119.9, 113.3, 40.3
 1H: 8.06 (1H, d, J = 8.5 Hz), 8.02 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.62 (1H, t, J = 7.9 Hz), 7.45 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.30 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.13 (2H, d, J = 8.6 Hz), 3.65 (3H, s)
- 5 Сполука номер 64 (MP: 84-85). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 161.9, 160.9, 149.1, 146.3, 143.5, 129.5, 128, 127.5, 126.1, 122.4, 113.8, 55.2, 40.4
 1H: 8.66 (1H, s), 7.71 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.39 (2H, t, J = 7.9 Hz), 7.32 (1H, t, J = 7.2 Hz), 7.19 (2H, d, J = 7.9 Hz), 6.87 (2H, d, J = 8.5 Hz), 3.82 (3H, s), 3.58 (3H, s)
- 10 Сполука номер 65 (MP: 105-106). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 162.6, 161.2, 148.8, 147.3, 128.3, 122.3, 114.1, 66.6, 55.3, 46.9
 1H: 8.81 (1H, s), 8.06 (2H, d, J = 8.9 Hz), 6.98 (2H, d, J = 8.9 Hz), 3.98 (4H, br), 3.87 (3H, s), 3.83 (4H, m br)
- 15 Сполука номер 66 (MP: 116). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 162.1, 161.5 (d, J = 248.0 Hz), 161, 149.1, 146.5, 139.5 (d, J = 3.5 Hz), 128.1 (d, J = 9.0 Hz), 128, 122.3, 116.3 (d, J = 22.5 Hz), 113.9, 55.3, 40.7
 1H: 8.74 (1H, s), 7.72 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.20 (2H, m, J = 5.0, 9.0 Hz), 7.09 (2H, t, J = 8.8 Hz), 6.89 (2H, d, J = 8.9 Hz), 3.83 (3H, s), 3.56 (3H, s)
- 20 Сполука номер 67 (MP: 91). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 161.2, 148.8, 146.5, 143.3, 135.8, 129.5, 128.7, 128.3, 127.8, 127.7, 126.1, 40.5
 1H: 8.69 (1H, s), 7.69 (2H, m, J = 8.3 Hz), 7.39 (2H, t, J = 7.8 Hz), 7.32 (1H, m), 7.31 (2H, m, J = 8.3 Hz), 7.19 (2H, d, J = 8.0 Hz), 3.58 (3H, s)
- 25 Сполука номер 68 (MP: 120-121). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 161.9, 148.5, 147.6, 136.2, 129, 128.2, 128.1, 66.6, 47.5, 46
 1H: 8.84 (1H, s), 8.06 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.44 (2H, d, J = 8.7 Hz), 3.98 (4H, br), 3.84 (4H, s br)
- 30 Сполука номер 69 (MP: 127-128). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 161.6 (d, J = 248.5 Hz), 161.4, 148.8, 146.7, 139.3 (d, J = 3.3 Hz), 135.9, 128.8, 128.2, 128.1 (d, J = 8.5 Hz), 127.8, 116.3 (d, J = 23.0 Hz), 40.7
 1H: 8.76 (1H, s), 7.71 (2H, d, J = 7.0 Hz), 7.35 (2H, d, J = 8.0 Hz), 7.19 (2H, m), 7.09 (2H, t, J = 8.5 Hz), 3.56 (3H, s)
- 35 Сполука номер 70 (MP: 91-92). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 161.8 (d d, J = 11.5, 251.0 Hz), 157.7 (d d, J = 12.5, 252.0 Hz), 150.1, 144.9, 132.7, 129.6, 129.3 (d d, J = 1.5, 10.0 Hz), 127.7 (d d, J = 5.0, 12.0 Hz), 125.4, 119.9, 113.5, 112.1 (d d, J = 4.0, 23.0 Hz), 105.1 (d d, J = 24.0, 26.5 Hz), 39.7
 1H: 8.10 (1H, d, J = 8.4 Hz), 8.01 (1H, d, J = 8.1 Hz), 7.63 (1H, m, J = 7.8 Hz), 7.45 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.30 (1H, m), 6.88 (1H, m), 6.84 (1H, m), 3.60 (3H, s)
- 40 Сполука номер 71 (MP: 65-66). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 146.1, 145.3, 132.8, 129.4, 125.5, 119.8, 114.4, 82.5, 79.6, 62.2, 23
 1H: 8.23 (1H, d, J = 8.4 Hz), 8.10 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.62 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.48 (1H, t, J = 7.7 Hz), 5.54 (2H, s), 3.90 (2H, s), 1.69 (6H, s)
- 45 Сполука номер 72 (MP: 85). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 152, 142.2, 138.9, 130.1, 124.2, 122.8, 119.8, 115.2, 67.1, 47.2
 1H: 8.09 (1H, d, J = 8.6 Hz), 7.69 (1H, d, J = 8.2 Hz), 7.58 (1H, t, J = 7.5 Hz), 7.36 (1H, t, J = 7.5 Hz), 3.87 (4H, br), 3.80 (4H, br)
- 50 Сполука номер 73 (MP: 80). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 162.8, 148.7, 147.4, 130.2, 129.6, 128.7, 126.7, 66.6, 47.3, 46.2
 1H: 8.85 (1H, s), 8.12 (2H, m), 7.47 (3H, m), 4.02 (4H, br), 3.84 (4H, m)
- 55 Сполука номер 74 (MP: 114). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 162.4, 162.0 (d d, J = 15.0, 251.0 Hz), 158.0 (d d, J = 13.0, 252.0 Hz), 148.9, 146.7, 130.0, 129.6, 129.2 (d d, J = 2.0, 10.0 Hz), 128.6, 127.6 (m, J = 13.0 Hz), 126.5, 111.8 (d d, J = 4.0, 22.5 Hz), 104.8 (t, J = 25.0 Hz), 39.9
 1H: 8.86 (1H, s), 7.74 (2H, br), 7.38 (3H, m br), 7.28 (1H, m), 6.95 (1H, m), 6.92 (1H, m), 3.52 (3H, s)
- 60 Сполука номер 75 (MP: oil). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 150.5, 145.2, 133.2, 129.2, 125.1, 119.7, 113.6, 51.7, 50.4, 38.0, 35.7, 30.1, 29.0, 19.8, 13.8
 1H: 8.10 (1H, d, J = 8.4 Hz), 8.0 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.59 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.45 (1H, t, J = 7.6 Hz), 3.67 (2H, br), 3.31 (3H, m br), 1.78 (2H, m), 1.45-1.30 (2H, m br), 1.0-0.9 (3H, m br)
- Сполука номер 76 (MP: 130). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 150.3, 150.1, 144.9, 135.3, 132.8, 129.2, 126.8, 125, 119.8, 115.8, 113.2, 66.7, 48.7, 40.5
 1H: 8.04 (1H, d, J = 8.4 Hz), 8.0 (1H, d, J = 8.2 Hz), 7.60 (1H, t, J = 7.9 Hz), 7.42 (1H, t, J = 7.6 Hz), 7.08 (2H, d, J = 7.7 Hz), 6.80 (2H, d, J = 8.7 Hz), 3.83 (4H, m), 3.63 (3H, s), 3.13 (4H, m)

Сполука номер 77 (MP: 163-138). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 161.2, 150.1, 145.2, 145, 132.8, 129.3, 125.1, 119.8, 113.2, 104.4, 99.1, 55.4, 40.3

¹H: 8.05 (1H, d, J = 8.7 Hz), 8.02 (1H, d, J = 8.9 Hz), 7.61 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.44 (1H, t, J = 7.7 Hz), 6.34 (1H, t, J = 2.0 Hz), 6.31 (2H, d, J = 2.0 Hz), 3.70 (6H, s), 3.65 (3H, s)

5 Сполука номер 78 (MP: 155-157). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 163.8 (d d, J = 12.0, 253.0 Hz), 160.8 (d d, J = 12.0, 258.0 Hz), 158.4 (d, J = 6.0 Hz), 148.4, 146.9, 131.5 (d d, J = 4.0, 10.0 Hz), 114.3 (d d, J = 4.0, 11.5 Hz), 111.8 (d d, J = 4.0, 21.5 Hz), 105.0 (t, J = 25.0 Hz), 66.6, 47.9, 45.9

10 ¹H: 8.87 (1H, s), 8.12 (1H, m, J = 6.7, 8.5 Hz), 7.0 (1H, m), 6.95 (1H, m), 4.10 (4H, br), 3.83 (4H, s br)

Сполука номер 79 (MP: 86). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 163.8 (d d, J = 12.0, 253.0 Hz), 160.8 (d d, J = 12.5, 259.0 Hz), 158.2 (d, J = 5.5 Hz), 148.5, 146.7, 139.7, 131.5 (d d, J = 4.0, 10.0 Hz), 129, 128.3, 126.1, 114.6 (d d, J = 4.0, 11.0 Hz), 111.7 (d d, J = 4.5, 21.0 Hz), 105.0 (t, J = 26.0 Hz), 47.7, 46.2, 42.8, 38, 31.9

15 ¹H: 8.83 (1H, s), 8.13 (1H, m, J = 6.8, 8.3 Hz), 7.31 (2H, t, J = 7.5 Hz), 7.23 (1H, m, J = 7.3 Hz), 7.17 (2H, d, J = 7.8 Hz), 7.0 (1H, m), 6.96 (1H, m), 4.62 (2H, m br), 3.02 (2H, br), 2.61 (2H, d, J = 6.9 Hz), 1.87 (1H, m), 1.81 (2H, d br, J = 14.0 Hz), 1.43 (2H, m, J = 4.0, 13.0 Hz)

Сполука номер 80 (MP: 91). ЯМР розчинник: CDCl₃

20 ¹³C: 163.7 (d d, J = 12, 253.5 Hz), 162.1 (d d, J = 11.0, 250.5 Hz), 160.7 (d d, J = 12.0, 260.0 Hz), 158.2, 157.9 (d d, J = 12.5, 251.5 Hz), 148.8, 146.2, 131.2 (d d, J = 4.0, 10.0 Hz), 129.0 (d br, J = 10.5 Hz), 126.4 (d d, J = 4.5, 13.0 Hz), 114.2 (d d, J = 4.0, 12.0 Hz), 111.8 (d d, J = 3.0, 22.5 Hz), 111.6 (d d, J = 4.0, 21.5 Hz), 104.9 (t, J = 25.3 Hz, 2 Carbons), 40.0

¹H: 8.89 (1H, s), 7.84 (1H, br), 7.26 (1H, m), 6.98-6.77 (4H, m), 3.51 (3H, s)

Сполука номер 81 (MP: 99-100). ЯМР розчинник: CDCl₃

25 ¹³C: 150.4, 149.4, 144.9, 132.9, 132.2, 129, 126.7, 124.9, 119.7, 113.1, 112.5, 40.5, 40.4

¹H: 8.03 (1H, d, J = 8.4 Hz), 8.0 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.59 (1H, m, J = 7.8 Hz), 7.41 (1H, t, 7.6 Hz), 7.03 (2H, br), 6.59 (2H, d br, J = 8.0 Hz), 3.62 (3H, s), 2.92 (6H, s)

Сполука номер 82 (MP: 179-182 (dec)). ЯМР розчинник: DMSO

30 ¹³C: 148.6, 144.7, 132.5, 129.6, 125.5, 119.7, 113.4, 61.7, 49, 46, 43.5, 25.8, 22.5, 21.6

¹H: 10.52 (1H, s br), 8.20 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.93 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.71 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.55 (1H, t, J = 7.7 Hz), 4.43 (2H, d br, J = 13.5 Hz), 3.52 (1H, m), 3.41 (2H, d br, J = 11.5 Hz), 3.23 (2H, t br), 2.94 (2H, m, J = 12.0 Hz), 2.25 (2H, br), 1.88 (2H, br), 1.86 (4H, m), 1.71 (1H, m, J = 14.0 Hz), 1.40 (1H, m)

Сполука номер 83 (MP: 259-261 (dec)). ЯМР розчинник: DMSO

35 ¹³C: 148.8, 144.8, 132.5, 129.8, 125.7, 119.7, 113.6, 51.9, 43.3, 42

¹H: 11.59 (1H, s br), 8.22 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.96 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.73 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.56 (1H, t, J = 7.6 Hz), 4.47 (2H, m), 3.71 (2H, m), 3.52 (2H, m), 3.29 (2H, m), 2.81 (3H, s)

Сполука номер 84 (MP: 92). ЯМР розчинник: CDCl₃

40 ¹³C: 155.9, 150.4, 148.7, 145.2, 138.4, 132.6, 129.5, 125.3, 121.8, 119.9, 119.5, 113.5, 37.8

¹H: 8.32 (1H, d d, J = 1.6, 5.0 Hz), 8.12 (1H, d, J = 8.3 Hz), 8.02 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.69 (1H, d t, J = 1.9, 7.9 Hz), 7.63 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.45 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.18 (1H, d, J = 8.1 Hz), 7.15 (1H, d d, J = 5.0, 7.5 Hz), 3.74 (3H, s)

Сполука номер 85 (MP: 66). ЯМР розчинник: CDCl₃

45 ¹³C: 149.2, 146.2, 141.8, 131.6, 129.9, 128.4 (2 sig.), 125.9, 125.4, 120, 113.9, 40.3, 35.4, 29.1, 28.5

¹H: 8.29 (1H, m, J = 8.3 Hz), 8.10 (1H, m, J = 8.4 Hz), 7.63 (1H, m, J = 1.0, 7.1 Hz), 7.47 (1H, m, J = 1.0, 7.1 Hz), 7.33 (1H, br), 7.30 (2H, m), 7.20 (2H, m), 7.19 (1H, m), 3.58 (2H, m), 2.71 (2H, m, J = 7.0 Hz), 1.77 (4H, m)

Сполука номер 86 (MP: 60). ЯМР розчинник: CDCl₃

50 ¹³C: 149.2, 146.3, 131.6, 129.9, 125.3, 119.9, 114, 40.5, 31.9, 29.6, 29.6, 29.5, 29.5, 29.3, 29.2, 26.8, 22.7, 14.1

¹H: 8.29 (1H, d, J = 8.3 Hz), 8.10 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.63 (1H, m, J = 1.0, 7.1 Hz), 7.47 (1H, m, J = 1.0, 7.1 Hz), 7.33 (1H, t br, J = 5.0 Hz), 3.55 (2H, m), 1.71 (2H, m), 1.50-1.15 (18H, m), 0.88 (3H, t, J = 7.1 Hz)

55 Сполука номер 87 (MP: 73). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 148.4, 146.3, 131.7, 129.8, 125.3, 119.9, 114, 49.8, 33, 25.3, 24.7

¹H: 8.28 (1H, d, J = 8.4 Hz), 8.09 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.63 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.47 (1H, t, J = 7.6 Hz), 7.21 (1H, d, J = 7.5 Hz), 3.95 (1H, m), 2.11 (2H, m), 1.83 (2H, m), 1.69 (1H, m), 1.43 (4H, m), 1.29 (1H, m)

60 Сполука номер 88 (MP: 186-188). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 146.5, 146.4, 140.2, 138.2, 135.3, 131.6, 130.3, 128.8, 128, 127.4, 126.9, 125.8, 120.3, 120.2, 114

¹H: 9.24 (1H, s), 8.37 (1H, d, J = 8.3 Hz), 8.16 (1H, d, J = 8.5 Hz), 7.78 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.69 (1H, m), 7.68 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.62 (2H, d, J = 7.7 Hz), 7.53 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.47 (2H, t, J = 7.7 Hz), 7.37 (1H, t, J = 7.6 Hz)

5

Сполука номер 89 (MP: 167 (dec)). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 148.1, 146.8, 129.3, 129, 128.8, 125.9, 120.9, 66.6, 48.5, 45.8

¹H: 8.38 (1H, s), 7.88 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.47 (2H, t, J = 7.7 Hz), 7.39 (1H, m, J = 7.5 Hz), 4.04 (2H, m br), 3.84 (6H, m)

10

Сполука номер 90 (MP: 230-231 (dec)). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 148.6, 144.7, 132.5, 129.6, 125.6, 119.7, 113.4, 63.3, 61.9, 48.3, 45.6, 43.6, 25.8

¹H: 11.53 (1H, s br), 8.20 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.93 (1H, d, J = 8.2 Hz), 7.71 (1H, m, J = 7.5 Hz), 7.55 (1H, m, J = 7.6 Hz), 4.44 (2H, d br, J = 12.5 Hz), 3.98 (2H, d br, J = 11.5 Hz), 3.90 (2H, t, J = 12.0 Hz), 3.54 (1H, m), 3.45 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 3.22 (2H, br), 3.11 (2H, m), 2.28 (2H, br), 1.90 (2H, m, J = 4.0, 12.3 Hz)

15

Сполука номер 91 (MP: 143). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 152.5, 148.7, 145.1, 144.7, 137.5, 132.6, 129.6, 128.4, 127.8, 127.6, 125.5, 119.7, 118, 115.4, 113.4, 69.4, 49.8, 47.5, 44.9

¹H: 8.21 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.96 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.71 (1H, t, J = 7.6 Hz), 7.55 (1H, t, J = 7.5 Hz), 7.43 (2H, d, J = 8.0 Hz), 7.38 (2H, t, J = 7.7 Hz), 7.31 (1H, m, J = 7.1 Hz), 6.94 (4H, m), 5.03 (2H, s), 3.90 (4H, m), 3.19 (4H, br)

20

Сполука номер 92 (MP: 218-220 (dec)). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 148.7, 144.8, 132.5, 129.6, 125.5, 119.7, 113.4, 60.2, 50.5, 45.7, 43.2, 27.9, 22.7

¹H: 11.24 (1H, s), 8.20 (1H, d, J = 8.2 Hz), 7.93 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.70 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.54 (1H, t, J = 7.4 Hz), 4.40 (2H, d br, J = 13.0 Hz), 3.49 (2H, br), 3.45 (1H, m), 3.22 (2H, m br), 3.08 (2H, br), 2.20 (2H, br), 1.96 (4H, m), 1.89 (2H, m)

25

Сполука номер 93 (MP: 254-256 (dec)). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 148.8, 144.8, 132.5, 131.5, 129.8, 129.6, 129.4, 128.8, 125.7, 119.7, 113.6, 58.6, 50.1, 43.6, 42.1

¹H: 11.97 (1H, s br), 8.21 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.95 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.67 (2H, m), 7.56 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.47 (3H, m), 7.33 (1H, t, J = 7.6 Hz), 4.47 (2H, d br, J = 15.0 Hz), 4.39 (2H, s), 3.79 (2H, m), 3.43 (2H, m), 3.28 (2H, m)

30

Сполука номер 94 (MP: 109-111). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 149.4, 145.4, 144.7, 133.2, 129.3, 128.6, 126.8, 126.6, 125.2, 119.8, 113.5, 48.8, 46.1, 42.6, 33.2

35

¹H: 8.12 (1H, m, J = 8.3 Hz), 8.02 (1H, m, J = 8.4 Hz), 7.63 (1H, m, J = 1.0, 7.1 Hz), 7.47 (1H, m, J = 1.0, 7.1 Hz), 7.35 (2H, m, J = 7.7 Hz), 7.27 (2H, m), 7.25 (1H, m), 4.70 (2H, d br, J = 13.5 Hz), 3.29 (2H, br), 2.89 (1H, m), 2.01 (4H, m)

Сполука номер 95 (MP: 157). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 150.2, 145.9, 141.5, 136.4, 133.2, 131.8, 131.1, 131, 129.9, 128.7, 118.6, 118, 114.4, 113.2, 58.6, 57.2, 32.6, 30.8, 29.7, 25.5, 25.3

40

¹H: 8.25 (1H, br), 8.09 (1H, d, J = 8.6 Hz), 7.90 (1H, d br, J = 7.9 Hz), 7.80 (1H, d d, J = 1.6, 8.7 Hz), 7.70 (1H, d, J = 7.6 Hz), 7.62 (1H, t, J = 7.7 Hz), 4.29 (1H, m br), 3.21 (3H, s), 2.02 (2H, m br), 1.90 (2H, m br), 1.73 (1H, br), 1.64 (2H, m), 1.46 (2H, m), 1.17 (1H, m)

45

Сполука номер 96 (MP: 146-147). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 162.6 (d, J = 247.0 Hz), 150.3, 146, 137.9, 136.3 (d, J = 3.0 Hz), 132.7, 129.1 (d, J = 8.4 Hz), 129.0, 117.4, 115.9 (d, J = 22.0 Hz), 113.8, 58.6, 57.2, 32.7, 30.4, 29.6, 25.5, 25.3

¹H: 8.21 (1H, br), 8.03 (1H, d, J = 8.5 Hz), 7.80 (1H, d d, J = 1.5, 8.5 Hz), 7.62 (2H, m d, J = 5.3, 8.7 Hz), 7.19 (2H, t, J = 8.5 Hz), 4.27 (1H, m br), 3.20 (3H, s br), 2.01 (2H, m), 1.89 (2H, m), 1.73 (1H, m), 1.64 (2H, m), 1.44 (2H, m), 1.17 (1H, m)

50

Сполука номер 97 (MP: 158). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 149.9, 146.3, 132.4, 132.3, 122.4, 118.3, 114.9, 58.8, 57.1, 32.6, 30.9, 29.5, 25.5, 25.3

¹H: 8.25 (1H, br, J = 2.0 Hz), 7.89 (1H, d, J = 8.8 Hz), 7.68 (1H, d d, J = 2.0, 8.8 Hz), 4.27 (1H, m br), 3.18 (3H, s), 1.98 (2H, m), 1.89 (2H, m), 1.70 (1H, m), 1.61 (2H, m), 1.45 (2H, m), 1.17 (1H, m)

55

Сполука номер 98 (MP: 93-94). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 148.8, 145.1, 133, 129.2, 125.2, 119.7, 114.3, 50.3, 48.5, 26.6, 24

¹H: 8.18 (1H, m, J = 8.4 Hz), 8.09 (1H, m, J = 8.3 Hz), 7.60 (1H, m, J = 1.0, 7.0 Hz), 7.46 (1H, m, J = 1.0, 7.0 Hz), 4.08 (2H, m), 3.81 (2H, m), 2.04 (4H, m)

Сполука номер 99 (MP: 139-141). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 154.7, 149.4, 145.4, 133.2, 130.7, 130.1, 129.3, 125.2, 119.8, 116.2, 113.5, 70.9, 44.4, 41.9, 30.4, 20.5

¹H: 8.11 (1H, d, J = 8.3 Hz), 8.0 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.62 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.46 (1H, t, J = 7.6 Hz), 7.12 (2H, m, J = 8.5 Hz), 6.87 (2H, m, J = 8.5 Hz), 4.66 (1H, m), 4.0 (4H, m), 2.31 (3H, s), 2.10 (4H, m)

5

Сполука номер 100 (MP: 80). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 149.3, 145.3, 142.1, 133.2, 129.2, 128.4, 128.3, 125.8, 125.1, 119.8, 113.4, 48.4, 45.8, 38, 35.4, 32.8, 32.2

¹H: 8.10 (1H, d, J = 8.2 Hz), 7.98 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.61 (1H, t, J = 8.0 Hz), 7.46 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.31 (2H, t, J = 7.1 Hz), 7.21 (1H, m), 7.20 (2H, d, J = 7.9 Hz), 4.53 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 3.15 (2H, br), 2.69 (2H, m, J = 7.5 Hz), 1.93 (2H, br), 1.49 (2H, br), 1.67 (3H, m)

10

Сполука номер 101 (MP: 134). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 150.7, 150.5, 142.6, 137, 132.8, 129.3, 128.7, 127.7, 125.2, 121.1, 116.9, 112.9, 49.5, 46.5

¹H: 7.91 (1H, s), 7.82 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.51 (1H, s), 7.42 (2H, t, J = 7.8 Hz), 7.32 (3H, m), 6.96 (3H, m), 3.83 (4H, m, J = 5.0 Hz), 3.29 (4H, m, J = 5.0 Hz)

15

Сполука номер 102 (MP: 122). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 150.6, 142.4, 137.1, 137, 132.8, 129.1, 128.7, 128.4, 127.6, 127.4, 125.1, 113, 62.7, 52.5, 46.5

¹H: 7.91 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.80 (2H, d, J = 8.0 Hz), 7.47 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.41 (2H, t, J = 7.8 Hz), 7.34 (4H, m), 7.32 (1H, m), 7.29 (1H, m), 3.67 (4H, m, J = 5.0 Hz), 3.58 (2H, s), 2.55 (4H, m, J = 5.0 Hz)

20

Сполука номер 103 (MP: 154). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 151.3, 142.1, 136.9, 133, 128.7, 127.5, 125.1, 113.2, 57.5, 31.3, 30, 25.4, 25.2

¹H: 7.92 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.81 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.50 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.41 (2H, t, J = 8.0 Hz), 7.29 (1H, t, J = 7.5 Hz), 3.96 (1H, m), 2.99 (3H, s), 1.86 (4H, m), 1.70 (1H, d br, J = 13.5 Hz), 1.58 (2H, m, J = 3.5, 13.1 Hz), 1.38 (2H, m), 1.13 (1H, t q, J = 3.5, 13.0 Hz)

25

Сполука номер 104 (MP: 83). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 150, 145.2, 133.3, 129, 125, 119.7, 113.5, 58.9, 40, 31.2, 25.7, 25.3, 15.1

¹H: 8.10 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.97 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.59 (1H, m, J = 1.0, 7.1 Hz), 7.45 (1H, m, J = 1.0, 7.1 Hz), 4.17 (1H, m), 3.63 (2H, m, J = 6.6 Hz), 2.02 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 1.85 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 1.69 (3H, br), 1.31 (5H, br), 1.17 (1H, m)

30

Сполука номер 105 (MP: 204). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 149.2, 145.3, 133, 129.3, 125.2, 119.7, 113.4, 53.5, 53.1, 48, 45.4, 33.5, 31.7 (2 sig.), 23.3

¹H: 12.38 (1H, s br), 8.07 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.94 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.59 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.44 (1H, t, J = 7.5 Hz), 4.52 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 3.79 (2H, br), 3.15 (2H, br), 3.12 (2H, m), 2.79 (2H, m br), 2.24 (2H, m br), 2.08 (2H, m br), 1.90 (5H, m br), 1.50 (2H, m br)

35

Сполука номер 106 (MP: oil). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 162.9 (d, J = 248 Hz), 150.5, 144.6, 141.7, 136.3 (d, J = 3 Hz), 133.9, 129.4 (d, J = 8 Hz), 125.1, 119.9, 115.8 (d, J = 21.5 Hz), 111.5, 58.9 (br), 57.0 (br), 32.6 (br), 30.6 (br), 29.7 (br), 25.5, 25.3

40

¹H: 8.12 (2H, m), 7.66-7.62 (3H, m), 7.17 (2H, m, J = 8.7 Hz), 4.28 (1H, br), 3.19 (3H, s br), 2.0 (2H, m br), 1.88 (2H, br), 1.76-1.56 (3H, br), 1.44 (2H, br), 1.18 (1H, m br)

Сполука номер 107 (MP: 232-233). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 167.2, 149.6, 145.5, 139.7, 136.9, 132.3, 131.8, 131.7, 129.5, 128.9, 128.6, 127.9, 117.3, 113.9, 56.9, 32.5, 30.2, 29, 25.2, 24.8

45

¹H: 13.19 (1H, s br), 8.49 (1H, s), 8.29 (1H, s), 8.06 (1H, m), 7.98 (3H, m), 7.65 (1H, t, J = 7.8 Hz), 4.09 (1H, m br), 3.08 (3H, s), 1.88 (2H, m), 1.80 (2H, m), 1.67 (2H, m), 1.60 (1H, m), 1.33 (2H, m), 1.16 (1H, br)

Сполука номер 108 (MP: 183). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 169.2, 150.3, 145.9, 140.8, 137.7, 134.1, 132.9, 131, 129.3, 129, 126.7, 126.3, 117.7, 114, 58.8, 57.1, 32.6, 30.7, 29.6, 25.5, 25.3

¹H: 8.27 (1H, s br), 8.15 (1H, s br), 8.04 (1H, d, J = 8.5 Hz), 7.85 (1H, br), 7.83 (1H, m), 7.81 (1H, m), 7.56 (1H, t, J = 7.8 Hz), 6.42 (1H, s br), 6.12 (1H, s b), 4.30 (1H, br), 3.22 (3H, s), 2.03 (2H, m), 1.91 (2H, m), 1.76 (1H, m), 1.67 (2H, m), 1.47 (2H, m), 1.20 (1H, m)

50

Сполука номер 109 (MP: 209-210). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 167.7, 149.7, 144.2, 140.9, 139.3, 135.2, 133.4, 130.3, 129.3, 127.4, 126.5, 125.2, 120, 111, 58.3, 57.2, 32.3, 29.6, 28.8, 25.2, 24.8

55

¹H: 8.28 (1H, d, J = 8.6 Hz), 8.26 (1H, s br), 8.22 (1H, s br), 8.17 (1H, br), 7.94 (2H, m), 7.91 (1H, m), 7.61 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.53 (1H, s br), 4.03 (1H, br), 3.09 (3H, s), 1.89 (2H, m), 1.80 (2H, m), 1.60 (1H, m), 1.36 (2H, m), 1.67 (2H, m), 1.16 (1H, m)

60

Сполука номер 110 (MP: 66-67). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 149.3, 145.3, 142.3, 133.1, 129.2, 128.3, 128.3, 125.7, 125.1, 119.8, 113.4, 48.4, 45.8, 36, 35.9, 35.8, 32.2, 28.5

¹H: 8.10 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.97 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.60 (1H, t, J = 7.5 Hz), 7.45 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.30 (2H, t, J = 7.8 Hz), 7.20 (1H, m), 7.19 (2H, d, J = 7.8 Hz), 4.51 (2H, m, br), 3.14 (2H, br), 2.64 (2H, t, J = 7.6 Hz), 1.86 (2H, m), 1.69 (2H, m), 1.64 (1H, m), 1.43 (2H, m), 1.38 (2H, m)

Сполука номер 111 (MP: 83). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 161.4, 150.6, 148.4, 148.1, 130.2, 129.7, 129.1, 129, 126.4, 119.5, 115.9, 48.2, 45.7

¹H: 9.17 (1H, s), 8.09 (2H, m, J = 1.5, 7.2 Hz), 7.53 (3H, m), 7.25 (2H, t, J = 7.6 Hz), 6.99 (2H, d, J = 8.1 Hz), 6.83 (1H, t, J = 7.2 Hz), 3.90 (4H, br), 3.30 (4H, m)

Сполука номер 112 (MP: 203). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 167.6, 149.9, 140.1, 137.9, 137.7, 136, 132.6, 128.9, 128.3, 128, 127.1, 124.4, 115.6, 61.7, 52.1, 45.9

¹H: 8.13 (1H, d, J = 1.2 Hz), 8.09 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.98 (1H, s br), 7.91 (4H, m br), 7.36 (1H, s br), 7.33 (4H, m), 7.26 (1H, m), 3.56 (4H, m, J = 5.5 Hz), 3.53 (2H, s), 2.47 (4H, m, J = 5.5 Hz)

Сполука номер 113 (MP: 231-233 (dec)). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 167.6, 149.7, 142.8, 139.3, 138, 135.7, 132.6, 129.9, 128, 127.7, 126.2, 124.2, 115.6, 39.6

¹H: 7.95 (1H, s br), 7.84 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.74 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.72 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.60 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.41 (2H, t, J = 7.6 Hz), 7.35 (1H, s br), 7.35 (2H, m), 7.31 (1H, t, J = 7.1 Hz), 3.43 (3H, s)

Сполука номер 114 (MP: 135-136). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 153.8, 149.8, 148.7, 144.7, 132.6, 129.5, 125.4, 122.4, 119.6, 113.3, 47.7, 45.2, 40.5, 31.8

¹H: 8.50 (2H, m, J = 5.0 Hz), 8.20 (1H, d, J = 8.5 Hz), 7.95 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.71 (1H, t, J = 7.9 Hz), 7.54 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.34 (2H, m, J = 5.0 Hz), 4.39 (2H, br), 3.32 (2H, br), 2.96 (1H, m), 1.95 (2H, br), 1.82 (2H, m, J = 4.0, 12.3 Hz)

Сполука номер 115 (MP: oil). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 150.5, 145.2, 138.1, 133.2, 129.1, 128.7, 128.6, 126.6, 125.1, 119.7, 113.8, 53.1 (br), 38.2 (very broad), 34.3 (br)

¹H: 8.08 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.91 (1H, br), 7.57 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.44 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.23 (5H, br), 3.96 (2H, br), 3.31 (3H, s), 3.10 (2H, m, J = 7.2 Hz)

Сполука номер 116 (MP: 147). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 181.1, 166.4, 152.1, 149.4, 148.6, 145.4, 134.7, 133.1, 129.5, 125.3, 123.7, 122.9, 119.9, 113.5, 46.9, 44.8, 34, 29.2

¹H: 9.32 (1H, d, J = 1.7 Hz), 8.76 (1H, d d, J = 1.6, 4.9 Hz), 8.37 (1H, d t, J = 2.0, 8.0 Hz), 8.12 (1H, d, J = 8.4 Hz), 8.0 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.63 (1H, t, J = 7.9 Hz), 7.48 (1H, t, J = 7.9 Hz), 7.45 (1H, d d, J = 4.9, 8.0 Hz), 4.56 (2H, d br), 3.57 (2H, br), 3.46 (1H, m), 2.37 (2H, m), 2.27 (2H, m)

Сполука номер 117 (MP: 138-139). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 155.4, 149.4, 145.4, 133.1, 129.6, 129.4, 126.2, 125.2, 119.9, 117.4, 113.5, 71.2, 44.4, 42, 30.4

¹H: 8.11 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.99 (1H, d, J = 8.2 Hz), 7.62 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.47 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.27 (2H, m, J = 9.0 Hz), 6.89 (2H, m, J = 9.0 Hz), 4.67 (1H, m), 4.01 (4H, s br), 2.15 (2H, m), 2.06 (2H, m)

Сполука номер 118 (MP: oil). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 150.5, 142.5, 141.0, 133.2, 129.2, 128.5, 128.2, 126.1, 125.1, 119.8, 113.6, 51.4, 50.4, 38.1, 35.8, 32.9, 29.6, 28.6

¹H: 8.10 (1H, d, J = 8.5 Hz), 8.01 (1H, d, J = 8.2 Hz), 7.61 (1H, t, J = 7.9 Hz), 7.46 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.24 (5H, br), 3.71 (2H, m, J = 7.2 Hz), 3.31 (3H, br), 2.71 (2H, br), 2.15 (2H, m, J = 7.5 Hz)

Сполука номер 119 (MP: oil). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 160.1, 151.0, 145.3, 137.4, 133.3, 129.9, 129.3, 125.2, 120.3, 119.9, 113.7 (2 sig.), 113.4, 55.3, 54.2, 37.5

¹H: 8.11 (1H, d, J = 8.2 Hz), 8.06 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.62 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.47 (1H, t, J = 7.5 Hz), 7.30 (1H, t, J = 7.7 Hz), 6.96 (2H, br), 6.87 (1H, d, J = 8.2), 4.89 (2H, br), 3.81 (3H, s), 3.29 (3H, br)

Сполука номер 120 (MP: 70-71). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 156.9, 149.4, 145.4, 133.2, 129.7, 129.3, 125.2, 121.3, 119.8, 116.1, 113.5, 70.6, 44.4, 42, 30.4

¹H: 8.11 (1H, d, J = 8.3 Hz), 8.0 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.62 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.47 (1H, t, J = 7.6 Hz), 7.33 (2H, m, J = 8.0 Hz), 7.0 (1H, t, J = 7.4 Hz), 6.97 (2H, d, J = 8.3 Hz), 4.72 (1H, m), 4.01 (4H, s br), 2.16 (2H, m), 2.10 (2H, m)

Сполука номер 121 (MP: 115). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 162.1 (d, J = 245.0 Hz), 149.3, 145.3, 133.1, 133.1, 130.6 (d, J = 8.0 Hz), 129.4, 125.2, 119.8, 115.2 (d, J = 21.0 Hz), 113.5, 61.9, 52.7, 48.1, 45.2

¹H: 8.10 (1H, m, J = 8.3 Hz), 7.99 (1H, m, J = 8.4 Hz), 7.61 (1H, m, J = 1.0, 7.0, 8.2 Hz), 7.46 (1H, m, J = 1.0, 7.0, 8.2 Hz), 7.32 (2H, m d, J = 5.6, 8.7 Hz), 7.06 (2H, m t, J = 8.3 Hz), 3.93 (4H, s br), 3.56 (2H, s), 2.63 (4H, s br)

Сполука номер 122 (MP: 188 (dec)). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 148.6, 144.7, 132.5, 129.5, 125.4, 119.6, 113.3, 59.7, 52.9, 46.5, 45.6, 44.1, 42.1, 27.9

¹H: 10.72 (1H, br), 8.19 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.91 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.70 (1H, t, J = 7.9 Hz), 7.53 (1H, t, J = 7.8 Hz), 4.28 (2H, s br), 3.21 (4H, m br), 2.96 (4H, m br), 2.68 (6H, m), 1.90 (2H, m br), 1.57 (2H, m br)

Сполука номер 123 (MP: oil). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 151.0, 145.2, 137.9, 134.7, 133.2, 130.1, 129.5, 128.2, 127.9, 126.2, 125.3, 119.9, 113.7, 54.8, 53.4, 37.8

¹H: 8.11 (1H, d, J = 8.5 Hz), 8.07 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.63 (1H, d d d, J = 1, 7.1, 8.2 Hz), 7.48 (1H, d d d, J = 1, 7.0, 8.2 Hz), 7.42 (1H, br), 7.32 (3H, br), 4.90 (2H, br), 3.28 (3H, br)

Сполука номер 124 (MP: 258-259 (dec)). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 161.6, 148.4, 148.3, 131.5, 130.3, 129.6, 129.5, 129.1, 129, 128.8, 126.5, 58.6, 50, 42.6

¹H: 12.03 (1H, s br), 9.16 (1H, s), 8.07 (2H, m), 7.67 (2H, m), 7.51 (3H, m), 7.45 (3H, m), 4.55 (2H, m), 4.38 (2H, s), 3.73 (2H, m, J = 12.0 Hz), 3.41 (2H, br, J = 11.7 Hz), 3.24 (2H, m)

Сполука номер 125 (MP: 232 (dec)). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 161.4, 159.9, 148.4, 148.2, 136.8, 131.5, 129.6, 129.5, 128.8, 128.5, 128.1, 128, 127.9, 122.2, 115.2, 69.4, 58.6, 50, 42.6

¹H: 11.97 (1H, s), 9.12 (1H, s), 8.0 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.66 (2H, m), 7.45 (5H, m), 7.40 (2H, t, J = 7.5 Hz), 7.33 (1H, t, J = 7.2 Hz), 7.15 (2H, d, J = 8.6 Hz), 5.17 (2H, s), 4.55 (2H, m), 4.37 (2H, s), 3.70 (2H, m, J = 12.0 Hz), 3.41 (2H, m), 3.24 (2H, m)

Сполука номер 126 (MP: 135). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 147.3, 146.3, 131.6, 129.7, 125.2, 119.9, 114.1, 52.8, 41.6, 36.1, 29.4

¹H: 8.27 (1H, d, J = 8.4 Hz), 8.09 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.61 (1H, m, J = 1.0, 7.0, 8.0 Hz), 7.45 (1H, m, J = 1.0, 7.0, 8.0 Hz), 7.17 (1H, s), 2.20 (9H, s), 1.76 (6H, s)

Сполука номер 127 (MP: 101). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 148.6, 144.7, 132.5, 129.5, 125.5, 119.7, 113.3, 62.6, 48.4, 45.2, 28.3, 25.9, 25.4

¹H: 8.18 (1H, d, J = 8.2 Hz), 7.91 (1H, d, J = 8.5 Hz), 7.69 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.56 (1H, t, J = 7.6 Hz), 3.71 (4H, m), 2.63 (4H, s br), 2.30 (1H, m), 1.76 (2H, m), 1.73 (2H, m), 1.56 (1H, d, J = 12.4 Hz), 1.20 (4H, m), 1.07 (1H, m)

Сполука номер 128 (MP: oil). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 149.4, 145.3, 138.4, 133.1, 129.3, 128.5, 127.7, 127.4, 125.1, 119.8, 113.5, 72.5, 70.1, 44.9, 42.3, 30.9

¹H: 8.10 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.98 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.61 (1H, d d d, J = 1, 7.1, 8.2 Hz), 7.46 (1H, d d d, J = 1, 7.1, 8.2 Hz), 7.40-7.28 (5H, m), 4.62 (2H, s), 4.06 (2H, m), 3.81 (3H, m), 2.08 (2H, m), 1.94 (2H, br)

Сполука номер 129 (MP: oil). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 150.5, 145.2, 142.3, 133.2, 129.2, 128.4, 128.3, 125.7, 125.1, 119.7, 113.6, 51.8, 50.6, 38.0, 35.8, 31.1, 28.0, 26.8, 26.2

¹H: 8.11 (1H, d, J = 8.3 Hz), 8.0 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.61 (1H, d d d, J = 1.0, 7.0, 8.2 Hz), 7.46 (1H, d d d, J = 1.0, 7.0, 8.2 Hz), 7.27 (2H, t, J = 7.7 Hz), 7.17 (3H, m), 3.66 (2H, m), 3.31 (3H, br), 2.64 (2H, br), 1.82 (2H, m, J = 7.7 Hz), 1.71 (2H, br), 1.47-1.31 (2H, very broad)

Сполука номер 130 (MP: oil). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 162.4 (d, J = 247 Hz), 150.9, 145.2, 133.2, 131.5 (d, J = 3 Hz), 129.9, 129.4, 125.3, 119.9, 115.8 (d, J = 22 Hz), 113.6, 54.5, 53.2, 37.6

¹H: 8.11 (1H, d, J = 8.4 Hz), 8.05 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.63 (1H, d d d, J = 1.0, 7.1, 8.2 Hz), 7.48 (1H, d d d, J = 1.0, 7.1, 8.2 Hz), 7.41 (2H, br), 7.08 (2H, t, J = 8.1 Hz), 4.88 (2H, br), 3.24 (3H, br)

Сполука номер 131 (MP: oil). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 150.9, 145.2, 133.9, 133.2, 130.9, 129.4, 128.9, 126.8, 126.1, 125.3 (2 signa Hzs), 123.1, 119.9, 113.6, 53.1, 51.7, 37.5

¹H: 8.24-8.06 (3H, m), 7.98-7.82 (2H, m), 7.65 (1H, d d d, J = 1.1, 7.0, 8.0 Hz), 7.60-7.45 (4H, m, br), 7.48 (1H, d d d, J = 1.0, 7.0, 8.0 Hz), 5.38 (2H, m br), 3.28 (3H, s br)

Сполука номер 132 (MP: 129-130 (dec)). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 161.3, 154.6, 150.6, 148.5, 147.6, 130, 129.6, 127.4, 120.8, 115.9, 115.5, 71.1, 51.8, 44.7, 43, 41.9, 30.3, 20.1

¹H: 11.17 (1H, s), 9.05 (1H, s), 7.92 (2H, d, J = 7.8 Hz), 7.11 (2H, d, J = 7.8 Hz), 7.08 (2H, d, J = 7.6 Hz), 6.89 (2H, d, J = 7.6 Hz), 4.64 (1H, m br), 3.95 (2H, m), 3.93 (2H, m), 3.61 (2H, m), 3.48 (2H, m), 3.17 (4H, m), 2.79 (3H, s), 2.22 (3H, s), 2.05 (2H, s br), 1.74 (2H, br)

Сполука номер 133 (MP: 140). ЯМР розчинник: DMSO

5 ¹³C: 161.7, 152.1, 148.6, 147.7, 138, 129, 128.3, 127.4, 127.1, 119.5, 114.7, 65.9, 62, 52.4, 47.4, 46.2

¹H: 9.04 (1H, s), 7.88 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.33 (4H, br), 7.27 (1H, br), 7.02 (2H, d, J = 8.2 Hz), 3.75 (4H, m br), 3.70 (4H, m br), 3.52 (2H, br), 3.23 (4H, br), 2.50 (4H, br)

Сполука номер 134 (MP: oil). ЯМР розчинник: DMSO

10 ¹³C: 163.1 (d d, J = 13.5, 251.5 Hz), 160.1 (d d, J = 13.0, 257.5 Hz), 157.1 (d, J = 6 Hz), 154.6, 148.2, 147.4, 131.6 (d d, J = 4.5, 10.5 Hz), 130.0, 129.6, 116.0, 114.6 (d d, J = 4.0, 11.5 Hz), 112.3 (d d, J = 4.0, 22.0 Hz), 105.3 (t, J = 25.5 Hz), 71.1, 43.1 (br), 30.3, 20.1

¹H: 9.17 (1H, s), 8.12 (1H, d t, J = 6.7, 8.6 Hz), 7.43 (1H, d d d, J = 2.5, 9.4, 11.5 Hz), 7.26 (1H, d t, J = 2.5, 8.5 Hz), 7.08 (2H, d, J = 8.4 Hz), 6.89 (2H, d, J = 8.4 Hz), 4.64 (1H, m, J = 3.7 Hz), 3.93 (2H, m br), 3.61 (2H, m br), 2.22 (3H, s br), 2.05 (2H, m), 1.73 (2H, m)

Сполука номер 135 (MP: oil). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 149.4, 145.3, 141.8, 133.1, 129.3, 128.4, 128.3, 125.8, 125.1, 119.8, 113.4, 73.0, 67.3, 45.0, 42.4, 32.3, 31.5, 30.9

20 ¹H: 8.11 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.98 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.61 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.46 (1H, t, J = 7.5 Hz), 7.30 (2H, t, J = 7.9 Hz), 7.21 (3H, m), 4.04 (2H, m), 3.77 (2H, m), 3.66 (1H, m, J = 3.4 Hz), 3.50 (2H, t, J = 6.3 Hz), 2.74 (2H, t, J = 7.9 Hz), 2.02 (2H, m), 1.94 (2H, m), 1.85 (2H, m)

Сполука номер 136 (MP: 197-198). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 151.5, 148.7, 144.7, 143.7, 132.6, 129.6, 125.5, 119.7, 118.6, 115.6, 113.4, 50.3, 47.4, 45.2

25 ¹H: 8.95 (1H, s), 8.20 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.95 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.71 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.55 (1H, t, J = 7.7 Hz), 6.85 (2H, m, J = 9.0 Hz), 6.68 (2H, m, J = 9.0 Hz), 3.89 (4H, m br), 3.12 (4H, m)

Сполука номер 137 (MP: 100-101). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 154.4, 150.8, 149.4, 145.4, 133.1, 129.3, 125.2, 119.8, 117.8, 114.8, 113.5, 72, 55.7, 44.5, 41.9, 30.5

30 ¹H: 8.11 (1H, d, J = 8.5 Hz), 8.0 (1H, d, J = 8.6 Hz), 7.62 (1H, d, J = 7.6 Hz), 7.47 (1H, m, J = 7.8 Hz), 6.92 (2H, m, J = 9.2 Hz), 6.86 (2H, m, J = 9.2 Hz), 4.57 (1H, m), 3.99 (4H, m br), 3.79 (3H, s), 2.09 (4H, m)

Сполука номер 138 (MP: 187-188). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 161.5, 151.9, 150.9, 149.8, 147.4, 129, 127.4, 120, 119.3, 115.7, 115, 48.2, 47.5, 37.8

35 ¹H: 9.02 (1H, s), 7.92 (2H, m, J = 9.0 Hz), 7.25 (2H, d d, J = 7.3, 8.5 Hz), 7.11 (2H, m, J = 9.0 Hz), 7.0 (2H, d, J = 8.5 Hz), 6.81 (1H, t, J = 7.3 Hz), 3.38 (4H, m), 3.29 (4H, m), 3.16 (6H, s br)

Сполука номер 139 (MP: 161-162). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 161.7, 152, 148.6, 147.7, 127.4, 119.5, 114.7, 65.9, 54.4, 47.2, 46.3, 45.7

¹H: 9.04 (1H, s), 7.89 (2H, m, J = 9.0 Hz), 7.03 (2H, m, J = 9.0 Hz), 3.75 (4H, br), 3.70 (4H, m), 3.23 (4H, m, J = 5.0 Hz), 2.47 (4H, m, J = 5.0 Hz), 2.23 (3H, s)

40 Сполука номер 140 (MP: 167-168). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 161.8, 161, 156.4, 149.8, 147.2, 134.2, 128.8, 126.9, 120.3, 118.7, 118.4, 106.3, 39.3, 38.6

¹H: 8.84 (1H, s), 8.19 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.64 (2H, d, J = 9.0 Hz), 7.15 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.08 (2H, d, J = 9.0 Hz), 3.41 (3H, s), 3.23 (3H, s)

Сполука номер 141 (MP: 144-145). ЯМР розчинник: CDCl₃

45 ¹³C: 162, 160.9, 156.6, 148.6, 147.6, 134.2, 128.9, 126.5, 120.3, 118.7, 118.4, 106.4, 66.6, 46.6

¹H: 8.85 (1H, s), 8.17 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.64 (2H, d, J = 8.9 Hz), 7.15 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.08 (2H, d, J = 8.9 Hz), 4.0 (8H, s br)

Сполука номер 142 (MP: 202-203). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 149, 145.5, 131.4, 130.2, 125.8, 119.9, 113.6, 49.6, 45.7, 45.4, 45, 24.7, 21.4, 17.2

50 ¹H: 10.72 (1H, s br), 9.55 (1H, d, J = 6.8 Hz), 8.23 (1H, d, J = 8.3 Hz), 8.18 (1H, d, J = 8.2 Hz), 7.74 (1H, m, J = 8.0 Hz), 7.57 (1H, m, J = 7.6 Hz), 4.41 (1H, m), 3.66 (1H, t, J = 11.5 Hz), 3.40 (1H, m), 3.20 (4H, m), 2.30 (1H, m), 2.12 (1H, m), 1.94 (1H, m), 1.74 (1H, m)

Сполука номер 143 (MP: 108-109). ЯМР розчинник: CDCl₃

55 ¹³C: 150.6, 145.2, 133.2, 129.2, 125.1, 119.8, 113.5, 96.3, 70.3, 70, 57.9, 55.8, 32.6, 31, 30.2, 26.1, 24.8, 22.6

¹H: 8.10 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.98 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.61 (1H, t, J = 7.5 Hz), 7.46 (1H, t, J = 7.6 Hz), 4.37 (1H, br), 3.53 (4H, s), 3.18 (3H, s), 2.41 (2H, br), 1.91 (4H, m), 1.53 (2H, br), 0.99 (6H, s)

Сполука номер 144 (MP: 67-68). ЯМР розчинник: CDCl₃

60 ¹³C: 153.8, 152.9, 149.3, 145.3, 133.1, 129.2, 125.1, 119.8, 115.3, 114.6, 113.4, 65.6, 55.7, 48.4, 45.8, 35.6, 32.9, 32.1

¹H: 8.11 (1H, m, J = 8.4 Hz), 7.98 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.61 (1H, m, J = 1.0, 7.1, 8.1 Hz), 7.46 (1H, m, J = 1.0, 7.1, 8.1 Hz), 6.85 (4H, s), 4.55 (2H, d br, J = 13.0 Hz), 4.01 (2H, t, J = 6.2 Hz), 3.78 (3H, s), 3.19 (2H, s br), 1.96 (3H, m), 1.81 (2H, q, J = 6.2 Hz), 1.52 (2H, m)

Сполука номер 145 (MP: 179-180 (dec)). ЯМР розчинник: DMSO

5 ¹³C: 160.8, 160.4, 156.2, 148.3, 148.2, 147.9, 134.8, 129.4, 128.6, 126.3, 122.8, 120.4, 118.7, 117.7 (2 sig.), 105.7, 50, 44.9

¹H: 9.19 (1H, s), 8.15 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.88 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.35 (2H, t, J = 7.3 Hz), 7.29 (2H, br), 7.28 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.19 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.05 (1H, t, J = 7.0 Hz), 4.05 (4H, br), 3.46 (4H, m br)

10 Сполука номер 146 (MP: 192-193). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 167.1, 160.8, 158.8, 157.4, 149.7, 147.7, 129.9, 129.6, 128.4, 125.6, 119.5, 118.1, 37.8

¹H: 9.10 (1H, s), 8.10 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.97 (1H, s br), 7.93 (2H, d, J = 8.9 Hz), 7.35 (1H, s br), 7.20 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.11 (2H, d, J = 8.9 Hz), 3.16 (6H, s br)

Сполука номер 147 (MP: 220-221). ЯМР розчинник: DMSO

15 ¹³C: 167.1, 160.9, 158.7, 157.5, 148.5, 148.1, 129.9, 129.6, 128.5, 125.5, 119.5, 118, 65.9, 46.2

¹H: 9.13 (1H, s), 8.10 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.98 (1H, s br), 7.93 (2H, d, J = 8.9 Hz), 7.36 (1H, s br), 7.20 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.11 (2H, d, J = 8.9 Hz), 3.75-3.70 (8H, m)

Сполука номер 148 (MP: 187-188). ЯМР розчинник: DMSO

20 ¹³C: 167.1, 161, 158.7, 157.5, 150.6, 148.4, 148.1, 129.9, 129.6, 129.1, 128.5, 125.5, 119.5, 119.5, 118.1, 115.9, 48.2, 45.6

¹H: 9.16 (1H, s), 8.12 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.98 (1H, s br), 7.94 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.36 (1H, s br), 7.25 (2H, t, J = 8.0 Hz), 7.21 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.11 (2H, d, J = 8.5 Hz), 6.98 (2H, d, J = 8.2 Hz), 6.82 (1H, t, J = 7.5 Hz), 3.90 (4H, m), 3.29 (4H, m)

Сполука номер 149 (MP: 191-192). ЯМР розчинник: DMSO

25 ¹³C: 167.1, 160.3, 158.6, 157.4, 148.7, 147.4, 143.2, 129.8, 129.6, 129.3, 128.1, 127.3, 126.1, 125.4, 119.2, 118.2, 39.9

¹H: 8.95 (1H, s), 7.97 (1H, s br), 7.92 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.75 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.37 (2H, t, J = 7.5 Hz), 7.35 (1H, s br), 7.32 (2H, d, J = 8.0 Hz), 7.28 (1H, t, J = 7.0 Hz), 7.08 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.07 (2H, d, J = 8.7 Hz), 3.49 (3H, s)

30 Сполука номер 150 (MP: 91-92). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 162.3 (d, J = 246.5 Hz), 151.8, 141.5, 137, 135.2, 129.1, 129.0 (d, J = 3.3 Hz), 128.2, 127.5, 126.8 (d, J = 8.0 Hz), 115.6 (d, J = 21.5 Hz), 112.8, 54.1, 36.5

¹H: 7.96 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.73 (2H, d d, J = 5.3, 8.9 Hz), 7.49 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.43 (2H, m, J = 7.5 Hz), 7.37 (1H, m, J = 7.2 Hz), 7.32 (2H, m, J = 8.1 Hz), 7.08 (2H, m t, J = 8.9 Hz), 4.69 (2H, s), 3.09 (3H, s)

Сполука номер 151 (MP: 143-144). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 167, 160.9, 158.6, 157.3, 149.7, 147.7, 136.2, 129.6, 129.6, 128.5, 128.2, 127.5, 127.4, 125.4, 119.2, 117.9, 53.3, 36.3

40 ¹H: 9.14 (1H, s), 8.05 (2H, d br, J = 8.0 Hz), 7.93 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.87 (1H, s br), 7.40 (4H, m), 7.33 (1H, m), 7.21 (1H, s br), 7.17 (2H, d, J = 8.0 Hz), 7.10 (2H, d, J = 8.5 Hz), 4.82 (2H, s), 3.14 (3H, s)

Сполука номер 152 (MP: 95-96). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 150.5, 145.2, 138.7, 133.2, 129.2, 128.4, 127.5, 127.5, 125.1, 119.8, 113.5, 76.1, 70.1, 56.3, 32.6, 31, 27.5

45 ¹H: 8.10 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.98 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.60 (1H, t, J = 7.6 Hz), 7.46 (1H, t, J = 8.0 Hz), 7.40-7.33 (4H, m), 7.30 (1H, m), 4.58 (2H, s), 4.30 (1H, m), 3.36 (1H, m), 3.16 (3H, s), 2.24 (2H, d br, J = 10.0 Hz), 2.06 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 1.72 (2H, m, J = 1.8, 13.0 Hz), 1.51 (2H, s br)

Сполука номер 153 (MP: 75). ЯМР розчинник: CDCl₃

50 ¹³C: 160.8, 160, 149.4, 145.4, 133.2, 129.9, 129.3, 125.2, 119.8, 113.5, 106.5, 106.4, 100.9, 71.8, 55.3, 48.1, 45.4, 36.1, 29

¹H: 8.11 (1H, m, J = 1.0, 8.3 Hz), 7.99 (1H, m, J = 1.0, 8.3 Hz), 7.61 (1H, m, J = 1.0, 7.1 Hz), 7.47 (1H, m, J = 1.0, 7.1 Hz), 7.20 (1H, t, J = 8.3 Hz), 6.55-6.49 (2H, m), 6.48 (1H, t, J = 2.5 Hz), 4.62 (2H, m br, J = 13.5 Hz), 3.88 (2H, d, J = 6.5 Hz), 3.81 (3H, s), 3.24 (2H, br), 2.20 (1H, m), 2.04 (2H, br), 1.66 (2H, m)

55 Сполука номер 154 (MP: 129-130). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 148.6, 144.7, 132.5, 129.6, 125.5, 119.7, 113.3, 66.4, 51.4, 47.7, 44.9, 29.8, 23.7

¹H: 8.19 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.91 (1H, m, J = 8.4 Hz), 7.69 (1H, m, J = 1.0, 7.0, 8.0 Hz), 7.53 (1H, m, J = 1.0, 7.0, 8.0 Hz), 3.73 (4H, m), 2.51 (1H, m), 2.50 (4H, m), 1.79 (2H, m), 1.61 (2H, m), 1.49 (2H, m), 1.34 (2H, m)

60 Сполука номер 155 (MP: 108). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 158.9, 150.7, 148.4, 147.4, 132.4, 129.3, 127.9, 127.8, 127.7, 120.8, 116.7, 49.4, 46.4
¹H: 8.83 (1H, s), 7.79 (1H d d, J = 1.2, 3.7 Hz), 7.44 (1H, d d, J = 1.2, 5.1 Hz), 7.33 (2H, d d, J = 7.3, 8.8 Hz), 7.15 (1H, d d, J = 3.7, 5.1 Hz), 6.98 (2H, m d, J = 8.8 Hz), 6.95 (1H, m, J = 7.3 Hz), 4.11 (4H, br), 3.34 (4H, m, J = 5.2 Hz)

5 Сполука номер 156 (MP: 66-67). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 150.9, 145.2, 137.8, 133.2, 129.2, 128.4, 127.7, 127.5, 125.1, 119.7, 113.6, 73.2, 68.2, 51.5, 51, 39.7, 37.1

¹H: 8.10 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.96 (1H, d, J = 8.0 Hz), 7.58 (1H, t, J = 8.2 Hz), 7.45 (1H, t, J = 7.9 Hz), 7.30 (5H, m), 4.53 (2H, s br), 3.93 (2H, s br), 3.85 (2H, s br), 3.41 (3H, s br)

10 Сполука номер 157 (MP: oil). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 154.1, 152.3, 150.9, 150.8, 145.2, 133.2, 129.3, 125.2, 119.8, 115.3, 114.6, 113.7, 66.9, 55.7, 50.9, 40, 37.3

¹H: 8.10 (1H, d, J = 8.3 Hz), 8.03 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.61 (1H, m, J = 1.0, 7.1, 8.3 Hz), 7.47 (1H, m, J = 1.0, 7.1, 8.3 Hz), 6.81 (4H, m br), 4.33 (2H, t br, J = 5.2 Hz), 4.10 (2H, br), 3.76 (3H, s), 3.55-3.42 (3H, m br)

15 Сполука номер 158 (MP: 257-259 (dec)). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 157.8, 148.2 (2 sig.), 132, 131.5, 129.6, 129.4, 128.8 (2 sig.), 128.3, 127.7, 58.6, 49.9, 42.6

¹H: 11.94 (1H, s br), 9.13 (1H, s), 7.73 (2H, d, J = 4.0 Hz), 7.65 (2H, m), 7.46 (3H, m), 7.20 (1H, t, J = 4.2 Hz), 4.47 (2H, br), 4.37 (2H, s), 3.70 (2H, m, J = 12.5 Hz), 3.40 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 3.22 (2H, m)

20 Сполука номер 159 (MP: 143). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 149.4, 145.3, 133.1, 129.3, 125.2, 119.8, 113.5, 66.4, 44.9, 42.4, 34

¹H: 8.10 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.98 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.61 (1H, t, J = 8.0 Hz), 7.46 (1H, t, J = 7.7 Hz), 4.16 (2H, m), 4.12 (1H, m), 3.69 (2H, m), 2.10 (2H, m), 1.80 (2H, m), 1.86 (1H, d, J = 3.8 Hz)

25 Сполука номер 160 (MP: 78-80). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 163.6, 149.2, 146.1, 143.3, 136.8, 129.5, 128.7, 128.3, 127.4, 126.5, 125.8, 40.3, 34.4

¹H: 8.52 (1H, s), 7.33 (3H, m), 7.21 (2H, m), 7.20 (1H, m), 7.11 (2H, d br, J = 8.0 Hz), 7.0 (2H, d br, J = 7.0 Hz), 3.86 (2H, s), 3.53 (3H, s)

30 Сполука номер 161 (MP: 89). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 146.5, 142.6, 136.2, 132.7, 128.7, 127.7, 125.2, 112, 81.1, 80.3, 61.8, 22.8

¹H: 7.96 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.79 (2H, m, J = 8.3 Hz), 7.52 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.41 (2H, m, J = 7.9 Hz), 7.30 (1H, m, J = 7.3 Hz), 5.13 (2H, s), 3.88 (2H, s), 1.62 (6H, s)

Сполука номер 162 (MP: 119-121). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 145.7, 144.1, 133.7, 129.3, 124.2, 120.8, 117.5, 82.4, 79.5, 62.4, 22.9

35 ¹H: 8.48 (1H, s br), 7.96 (1H, d, J = 8.7 Hz), 7.59 (1H, d d, J = 1.5, 8.7 Hz), 5.53 (2H, s), 3.90 (2H, s), 1.68 (6H, s)

Сполука номер 163 (MP: 231-232). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 167.6, 145.6, 144.3, 141.2, 139.3, 135.2, 133, 130.3, 129.3, 127.5, 126.5, 125.6, 120.2, 111.7, 81.8, 78.7, 61.6, 22.6

40 ¹H: 8.37 (1H, br), 8.30 (1H, d, J = 8.5 Hz), 8.26 (1H, br), 8.22 (1H, s br), 7.94 (2H, m), 7.93 (1H, d, J = 8.5 Hz), 7.62 (1H, t, J = 7.6 Hz), 7.52 (1H, s br), 5.46 (2H, s), 3.91 (2H, s), 1.60 (6H, s)

Сполука номер 164 (MP: 102). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 153.5, 150.9, 149.4, 145.3, 137.1, 133.1, 129.3, 128.6, 127.9, 127.5, 125.2, 119.8, 117.7, 115.8, 113.5, 71.8, 70.5, 44.5, 42, 30.5

45 ¹H: 8.11 (1H, d, J = 8.4 Hz), 8.0 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.62 (1H, m, J = 1.0, 7.2, 8.2 Hz), 7.47 (1H, m, J = 1.0, 7.1, 8.2 Hz), 7.44 (2H, d, J = 7.0 Hz), 7.40 (2H, m, J = 7.4 Hz), 7.34 (1H, m, J = 7.1 Hz), 6.93 (4H, m), 5.04 (2H, s), 4.58 (1H, m), 3.99 (4H, br), 2.10 (4H, m br)

Сполука номер 165 (MP: 131). ЯМР розчинник: CDCl₃

50 ¹³C: 153.8, 152.9, 149.4, 145.3, 133.1, 129.3, 125.1, 119.8, 115.3, 114.6, 113.4, 72.5, 55.7, 48.1, 45.5, 36.2, 29.1

¹H: 8.11 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.99 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.61 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.46 (1H, t, J = 7.6 Hz), 6.85 (4H, s), 4.61 (2H, d br, J = 13.0 Hz), 3.85 (2H, d, J = 6.4 Hz), 3.78 (3H, s), 3.23 (2H, s br), 2.18 (1H, m), 2.03 (2H, m), 1.62 (2H, m)

Сполука номер 166 (MP: 87). ЯМР розчинник: CDCl₃

55 ¹³C: 160.9, 158.1, 149.4, 145.4, 133.1, 130.1, 129.4, 125.2, 119.8, 113.5, 108, 106.6, 102.6, 70.6, 55.3, 44.5, 41.9, 30.4

¹H: 8.11 (1H, d, J = 8.4 Hz), 8.0 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.62 (1H, m, J = 1.0, 7.1, 8.2 Hz), 7.47 (1H, m, J = 1.0, 7.1, 8.1 Hz), 7.22 (1H, t, J = 8.2 Hz), 6.58-6.54 (2H, m), 6.52 (1H, t, J = 2.2 Hz), 4.70 (1H, m), 4.01 (4H, m), 3.81 (3H, s), 2.12 (4H, m)

60 Сполука номер 167 (MP: 162 (dec.)). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: NO DATA

1H: 8.15 (2H, m), 7.69 (1H, m, J = 1.0, 7.1, 8.2 Hz), 7.55 (1H, m, J = 1.0, 7.1, 8.2 Hz), 5.09 (2H, s br), 4.46 (2H, s br), 3.45 (2H, t, J = 7.1 Hz)

Сполука номер 168 (MP: 72). ЯМР розчинник: CDCl₃

5 13C: 153.9, 150.6, 149.4, 145.3, 133.1, 129.3, 125.2, 119.8, 117.8, 115.4, 113.5, 71.9, 68.2, 44.5, 41.8, 31.4, 30.5, 19.2, 13.9

1H: 8.11 (1H, d, J = 8.4 Hz), 8.0 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.62 (1H, m, J = 1.0, 7.1, 8.3 Hz), 7.47 (1H, m, J = 1.0, 7.1, 8.2 Hz), 6.90 (2H, m, J = 9.3 Hz), 6.85 (2H, m, J = 9.3 Hz), 4.57 (1H, m), 3.99 (4H, br), 3.93 (2H, t, J = 6.5 Hz), 2.11 (2H, m), 2.05 (2H, m), 1.76 (2H, m), 1.49 (2H, m), 0.98 (3H, t, J = 7.4 Hz)

10 Сполука номер 169 (MP: 90). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 151, 145.1, 132.9, 129.6, 125.4, 119.9, 113.5, 62.2, 36.4

1H: 8.11 (1H, d, J = 8.4 Hz), 8.05 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.62 (1H, m, J = 1.0, 7.1, 8.3 Hz), 7.47 (1H, m, J = 1.0, 7.1, 8.2 Hz), 3.99 (3H, s), 3.55 (3H, s)

Сполука номер 170 (MP: 51). ЯМР розчинник: CDCl₃

15 13C: 148.4, 145.2, 132.9, 129.6, 125.6, 119.9, 114.1, 51.8, 51, 31.7, 29.2

1H: 8.14 (1H, d, J = 8.5 Hz), 8.11 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.63 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.49 (1H, t, J = 7.4 Hz), 5.0 (2H, s br), 4.28 (2H, s br), 3.19 (2H, t, J = 6.3 Hz)

Сполука номер 171 (MP: 81). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 150.1, 145.1, 133.1, 129.1, 125, 119.7, 113.4, 51.5, 49.8, 26.9, 26.7, 25.8, 25.2, 24.1

20 1H: 8.10 (1H, d, J = 8.3 Hz), 8.0 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.59 (1H, m, J = 1.1, 7.1, 8.1 Hz), 7.45 (1H, m, J = 1.0, 7.1, 8.2 Hz), 3.86 (2H, m, J = 5.3 Hz), 3.79 (2H, m, J = 5.3 Hz), 1.95 (2H, m), 1.79 (2H, m), 1.67 (6H, m)

Сполука номер 172 (MP: 37-38). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 150.5, 145.1, 133.2, 129.1, 125, 119.7, 113.5, 50.4, 49, 29.1, 27.4, 27.3, 26.6

25 1H: 8.09 (1H, m d, J = 8.3 Hz), 8.01 (1H, m d, J = 8.5 Hz), 7.59 (1H, m, J = 1.0, 7.0, 8.2 Hz), 7.45 (1H, m, J = 1.0, 7.1, 8.2 Hz), 3.87 (2H, t, J = 6.0 Hz), 3.79 (2H, t, J = 6.0 Hz), 1.94 (2H, m), 1.90 (2H, m), 1.71 (2H, m), 1.68 (2H, m)

Сполука номер 173 (MP: oil). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 150.2, 145.1, 133.3, 129, 124.9, 119.7, 113.1, 49, 30.1, 21.4, 13.8

30 1H: 8.10 (1H, d, J = 8.5 Hz), 7.92 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.59 (1H, m, J = 7.9 Hz), 7.45 (1H, m, J = 7.6 Hz), 4.78 (2H, m), 1.94 (1H, m), 1.87 (2H, m), 1.69 (2H, d br, J = 13.5 Hz), 1.61 (1H, m), 1.45 (6H, d, J = 7.1 Hz)

Сполука номер 174 (MP: 193). ЯМР розчинник: CDCl₃

35 13C: 148.9, 145.1, 136.6, 134.4, 133.1, 129.5, 127.9, 127.9, 125.5, 122.6, 122.6, 119.8, 114.5, 56, 54.8

1H: 8.28 (1H, d, J = 8.4 Hz), 8.14 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.64 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.50 (1H, t, J = 7.6 Hz), 7.36 (4H, m), 5.53 (2H, s), 5.19 (2H, s)

Сполука номер 175 (MP: oil). ЯМР розчинник: CDCl₃

40 13C: 150.1, 149.2, 145.4, 133.3, 129.1, 125, 125, 119.8, 113.5, 113.4, 54.4, 52.6, 42.3, 39.2, 31.6, 27.4, 18.8, 18

1H: 8.10 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.97 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.59 (1H, t, J = 7.6 Hz), 7.44 (1H, t, J = 7.6 Hz), 4.45 (1.4H, d, J = 12.0 Hz), 3.88 (0.6H, br), 3.50 (0.6H, br), 2.63 (1.4H, br), 2.15 (0.6H, m), 1.89 (1.4H, m), 1.0-0.96 (6H, m br), 1.93, 1.57, 0.9 (2H, m)

Сполука номер 176 (MP: 48). ЯМР розчинник: CDCl₃

45 13C: 173.9, 149.4, 145.3, 133.1, 129.4, 125.2, 119.8, 113.5, 60.8, 47.4, 44.9, 40.7, 28, 14.2

1H: 8.10 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.98 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.61 (1H, m, J = 7.8 Hz), 7.46 (1H, m, J = 7.8 Hz), 4.41 (2H, d t, J = 4.0, 13.5 Hz), 4.19 (2H, q, J = 7.1 Hz), 3.39 (2H, s br), 2.11 (2H, d br, J = 12.9 Hz), 1.98 (2H, m), 1.29 (3H, t, J = 7.1 Hz)

Сполука номер 177 (MP: 75). ЯМР розчинник: CDCl₃

50 13C: 155.3, 149.5, 145.3, 133.1, 129.6, 125.4, 119.9, 113.6, 61.9, 47.8, 45.1, 43.5, 14.6

1H: 8.11 (1H, d, J = 8.4 Hz), 8.0 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.63 (1H, m, J = 8.2 Hz), 7.48 (1H, m, J = 7.6 Hz), 4.20 (2H, q, J = 7.2 Hz), 3.92 (4H, s br), 3.71 (4H, m), 1.30 (3H, t, J = 7.2 Hz)

Сполука номер 178 (MP: 143). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 169.2, 149.5, 145.3, 133.1, 129.7, 125.5, 120, 113.6, 47.8, 46.3, 46, 41.2, 21.4

55 1H: 8.11 (1H, d, J = 8.3 Hz), 8.0 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.63 (1H, m, J = 1.0, 7.1, 8.2 Hz), 7.48 (1H, m, J = 1.0, 7.1, 8.2 Hz), 3.94 (4H, s br), 3.85 (2H, m), 3.71 (2H, m), 2.18 (3H, s)

Сполука номер 179 (MP: 197 (dec.)). ЯМР розчинник: DMSO

13C: 175.7, 148.7, 144.7, 132.5, 129.5, 125.4, 119.6, 113.2, 47.1, 44.5, 41, 28.4

¹H: 8.19 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.91 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.70 (1H, m, J = 7.8 Hz), 7.53 (1H, m, J = 7.7 Hz), 7.38 (1H, s br), 6.90 (1H, s br), 4.23 (2H, s br), 3.24 (2H, s br), 2.47 (1H, m), 1.85 (2H, s br), 1.69 (2H, m, J = 4.2, 12.0 Hz)

Сполука номер 180 (MP: oil). ЯМР розчинник: CDCl₃

5 ¹³C: 158.2, 148.8, 146.4, 143.2, 132.5, 129.5, 127.7, 127.7, 127.5, 127.3, 126.1, 40.5

¹H: 8.63 (1H, s), 7.47 (1H, d br, J = 3.6 Hz), 7.39 (2H, m, J = 8.0 Hz), 7.33 (1H, m, J = 7.3 Hz), 7.31 (1H, d d, J = 1.2, 5.0 Hz), 7.19 (2H, m, J = 8.3 Hz), 7.02 (1H, d d, J = 3.6, 5.0 Hz), 3.58 (3H, s)

Сполука номер 181 (MP: 79). ЯМР розчинник: CDCl₃

10 ¹³C: 158.8, 149.9, 147.3, 135.8, 132.5, 128.8, 128, 127.8, 127.6, 127.6, 54.4, 36.9, 36.2

¹H: 8.86 (1H, s), 7.46-7.30 (6H, m), 7.73 (1H, br), 7.11 (1H, t, J = 4.0 Hz), 4.93 (2H, br), 3.24 (3H, br)

Сполука номер 182 (MP: 87). ЯМР розчинник: CDCl₃

15 ¹³C: 164.3, 150.7, 148.6, 147.3, 137, 129.3, 128.8, 128.6, 126.8, 120.7, 116.7, 49.4, 46.5, 34.7

¹H: 8.73 (1H, s), 7.37-7.21 (5H, m), 7.32 (2H, m), 6.95 (2H, m), 6.93 (1H, m), 4.11 (2H, s), 4.03 (4H, br), 3.27 (4H, m)

Сполука номер 183 (MP: 144). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 163.8 (d d, J = 12.0, 253.0 Hz), 160.8 (d d, J = 14.0, 261.0 Hz), 158.5 (d, J = 6.0 Hz), 145.6, 144.7, 131.4 (d d, J = 4.2, 10.0 Hz), 114.4 (d d, J = 4.0, 11.5 Hz), 111.8 (d d, J = 4.0, 22.0 Hz), 105.0 (t, J = 25.0 Hz), 82.1, 79.2, 62.2, 22.8

20 ¹H: 8.96 (1H, s), 8.12 (1H, m, J = 7.0, 8.4 Hz), 7.0 (1H, m), 6.95 (1H, m), 5.53 (2H, s), 3.84 (2H, s), 1.62 (6H, s)

Сполука номер 184 (MP: 126). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 151, 142.5, 136.9, 133.7, 132.8, 131.7, 128.9, 128.7, 127.6, 127.3, 126.8, 126.3, 125.2, 112.9, 48.5, 44.6, 28.5

25 ¹H: 7.99 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.82 (2H, m, J = 8.2 Hz), 7.55 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.42 (2H, t, J = 7.8 Hz), 7.31 (1H, m, J = 7.4 Hz), 7.27-7.19 (3H, m), 7.12 (1H, m), 4.80 (2H, br), 3.88 (2H, t, J = 5.8 Hz), 3.05 (2H, t, J = 5.8 Hz)

Сполука номер 185 (MP: 125). ЯМР розчинник: DMSO

30 ¹³C: 160.4, 148.6, 147.8, 134.7, 134.2, 132.4, 129, 128.6, 128.4, 128, 126.7, 126.3, 126.2, 47.3, 44.2, 28

¹H: 9.14 (1H, s), 8.10 (2H, m, J = 8.6 Hz), 7.59 (2H, m, J = 8.6 Hz), 7.23 (4H, br), 4.88 (2H, br), 3.93 (2H, t, J = 5.8 Hz), 3.02 (2H, t, J = 5.8 Hz)

Сполука номер 186 (MP: 136). ЯМР розчинник: CDCl₃

35 ¹³C: 146.3, 141.6, 136.2, 133.3, 131.3, 128.9, 126.4, 112.3, 81.1, 80.4, 61.9, 22.8

¹H: 7.94 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.72 (2H, m, J = 8.7 Hz), 7.51 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.37 (2H, m, J = 8.7 Hz), 5.13 (2H, s), 3.89 (2H, s), 1.62 (6H, s)

Сполука номер 187 (MP: 176-177). ЯМР розчинник: DMSO

40 ¹³C: 167.1, 161.1, 158.7, 157.5, 147.1, 144.6, 129.8, 129.6, 128.5, 125.5, 119.5, 118, 81.4, 78.4, 61.4, 22.4

¹H: 9.21 (1H, s), 8.11 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.98 (1H, s br), 7.93 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.36 (1H, s br), 7.20 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.11 (2H, d, J = 8.4 Hz), 5.44 (2H, s), 3.85 (2H, s), 1.52 (6H, s)

Сполука номер 188 (MP: 88). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 162.8, 161.1, 146, 145, 128.2, 122.4, 114.1, 82, 79.3, 62.1, 55.3, 22.8

45 ¹H: 8.90 (1H, s), 8.05 (2H, m, J = 9.0 Hz), 6.98 (2H, m, J = 9.0 Hz), 5.56 (2H, s), 3.87 (3H, s), 3.84 (2H, s), 1.62 (6H, s)

Сполука номер 189 (MP: 132). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 162.1, 146.3, 144.7, 136.1, 129, 128.3, 128, 81.9, 79.3, 62.3, 22.8

¹H: 8.93 (1H, s), 8.05 (2H, m, J = 8.6 Hz), 7.44 (2H, m, J = 8.6 Hz), 5.55 (2H, s), 3.85 (2H, s), 1.62 (6H, s)

50 Сполука номер 190 (MP: 82). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 162.7, 150.1, 147.4, 136, 134.1, 133.1, 128.8, 128.7, 128.4, 128, 127.8, 127.1, 126.9, 126.7, 126.5, 123.7, 54.5, 36.7

¹H: 8.96 (1H, s), 8.64 (1H, br), 8.15 (1H, br), 7.90 (3H, m), 7.53 (2H, m), 7.47-7.31 (5H, m), 5.0 (2H, br), 3.28 (3H, br)

55 Сполука номер 191 (MP: 107). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 161.7, 150, 147.3, 136.3, 133.6, 130.6, 128.7, 128.6, 128.5, 127.6, 127.1, 126.1, 125.8, 125.4, 53.6, 37.3, 35.8

¹H: 9.34 (1H, s), 8.87 (1H, br), 8.27 (1H, d, J = 7.2 Hz), 8.06 (1H, d, J = 8.0 Hz), 8.0 (1H, br), 7.63 (1H, t, J = 7.5 Hz), 7.55 (1H, br), 7.46-7.26 (6H, m), 4.90 (2H, br), 3.16 (3H, s)

60 Сполука номер 192 (MP: 121-123 (dec.)). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 161, 148.7, 146.9, 143.5, 133.4, 130.5, 129.6, 129.5, 128.4, 128.3, 127.2, 127, 126 (2 sig.), 125.8, 125.2, 40.1

¹H: 9.21 (1H, s), 8.10 (1H, d d, J = J = 1.2, 7.2 Hz), 7.98 (1H, d, J = 8.2 Hz), 7.93 (2H, m), 7.60-7.30 (8H, m), 3.52 (3H, s)

5 Сполука номер 193 (MP: 142). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 149.2, 145.3, 133.1, 129.5, 125.3, 119.9, 113.5, 71.8, 53.3, 50.2, 18.6

¹H: 8.11 (1H, d, J = 8.3 Hz), 8.0 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.62 (1H, m, J = 1.0, 7.1, 8.1 Hz), 7.47 (1H, m, J = 1.0, 7.1, 8.1 Hz), 4.42 (2H, d br, J = 13.0 Hz), 3.83 (2H, m), 3.03-2.90 (2H, m br), 1.26 (6H, s br)

10 Сполука номер 194 (MP: 75). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 150, 145.3, 133.1, 129.5, 125.4, 119.9, 113.6, 66.1, 52.8, 49.7, 17.5

¹H: 8.11 (1H, d, J = 8.3 Hz), 8.01 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.63 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.48 (1H, t, J = 7.8 Hz), 4.22 (2H, s br), 4.06-3.90 (2H, m br), 3.66 (2H, s br), 1.31 (6H, s br)

Сполука номер 195 (MP: oil). ЯМР розчинник: CDCl₃

15 ¹³C: 150.9, 145.3, 139.1, 133.3, 129.3, 128.7, 127.9, 127.3, 125.2, 119.8, 113.6, 55, 32.2, 16

¹H: 8.12 (1H, m, J = 8.3 Hz), 8.07 (1H, m, J = 8.4 Hz), 7.63 (1H, m, J = 1.0, 7.0, 8.0 Hz), 7.48 (1H, m, J = 1.0, 7.1, 8.3 Hz), 7.45 (2H, br), 7.41 (2H, m, J = 7.4 Hz), 7.34 (1H, m J = 8.0 Hz), 5.95 (1H, q, J = 6.8 Hz), 3.0 (3H, s), 1.78 (3H, d, J = 7.1 Hz)

Сполука номер 196 (MP: 140). ЯМР розчинник: CDCl₃

20 ¹³C: 150.7, 150.5, 142.6, 141.7, 140.9, 137.1, 133.2, 129.3, 129.2, 128.7, 127.4, 127.2, 126.5, 124.1, 124, 121.1, 116.9, 113.2, 49.5, 46.5

¹H: 8.07 (1H, t, J = 1.7 Hz), 7.99 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.80 (1H, d t, J = 1.5, 7.6 Hz), 7.67 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.57 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.56 (1H, d t, J = 1.5, 7.7 Hz), 7.49 (1H, t, J = 7.5 Hz), 7.47 (2H, m, J = 7.7 Hz), 7.37 (1H, m, J = 7.2 Hz), 7.32 (2H, m, J = 8.2 Hz), 6.96 (3H, m), 3.85 (4H, m, J = 5.0 Hz), 3.30 (4H, m, J = 5.0 Hz)

Сполука номер 197 (MP: 113). ЯМР розчинник: CDCl₃

25 ¹³C: 150.5, 142.2, 141.3, 137, 133.1, 131.5, 128.8, 128.3 (2 sig.), 126.4, 125.8, 113.3, 47, 35.9, 35.8, 35.7, 32.1, 28.4

¹H: 7.88 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.73 (2H, m), 7.45 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.37 (2H, m), 7.30 (2H, m, J = 7.5 Hz), 7.20 (1H, m, J = 7.6 Hz), 7.19 (2H, m, J = 8.0 Hz), 4.14 (2H, d br, J = 13.2 Hz), 3.04 (2H, d t, J = 2.3, 13.0 Hz), 2.63 (2H, t, J = 7.7 Hz), 1.83 (2H, d br, J = 13.5 Hz), 1.67 (2H, m), 1.58 (1H, m), 1.36 (2H, m), 1.25 (2H, d q, J = 4.2, 13.1 Hz)

Сполука номер 198 (MP: 178). ЯМР розчинник: CDCl₃

35 ¹³C: 150.3, 140.3, 137.2, 133, 132.8, 131.2, 130.6, 127, 124.3, 113.9, 106.1, 64.6, 44.8, 35

¹H: 7.90 (1H, d, J = 2.0 Hz), 7.89 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.61 (1H, d d, J = 2.1, 8.4 Hz), 7.49 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.46 (1H, d, J = 8.4 Hz), 4.01 (4H, s), 3.73 (4H, m, J = 5.5 Hz), 1.82 (4H, m, J = 5.5 Hz)

Сполука номер 199 (MP: 174). ЯМР розчинник: CDCl₃

40 ¹³C: 150.2, 145.8, 143, 141.7, 137.5, 130.3, 128, 126.2, 125.9, 123.5, 115.1, 111.7, 40.1

¹H: 7.49 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.41 (2H, m, J = 8.4 Hz), 7.40 (2H, m, J = 7.5 Hz), 7.33 (1H, m, J = 7.4 Hz), 7.17 (2H, m, J = 8.4 Hz), 7.04 (1H, d, J = 1.2 Hz), 6.65 (2H, m, J = 8.4 Hz), 3.69 (2H, s), 3.51 (3H, s)

Сполука номер 200 (MP: Hygroscopic). ЯМР розчинник: DMSO

45 ¹³C: 157.8, 149, 142.4, 137.5, 130, 129.9, 127.9, 126.2, 118, 115.4, 114.4, 111, 62.3, 54.4, 48.4, 39.7

¹H: 12.25 (1H, s br), 9.94 (2H, s), 8.04 (1H, s), 7.82 (1H, s), 7.42 (2H, t, J = 8.0 Hz), 7.39 (1H, s), 7.36 (2H, m), 7.32 (1H, m), 7.30 (2H, m), 6.92 (1H, m), 4.46 (2H, m), 3.63 (6H, m), 3.48 (4H, m), 3.45 (3H, s)

Сполука номер 201 (MP: 119). ЯМР розчинник: CDCl₃

50 ¹³C: 149.8 (d d, J = 13.0, 244.5 Hz), 149.8, 148.5 (d d, J = 12.5, 245.0 Hz), 138.9, 137.9, 131.1 (d d, J = 4.0, 7.0 Hz), 121.4 (d d, J = 3.0, 6.5 Hz), 117.8 (d, J = 17.3 Hz), 115.2, 113.5 (d, J = 18.7 Hz), 62.7, 48.1, 46.5, 28.3, 25.8, 25.3

¹H: 8.12 (1H, s), 8.06 (1H, s), 7.87 (1H, d d d, J = 2.0, 7.8, 12.0 Hz), 7.70 (1H, m), 7.46 (1H, d t, J = 8.7, 10.7 Hz), 3.51 (4H, m), 2.57 (4H, m), 2.29 (1H, br), 1.74 (4H, m), 1.57 (1H, d br, J = 12.0 Hz), 1.20 (4H, m), 1.07 (1H, t br, J = 10.0 Hz)

55 Сполука номер 202 (MP: oil). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 150.4, 145.1, 137.8, 133.2, 129.2, 128.4, 127.7, 127.6, 125.1, 119.7, 113.7, 73.3, 69.4, 68.3, 48.7, 45.1, 13.9, 12.6

¹H: 8.09 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.98 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.58 (1H, t, J = 7.9 Hz), 7.45 (1H, m, J = 1.0, 7.2, 8.2 Hz), 7.31 (5H, m), 4.53 (2H, br), 3.95-3.75 (6H, m), 1.38 (3H, t, J = 6.9 Hz)

60 Сполука номер 203 (MP: 132). ЯМР розчинник: DMSO

13C: 157.4, 148.6, 142.2, 137.3, 136.6, 129.9, 128, 126.5, 126.3, 123.2, 115.2, 114.3, 62.4, 54.4, 48.4, 39.7 (2 sig.)

1H: 11.97 (1H, s br), 9.68 (2H, s), 7.88 (1H, s), 7.62 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.57 (1H, s), 7.42 (2H, t, J = 7.4 Hz), 7.36 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.32 (1H, t, J = 7.4 Hz), 7.0 (2H, d, J = 8.8 Hz), 4.42 (2H, m), 3.61 (6H, m), 3.47 (4H, m), 3.43 (3H, s)

Сполука номер 204 (MP: 141). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 161.7, 148.5, 147.3, 136.1, 128.9, 128.4, 128, 106.5, 64.6, 44.7, 35.1

1H: 8.80 (1H, s), 8.07 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.43 (2H, d, J = 8.8 Hz), 4.02 (4H, s), 3.95 (4H, br), 1.89 (4H, m)

Сполука номер 205 (MP: 74-75). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 162.3, 161, 148.8, 147, 142.3, 128.3 (2 sig.), 128.2, 125.7, 122.6, 114, 55.3, 47, 36, 35.8 (2 sig.), 32.1, 28.5

1H: 8.75 (1H, s), 8.07 (2H, d, J = 7.7 Hz), 7.28 (2H, m), 7.19 (3H, m), 6.98 (2H, d, J = 7.7 Hz), 4.61 (2H, br), 3.03 (2H, br), 3.86 (3H, s), 2.62 (2H, m), 1.84 (2H, m), 1.67 (2H, m), 1.59 (1H, m), 1.30 (4H, m)

Сполука номер 206 (MP: 131). ЯМР розчинник: DMSO

13C: 161.8, 150.6, 148.5, 147.3, 133.6, 130.7, 130, 129.1, 128.7, 128.4, 127.3, 126.4, 126.3, 125.8, 125.4, 119.5, 115.9, 48.2, 45.8

1H: 9.29 (1H, s), 9.03 (1H, d, J = 8.4 Hz), 8.28 (1H, d d, J = 1.0, 7.3 Hz), 8.10 (1H, d, J = 8.1 Hz), 8.05 (1H, d, J = 8.0 Hz), 7.72-7.57 (3H, m), 7.25 (2H, t, J = 7.8 Hz), 6.99 (2H, d, J = 8.3 Hz), 6.82 (1H, t, J = 7.3 Hz), 3.94 (4H, s br), 3.32 (4H, m, J = 5.0 Hz)

Сполука номер 207 (MP: 181). ЯМР розчинник: DMSO

13C: 167.1, 160.7, 158.8, 156.6, 148.7, 148, 134.2, 132.6, 131.7, 131.1, 129.9, 129.7, 128.6, 126.8, 126.4, 126.3, 121.8, 120.8, 118.2, 116.1, 46.9, 44.9, 28.2

1H: 9.15 (1H, s), 7.98 (1H, s br), 7.96 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.90 (1H, d, J = 7.7 Hz), 7.66 (1H, m br), 7.59 (1H, t, J = 8.0 Hz), 7.37 (1H, s br), 7.24 (1H, d d, J = 2.4, 8.2 Hz), 7.21 (4H, m br), 7.13 (2H, d, J = 8.8 Hz), 4.83 (2H, m br), 3.88 (2H, m br), 2.96 (2H, t, J = 5.3 Hz)

Сполука номер 208 (MP: 217-218). ЯМР розчинник: DMSO

13C: 167.2, 160.7, 159, 156.4, 150.6, 148.3, 148.1, 131.7, 131.1, 129.8, 129.6, 129.1, 122, 121, 119.5, 117.9, 116.6, 115.9, 48.2, 45.8

1H: 9.15 (1H, s), 7.98 (1H, s br), 7.94 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.91 (1H, m), 7.69 (1H, m br), 7.59 (1H, t, J = 8.0 Hz), 7.36 (1H, s br), 7.24 (2H, t, J = 7.7 Hz), 7.23 (1H, m), 7.11 (2H, d, J = 8.8 Hz), 6.97 (2H, d, J = 8.0 Hz), 6.82 (1H, t, J = 7.0 Hz), 3.88 (4H, br), 3.27 (4H, br)

Сполука номер 209 (MP: 192-193). ЯМР розчинник: DMSO

13C: 167.1, 160.8, 159, 156.3, 147.2, 144.5, 131.7, 131.1, 129.8, 129.5, 122.1, 121, 117.8, 116.8, 81.3, 78.3, 61.4, 22.3

1H: 9.20 (1H, s), 7.96 (1H, s br), 7.93 (2H, m, J = 8.8 Hz), 7.90 (1H, m), 7.69 (1H, d d, J = 1.8, 2.4 Hz), 7.57 (1H, t, J = 8.0 Hz), 7.35 (1H, s br), 7.22 (1H, d d d, J = 0.9, 2.5, 8.2 Hz), 7.09 (2H, m, J = 8.8 Hz), 5.39 (2H, s), 3.82 (2H, s), 1.50 (6H, s)

Сполука номер 210 (MP: 185). ЯМР розчинник: DMSO

13C: 167.1, 160.7, 158.9, 156.5, 148.3, 148.1, 131.7, 131.1, 129.8, 129.6, 122, 120.9, 118, 116.5, 65.8, 46.2

1H: 9.13 (1H, s), 7.97 (1H, s br), 7.93 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.88 (1H, d, J = 7.7 Hz), 7.65 (1H, m br), 7.58 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.35 (1H, s br), 7.22 (1H, d d, J = 1.9, 7.9 Hz), 7.10 (2H, d, J = 8.7 Hz), 3.80-3.63 (8H, m)

Сполука номер 211 (MP: 116). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 162.6, 161.2, 157.7 (d, J = 240.0 Hz), 148.7, 147.4 (d, J = 2.0 Hz), 147.3, 128.3, 122.3, 118.7 (d, J = 7.8 Hz), 115.8 (d, J = 22.0 Hz), 114.1, 55.3, 50.5, 46.4

1H: 8.83 (1H, s), 8.08 (2H, m), 7.01 (2H, t, J = 9.4 Hz), 7.0 (2H, m), 6.93 (2H, m), 4.12 (4H, br), 3.88 (3H, s), 3.25 (4H, m)

Сполука номер 212 (MP: 281 (dec.)). ЯМР розчинник: DMSO

13C: 160.6, 148.5, 148.1, 135, 129.2, 128.4, 128.2, 64.3, 47.3, 42.9, 26.1, 24.7, 24.5

1H: 11.29 (1H, s), 9.20 (1H, s), 8.10 (2H, m, J = 8.8 Hz), 7.60 (2H, m, J = 8.8 Hz), 4.55 (2H, m br), 3.75 (2H, t br, J = 12.0 Hz), 3.55 (2H, d br, J = 11.5 Hz), 3.23 (3H, m), 2.13 (2H, d br, J = 10.5 Hz), 1.82 (2H, d br, J = 12.8 Hz), 1.61 (1H, d br, J = 12.5 Hz), 1.43 (2H, m, J = 11.5 Hz), 1.26 (2H, m, J = 12.8 Hz), 1.10 (1H, m, J = 12.5 Hz)

Сполука номер 213 (MP: 99). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 159, 146.2, 144.7, 132.4, 127.9, 127.7, 127.6, 82, 79.2, 62.2, 22.8

1H: 8.89 (1H, s), 7.74 (1H, d, J = 3.0 Hz), 7.41 (1H, d, J = 4.9 Hz), 7.13 (1H, m), 5.51 (2H, s), 3.84 (2H, s), 1.61 (6H, s)

Сполука номер 214 (MP: 121). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 162.1, 147.0 (2 sig.), 136.2, 129, 128.2, 128.1, 51.8, 51.1, 32, 28.9

¹H: 8.93 (1H, s), 8.07 (2H, m, J = 8.8 Hz), 7.44 (2H, m, J = 8.8 Hz), 4.97 (2H, m br), 4.23 (2H, m br), 3.14 (2H, br)

5 Сполука номер 215 (MP: 129). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 150.6 (d d, J = 13.0, 248.0 Hz), 149.9 (d d, J = 13.0, 249.0 Hz), 149.4, 140.9, 137, 129.9 (d d, J = 4.0, 7.0 Hz), 121.2 (d d, J = 4.0, 6.5 Hz), 117.6 (d, J = 17.7 Hz), 114.3 (d, J = 19.0 Hz), 113, 51.3, 50.9, 30.5

¹H: 8.02 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.61 (1H, d d d, J = 2.0, 7.7, 11.5 Hz), 7.55 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.50 (1H, m), 7.19 (1H, d t, J = 8.3, 10.0 Hz), 4.71 (2H, s), 3.98 (2H, t, J = 6.3 Hz), 3.14 (2H, t, J = 6.3 Hz)

10 Сполука номер 216 (MP: 115). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 149.3, 149, 144.2, 136.4, 135.8, 121, 118, 114, 112, 109.1, 80.7, 79.3, 61.4, 55.8, 55.6, 22.2

¹H: 9.22 (1H, s), 8.36 (1H, s), 7.55 (1H, d, J = 1.8 Hz), 7.49 (1H, d d, J = 1.8, 8.4 Hz), 7.05 (1H, d, J = 8.4 Hz), 5.22 (2H, s), 3.87 (2H, s), 3.83 (3H, s), 3.79 (3H, s), 1.52 (6H, s)

15 Сполука номер 217 (MP: 154-155). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 151.3, 149.1, 148.5, 141.9, 136.7, 126.1, 117.4, 112.4, 111.2, 108.4, 57.5, 55.9 (2 sig.), 31.4, 30, 25.4, 25.2

¹H: 7.90 (1H, s), 7.43 (1H, s), 7.40 (1H, s), 7.31 (1H, d br, J = 8.6 Hz), 6.91 (1H, d, J = 8.3 Hz), 3.97 (3H, s), 3.97 (1H, m), 3.91 (3H, s), 3.0 (3H, s), 1.86 (4H, m), 1.70 (1H, d br, J = 13.5 Hz), 1.58 (2H, m), 1.38 (2H, m), 1.13 (1H, m)

20 Сполука номер 218 (MP: 140-141). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 149.2, 139.9, 137, 133.1, 132.8, 131.1, 130.6, 126.9, 124.3, 113.6, 48.9, 25.3

¹H: 8.05 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.90 (1H, d, J = 2.0 Hz), 7.65 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.61 (1H, d d, J = 2.0, 8.5 Hz), 7.46 (1H, d, J = 8.5 Hz), 3.68 (4H, m), 2.03 (4H, m)

25 Сполука номер 219 (MP: 106). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 147, 143.1, 139.8, 131.8, 124.8, 124, 120.7, 113, 81, 80.6, 61.5, 23.1

¹H: 8.11 (1H, s), 7.82 (1H, d, J = 7.8 Hz), 7.70 (1H, d, J = 7.7 Hz), 7.40 (1H, d t, J = 1.5, 7.4 Hz), 7.36 (1H, d t, J = 1.5, 7.4 Hz), 5.04 (2H, s), 3.92 (2H, s), 1.67 (6H, s)

30 Сполука номер 220 (MP: 114-115). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 146.9, 142.2, 136.6, 132.8, 128.7, 127.6, 125.1, 112.5, 96.3, 63.5, 48.2, 24.1

¹H: 8.06 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.80 (2H, m, J = 8.2 Hz), 7.62 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.41 (2H, t, J = 7.8 Hz), 7.30 (1H, m, J = 7.4 Hz), 4.10 (2H, t, J = 6.0 Hz), 3.84 (2H, t, J = 6.0 Hz), 1.73 (6H, s)

Сполука номер 221 (MP: 120). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 151.4, 142.2, 136.7, 133, 128.7, 127.4, 125.1, 113.2, 49.1, 30, 21.2, 13.6

¹H: 7.87 (1H, d, J = 1.5 Hz), 7.80 (2H, m, J = 8.0 Hz), 7.46 (1H, d, J = 1.5 Hz), 7.41 (2H, t, J = 8.0 Hz), 7.29 (1H, m, J = 7.5 Hz), 4.41 (2H, m), 1.90 (1H, m), 1.77 (2H, m), 1.66 (2H, m), 1.62 (1H, m), 1.39 (6H, d, J = 7.2 Hz)

Сполука номер 222 (MP: 116). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 151.7, 143.3, 141.4, 132.1, 124.5, 123.6, 120.6, 112.6, 57.4, 31.3, 30, 25.4, 25.3

¹H: 8.16 (1H, s), 7.82 (1H, m, J = 7.8 Hz), 7.55 (1H, m), 7.38 (1H, d t, J = 1.5, 7.3 Hz), 7.35 (1H, d t, J = 1.5, 7.3 Hz), 4.0 (1H, m, J = 3.4, 12.1 Hz), 2.96 (3H, s), 1.89 (4H, m), 1.70 (1H, d br, J = 13.5 Hz), 1.61 (2H, d q, J = 4.0, 12.5 Hz), 1.38 (2H, t q, J = 4.0, 13.5 Hz), 1.14 (1H, t q, J = 3.5, 13.5 Hz)

Сполука номер 223 (MP: 155). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 157.9 (d, J = 241.0 Hz), 150.5, 147.1 (d, J = 2.5 Hz), 141.6, 137, 133.3, 131.3, 128.9, 126.4, 118.9 (d, J = 7.7 Hz), 115.8 (d, J = 22.0 Hz), 113.2, 50.5, 46.5

¹H: 7.94 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.74 (2H, m, J = 8.6 Hz), 7.50 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.38 (2H, m, J = 8.6 Hz), 7.01 (2H, m), 6.91 (2H, m), 3.82 (4H, m, J = 5.0 Hz), 3.19 (4H, m, J = 5.0 Hz)

Сполука номер 224 (MP: 201-202). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 156.8, 149.8, 143, 139.8, 137.7, 129.9, 127.7, 126.5, 126.3, 126, 114.9, 113.3, 62.2, 54.9, 52.8, 39.6, 22.5, 21.2

¹H: 9.28 (1H, s br), 7.60 (2H, d, J = 8.9 Hz), 7.55 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.48 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.41 (2H, t, J = 7.4 Hz), 7.34 (2H, d, J = 7.3 Hz), 7.32 (1H, m, J = 7.2 Hz), 6.98 (2H, d, J = 8.9 Hz), 4.32 (2H, t, J = 5.0 Hz), 3.50 (2H, br), 3.48 (2H, m), 3.42 (3H, s), 3.0 (2H, br), 1.79 (2H, br), 1.69 (3H, br), 1.39 (1H, br)

55 Сполука номер 225 (MP: 109). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 149.8, 147.8, 146.5, 142.5, 137, 136, 128.5, 127.8, 127.2, 126.4, 117.4, 114.1, 111.3, 108.9, 81.1, 80.4, 71, 61.8, 56, 22.9

¹H: 7.93 (1H, d, J = 1.5 Hz), 7.46 (2H, d, J = 8.0 Hz), 7.42 (1H, d, J = 1.5 Hz), 7.41 (1H, d, J = 2.0 Hz), 7.38 (2H, t, J = 7.7 Hz), 7.31 (1H, m), 7.21 (1H, d d, J = 2.0, 8.3 Hz), 6.91 (1H, d, J = 8.3 Hz), 5.20 (2H, s), 5.12 (2H, s), 3.97 (3H, s), 3.88 (2H, s), 1.61 (6H, s)

Сполука номер 226 (MP: 230-232 (dec.)). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 145.4, 140.5, 139.7, 138.3, 137.6, 134.8, 132.6, 127.5, 117.7, 80.7, 79.3, 61.1, 22.4

¹H: 9.34 (1H, d, J = 1.8 Hz), 8.97 (1H, t d, J = 1.5, 8.2 Hz), 8.81 (1H, d br, J = 5.2 Hz), 8.59 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.41 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.11 (1H, d d, J = 5.2, 8.2 Hz), 5.20 (2H, s), 3.86 (2H, s), 1.50 (6H, s)

Сполука номер 227 (MP: 118-119). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 148.7, 142.6, 136.7, 132.7, 128.7, 127.7, 125.2, 112.3, 88, 66.4, 48, 19.2

¹H: 8.08 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.81 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.62 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.42 (2H, t, J = 7.9 Hz), 7.31 (1H, m, J = 7.4 Hz), 5.49 (1H, q, J = 5.2 Hz), 4.27 (1H, m), 3.89 (1H, m), 3.80 (2H, m), 1.57 (3H, d, J = 5.2 Hz)

Сполука номер 228 (MP: 204-205). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 147.7, 146.3, 145.9, 141.3, 136.6, 124.8, 117.5, 115.6, 111.9, 109, 80.6, 79.3, 60.8, 55.6, 22.4

¹H: 9.03 (1H, s), 8.09 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.87 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.38 (1H, d, J = 1.7 Hz), 7.26 (1H, d d, J = 1.7, 8.1 Hz), 6.77 (1H, d, J = 8.1 Hz), 5.17 (2H, s), 3.84 (2H, s), 3.81 (3H, s), 1.50 (6H, s)

Сполука номер 229 (MP: 152). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 151.2, 142.1, 137.2, 133.1, 128.6, 127.4, 125.1, 113, 58.4, 38.6, 36.2, 34.1, 29.7

¹H: 7.92 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.80 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.48 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.40 (2H, t, J = 7.8 Hz), 7.29 (1H, t, J = 7.3 Hz), 2.99 (3H, s), 2.20 (9H, s), 1.73 (6H, s)

Сполука номер 230 (MP: 67-68). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 157.4, 148.7, 142.3, 137.4, 136.8, 129.9, 127.9, 126.5, 126.3, 123.4, 115.1, 114.2, 63.1, 62.3, 54.7, 51.6, 39.7

¹H: 11.54 (1H, s br), 8.28 (1H, s), 7.70 (1H, s), 7.66 (2H, d, J = 8.9 Hz), 7.43 (2H, t, J = 7.9 Hz), 7.40 (2H, d, J = 7.7 Hz), 7.34 (1H, m, J = 6.9 Hz), 7.03 (2H, d, J = 8.9 Hz), 4.46 (2H, m), 3.95 (2H, d br, J = 13.0 Hz), 3.85 (2H, t br, J = 11.70 Hz), 3.54 (2H, m), 3.48 (2H, m), 3.46 (3H, s), 3.19 (2H, m)

Сполука номер 231 (MP: 46-47). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 146.5, 142.5, 141.7, 140.9, 136.3, 133.2, 129.1, 128.7, 127.4, 127.2, 126.5, 124.1, 124, 112.2, 81.1, 80.4, 61.8, 22.9

¹H: 8.05 (1H, t, J = 1.6 Hz), 7.99 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.77 (1H, t d, J = 1.3, 7.6 Hz), 7.66 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.58 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.54 (1H, t d, J = 1.3, 7.7 Hz), 7.48 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.46 (2H, t, J = 7.8 Hz), 7.37 (1H, m, J = 7.4 Hz), 5.15 (2H, s), 3.89 (2H, s), 1.63 (6H, s)

Сполука номер 232 (MP: 191-192). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 167.9, 146.2, 140.7, 140.1, 140, 137.1, 135, 134, 129.6, 129.4, 129, 126.7, 125.8, 125.7, 124.2, 123.2, 114, 80.6, 79.3, 60.8, 22.4

¹H: 8.23-8.17 (4H, m), 8.15 (1H, s br), 7.88 (3H, m), 7.63 (1H, m, J = 8.1 Hz), 7.57 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.52 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.49 (1H, s br), 5.20 (2H, s), 3.86 (2H, s), 1.51 (6H, s)

Сполука номер 233 (MP: 130-131). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 146.5, 141.2, 136.7, 133.3, 131.4, 128.9, 126.4, 112.8, 98.6, 63.6, 48.8, 29.2, 22.3, 7.6

¹H: 8.05 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.73 (2H, m, J = 8.6 Hz), 7.61 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.38 (2H, m, J = 8.6 Hz), 4.16 (1H, m), 4.06 (1H, m), 3.83 (2H, m), 2.21 (1H, m), 2.06 (1H, m), 1.70 (3H, s), 0.95 (3H, t, J = 7.4 Hz)

Сполука номер 234 (MP: 135-136 (dec.)). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 150.1, 148.4, 143.6, 142.3, 142.2, 137.1, 137, 132.6, 132.3, 128.8, 128.7, 128, 127.7, 125.3, 125.2, 125.1, 112.8, 111.6, 65.2, 48.9, 32.8, 30.2, 22.1

¹H: 8.18 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.98 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.81 (2H, m, J = 8.5 Hz), 7.77 (2H, m, J = 8.5 Hz), 7.67 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.57 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.42 (2H, t, J = 7.5 Hz), 7.40 (2H, t, J = 7.5 Hz), 7.33 (1H, m), 7.30 (1H, m), 5.61 (1H, m), 4.73 (2H, t, J = 5.3 Hz), 4.12 (2H, t, J = 5.3 Hz), 2.34 (2H, m), 2.30 (2H, m), 1.91 (2H, qt, J = 7.6 Hz)

Сполука номер 235 (MP: 154-155). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 147.3, 141.7, 136.1, 133.3, 131.3, 128.9, 126.4, 112.3, 88.8, 78.6, 62.5, 24.8, 22, 20.7

¹H: 7.92 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.74 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.50 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.38 (2H, d, J = 8.6 Hz), 5.48 (1H, q, J = 5.2 Hz), 3.93 (1H, d, J = 8.6 Hz), 3.72 (1H, d, J = 8.6 Hz), 1.62 (3H, s), 1.47 (3H, s), 1.20 (3H, d, J = 5.2 Hz)

Сполука номер 236 (MP: 114-115). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 159.9, 146.5, 142.5 (2 sig.), 141.6, 136.3, 133.2, 129.7, 129.1, 126.6, 124.2, 124, 119.7, 112.8, 112.8, 112.3, 81.1, 80.4, 61.9, 55.3, 22.9

¹H: 8.02 (1H, t, J = 1.8 Hz), 7.99 (1H, d, J = 1.5 Hz), 7.78 (1H, t d, J = 1.5, 7.6 Hz), 7.57 (1H, d, J = 1.5 Hz), 7.53 (1H, t d, J = 1.5, 7.7 Hz), 7.48 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.38 (1H, t, J = 8.1 Hz), 7.25 (1H, d d, J = 1.0, 1.5, 7.6 Hz), 7.19 (1H, d d, J = 1.8, 2.6 Hz), 6.92 (1H, d d d, J = 1.0, 2.6, 8.2 Hz), 5.15 (2H, s), 3.89 (5H, s), 1.63 (6H, s)

Сполука номер 237 (MP: 148-149). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 146.8, 143.2, 135.9, 132.9, 128.7, 127.6, 125.2, 110.7, 53.2, 41.5, 36.1, 29.4

¹H: 8.10 (1H, s), 7.79 (2H, d, J = 8.0 Hz), 7.52 (1H, s), 7.40 (2H, t, J = 8.0 Hz), 7.30 (1H, t, J = 7.5 Hz), 5.39 (1H, s), 2.17 (3H, s), 2.11 (6H, s), 1.74 (6H, s)

5 Сполука номер 238 (MP: 175). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 169.3, 151.3, 141.8, 141.5, 140.6, 137, 133.8, 133.7, 130.7, 129.3, 129, 126.3, 126.3, 126.1, 124.5, 124, 113.6, 57.5, 31.4, 29.9, 25.4, 25.2

¹H: 8.11 (1H, t, J = 1.8 Hz), 8.08 (1H, t, J = 1.6 Hz), 7.94 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.81 (2H, m), 7.78 (1H, m), 7.57 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.52 (1H, t, J = 7.6 Hz), 7.51 (1H, m), 7.48 (1H, t, J = 7.6 Hz), 6.43 (1H, s br), 5.93 (1H, s br), 3.97 (1H, m), 3.0 (3H, s), 1.88 (2H, m), 1.85 (2H, m), 1.70 (1H, d br, J = 13.5 Hz), 1.58 (2H, d q, J = 3.5, 12.5 Hz), 1.38 (2H, t q, J = 3.0, 13.0 Hz), 1.13 (1H, t q, J = 3.3, 13.0 Hz)

10 Сполука номер 239 (MP: 129). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 151.3, 142.1, 141.7, 141, 137, 133.5, 129.1, 128.7, 127.3, 127.2, 126.3, 124, 124, 113.4, 57.5, 31.3, 30, 25.4, 25.2

¹H: 8.07 (1H, t, J = 1.8 Hz), 7.95 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.78 (1H, t d, J = 1.7, 7.7 Hz), 7.67 (2H, d, J = 8.0 Hz), 7.56 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.54 (1H, d t, J = 1.8, 7.9 Hz), 7.48 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.46 (2H, t, J = 7.9 Hz), 7.37 (1H, m), 3.97 (1H, m), 3.0 (3H, s), 1.89 (2H, m), 1.85 (2H, m), 1.71 (1H, d br, J = 13.0 Hz), 1.59 (2H, d q, J = 3.5, 12.5 Hz), 1.38 (2H, t q, J = 3.0, 13.0 Hz), 1.13 (1H, t q, J = 3.5, 13.0 Hz)

20 Сполука номер 240 (MP: 129-130). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 159.9, 151.3, 142.6, 142, 141.5, 137, 133.5, 129.7, 129.1, 126.4, 124.2, 124, 119.8, 113.4, 112.8, 112.8, 57.5, 55.3, 31.3, 30, 25.4, 25.2

¹H: 8.04 (1H, t, J = 1.6 Hz), 7.94 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.79 (1H, t t, J = 1.5, 7.5 Hz), 7.56 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.52 (1H, d t, J = 2.0, 7.9 Hz), 7.48 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.38 (1H, t, J = 7.9 Hz), 7.25 (1H, d d, J = 1.0, 1.7, 7.7 Hz), 7.19 (1H, d d, J = 1.8, 2.5 Hz), 6.92 (1H, d d d, J = 1.0, 2.6, 8.2), 3.97 (1H, m), 3.89 (3H, s), 3.0 (3H, s), 1.88 (2H, m), 1.85 (2H, m), 1.71 (1H, d br, J = 13.0 Hz), 1.59 (2H, d q, J = 3.5, 12.3 Hz), 1.39 (2H, t q, J = 3.0, 13.0 Hz), 1.13 (1H, t q, J = 3.3, 13.0 Hz)

25 Сполука номер 241 (MP: 173-174). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 149.1, 141.7, 136.7 (2 sig.), 133.4, 131.2, 129.7, 128.9, 128.8, 126.9, 126.4, 112.5, 91, 66.2, 47.9

¹H: 8.01 (1H, br), 7.68 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.54 (1H, br), 7.51 (2H, m), 7.42 (3H, m), 7.36 (2H, d, J = 8.3 Hz), 6.39 (1H, s), 4.32 (1H, br), 4.12 (1H, m), 4.04 (1H, m), 3.94 (1H, m)

30 Сполука номер 242 (MP: 173-174). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 158.9, 151.8, 140.2, 134.6, 120.8, 117, 97.4, 59.7, 57.3, 33.2, 30.9, 29.6, 25.4, 25.3

¹H: 8.61 (1H, s br), 7.94 (1H, d, J = 9.0 Hz), 7.53 (1H, d, J = 2.0 Hz), 7.06 (1H, d d, J = 2.0, 9.0 Hz), 3.21 (3H, s), 2.0 (2H, m), 1.89 (2H, m), 1.70 (2H, m), 1.61 (3H, m), 1.18 (1H, m)

35 Сполука номер 243 (MP: 165-166). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 167.7, 145.6, 145.5, 139, 137.4, 135.1, 131.9, 130, 129.2, 129.1, 127.1, 126.1, 117.3, 114.5, 81.8, 78.7, 61.6, 22.6

¹H: 8.57 (1H, d d, J = 0.7, 1.6 Hz), 8.31 (1H, t, J = 1.7 Hz), 8.21 (1H, d d, J = 0.7, 8.8 Hz), 8.18 (1H, s br), 8.11 (1H, d d, J = 1.6, 8.8 Hz), 7.98 (1H, d t, J = 1.5, 7.8 Hz), 7.91 (1H, d t, J = 1.4, 7.8 Hz), 7.60 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.51 (1H, s br), 5.46 (2H, s), 3.91 (2H, s), 1.60 (6H, s)

40 Сполука номер 244 (MP: 148). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 151.5, 141.1, 137, 133.1, 131.5, 128.8, 126.4, 113.5, 59.3, 31.2, 28.9, 24.4

¹H: 7.91 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.73 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.50 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.37 (2H, d, J = 8.6 Hz), 4.44 (1H, qt, J = 8.2 Hz), 3.0 (3H, s), 1.95 (2H, m), 1.78 (2H, m), 1.68 (2H, m), 1.63 (2H, m)

45 Сполука номер 245 (MP: 213-215). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 167.6, 150.9, 142.7, 140.4, 139.6, 137.7, 134.2, 133.2, 129.4, 128.2, 126.6, 125.6, 124.4, 123.1, 115, 56.8, 31.4, 29, 25.2, 24.9

¹H: 8.20 (1H, t, J = 1.8 Hz), 8.18 (1H, d, J = 1.1 Hz), 8.15 (1H, d, J = 1.1 Hz), 8.07 (1H, s br), 8.0 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.90 (1H, t d, J = 1.4, 7.7 Hz), 7.83 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.62 (1H, t d, J = 1.6, 8.0 Hz), 7.51 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.44 (1H, s br), 3.84 (1H, m), 2.95 (3H, s), 1.80 (4H, m), 1.60 (1H, m), 1.57 (2H, m), 1.30 (2H, m, J = 12.7 Hz), 1.11 (1H, m, J = 13 Hz)

50 Сполука номер 246 (MP: 118-119). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 163.1 (d, J = 245.0 Hz), 151.3, 143.3 (d, J = 8.0 Hz), 141.8, 140.4 (d, J = 2.0 Hz), 137, 133.7, 130.1 (d, J = 8.5 Hz), 129.2, 126.2, 124.5, 123.9, 122.8 (d, J =), 114.1 (d, J = 22.0 Hz), 114.1 (d, J = 21.0 Hz), 113.5, 57.6, 31.4, 30, 25.4, 25.2

¹H: 8.05 (1H, m), 7.94 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.79 (1H, t d, J = 2.0, 6.7 Hz), 7.57 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.50 (2H, m), 7.44 (2H, m), 7.37 (1H, d d d, J = 1.7, 2.5, 10.5 Hz), 7.06 (1H, m), 3.98 (1H, m), 3.02

(3H, s), 1.89 (2H, m), 1.87 (2H, m), 1.71 (1H, d br, J = 11.5 Hz), 1.59 (2H, d q, J = 3.6, 12.5 Hz), 1.39 (2H, t q, J = 3.2, 13.2 Hz), 1.13 (1H, t q, J = 3.3, 13.0 Hz)

Сполука номер 247 (MP: 208-209). ЯМР розчинник: DMSO

13C: 157.9, 150.9, 141.6, 140.7, 140.5, 137.7, 134, 130, 129.2, 125.3, 123.8, 122.9, 117.6, 114.8, 114.5, 113.6, 56.8, 31.4, 29, 25.2, 24.9

1H: 9.56 (1H, s, br), 8.14 (2H, s), 8.08 (1H, s), 7.83 (1H, t d, J = 2.0, 6.6 Hz), 7.47 (1H, m), 7.45 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.27 (1H, t, J = 8.0 Hz), 7.13 (1H, d d d, J = 1.0, 1.7, 7.6 Hz), 7.08 (1H, t, J = 1.9 Hz), 6.78 (1H, d d d, 1.0, 2.4, 8.0 Hz), 3.84 (1H, m), 2.94 (3H, s), 1.79 (4H, m), 1.60 (1H, m), 1.57 (2H, m), 1.30 (2H, q, J = 12.7 Hz), 1.13 (1H, m, J = 13.0 Hz)

10 Сполука номер 248 (MP: 131-132). ЯМР розчинник: DMSO

13C: 150.9, 149 (m, J = 2.0 Hz), 142.5, 140.3, 138.8, 137.7, 134.3, 130.9, 129.5, 126.0, 125.6, 124.6, 123.1, 120.2 (q, J = 256.0 Hz), 119.9, 119.4, 115.1, 56.8, 31.4, 29, 25.2, 24.9

1H: 8.20 (1H, d, J = 1.2 Hz), 8.17 (1H, t, J = 1.6 Hz), 8.15 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.91 (1H, t d, J = 1.4, 7.8 Hz), 7.79 (1H, d, J = 7.9 Hz), 7.71 (1H, br), 7.62 (1H, t, J = 8.1 Hz), 7.61 (1H, m), 7.51 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.39 (1H, d, J = 8.2 Hz), 2.94 (3H, s), 3.84 (1H, m), 1.78 (4H, m), 1.60 (1H, m), 1.56 (2H, m), 1.30 (2H, m, J = 12.8 Hz), 1.11 (1H, m)

15 Сполука номер 249 (MP: 162-163). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 151.5, 141.2, 136.9, 136.8, 133.1, 131.4, 128.9, 128.8, 127.7, 126.6, 126.3, 113.1, 51.7, 48.6, 20.4

20 1H: 7.91 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.46 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.64 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.39 (2H, t, J = 7.5 Hz), 7.34 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.32 (1H, m), 7.31 (2H, d, J = 8.2 Hz), 4.61 (2H, s), 4.20 (1H, m, J = 6.8 Hz), 1.37 (6H, d, J = 6.8 Hz)

Сполука номер 250 (MP: 111). ЯМР розчинник: CDCl₃

25 13C: 151.7, 142.3, 137, 136.7, 132.9, 128.9, 128.6, 127.7, 127.5, 126.6, 125.1, 112.9, 51.7, 48.5, 20.4

1H: 7.93 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.72 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.48 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.39 (2H, m), 7.37 (2H, m), 7.31 (3H, m), 7.27 (1H, m), 4.62 (2H, s), 4.21 (1H, m, J = 6.7 Hz), 1.37 (6H, d, J = 6.7 Hz)

Сполука номер 251 (MP: 132-133). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 152.2, 142, 138.4, 136.8, 133, 129, 128.6, 127.6, 127.3, 126.1, 125, 113, 59.4, 51.3, 28.1

30 1H: 7.91 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.65 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.46 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.38 (2H, t, J = 7.1 Hz), 7.35 (2H, t, J = 8.0 Hz), 7.31 (1H, m, J = 7.4 Hz), 7.26 (2H, m), 7.25 (1H, m), 4.69 (2H, s), 1.52 (9H, s)

Сполука номер 252 (MP: 129-130). ЯМР розчинник: CDCl₃

35 13C: 152.1, 141, 138.4, 136.9, 133, 131.5, 129, 128.8, 127.6, 126.2, 126.1, 113.2, 59.5, 51.3, 28.1

1H: 7.89 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.57 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.43 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.38 (2H, t, J = 7.6 Hz), 7.31 (1H, m), 7.31 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.24 (2H, d, J = 8.0 Hz), 4.68 (2H, s), 1.52 (9H, s)

Сполука номер 253 (MP: 147-148). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 162.9, 147.5, 147.3, 136.8, 129.1, 128.2, 127.5, 64.6, 47.3, 44.2

40 1H: 8.95 (1H, s), 8.07 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.47 (2H, d, J = 8.7 Hz), 5.15 (2H, br), 4.36 (2H, br), 3.40 (2H, t, J = 6.8 Hz)

Сполука номер 254 (MP: 141-142). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 151.5, 138.3, 134.2, 133.9, 128.4, 127.1, 126.8, 122.9, 57.2, 30.8, 30.1, 25.4, 25.2, 10.5

45 1H: 7.68 (2H, d, J = 8.1 Hz), 7.62 (1H, s), 7.43 (2H, t, J = 7.8 Hz), 7.30 (1H, t, J = 7.4 Hz), 3.91 (1H, m), 2.91 (3H, s), 2.46 (3H, s), 1.86 (2H, m), 1.81 (2H, m), 1.70 (1H, d br, J = 13.0 Hz), 1.57 (2H, m), 1.36 (2H, m), 1.12 (1H, m)

Сполука номер 255 (MP: oil). ЯМР розчинник: CDCl₃

50 13C: 159.9, 151.6, 142.1, 137, 136.7, 134.3, 129.7, 128.9, 127.7, 126.6, 117.5, 113.7, 113.2, 110, 55.3, 51.7, 48.6, 20.4

1H: 7.92 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.47 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.39 (2H, t, J = 7.2 Hz), 7.31 (4H, m), 7.28 (2H, m), 6.84 (1H, m), 4.61 (2H, s), 4.21 (1H, m, J = 6.8 Hz), 3.85 (3H, s), 1.37 (6H, d, J = 6.8 Hz)

Сполука номер 256 (MP: oil). ЯМР розчинник: CDCl₃

55 13C: 159.8, 152.2, 141.8, 138.5, 136.8, 134.4, 129.6, 129, 127.6, 126.1, 117.4, 113.8, 113.3, 109.7, 59.4, 55.2, 51.2, 28.1

1H: 7.91 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.45 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.39 (2H, t, J = 7.6 Hz), 7.30 (1H, m, J = 7.3 Hz), 7.26 (2H, m), 7.24 (2H, m), 7.19 (1H, m), 6.81 (1H, d d d, J = 1.2, 2.6, 8.0 Hz), 4.69 (2H, s), 3.82 (3H, s), 1.53 (9H, s)

Сполука номер 257 (MP: 138-139). ЯМР розчинник: CDCl₃

60 13C: 151.3, 142.8, 141.8, 140.2, 137, 134.6, 133.7, 129.9, 129.2, 127.3, 127.3, 126.2, 125.4, 124.5, 123.9, 113.6, 57.6, 31.4, 30, 25.4, 25.2

¹H: 8.04 (1H, m), 7.94 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.78 (1H, m), 7.66 (1H, t, J = 1.7 Hz), 7.57 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.54 (1H, t d, J = 1.5, 7.6 Hz), 7.49 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.48 (1H, m), 7.39 (1H, t, J = 7.6 Hz), 7.34 (1H, d d d, J = 1.5, 2.2, 8.1 Hz), 3.98 (1H, m), 3.02 (3H, s), 1.89 (2H, m), 1.87 (2H, m), 1.71 (1H, d br, J = 13.3 Hz), 1.60 (2H, m), 1.39 (2H, t q, J = 3.0, 12.7 Hz), 1.14 (1H, t q, J = 3.3, 13.0 Hz)

5 Сполука номер 258 (MP: 115-118). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 159.2, 151.3, 142.5, 142, 141.6, 137, 133.5, 129.7, 129.1, 126.4, 124.1, 124, 119.6, 113.4 (2 sig.), 113.3, 63.5, 57.5, 31.4, 30, 25.4, 25.2, 14.9

¹H: 8.04 (1H, m, J = 1.7 Hz), 7.94 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.78 (1H, t d, J = 1.7, 7.5 Hz), 7.55 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.52 (1H, d t, J = 1.5, 7.9 Hz), 7.47 (1H, t, J = 7.6 Hz), 7.36 (1H, t, J = 8.0 Hz), 7.24 (1H, d d, J = 1.0, 1.7, 7.7 Hz), 7.19 (1H, d d, J = 1.7, 2.5 Hz), 6.91 (1H, d d d, J = 1.0, 2.5, 8.2 Hz), 4.11 (2H, q, J = 7.0 Hz), 3.97 (1H, m), 3.01 (3H, s), 1.89 (2H, m), 1.86 (2H, m), 1.71 (1H, d br, J = 12.5 Hz), 1.59 (2H, qd, J = 3.5, 12.5 Hz), 1.46 (3H, t, J = 7.0 Hz), 1.39 (2H, t q, J = 3.0, 13.0 Hz), 1.13 (1H, t q, J = 3.5, 13.0 Hz)

15 Сполука номер 259 (MP: 137-139). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 158.3 (d, J = 248.0 Hz), 151.3, 141.7, 137.0, 135.0 (d, J = 1.3 Hz), 133.5, 130.5 (d, J = 3.5 Hz), 130.4 (m, J = 14.0 Hz), 129.3 (d, J = 3.3 Hz), 128.9, 128.7 (d, J = 8.5 Hz), 128.0, 125.6 (d, J = 2.5 Hz), 124.9, 117.4 (d, J = 25.0 Hz), 113.6, 57.5, 31.4, 30, 25.4, 25.2

¹H: 7.97 (1H, s br), 7.93 (1H, d, J = 1.1 Hz), 7.82 (1H, t d, J = 1.7, 7.2 Hz), 7.56 (1H, d, J = 1.1 Hz), 7.52-7.43 (3H, m), 7.29 (1H, m), 7.11 (1H, t, J = 9.5 Hz), 3.96 (1H, m), 3.0 (3H, s), 1.88 (2H, m), 1.85 (2H, m), 1.71 (1H, d br, J = 13.0 Hz), 1.59 (2H, d q, J = 3.5, 12.5 Hz), 1.39 (2H, t q, J = 3.0, 13.0 Hz), 1.13 (1H, t q, J = 3.5, 13.0 Hz)

20 Сполука номер 260 (MP: 190-191). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 156.8, 146.3, 141.3, 136.7, 126.2, 124.4, 115.4, 111.6, 80.6, 79.3, 60.8, 22.5

¹H: 9.48 (1H, s), 8.09 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.80 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.64 (2H, m d, J = 8.5 Hz), 6.76 (2H, m d, J = 8.5 Hz), 5.14 (2H, s), 3.84 (2H, s), 1.49 (6H, s)

25 Сполука номер 261 (MP: 197-199). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 156.7, 151, 140.9, 137.3, 126.1, 124.4, 115.4, 112.5, 56.8, 31.3, 29.1, 25.2, 24.9

¹H: 9.48 (1H, s), 8.05 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.77 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.64 (2H, m, J = 8.3 Hz), 6.77 (2H, m, J = 8.3 Hz), 3.80 (1H, m), 2.91 (3H, s), 1.77 (4H, m), 1.59 (1H, m), 1.55 (2H, m), 1.28 (2H, m), 1.10 (1H, m)

30 Сполука номер 262 (MP: 170 (dec.)). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 157.9, 149, 137.3, 135.3, 130.2, 129.5, 116.3, 116, 115.9, 112.3, 58.7, 31.5, 28.2, 24

¹H: 9.70 (1H, s), 9.24 (1H, s), 8.32 (1H, s), 7.29 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.27 (1H, m), 7.24 (1H, m), 6.83 (1H, m, J = 2.2, 6.7 Hz), 4.39 (1H, m), 2.97 (3H, s), 1.89 (2H, m), 1.70 (4H, m), 1.53 (2H, m)

35 Сполука номер 263 (MP: 89-91). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 146.8, 138.7, 134, 133.1, 128.4, 127.2, 126.9, 122.8, 81.2, 80.7, 61, 23, 10.6

¹H: 7.66 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.63 (1H, s), 7.43 (2H, t, J = 7.8 Hz), 7.31 (1H, t, J = 7.4 Hz), 4.93 (2H, s), 3.90 (2H, s), 2.49 (3H, s), 1.61 (6H, s)

40 Сполука номер 264 (MP: 118-119). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 152.1, 138.7, 135.3, 134.2, 134.1, 129.1, 128.4, 128.2, 127.7, 127.2, 126.9, 123.2, 53.9, 36, 10.6

¹H: 7.69 (1H, s), 7.67 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.43 (2H, t, J = 7.7 Hz), 7.31 (1H, t, J = 7.4 Hz), 7.40-7.27 (5H, m), 4.66 (2H, s), 3.01 (3H, s), 2.49 (3H, s)

45 Сполука номер 265 (MP: 178-180 (dec.)). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 157.9, 149.1, 137.3, 136.8, 135.8, 130.2, 129.5, 128.5, 127.2, 126.8, 116.3, 116.1, 115.4, 112.4, 51.4, 47.1, 20.1

¹H: 9.73 (1H, s), 9.18 (1H, s), 8.29 (1H, s), 7.36-7.28 (5H, m), 7.27 (1H, t, J = 8.0 Hz), 7.21 (1H, m), 7.18 (1H, m), 6.82 (1H, m, J = 2.5, 8.1 Hz), 4.65 (2H, s), 4.16 (1H, m), 1.28 (6H, d, J = 6.7 Hz)

50 Сполука номер 266 (MP: oil). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 150.7, 145.2, 133.2, 129.1, 125.1, 119.7, 113.5, 59.3, 28.8, 24.3

¹H: 8.09 (1H, m d, J = 8.3 Hz), 7.98 (1H, m d, J = 8.3 Hz), 7.59 (1H, m, J = 7.7 Hz), 7.45 (1H, m, J = 7.7 Hz), 4.78 (1H, m), 3.17 (3H, s), 2.07 (2H, m), 1.75 (4H, m), 1.63 (2H, m)

55 Сполука номер 267 (MP: 142-143). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 146.6, 141.2, 136.7, 133.2, 131.4, 128.9, 126.4, 112.8, 96.5, 75.9, 53.4, 25.6, 25.4, 23.7, 9.8

¹H: 8.03 (1H, br), 7.73 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.59 (1H, br), 7.37 (2H, d, J = 8.5 Hz), 4.10 (1H, m), 3.81 (1H, d d, J = 5.3, 9.0 Hz), 3.43 (1H, t, J = 9.2 Hz), 1.74 (3H, s), 1.72 (2H, m), 1.66 (3H, s), 1.0 (3H, t, J = 7.5 Hz)

Сполука номер 268 (MP: 117-118). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 144.9, 136.5, 133.6, 131.7, 128.5, 127.8, 126.4, 110.8, 95.7, 63.1, 47.7, 23.9

- 1H: 7.96 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.78 (1H, s), 7.45 (2H, t, J = 8.0 Hz), 7.35 (1H, t, J = 7.5 Hz), 4.07 (2H, t, J = 6.2 Hz), 3.58 (2H, t, J = 6.2 Hz), 1.74 (6H, s)
 Сполука номер 269 (MP: 92-93). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 141.6, 135.3, 133.9, 129.4, 128.8, 128.1, 127.5, 111.0, 80.6, 61.3, 29.7, 22.7, 22.5
- 5 1H: 7.85 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.40 (2H, d, J = 8.8 Hz), 4.81 (2H, s), 3.84 (2H, s), 1.65 (6H, s)
 Сполука номер 270 (MP: oil). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 146.7, 142.2, 136.6, 132.9, 128.7, 127.6, 125.2, 112.5, 96.4, 75.9, 53.4, 25.6, 25.4, 23.7, 9.8
 1H: 8.05 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.80 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.61 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.41 (2H, t, J = 8.0 Hz), 7.30 (1H, t, J = 7.4 Hz), 4.11 (1H, m), 3.81 (1H, d d, J = 5.2, 9.0 Hz), 3.44 (1H, t, J = 9.5 Hz), 1.75 (3H, s), 1.73 (3H, s), 1.72 (2H, m), 1.0 (3H, t, J = 7.7 Hz)
- 10 Сполука номер 271 (MP: 113-114). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 156, 151.7, 137.4, 136, 128, 127.6, 121.7, 120.9, 117.2, 110.6, 57.5, 55.2, 31.1, 30.1, 25.4, 25.2
 1H: 8.23 (1H, d d, J = 1.8, 7.7 Hz), 7.94 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.82 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.28 (1H, d t, J = 2.0, 7.6 Hz), 7.07 (1H, J = 1.1, 7.6 Hz), 6.97 (1H, d, J = 8.3 Hz), 3.95 (3H, s), 3.95 (1H, m), 2.99 (3H, s), 1.87 (4H, m), 1.69 (1H, d br, J = 12.3 Hz), 1.59 (2H, d q, J = 3.5, 12.5 Hz), 1.37 (2H, t q, J = 3.0, 13.0 Hz), 1.13 (1H, t q, J = 3.3, 13.1 Hz)
- 15 Сполука номер 272 (MP: 178-181). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 151.0, 150.5 (d d, J = 12.7, 247 Hz), 149.7 (d d, J = 13.0, 248.0 Hz), 140.3, 137, 130.3 (d d, J = 3.7, 6.6 Hz), 121.0 (d d, J = 3.5, 6.3 Hz), 117.5 (d, J = 17.5 Hz), 114.1 (d, J = 18.5 Hz), 113.5 (d, J = 1.0 Hz), 57.6, 31.3, 29.9, 25.4, 25.2
 1H: 7.88 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.61 (1H, d d d, J = 2.2, 7.7, 11.6 Hz), 7.49 (1H, m), 7.45 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.17 (1H, d t, J = 8.4, 10.5 Hz), 3.93 (1H, m), 2.99 (3H, s), 1.86 (4H, m), 1.70 (1H, d br), 1.58 (2H, d q, J = 3.5, 12.3 Hz), 1.37 (2H, t q, J = 3.0, 13.0 Hz), 1.12 (1H, t q, J = 3.5, 13.0 Hz)
- 20 Сполука номер 273 (MP: 142-143). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 162.3 (d, J = 246 Hz), 151.3, 141.3, 136.9, 129.2 (d, J = 3.2 Hz), 126.8 (d, J = 8.0 Hz), 115.6 (d, J = 22.0 Hz), 112.9, 57.5, 31.3, 30, 25.4, 25.2
 1H: 7.89 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.76 (2H, m, J = 5.4, 8.9 Hz), 7.74 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.09 (2H, m, J = 8.8 Hz), 3.95 (1H, m), 2.99 (3H, s), 1.87 (4H, m), 1.70 (1H, d br, J = 13.0 Hz), 1.58 (2H, d q, J = 3.5, 12.2 Hz), 1.37 (2H, t q, J = 3.5, 13.0 Hz), 1.13 (1H, t q, J = 3.5, 13.0 Hz)
- 25 Сполука номер 274 (MP: 156-158). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 151, 140, 137.1, 133.2, 132.8, 131.1, 130.6, 126.9, 124.3, 114, 57.6, 31.4, 29.9, 25.4, 25.2
 1H: 7.91 (1H, d, J = 2.0 Hz), 7.90 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.61 (1H, d d, J = 2.0, 8.4 Hz), 7.51 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.45 (1H, d, J = 8.4 Hz), 3.94 (1H, m), 3.0 (3H, s), 1.86 (4H, m), 1.71 (1H, m), 1.58 (2H, J = 3.5, 12.5 Hz), 1.38 (2H, t q, J = 3.0, 13.0 Hz), 1.13 (1H, t q, J = 3.5, 13.0 Hz)
- 30 Сполука номер 275 (MP: 160-162). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 150.9, 148.6, 140, 137.3, 134.9, 130.9, 129.7, 122, 119.9, 114.6, 57.6, 31.4, 29.9, 25.4, 25.2
 1H: 8.61 (1H, t, J = 2 Hz), 8.14 (2H, m), 7.94 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.64 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.57 (1H, t, J = 8.0 Hz), 3.96 (1H, m, J = 12.0 Hz), 3.02 (3H, s), 1.88 (4H, m), 1.72 (1H, m), 1.60 (2H, d q, J = 3.5, 12.5 Hz), 1.39 (2H, t q, J = 3.0, 13.0 Hz), 1.14 (1H, t q, J = 3.5, 13.0 Hz)
- 35 Сполука номер 276 (MP: 130-131). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 151.2, 150.5 (t, J = 2.7 Hz), 141.1, 137, 130.5, 126.5, 119.7, 115.9 (t, J = 259.5 Hz), 113.2, 57.6, 31.3, 30, 25.4, 25.2
 1H: 7.89 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.79 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.47 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.15 (2H, d, J = 8.8 Hz), 6.54 (1H, t, J = 7.4 Hz), 3.95 (1H, m, J = 11.0 Hz), 3.0 (3H, s), 1.86 (4H, m), 1.70 (1H, dbr, J = 14.0 Hz), 1.58 (2H, d q, J = 3.6, 12.2 Hz), 1.37 (2H, J = 3.2, 13.0 Hz), 1.13 (1H, J = 3.5, 13.0 Hz)
- 40 Сполука номер 277 (MP: 168-169). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 151.2, 141.1, 137, 133.1, 131.6, 128.8, 126.4, 113.4, 57.6, 31.3, 30, 25.4, 25.2
 1H: 7.90 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.73 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.49 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.37 (2H, J = 8.7 Hz), 3.95 (1H, m, J = 11.8 Hz), 2.99 (3H, s), 1.86 (4H, m), 1.70 (1H, d, J = 13.5 Hz), 1.58 (2H, d q, J = 3.5, 12.3 Hz), 1.38 (2H, t q, J = 3.0, 13.0 Hz), 1.13 (1H, t q, J = 3.5, 13 Hz)
- 45 Сполука номер 278 (MP: 160). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 151.5, 142.3, 136.9, 132.8, 128.7, 127.6, 125.1, 113.1, 67, 54.4, 31.8, 29.5
 1H: 7.94 (1H, s), 7.80 (2H, d, J = 7.6 Hz), 7.51 (1H, s), 7.41 (2H, t, J = 7.6 Hz), 7.30 (1H, t, J = 7.3 Hz), 4.28 (1H, m), 4.09 (2H, d d, J = 4.0, 11.5 Hz), 3.50 (2H, t, J = 11.5 Hz), 3.04 (3H, s), 1.94 (2H, d q, J = 4.5, 12.3 Hz), 1.77 (2H, d br, J = 12.0 Hz)
- 50 Сполука номер 279 (MP: 157-159). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 152.2, 145.6, 140.7, 133.3, 128.6, 127.1, 125, 112.4, 57, 30.7, 30.1, 25.4, 25.2, 14
- 55

¹H: 7.76 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.38 (2H, t, J = 7.9 Hz), 7.26 (1H, t, J = 7.5 Hz), 7.21 (1H, s), 3.90 (1H, m br), 2.88 (3H, s), 2.52 (3H, s), 1.81 (4H, m), 1.68 (1H, d br, J = 13.0 Hz), 1.55 (2H, d q, J = 3.3, 12.2 Hz), 1.35 (2H, q br, J = 12.5 Hz), 1.11 (1H, t q, J = 3.0, 13.0 Hz)

Сполука номер 280 (MP: 137). ЯМР розчинник: CDCl₃

5 ¹³C: 143.9, 135.7, 133.7, 133.7, 130.1, 128.7, 127.7, 111.2, 80.9, 80.6, 61.3, 22.9

¹H: 7.90 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.73 (1H, s), 7.41 (2H, s, J = 8.6 Hz), 4.88 (2H, s), 3.91 (2H, s), 1.62 (6H, s)

Сполука номер 281 (MP: 132-134). ЯМР розчинник: CDCl₃

10 ¹³C: 151.7, 149.1, 148.5, 142, 136.7, 126.1, 117.4, 112.4, 111.2, 108.4, 59.3, 55.9, 55.9, 31.2, 28.8, 24.3

¹H: 7.91 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.44 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.40 (1H, d, J = 2.0 Hz), 7.30 (1H, d d, J = 2.0, 8.3 Hz), 6.90 (1H, d, J = 8.3 Hz), 4.44 (1H, m, J = 8.2 Hz), 3.96 (3H, s), 3.91 (3H, s), 2.99 (3H, s), 1.95 (2H, m), 1.73 (4H, m), 1.62 (2H, m)

Сполука номер 282 (MP: 189-191). ЯМР розчинник: CDCl₃

15 ¹³C: 151.5, 142.2, 138.1, 137, 132.9, 129.1, 128.7, 128.3, 127.6, 127.2, 125.1, 113.1, 62.8, 55.8, 52.5, 31.6, 28.9

¹H: 7.92 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.80 (2H, m, J = 8.0 Hz), 7.50 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.41 (2H, t, J = 7.6 Hz), 7.37-7.25 (6H, m), 4.03 (1H, m), 3.53 (2H, s), 3.03 (3H, s), 3.01 (2H, m), 2.11 (2H, t br, J = 11.2 Hz), 1.90 (2H, q br, J = 12.0 Hz), 1.79 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

20 Сполука номер 283 (MP: 128). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 162.3, 149.8, 147.2, 130.1, 129.9, 128.7, 126.7, 57.6, 30.2 (2 sig.), 25.5, 25.3

¹H: 8.82 (1H, s), 8.15 (2H, m), 7.48 (3H, m), 4.32 (1H, m br), 3.14 (3H, s), 1.93 (4H, m), 1.71 (1H, d br, J = 13.3 Hz), 1.59 (2H, m), 1.40 (2H, m), 1.15 (1H, t q, J = 3.5, 13.0 Hz)

Сполука номер 284 (MP: 151-153). ЯМР розчинник: CDCl₃

25 ¹³C: 160.3, 153.3, 151, 130.3, 129.6, 128.6, 126.5, 58.7, 30.8, 29.5, 25.5, 25.2, 13.8

¹H: 8.10 (2H, m, J = 7.5 Hz), 7.45 (3H, m), 4.21+3.80 (1H, m), 3.03-2.99 (3H, m), 2.69 (3H, s), 1.88 (4H, m), 1.72 (1H, m), 1.58 (2H, m), 1.54 (2H, m), 1.12 (1H, m)

Сполука номер 285 (MP: 135-138). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 162.9, 146.2, 144.9, 130.1, 129.8, 128.7, 126.7, 82, 79.3, 62.2, 22.8

30 ¹H: 8.94 (1H, s), 8.12 (2H, m), 7.47 (3H, m), 5.57 (2H, s), 3.86 (2H, s), 1.63 (6H, s)

Сполука номер 286 (MP: 125-127). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 160, 157.7, 146.4, 129.9, 129.9, 128.6, 126.6, 82.2, 79.6, 61.7, 22.8, 15.1

¹H: 8.08 (2H, m), 7.45 (3H, m), 5.40 (2H, s), 3.85 (2H, s), 2.80 (3H, s), 1.62 (6H, s)

Сполука номер 287 (MP: 222-224). ЯМР розчинник: DMSO

35 ¹³C: 167.8, 150.7, 140.5, 140.2, 140, 137.8, 135, 134.2, 129.6, 129.3, 129, 126.7, 125.8, 125.6, 124.1, 123.1, 114.7, 57.5, 37.9, 35.9, 33.8, 29.2

¹H: 8.21 (1H, m, J = 1.6 Hz), 8.17 (1H, m, J = 1.6 Hz), 8.15 (1H, s br), 8.14 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.12 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.88 (1H, d d, J = 1.6, 7.8 Hz), 7.88 (2H, m), 7.62 (1H, m), 7.57 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.51 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.48 (1H, s br), 2.94 (3H, s), 2.16 (6H, s), 2.11 (3H, s), 1.66 (6H, s)

40 Сполука номер 288 (MP: 138-139). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 159.2, 151.2, 141.9, 137.2, 137, 134.6, 129.7, 128.5, 127.9, 127.5, 117.8, 114.3, 113.3, 111.2, 69.9, 58.4, 38.6, 36.2, 34.1, 29.7

¹H: 7.93 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.50 (1H, m), 7.47 (2H, m), 7.46 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.40 (2H, m), 7.38 (1H, m), 7.34 (1H, m), 7.31 (1H, t, J = 7.9 Hz), 6.92 (1H, d d, J = 1.0, 2.5, 8.2 Hz), 5.14 (2H, s), 2.99 (3H, s), 2.20 (9H, s), 1.74 (6H, s)

45 Сполука номер 289 (MP: 165-169 (dec.)). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 150.9, 148.4, 146.7, 139.1, 137.6, 132.4, 129.1, 123.6, 113.8, 58.5, 38.5, 36.2, 34.1, 29.6

¹H: 9.0 (1H, d, J = 1.5 Hz), 8.52 (1H, d d, J = 1.3, 4.7 Hz), 8.11 (1H, d t, J = 1.8, 7.8 Hz), 7.94 (1H, s), 7.55 (1H, s), 7.33 (1H, d d, J = 4.9, 7.7 Hz), 2.99 (3H, s), 2.19 (9H, s), 1.73 (6H, s)

50 Сполука номер 290 (MP: 149). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 151.2, 142, 141.6, 141, 137.3, 133.6, 129.1, 128.7, 127.3, 127.2, 126.3, 124, 123.9, 113.2, 58.4, 38.6, 36.2, 34.1, 29.7

¹H: 8.05 (1H, t br, J = 1.8 Hz), 7.95 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.78 (1H, d t, J = 1.5, 7.5 Hz), 7.67 (2H, m, J = 8.5 Hz), 7.53 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.53 (1H, m), 7.48 (1H, t, J = 7.6 Hz), 7.46 (2H, t, J = 7.8 Hz), 7.37 (1H, m, J = 7.5 Hz), 3.0 (3H, s), 2.21 (9H, s), 1.74 (6H, s)

55 Сполука номер 291 (MP: 208-210). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 151.1, 150.2, 148.2, 141.5, 138.6, 137.4, 134.1, 129.4, 126, 125.7, 123.8, 121.7, 113.5, 58.5, 38.6, 36.2, 34.1, 29.7

¹H: 8.67 (2H, m, J = 5.0 Hz), 8.11 (1H, m, J = 2.0 Hz), 7.95 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.84 (1H, d t, J = 1.7, 7.5 Hz), 7.58 (2H, m), 7.55 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.55 (1H, m), 7.51 (1H, t, J = 7.6 Hz), 3.0 (3H, s), 2.20 (9H, s), 1.73 (6H, s)

Сполука номер 292 (MP: 75-77). ЯМР розчинник: CDCl₃

5 ¹³C: 146.4, 141.3, 136.9, 136.3, 133.2, 131.3, 129, 128.9, 128.8, 126.4, 126.2, 112.5, 97, 76.3, 55.5, 25.4, 24

¹H: 8.05 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.70 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.56 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.46-7.38 (5H, m), 7.35 (2H, d, J = 8.5 Hz), 5.21 (1H, d d, J = 5.5, 9.8 Hz), 4.10 (1H, d d, J = 5.5, 9.3 Hz), 3.68 (1H, t, J = 9.5 Hz), 1.88 (3H, s), 1.87 (3H, s)

10 Сполука номер 293 (MP: 164-165). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 161.4, 146.5, 140.5, 134.4, 120.3, 117.9, 94.7, 82.6, 79.6, 62.1, 56, 23

¹H: 7.92 (1H, d d, J = 0.5, 9.0 Hz), 7.58 (1H, d, J = 2.5 Hz), 7.08 (1H, d d, J = 2.5, 9.0 Hz), 5.53 (1H, s), 3.94 (3H, s), 3.90 (2H, s), 1.69 (6H, s)

Сполука номер 294 (MP: 190-193 (dec.)). ЯМР розчинник: DMSO

15 ¹³C: 156.9, 151, 140.3, 137.2, 126.2, 123.8, 115.4, 112.7, 58.4, 31.2, 28.2, 24

¹H: 9.53 (1H, s), 8.18 (1H, s), 7.81 (1H, s), 7.65 (2H, d, J = 8.7 Hz), 6.79 (2H, d, J = 8.7 Hz), 4.36 (1H, m), 2.92 (3H, s), 1.86 (2H, m), 1.67 (4H, m), 1.53 (2H, m)

Сполука номер 295 (MP: 91-93). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 144.0, 136.6, 133.6, 131.6, 128.5, 127.9, 126.5, 110.9, 81.0, 80.6, 61.3, 22.9

20 ¹H: 7.96 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.74 (1H, s), 7.45 (2H, m, J = 7.8 Hz), 7.35 (1H, m, J = 7.6 Hz), 4.88 (2H, s), 3.91 (2H, s), 1.62 (6H, s)

Сполука номер 296 (MP: 106-110). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 156.9, 150.9, 141.6, 137.3, 134, 130, 117.1, 115.1, 113.5, 112.6, 58.5, 38.5, 36.2, 34.1, 29.7

25 ¹H: 7.95 (1H, s), 7.46 (1H, m), 7.42 (1H, s), 7.24 (1H, m), 7.23 (1H, m), 6.91 (1H, m), 2.96 (3H, s), 2.18 (9H, s), 1.72 (6H, s)

Сполука номер 297 (MP: 119-121). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 149.8, 144.6, 132.6, 129.3, 125.3, 119.6, 113.3, 67.9, 57.6, 56.1, 34.2, 27.2

30 ¹H: 8.18 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.90 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.68 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.52 (1H, t, J = 7.6 Hz), 4.64 (1H, s br), 4.03 (1H, s br), 3.40 (1H, s br), 3.03 (3H, s), 1.90 (2H, s br), 1.82 (2H, s br), 1.75 (2H, s br), 1.26 (2H, s br)

Сполука номер 298 (MP: 94-95). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 146.6, 142.4, 136.9, 136.3, 132.8, 129, 128.9, 128.7, 127.6, 126.2, 125.2, 112.3, 96.9, 76.3, 55.5, 25.4, 24

35 ¹H: 8.06 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.78 (2H, m, J = 8.3 Hz), 7.58 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.44 (5H, m), 7.39 (2H, m, J = 7.8 Hz), 7.29 (1H, m, J = 7.4 Hz), 5.21 (1H, d d, J = 5.5, 9.8 Hz), 4.11 (1H, d d, J = 5.5, 9.3 Hz), 3.69 (1H, t, J = 9.5 Hz), 1.89 (3H, s), 1.87 (3H, s)

Сполука номер 299 (MP: 140-142). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 146.7, 141.2, 136.7, 133.3, 131.4, 128.9, 126.4, 112.8, 96.4, 63.6, 48.3, 24.1

40 ¹H: 8.06 (1H, br), 7.73 (2H, m, J = 8.6 Hz), 7.61 (1H, br), 7.38 (2H, m, J = 8.6 Hz), 4.12 (2H, t, J = 6.0 Hz), 3.85 (2H, t, J = 6.0 Hz), 1.74 (6H, s)

Сполука номер 300 (MP: 149-150). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 149.1, 136.3, 134.3, 131.9, 128.5, 127.7, 126.4, 111.6, 57, 30.6, 29.8, 25.3, 25.2

45 ¹H: 7.98 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.72 (1H, br), 7.45 (2H, m, J = 7.6 Hz), 7.34 (1H, m, J = 7.5 Hz), 4.24 (1H, m br), 2.88 (3H, br), 1.86 (4H, m), 1.70 (1H, m), 1.56 (2H, m), 1.40 (2H, m), 1.13 (1H, m)

Сполука номер 301 (MP: 136-137). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 144.3, 138.8, 135.2, 133.8, 130.5, 128.6, 128.1, 96.1, 81.1, 80.7, 61.3, 22.9

¹H: 7.91 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.82 (1H, s), 7.41 (2H, d, J = 8.5 Hz), 4.84 (2H, s), 3.91 (2H, s), 1.63 (6H, s)

Сполука номер 302 (MP: 108). ЯМР розчинник: CDCl₃

50 ¹³C: 149.4, 143.0, 136.4, 132.6, 128.7, 127.8, 125.2, 112.2, 80.7, 71.4, 57.8, 24.9, 9.8

¹H: 7.98 (1H, br), 7.81 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.54 (1H, br), 7.42 (2H, t, J = 7.4 Hz), 7.31 (1H, t, J = 7.3 Hz), 5.13 (1H, d, J = 4.5 Hz), 5.0 (1H, d, J = 4.5 Hz), 4.32 (2H, m), 3.73 (1H, m), 1.91 (1H, m), 1.64 (1H, m), 0.98 (3H, t, J = 7.5 Hz)

Сполука номер 303 (MP: 80-81). ЯМР розчинник: CDCl₃

55 ¹³C: 150.6 (d d, J = 13.0, 247.5 Hz), 149.9 (d d, J = 13.0, 249.0 Hz), 149.1, 141.1, 136.5, 129.9 (d d, J = 3.8, 7.0 Hz), 121.2 (d d, J = 3.5, 6.2 Hz), 117.6 (d, J = 17.5 Hz), 114.3 (d, J = 18.6 Hz), 112.5, 80.7, 71.5, 57.8, 24.9, 9.8

60 ¹H: 7.95 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.62 (1H, d d d, J = 2.0, 7.5, 11.5 Hz), 7.50 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.49 (1H, m), 7.19 (1H, d t, J = 8.4, 10.2 Hz), 5.12 (1H, d, J = 4.5 Hz), 4.99 (1H, d, J = 4.5 Hz), 4.33 (2H, m), 3.74 (1H, m), 1.90 (1H, m), 1.64 (1H, m), 0.98 (3H, t, J = 7.4 Hz)

Сполука номер 304 (MP: 100-101). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 159.9, 149.3, 142.8, 136.4, 134, 129.7, 117.6, 113.9, 112.4, 110.3, 80.7, 71.4, 57.8, 55.3, 24.9, 9.8

¹H: 7.98 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.52 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.39 (1H, m), 7.36 (1H, d t, J = 1.5, 7.7 Hz), 7.31 (1H, t, J = 7.7 Hz), 6.88 (1H, d d d, J = 1.4, 2.6, 8.0 Hz), 5.13 (1H, d, J = 4.5 Hz), 5.0 (1H, d, J = 4.5 Hz), 4.32 (2H, m), 3.88 (3H, s), 3.73 (1H, m), 1.90 (1H, m), 1.63 (1H, m), 0.98 (3H, t, J = 7.5 Hz)

Сполука номер 305 (MP: 131-132). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 151.1, 148.5, 148.3, 141.6, 138.3, 137.3, 136.5, 134.5, 134, 129.4, 126.2, 124.8, 123.9, 123.5, 113.4, 58.4, 38.6, 36.2, 34.1, 29.7

¹H: 8.91 (1H, d, J = 2.5 Hz), 8.61 (1H, d d, J = 1.7, 4.8 Hz), 8.05 (1H, m), 7.95 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.95 (1H, m), 7.82 (1H, m), 7.55 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.51 (1H, m), 7.50 (1H, m), 7.38 (1H, d d d, J = 0.8, 4.8, 7.9 Hz), 3.0 (3H, s), 2.10 (9H, s), 1.73 (6H, s)

Сполука номер 306 (MP: 195-196). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 157.5, 155, 151, 141.2, 137.4, 134.7, 134.4, 134.2, 129.7, 125.9, 125.6, 123.7, 113.6, 58.5, 38.5, 36.2, 34.1, 29.6

¹H: 9.22 (1H, s), 9.01 (2H, s), 8.05 (1H, s), 7.95 (1H, s), 7.85 (1H, d, J = 7.5 Hz), 7.56 (1H, s), 7.54 (1H, t, J = 7.5 Hz), 7.48 (1H, d, J = 7.5 Hz), 3.0 (3H, s), 2.19 (9H, s), 1.73 (6H, s)

Сполука номер 307 (MP: 150-151). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 157.6, 150.8, 140.7, 137.5, 134.6, 129.6, 115.7, 114.3, 114.1, 111.7, 56.8, 31.3, 29.1, 25.2, 24.9

¹H: 9.43 (1H, s), 8.09 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.90 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.26 (2H, m), 7.16 (1H, t, J = 8.0 Hz), 6.65 (1H, d d d, J = 1.0, 2.2, 8.0 Hz), 3.80 (1H, m), 2.92 (3H, s), 1.77 (4H, m), 1.59 (1H, m), 1.55 (2H, m), 1.29 (2H, m, J = 11.5 Hz), 1.10 (1H, q, J = 13.0 Hz)

Сполука номер 308 (MP: 139-140). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 150.6 (d d, J = 13.0, 248.0 Hz), 149.9 (d d, J = 13.0, 249.0 Hz), 148.1, 141.1, 136.7, 136.1, 129.8 (d d, J = 3.9, 6.5 Hz), 129.1, 128.9, 126.1, 121.2 (d d, J = 3.5, 6.2 Hz), 117.6 (d, J = 17.8 Hz), 114.3 (d, J = 18.5 Hz), 112.4, 80.4, 80.1, 53.0

¹H: 8.05 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.62 (1H, d d d, J = 2.0, 7.6, 11.5 Hz), 7.56 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.45 (1H, m), 7.42-7.37 (5H, m), 7.18 (1H, d t, J = 8.3, 10.0 Hz), 5.44 (1H, d, J = 4.5 Hz), 5.26 (1H, d, J = 4.5 Hz), 5.18 (1H, d d, J = 6.1, 8.8 Hz), 4.16 (1H, d d, J = 6.1, 10.0 Hz), 3.68 (1H, d d, J = 9.0, 10.0 Hz)

Сполука номер 309 (MP: 155-157). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 148.4, 142.9, 136.6, 136.2, 132.5, 129.0, 128.9, 128.7, 127.8, 126.1, 125.2, 112.1, 80.4, 80.0, 53.0

¹H: 8.08 (1H, br), 7.80 (2H, d, J = 8.0 Hz), 7.60 (1H, br), 7.42 (7H, m), 7.31 (1H, t, J = 7.5 Hz), 5.44 (1H, d, J = 4.8 Hz), 5.27 (1H, d, J = 4.8 Hz), 5.16 (1H, d d, J = 6.3, 8.8 Hz), 4.16 (1H, d d, J = 6.3, 10.1 Hz), 3.68 (1H, t, J = 9.6 Hz)

Сполука номер 310 (MP: 126-127). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 148.9, 142.9, 136.4, 132.6, 128.7, 127.8, 125.2, 112.1, 80.4, 73.4, 52.9, 17

¹H: 7.99 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.80 (2H, m d, J = 8.4 Hz), 7.54 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.42 (2H, m t, J = 7.8 Hz), 7.31 (1H, m t, J = 7.5 Hz), 5.14 (1H, d, J = 4.5 Hz), 5.04 (1H, d, J = 4.5 Hz), 4.39 (1H, m), 4.36 (1H, m), 3.63 (1H, d d, J = 6.9, 8.4 Hz), 1.37 (3H, d, J = 6.0 Hz)

Сполука номер 311 (MP: 127). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 150.6 (d d, J = 12.5, 247.5 Hz), 149.9 (d d, J = 13.0, 248.5 Hz), 148.6, 141.1, 136.4, 129.9 (d d, J = 3.5, 7.0 Hz), 121.2 (d d, J = 3.5, 6.3 Hz), 117.6 (d, J = 17.5 Hz), 114.3 (d, J = 18.6 Hz), 112.5, 80.4, 73.4, 53, 17.0

¹H: 7.96 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.62 (1H, d d d, J = 2.1, 7.7, 11.5 Hz), 7.51 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.49 (1H, m), 7.19 (1H, d t, J = 8.3, 10.1 Hz), 5.13 (1H, d, J = 4.5 Hz), 5.04 (1H, d, J = 4.5 Hz), 4.39 (1H, m), 4.36 (1H, m), 3.65 (1H, m), 1.37 (3H, d, J = 6.0 Hz)

Сполука номер 312 (MP: 118). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 150.9, 142.2, 136.5, 133, 128.7, 127.4, 125.1, 113, 58.9, 39.4, 31.4, 25.6, 25.1, 14.9

¹H: 7.89 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.81 (2H, m d, J = 8.3 Hz), 7.48 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.41 (2H, m t, J = 7.9 Hz), 7.30 (1H, m t, J = 7.5 Hz), 3.77 (1H, t t, J = 3.5, 12.0 Hz), 3.43 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.82 (4H, m), 1.66 (3H, m), 1.30 (2H, m), 1.25 (3H, t, J = 7.1 Hz), 1.13 (1H, m)

Сполука номер 313 (MP: 121-122). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 150.9, 149.1, 148.5, 142, 136.2, 126.2, 117.3, 112.3, 111.2, 108.4, 58.9, 55.9, 55.9, 39.4, 31.4, 25.6, 25.1, 14.9

¹H: 7.86 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.41 (1H, s), 7.41 (1H, d, J = 1.3 Hz), 6.91 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.30 (1H, d d, J = 2.0, 8.4 Hz), 3.96 (3H, s), 3.91 (3H, s), 3.77 (1H, t t, J = 3.5, 12.0 Hz), 3.43 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.84 (4H, m), 1.68 (3H, m), 1.29 (2H, m), 1.25 (3H, t, J = 7.1 Hz), 1.12 (1H, m)

Сполука номер 314 (MP: 208). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 151.6 (d, J = 243.0 Hz), 150.6, 146.1 (d, J = 11.0 Hz), 139.5 (d, J = 2.5 Hz), 137.2, 126.8 (d, J = 7.0 Hz), 120.8 (d, J = 3.4 Hz), 114.1 (d, J = 2.0 Hz), 113.7, 112.1 (d, J = 19.5 Hz), 56.8, 56, 31, 28.9, 25, 24.6

5 ¹H: 8.04 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.90 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.64 (1H, d d, J = 2.0, 8.3 Hz), 7.61 (1H, m), 7.18 (1H, t, J = 9.3 Hz), 3.86 (3H, s), 3.80 (1H, m), 2.92 (3H, s), 1.79 (4H, m), 1.62 (1H, m), 1.59 (2H, m), 1.30 (2H, m), 1.12 (1H, m)

Сполука номер 315 (MP: 162-163). ЯМР розчинник: DMSO

10 ¹³C: 151.6 (d, J = 242.5 Hz), 150.7, 146.4 (d, J = 10.5 Hz), 138.5, 137.5, 125.7 (d, J = 7.6 Hz), 121.2 (d, J = 3.0 Hz), 114.3, 114.1 (d, J = 2.0 Hz), 112.4 (d, J = 19.5 Hz), 58.5, 56.1, 31.3, 28.2, 24

¹H: 8.31 (1H, s br), 8.03 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.69 (1H, d d, J = 2.0, 12.5 Hz), 7.65 (1H, m), 7.21 (1H, t, J = 8.8 Hz), 4.37 (1H, m), 3.86 (3H, s), 2.93 (3H, s), 1.88 (2H, m), 1.68 (4H, m), 1.53 (2H, m)

Сполука номер 316 (MP: 205). ЯМР розчинник: DMSO

15 ¹³C: 151.6 (d, J = 243.5 Hz), 147.2 (d, J = 10.5 Hz), 144.6, 136.8, 136, 122.9, 121.8 (d, J = 3.3 Hz), 114.3, 114.3, 112.9 (d, J = 20.0 Hz), 80.7, 79.3, 61.3, 56.1, 22.3

¹H: 9.05 (1H, s br), 8.31 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.82 (1H, d d, J = 2.2, 12.7 Hz), 7.74 (1H, d, J = 8.5 Hz), 7.28 (1H, t, J = 8.7 Hz), 5.21 (2H, s), 3.87 (3H, s), 3.86 (2H, s), 1.51 (6H, s)

Сполука номер 317 (MP: 173-174). ЯМР розчинник: CDCl₃

20 ¹³C: 151.3, 150, 142.3, 141.5, 137.2, 133.4, 129 (2 sig.), 127.7, 125.4, 123, 122.8, 113.1, 112.7, 58.3, 40.6, 38.6, 36.2, 34.1, 29.7

¹H: 8.01 (1H, s), 7.95 (1H, s), 7.69 (1H, d, J = 7.5 Hz), 7.59 (2H, m, J = 8.8 Hz), 7.51 (1H, s), 7.50 (1H, d, J = 8.0 Hz), 7.43 (1H, t, J = 7.7 Hz), 6.82 (2H, m, J = 8.8 Hz), 3.01 (6H, s), 3.0 (3H, s), 2.21 (9H, s), 1.74 (6H, s)

Сполука номер 318 (MP: 181-182). ЯМР розчинник: CDCl₃

25 ¹³C: 168.1, 164.5, 157.6, 151.1, 141.7, 137.2, 133.7, 133.4, 128.7, 128, 125.5, 124.4, 116.1, 113.3, 58.4, 54.8, 54.2, 38.5, 36.2, 34.1, 29.6

¹H: 8.31 (1H, s), 7.93 (1H, s), 7.91 (1H, s), 7.78 (1H, d, J = 7.6 Hz), 7.50 (1H, s), 7.46 (1H, t, J = 7.5 Hz), 7.40 (1H, d, J = 7.5 Hz), 4.04 (3H, s), 4.03 (3H, s), 2.99 (3H, s), 2.19 (9H, s), 1.73 (6H, s)

Сполука номер 319 (MP: 109-111). ЯМР розчинник: CDCl₃

30 ¹³C: 151.9 (d, J = 246.0 Hz), 151.2, 147.8 (d, J = 11.0 Hz), 141.3, 136.8, 129.6 (d, J = 3.5 Hz), 117.3 (d, J = 7.0 Hz), 116.1 (d, J = 19.0 Hz), 113.1, 110.3 (d, J = 1.5 Hz), 57.6, 56.2, 31.3, 30, 25.4, 25.2

35 ¹H: 7.89 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.50 (1H, d d, J = 2.0, 8.2 Hz), 7.45 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.24 (1H, d d, J = 2.0, 4.3, 8.3 Hz), 7.09 (1H, d d, J = 8.3, 11.0 Hz), 3.96 (3H, s), 3.95 (1H, m), 2.99 (3H, s), 1.86 (4H, m), 1.70 (1H, d br, J = 13.0 Hz), 1.58 (2H, d q, J = 4.5, 13.5 Hz), 1.37 (2H, t q, J = 3.0, 13.0 Hz), 1.13 (1H, t q, J = 3.4, 13.0 Hz)

Сполука номер 320 (MP: 170-171). ЯМР розчинник: CDCl₃

40 ¹³C: 163.1 (d, J = 240.0 Hz), 151.1, 145.9 (d, J = 15.0 Hz), 141.5, 139.9 (d, J = 8.0 Hz), 137.4, 137.2, 134.7 (d, J = 4.5 Hz), 134.1, 129.5, 126.1, 124.8, 123.8, 113.5, 109.4 (d, J = 37.5 Hz), , 58.5, 38.6, 36.2, 34.1, 29.7

¹H: 8.49 (1H, m, J = 2.5 Hz), 8.05 (1H, m, J = 2.5, 7.5 Hz), 8.02 (1H, m, J = 1.6 Hz), 7.95 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.81 (1H, d t, J = 1.5, 7.5 Hz), 7.55 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.51 (1H, t, J = 7.5 Hz), 7.46 (1H, d t, J = 1.5, 7.8 Hz), 7.03 (1H, m, J = 3.0, 8.5 Hz), 3.0 (3H, s), 2.20 (9H, s), 1.74 (6H, s)

Сполука номер 321 (MP: 100-103). ЯМР розчинник: CDCl₃

45 ¹³C: 151.9 (d, J = 246.0 Hz), 151.5, 147.8 (d, J = 11.0 Hz), 141.3, 136.8, 129.5 (d, J = 3.5 Hz), 117.3 (d, J = 7.0 Hz), 116.2 (d, J = 19.0 Hz), 113.2, 110.3, 59.3, 56.2, 31.2, 28.9, 24.3

¹H: 7.94 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.50 (1H, d d, J = 2.0, 7.50 Hz), 7.47 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.24 (1H, d d d, J = 2.0, 4.3, 8.3 Hz), 7.09 (1H, d d, J = 8.3, 11.0 Hz), 4.44 (1H, qt, J = 8.0 Hz), 3.97 (3H, s), 3.0 (3H, s), 1.96 (2H, m), 1.75 (4H, m), 1.63 (2H, m)

50 Сполука номер 322 (MP: 216-217). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 156.9, 151, 142.4, 141.9, 141.4, 137.3, 132.9, 129.7, 129, 126.3, 124.2, 124.1, 118.8, 114.7, 114.5, 113.4, 58.5, 38.6, 36.2, 34.1, 29.7

55 ¹H: 8.07 (1H, br), 8.03 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.90 (1H, s br), 7.70 (1H, d t, J = 1.7, 7.4 Hz), 7.52 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.44 (1H, d t, J = 1.8, 7.8 Hz), 7.40 (1H, t, J = 7.6 Hz), 7.24 (1H, t, J = 7.9 Hz), 7.17 (1H, s br), 7.13 (1H, m), 6.85 (1H, d d d, J = 0.9, 2.5, 8.0 Hz), 3.0 (3H, s), 2.20 (9H, s), 1.74 (6H, s)

Сполука номер 323 (MP: 184-185). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 163.6, 151.2, 145, 141.8, 138.3, 137.6, 137.3, 133.8, 130, 129.3, 125.7, 124, 123.5, 113.3, 110.7, 58.4, 53.5, 38.6, 36.2, 34.1, 29.7

¹H: 8.44 (1H, d d, J = 0.6, 2.5 Hz), 7.98 (1H, m), 7.95 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.87 (1H, d d, J = 2.5, 8.6 Hz), 7.77 (1H, d t, J = 1.8, 7.0 Hz), 7.53 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.48 (1H, t, J = 7.5 Hz), 7.45 (1H, m), 6.83 (1H, d d, J = 0.6, 8.6 Hz), 3.99 (3H, s), 3.0 (3H, s), 2.20 (9H, s), 1.73 (6H, s)

Сполука номер 324 (MP: 138-140). ЯМР розчинник: CDCl₃

5 ¹³C: 168.4, 151.2, 142, 140.9, 137.3, 137.3, 136.8, 133.5, 129.1, 127.6, 126, 123.8, 123.6, 120, 113.3, 58.4, 38.6, 36.2, 34.1, 29.7, 24.6

¹H: 8.01 (1H, t, J = 1.7 Hz), 7.95 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.74 (1H, d t, J = 1.7, 7.3 Hz), 7.60 (4H, br), 7.52 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.49 (1H, d t, J = 1.9, 7.8 Hz), 7.44 (1H, t, J = 7.6 Hz), 3.0 (3H, s), 2.20 (9H, s), 2.19 (3H, s), 1.73 (6H, s)

10 Сполука номер 325 (MP: 150-152). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 151.1, 143.6, 141.8, 138.7, 137.2, 133.6, 132.8, 129.1, 126.3, 124.9, 123.7, 122.5, 113.2, 108.9, 58.4, 38.5, 36.2, 34.1, 29.6

¹H: 7.96 (1H, s), 7.94 (1H, s), 7.81 (1H, s), 7.66 (1H, m), 7.51 (1H, s), 7.49 (1H, m), 7.40 (2H, m), 6.78 (1H, m), 2.99 (3H, s), 2.20 (9H, s), 1.73 (6H, s)

15 Сполука номер 326 (MP: 105-107). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 159.1, 151.8, 142, 136.8, 126.4, 125.8, 114, 112.1, 59.3, 55.3, 31.1, 28.8, 24.3

¹H: 7.91 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.73 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.41 (1H, d, J = 1.2 Hz), 6.95 (2H, d, J = 8.8 Hz), 4.45 (1H, qt, J = 8.0 Hz), 3.85 (3H, s), 3.0 (3H, s), 1.95 (2H, m), 1.76 (2H, m), 1.67 (2H, m), 1.63 (2H, m)

20 Сполука номер 327 (MP: 92-94). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 159.9, 151.6, 142, 136.9, 134.4, 129.7, 117.5, 113.6, 113.5, 110.1, 59.3, 55.3, 31.2, 28.9, 24.3

¹H: 7.93 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.51 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.40 (1H, d d, J = 1.4, 2.4 Hz), 7.36 (1H, td, J = 1.2, 7.6 Hz), 7.32 (1H, t, J = 7.7 Hz), 6.86 (1H, d d d, J = 1.3, 2.7, 8.0 Hz), 4.45 (1H, m), 3.88 (3H, s), 3.0 (3H, s), 1.96 (2H, m), 1.78 (2H, m), 1.68 (2H, m), 1.60 (2H, m)

25 Сполука номер 328 (MP: 153-154). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 159.2, 146.6, 142.5, 136.1, 126.4, 125.5, 114.1, 110.9, 81.1, 80.3, 61.8, 55.3, 22.9

¹H: 7.93 (1H, d, J = 1.5 Hz), 7.71 (2H, d, J = 8.9 Hz), 7.41 (1H, d, J = 1.5 Hz), 6.94 (2H, d, J = 8.9 Hz), 5.13 (2H, s), 3.88 (2H, s), 3.84 (3H, s), 1.61 (6H, s)

30 Сполука номер 329 (MP: 100-101). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 159.9, 146.4, 142.4, 136.1, 134.1, 129.7, 117.5, 113.8, 112.3, 110.2, 81, 80.3, 61.8, 55.3, 22.8

¹H: 7.95 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.51 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.40 (1H, d d, J = 1.5, 2.5 Hz), 7.34 (1H, t d, J = 1.5, 7.6 Hz), 7.30 (1H, t, J = 7.8 Hz), 6.85 (1H, d d d, J = 1.5, 2.7, 7.9 Hz), 5.12 (2H, s), 3.87 (2H, s), 3.86 (3H, s), 1.61 (6H, s)

35 Сполука номер 330 (MP: 164-166). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 151.2 (d, J = 240.0 Hz), 150.8, 144.0 (d, J = 12.3 Hz), 139.9 (d, J = 2.0 Hz), 137.4, 125.4 (d, J = 7.0 Hz), 121.0 (d, J = 3.0 Hz), 117.9 (d, J = 3.2 Hz), 113.5, 112.5 (d, J = 19.5 Hz), 56.8, 31.3, 29, 25.1, 24.8

40 ¹H: 9.89 (1H, s), 8.06 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.88 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.58 (1H, d d, J = 2.0, 12.7 Hz), 7.48 (1H, m, J = 2.0, 8.4 Hz), 6.95 (1H, d d, J = 8.4, 9.0 Hz), 3.80 (1H, m), 2.91 (3H, s), 1.76 (4H, m), 1.60 (1H, m), 1.55 (2H, m), 1.29 (2H, m), 1.10 (1H, m)

Сполука номер 331 (MP: 170-171). ЯМР розчинник: DMSO

45 ¹³C: 151.2 (d, J = 240.0 Hz), 151.2, 144.0 (d, J = 12.5 Hz), 139.9 (d, J = 2.6 Hz), 137.4, 125.4 (d, J = 6.9 Hz), 121.0 (d, J = 3.0 Hz), 117.9 (d, J = 3.3 Hz), 113.5, 112.5 (d, J = 19.5 Hz), 58.4, 31.2, 28.2, 24

¹H: 9.89 (1H, s), 8.06 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.88 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.58 (1H, d d, J = 2.0, 12.7 Hz), 7.48 (1H, d d d, J = 1.0, 2.0, 8.4 Hz), 6.95 (1H, d d, J = 8.4, 9.1 Hz), 4.35 (1H, m), 2.92 (3H, s), 1.87 (2H, m), 1.67 (4H, m), 1.53 (2H, m)

50 Сполука номер 332 (MP: 194-196). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 151.2 (d, J = 240.0 Hz), 146.2, 144.1 (d, J = 12.0 Hz), 140.2 (d, J = 2.3 Hz), 136.9, 125.3 (d, J = 6.8 Hz), 121.1 (d, J = 3.0 Hz), 117.9 (d, J = 3.7 Hz), 112.5 (d, J = 20.0 Hz), 112.5, 80.6, 79.3, 60.8, 22.4

55 ¹H: 9.91 (1H, s), 8.11 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.91 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.59 (1H, d d, J = 2.1, 12.5 Hz), 7.48 (1H, m, J = 2.1, 8.6 Hz), 6.95 (1H, d d, J = 8.6, 9.1 Hz), 5.16 (2H, s), 3.84 (2H, s), 1.49 (6H, s)

Сполука номер 333 (MP: 173-176). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 150.4 (d, J = 240.0 Hz), 146.1, 145.0 (d, J = 12.5 Hz), 140.2, 136.9, 130.1 (d, J = 3.0 Hz), 116.2 (d, J = 18.5 Hz), 115.9 (d, J = 6.3 Hz), 114.3 (d, J = 2.7 Hz), 113.1, 80.6, 79.3, 60.8, 22.4

¹H: 9.93 (1H, s), 8.13 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.92 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.46 (1H, d d, J = 2.1, 8.8 Hz), 7.24 (1H, d d d, J = 2.1, 4.4, 8.5 Hz), 7.13 (1H, d d, J = 8.5, 11.2 Hz), 5.16 (2H, s), 3.84 (2H, s), 1.49 (6H, s)

Сполука номер 334 (MP: 154-155). ЯМР розчинник: CDCl₃

5 ¹³C: 154.6, 150.9, 150.7, 137.8, 134.3, 128.9, 124.2, 122.9, 121, 114.6, 110.9, 101.9, 57.6, 31.4, 29.9, 25.4, 25.2

¹H: 7.97 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.61 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.60 (1H, m), 7.49 (1H, d, J = 8.0 Hz), 7.28 (1H, d t, J = .15, 7.5 Hz), 7.24 (1H, d t, J = 1.1, 7.3 Hz), 7.10 (1H, s), 3.97 (1H, m), 3.01 (3H, s), 1.87 (4H, m), 1.71 (1H, d br, J = 13.0 Hz), 1.59 (2H, d q, J = 3.5, 12.5 Hz), 1.39 (2H, q, J = 13.0 Hz), 1.14 (1H, t q, J = 3.5, 13.0 Hz)

10 Сполука номер 335 (MP: 161-163). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 151, 148.5, 146.7, 139.2, 137.3, 132.4, 129, 123.6, 114, 57.6, 31.4, 30, 25.4, 25.2

¹H: 9.01 (1H, d d, J = 0.8, 2.3 Hz), 8.53 (1H, d d, J = 1.7, 4.8 Hz), 8.12 (1H, d d d, J = 1.8, 2.2, 8.0 Hz), 7.94 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.58 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.34 (1H, d d d, J = 0.8, 4.9, 8.0 Hz), 3.95 (1H, m), 3.01 (3H, s), 1.87 (4H, m), 1.71 (1H, d br, J = 13.5 Hz), 1.59 (2H, d q, J = 3.5, 12.5 Hz), 1.38 (2H, t q, J = 3.5, 13.0 Hz), 1.13 (1H, t q, J = 3.5, 13.5 Hz)

15 Сполука номер 336 (MP: 211-213). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 151, 150.4, 148, 141.4, 137.4, 137.3, 137, 135.5, 134.2, 129.5, 126, 125.1, 124.2, 123.8, 113.6, 58.5, 38.6, 36.2, 34.1, 29.7

20 ¹H: 8.66 (1H, d, J = 2.0 Hz), 8.02 (1H, s), 7.95 (1H, s), 7.92 (1H, d d, J = 2.5, 8.3 Hz), 7.81 (1H, d, J = 7.3 Hz), 7.55 (1H, s), 7.51 (1H, t, J = 7.51 Hz), 7.46 (1H, d, J = 8.0 Hz), 7.41 (1H, d, J = 8.3 Hz), 3.0 (3H, s), 2.20 (9H, s), 1.73 (6H, s)

Сполука номер 337 (MP: oil). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 147.5, 145.8, 140.9, 133, 128.6, 127.3, 125, 111.1, 81, 80.6, 61, 22.9, 14.3

25 ¹H: 7.74 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.38 (2H, t, J = 7.9 Hz), 7.27 (1H, t, J = 7.6 Hz), 7.20 (1H, s), 4.90 (2H, s), 3.88 (2H, s), 2.56 (3H, s), 1.61 (6H, s)

Сполука номер 338 (MP: 129-130). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 154.6, 150.4, 146.1, 137.3, 134.9, 128.8, 124.3, 123, 121.1, 113.2, 110.9, 102.3, 81.1, 80.3, 62, 22.8

30 ¹H: 8.04 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.61 (1H, d, 1.3 Hz), 7.60 (1H, m), 7.48 (1H, m, J = 7.8 Hz), 7.30 (1H, d t, J = 1.5, 7.3 Hz), 7.24 (1H, d t, J = 1.2, 7.4 Hz), 7.10 (1H, s), 5.16 (2H, s), 3.89 (2H, s), 1.62 (6H, s)

Сполука номер 339 (MP: 154-155). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 148.6, 142.8, 136.5, 132.6, 128.7, 127.8, 125.2, 112.2, 80.3, 67.1, 46.0

35 ¹H: 8.05 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.80 (2H, m d, J = 8.4 Hz), 7.60 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.41 (2H, m t, J = 7.5 Hz), 7.31 (1H, m t, J = 7.3 Hz), 5.12 (2H, s), 4.15 (2H, t, J = 6.5 Hz), 3.80 (2H, t, J = 6.5 Hz)

Сполука номер 340 (MP: 122-123). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 159.9, 148.4, 142.8, 136.6, 136.2, 133.9, 129.7, 129, 128.9, 126.1, 117.6, 113.9, 112.3, 110.3, 80.4, 80, 55.3, 53

40 ¹H: 8.97 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.59 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.47-7.37 (5H, m), 7.40 (1H, m), 7.36 (1H, m), 7.31 (1H, t, J = 7.7 Hz), 6.87 (1H, d d d, J = 1.3, 2.6, 7.9 Hz), 5.43 (1H, d, J = 4.5 Hz), 5.26 (1H, d, J = 4.5 Hz), 5.16 (1H, d d, J = 6.1, 8.8 Hz), 4.16 (1H, d d, J = 6.2, 10.0 Hz), 3.87 (3H, s), 3.68 (1H, t, J = 9.5 Hz)

Сполука номер 341 (MP: 164-165). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 159.1, 151.4, 142, 136.8, 126.4, 125.8, 114, 112.1, 57.5, 55.3, 31.3, 30, 25.4, 25.2

45 ¹H: 7.89 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.40 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.33 (2H, m d, J = 9.0 Hz), 6.95 (2H, m d, J = 9.0 Hz), 3.95 (1H, m), 3.84 (3H, s), 2.99 (3H, s), 1.86 (4H, m), 1.70 (1H, d br, J = 13.0 Hz), 1.58 (2H, d q, J = 3.5, 12.5 Hz), 1.37 (2H, t q, J = 3.2, 13.0 Hz), 1.12 (1H, t q, J = 3.5, 13.0 Hz)

Сполука номер 342 (MP: 122-123). ЯМР розчинник: CDCl₃

50 ¹³C: 159.9, 151.3, 141.9, 136.8, 134.4, 129.7, 117.5, 113.6, 113.5, 110.1, 57.5, 55.3, 31.3, 30, 25.4, 25.2

¹H: 7.92 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.49 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.40 (1H, d d, J = 1.4, 2.5 Hz), 7.36 (1H, t d, J = 1.4, 7.7 Hz), 7.31 (1H, 1H, t, J = 8.0 Hz), 6.85 (1H, d d d, J = 1.2, 2.5, 7.9 Hz), 3.95 (1H, m), 3.88 (3H, s), 3.0 (3H, s), 1.86 (2H, m), 1.84 (2H, m), 1.70 (1H, d br, J = 13.0 Hz), 1.58 (2H, d q, J = 4.5, 13.3 Hz), 1.38 (2H, t q, J = 3.2, 13.0 Hz), 1.13 (1H, t q, J = 3.5, 13.0 Hz)

55 Сполука номер 343 (MP: 150-152). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 150.3 (d, J = 240.0 Hz), 150.8, 144.9 (d, J = 12.5 Hz), 139.9, 137.5, 130.2 (d, J = 3.5 Hz), 116.2 (d, J = 18.7 Hz), 115.9 (d, J = 6.3 Hz), 114.2 (d, J = 3.0 Hz), 114.1, 56.8, 31.3, 29, 25.1, 24.8

60 ¹H: 9.89 (1H, s br), 8.08 (1H, s), 7.89 (1H, s), 7.45 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.24 (1H, s br), 7.13 (1H, m, J = 9.0, 11.0 Hz), 3.79 (1H, s br), 2.91 (3H, s), 1.76 (4H, m), 1.58 (3H, m), 1.29 (2H, m), 1.10 (1H, m)

Сполука номер 344 (MP: 144-145). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 151.1, 150.3 (d, J = 241.0 Hz), 144.9 (d, J = 12.5 Hz), 140.0, 137.5, 130.2 (d, J = 3.2 Hz), 116.3 (d, J = 18.5 Hz), 115.9 (d, J = 6.5 Hz), 114.2 (d, J = 3.0 Hz), 114.1, 58.4, 31.2, 28.2, 24.0

¹H: 9.91 (1H, s), 8.08 (1H, s), 7.88 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.45 (1H, d d, J = 2.0, 8.7 Hz), 7.24 (1H, m), 7.13 (1H, d d, J = 8.6, 11.2 Hz), 4.35 (1H, m), 2.92 (3H, s), 1.87 (2H, m), 1.68 (4H, m), 1.53 (2H, m)

Сполука номер 345 (MP: 113-114). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 150.8, 150.5 (t, J = 3.0 Hz), 141.2, 136.6, 130.5, 126.5, 119.7, 115.9 (t, J = 259.5 Hz), 113.1, 58.9, 39.4, 31.4, 25.6, 25.1, 14.9

¹H: 7.87 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.80 (2H, m d, J = 8.8 Hz), 7.45 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.16 (2H, m d, J = 8.8 Hz), 6.54 (1H, t, J = 7.4 Hz), 3.75 (1H, t t, J = 3.5, 12.0 Hz), 3.43 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.85 (4H, m), 1.68 (2H, m), 1.64 (1H, m), 1.29 (2H, m), 1.25 (3H, t, J = 7.1 Hz), 1.12 (1H, m)

Сполука номер 346 (MP: 129-131). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 150.6 (d d, J = 13.0, 247.5 Hz), 150.6, 149.7 (d d, J = 12.5, 248.0 Hz), 140.4 (d, J = 2.0 Hz), 136.6, 130.3 (d d, J = 3.5, 7.0 Hz), 121.0 (d d, J = 3.6, 6.1 Hz), 117.5 (d, J = 17.5 Hz), 114.1 (d, J = 18.5 Hz), 113.4, 59, 39.5, 31.4, 25.6, 25.1, 14.9

¹H: 7.85 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.61 (1H, d d d, J = 2.2, 7.6, 11.6 Hz), 7.49 (1H, m), 7.44 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.18 (1H, d t, J = 8.4, 10.2 Hz), 3.74 (1H, t t, J = 3.5, 12.0 Hz), 3.43 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.85 (4H, m), 1.67 (2H, m), 1.64 (1H, m), 1.30 (2H, m), 1.25 (3H, t, J = 7.1 Hz), 1.13 (1H, m)

Сполука номер 347 (MP: 144-145). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 157.6, 146.2, 141, 136.9, 134.6, 129.6, 115.7, 114.2, 113.4, 111.7, 80.6, 79.3, 60.8, 22.4

¹H: 9.43 (1H, s), 8.13 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.93 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.26 (2H, m), 7.16 (1H, t, J = 7.8 Hz), 6.66 (1H, d d d, J = 1.5, 2.0, 8.0 Hz), 5.17 (2H, s), 3.83 (2H, s), 1.50 (6H, s)

Сполука номер 348 (MP: 129-130). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 146.4, 141.8, 136.4, 132.9, 130.6, 128.7, 128.5, 125, 123.1, 112.4, 94, 81.9, 81.1, 80.3, 65.5, 61.9, 31.5, 22.8

¹H: 7.97 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.85 (1H, br), 7.74 (1H, m), 7.51 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.34 (2H, m), 5.12 (2H, s), 3.88 (2H, s), 1.63 (6H, s), 1.61 (6H, s)

Сполука номер 349 (MP: 129-131). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 150.3, 138.4, 137.5, 134.2, 131.5, 130.9, 129.1, 126.3, 124.8, 115.7, 58.3, 39.1, 30.2, 25.3, 24.7, 14.7

¹H: 8.15 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.11 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.09 (1H, d, J = 2.0 Hz), 7.84 (1H, d d, J = 2.0, 8.4 Hz), 7.65 (1H, d, J = 8.4 Hz), 3.57 (1H, t br, J = 10.5 Hz), 3.38 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.79 (2H, m), 1.75 (2H, m), 1.64 (2H, m), 1.55 (1H, m), 1.17 (2H, m), 1.1 (3H, t, J = 7.1 Hz), 1.10 (1H, m)

Сполука номер 350 (MP: 92-93). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 159.1, 151, 142, 136.4, 126.4, 125.8, 114.1, 111.9, 58.9, 55.3, 39.3, 31.4, 25.6, 25.1, 14.9

¹H: 7.87 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.73 (2H, m d, J = 8.8 Hz), 7.38 (1H, d, J = 1.3 Hz), 6.85 (2H, m d, J = 8.8 Hz), 3.84 (3H, s), 3.77 (1H, t t, J = 3.5, 12.0 Hz), 3.43 (2H, t, J = 7.1 Hz), 1.85 (4H, m), 1.68 (2H, m), 1.64 (1H, m), 1.30 (2H, m), 1.25 (3H, t, J = 7.1 Hz), 1.12 (1H, m)

Сполука номер 351 (MP: 100-101). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 152.0 (d, J = 246.5 Hz), 147.8 (d, J = 11.0 Hz), 146.4, 141.8, 136.1, 129.4 (d, J = 3.5 Hz), 117.4 (d, J = 7.0 Hz), 116.2 (d, J = 18.5 Hz), 112, 110.4 (d, J = 1.5 Hz), 81.1, 80.3, 61.9, 56.2, 22.8

¹H: 7.94 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.48 (1H, d d, J = 2.0, 8.2 Hz), 7.47 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.23 (1H, d d, J = 2.0, 4.3, 8.3 Hz), 7.09 (1H, d d, J = 8.3, 11.0 Hz), 5.13 (2H, s), 3.96 (3H, s), 3.89 (2H, s), 1.61 (6H, s)

Сполука номер 352 (MP: 113-114). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 146.5, 143.1, 142.6, 136.2, 132.8, 128.8, 127.8, 125.2, 122.6, 112, 81.1, 80.4, 70.9, 61.8, 45.7, 30.7, 29.3, 22.9

¹H: 7.97 (1H, d, J = , 1.3 Hz), 7.68 (1H, t br, J = 2.0 Hz), 7.58 (1H, m d, J = 7.7 Hz), 7.50 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.32 (1H, t, J = 7.6 Hz), 7.15 (1H, m d, J = 7.7 Hz), 5.13 (2H, s), 3.89 (2H, s), 2.75 (2H, m), 1.84 (2H, m), 1.62 (6H, s), 1.30 (6H, s)

Сполука номер 353 (MP: 192 (dec.)). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 150.4, 137.9, 137.5, 136.7, 136, 132.9, 125.9, 122.7, 115.2, 58.7, 38.5, 36.1, 34.1, 29.6

¹H: 8.68 (1H, s), 8.13 (1H, d, J = 6.3 Hz), 7.92 (1H, d, J = 0.9 Hz), 7.70 (1H, d, J = 8.1 Hz), 7.56 (1H, d, J = 0.9 Hz), 7.30 (1H, d d, J = 6.3, 8.1 Hz), 2.98 (3H, s), 2.18 (9H, m), 1.72 (6H, m)

Сполука номер 354 (MP: 217 (dec.)). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 151, 141.1, 140.2, 137.6, 137.6, 137.5, 135.5, 134.4, 129.7, 125.9, 125.8, 125.7, 124.8, 123.7, 113.6, 58.5, 38.6, 36.2, 34.1, 29.6

¹H: 8.54 (1H, t, J = 1.5 Hz), 8.21 (1H, d d d, J = 1.0, 1.6, 6.4 Hz), 8.0 (1H, t, J = 1.8 Hz), 7.95 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.86 (1H, td, J = 1.5, 7.8 Hz), 7.56 (1H, d d d, J = 1.0, 1.5, 8.0 Hz), 7.55 (1H, d, J = 1.3

Hz), 7.52 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.44 (1H, d d d, J = 1.5, 1.8, 7.8 Hz), 7.36 (1H, d d, J = 6.5, 8.0 Hz), 3.0 (3H, s), 2.20 (9H, s), 1.73 (6H, s)

Сполука номер 355 (MP: 144-147). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 160, 149.9, 140.6, 135.9, 132.5, 129.9, 117.6, 114.5, 113.5, 110.3, 59.2, 55.5, 39.7, 31.3, 25.5, 25, 14.9

1H: 8.13 (1H, br), 7.50 (1H, m), 7.50 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.38 (1H, m, J = 7.7 Hz), 7.34 (1H, t, J = 7.8 Hz), 6.90 (1H, d d d, J = 1.3, 2.6, 8.0 Hz), 3.90 (3H, s), 3.72 (1H, t t, J = 3.5, 12 Hz), 3.44 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.86 (4H, m), 1.69 (2H, m), 1.65 (1H, m), 1.30 (2H, m), 1.27 (3H, t, J = 7.1 Hz), 1.13 (1H, m)

Сполука номер 356 (MP: 120-121). ЯМР розчинник: DMSO

13C: 146.3, 145.9, 141.7, 137.5, 136.5, 126.1, 113.2, 111.7, 110.7, 110.6, 80.6, 79.3, 60.8, 55.3, 22.5

1H: 8.07 (1H, d, 1.3 Hz), 7.71 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.14 (1H, d, J = 2.0 Hz), 7.0 (1H, d d, J = 2.0, 8.5 Hz), 6.79 (1H, d, J = 8.5 Hz), 5.16 (2H, s), 4.72 (2H, s), 3.83 (2H, s), 3.77 (3H, s), 1.49 (6H, s)

Сполука номер 357 (MP: 176 (dec.)). ЯМР розчинник: DMSO

13C: 150.8, 149.5, 137.3, 136.7, 126.1, 122, 121, 119.7, 116.6, 114.3, 57, 31.4, 28.9, 25, 24.8

1H: 11.13 (1H, s), 10.0 (3H, br), 8.75 (1H, s br), 8.05 (1H, s br), 7.81 (1H, s br), 7.70 (1H, d, J = 7.7 Hz), 7.13 (1H, d, J = 7.7 Hz), 3.85 (1H, m), 2.93 (3H, s), 1.78 (4H, m), 1.55 (3H, m), 1.30 (2H, m), 1.16 (1H, m)

Сполука номер 358 (MP: 209 (dec.)). ЯМР розчинник: DMSO

13C: 150.7, 145.2, 137.8, 136.9, 126.1, 122.8, 121, 119.6, 116.6, 113.3, 80.6, 79.3, 61.1, 22.4

1H: 11.08 (1H, s), 9.98 (3H, s br), 8.62 (1H, s br), 8.04 (1H, s br), 7.81 (1H, d, J = 2.0 Hz), 7.70 (1H, d d, J = 2.0, 8.5 Hz), 7.11 (1H, d, J = 8.5 Hz), 5.18 (2H, s), 3.85 (2H, s), 1.50 (6H, s)

Сполука номер 359 (MP: 97-98). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 145.9, 145.6, 131.5, 131.3, 130.3, 119.2, 115.4, 82.4, 79.5, 62.4, 22.9

1H: 8.18 (1H, d, J = 8.8 Hz), 8.08 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.58 (1H, d d, J = 1.4, 8.8 Hz), 5.53 (2H, s), 3.90 (2H, s), 1.68 (6H, s)

Сполука номер 360 (MP: 138-140). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 163.3 (d d, J = 10.0, 252.0 Hz), 152.9 (d d, J = 15.0, 262.5 Hz), 145.3, 135.1 (d d, J = 7.2, 16.8 Hz), 132.7 (d, J = 19.0 Hz), 101.7 (d d, J = 20.0, 30.0 Hz), 97.2 (d d, J = 5.5, 29.5 Hz), 82.4, 79.5, 62.5, 22.9

1H: 7.75 (1H, d d d, J = 0.9, 2.1, 8.0 Hz), 6.97 (1H, d t, J = 2.1, 9.4 Hz), 5.52 (2H, s), 3.90 (2H, s), 1.67 (6H, s)

Сполука номер 361 (MP: 146-147). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 146.2, 144.7, 143.1, 140.2, 133.5, 128.9, 128.1, 127.9, 125.7, 119.9, 112.4, 82.5, 79.6, 62.2, 23

1H: 8.44 (1H, d d, J = 1.7, 1.6 Hz), 8.14 (1H, d d, J = 0.7, 8.7 Hz), 7.74 (1H, d d, J = 1.6, 8.7 Hz), 7.71 (2H, m, J = 8.2 Hz), 7.50 (2H, m, J = 7.9 Hz), 7.42 (1H, m, J = 7.5 Hz), 5.57 (2H, s), 3.92 (2H, s), 1.70 (6H, s)

Сполука номер 362 (MP: 225 (dec.)). ЯМР розчинник: DMSO

13C: 150.4, 138.3, 137.1, 135.7, 134.7, 132.8, 126.7, 121.2, 117, 56.8, 31.4, 29, 25.1, 24.8

1H: 8.70 (1H, t, J = 1.5 Hz), 8.28 (1H, s), 8.20 (1H, s), 8.11 (1H, d, J = 6.5 Hz), 7.78 (1H, d, J = 8.1 Hz), 7.45 (1H, d d, J = 6.5, 8.1 Hz), 3.80 (1H, m), 2.92 (3H, s), 1.77 (4H, m), 1.56 (3H, m), 1.30 (2H, m), 1.11 (1H, m)

Сполука номер 363 (MP: 171). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 161.6, 155.2, 151.1, 141, 137, 135.5, 134.1, 130.5, 121.8, 119.3, 118.9, 117.9, 117, 113.9, 105.7, 57.6, 31.3, 29.9, 25.4, 25.2

1H: 7.89 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.64 (1H, t d, J = 1.2, 7.9 Hz), 7.60 (2H, m d, J = 8.9 Hz), 7.53 (1H, t br, J = 2.0 Hz), 7.51 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.43 (1H, t, J = 7.9 Hz), 7.05 (2H, m d, J = 8.9 Hz), 7.0 (1H, d d d, J = 1.0, 2.5, 7.9 Hz), 3.94 (1H, m), 2.99 (3H, s), 1.87 (2H, m), 1.84 (2H, m), 1.70 (1H, d br, J = 13.5 Hz), 1.58 (2H, d q, J = 3.4, 12.3 Hz), 1.37 (2H, t q, J = 3.0, 12.7 Hz), 1.12 (1H, t q, J = 3.2, 13.2 Hz)

Сполука номер 364 (MP: 173). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 161.6, 155.3, 146.2, 141.5, 136.2, 135.2, 134.1, 130.5, 121.8, 119.5, 118.9, 118, 117.1, 112.8, 105.8, 81, 80.3, 61.9, 22.8

1H: 7.93 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.64 (1H, m), 7.61 (2H, m d, J = 9.0 Hz), 7.53 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.52 (1H, t br, J = 2.0 Hz), 7.44 (1H, t, J = 8.0 Hz), 7.05 (2H, m d, J = 9.0 Hz), 7.0 (1H, d d d, J = 1.0, 2.5, 8.0 Hz), 5.11 (2H, s), 3.88 (2H, s), 1.61 (6H, s)

Сполука номер 365 (MP: 154 (dec.)). ЯМР розчинник: DMSO

13C: 150.6, 148.4, 139.9, 137.4, 130, 125.9, 118.8, 114.9, 113.4, 111.6, 56.8, 55.8, 31.3, 29, 25.2, 24.8

1H: 8.19 (1H, s br), 7.84 (1H, s br), 7.44 (1H, d, J = 2.0 Hz), 7.38 (1H, dd, J = 2.0, 8.6 Hz), 7.01 (1H, d, J = 8.6 Hz), 3.84 (3H, s), 3.80 (1H, br), 2.92 (3H, s), 1.77 (4H, m), 1.57 (3H, m br), 1.29 (2H, q br, J = 13.0 Hz), 1.11 (1H, q bbr, J = 13.0 Hz)

Сполука номер 366 (MP: 135-136). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 156.8, 149.5, 145.4, 125.7, 124, 123.6, 82.4, 79.4, 62.5, 22.9

1H: 8.82 (1H, d d, J = 1.6, 4.5 Hz), 8.60 (1H, d d, J = 1.6, 8.4 Hz), 7.57 (1H, d d, J = 4.5, 8.4 Hz), 5.58 (2H, s), 3.90 (2H, s), 1.68 (6H, s)

Сполука номер 367 (MP: 67-68). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 146.1, 144, 140.4, 133.3, 127.6, 119.1, 113.7, 82.5, 79.6, 62.1, 23, 22

1H: 8.02 (1H, br), 7.95 (1H, d, J = 8.5 Hz), 7.29 (1H, d d, J = 1.0, 8.5 Hz), 5.53 (2H, s), 3.89 (2H, s), 2.55 (3H, s), 1.68 (6H, s)

Сполука номер 368 (MP: 111-112). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 152.2, 145.9, 144.3, 136.8, 129, 121, 81.9, 80, 62.1, 22.9

1H: 8.88 (1H, d d, J = 1.0, 4.4 Hz), 8.46 (1H, d d, J = 1.0, 8.3 Hz), 7.48 (1H, d d, J = 4.4, 8.3 Hz), 5.37 (2H, s), 3.93 (2H, s), 1.72 (6H, s)

Сполука номер 369 (MP: 84-85). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 147.4, 145.4, 132.6, 129.7, 125.6, 119.8, 114.3, 81.3, 80.5, 68.5, 65.8, 47.7, 45.7

1H: 8.24 (1H, d, J = 8.3 Hz), 8.11 (1H, m, J = 1.0, 8.3 Hz), 7.63 (1H, m, J = 1.0, 7.2, 8.3 Hz), 7.49 (1H, m, J = 1.2, 7.2, 8.3 Hz), 5.50-5.30 (2H, 2 s), 4.20-3.91 (4H, 2 s)

Сполука номер 370 (MP: 121-123). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 156.4, 146.2, 144.4, 140.7, 133, 131.2, 129.6, 129.5, 128.1, 120.9, 118.7, 114.6, 111.1, 82.5, 79.6, 62.1, 55.6, 23

1H: 8.33 (1H, m), 8.09 (1H, d d, J = 0.7, 8.5 Hz), 7.67 (1H, d d, J = 1.5, 8.5 Hz), 7.39 (1H, d, J = 7.6 Hz), 7.38 (1H, m), 7.06 (1H, d t, J = 1.0, 7.5 Hz), 7.02 (1H, d, J = 8.4 Hz), 5.54 (2H, s), 3.90 (2H, s), 3.83 (3H, s), 1.68 (6H, s)

Сполука номер 371 (MP: 134-136). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 145.5, 144.6, 134.4, 128.2 (q, J = 33.0 Hz), 126.0 (q, J = 3.3 Hz), 123.7 (q, J = 273.0 Hz), 117.9 (q, J = 5.0 Hz), 115.5, 82.5, 79.6, 62.5, 22.9

1H: 8.42 (1H, m), 8.38 (1H, d, J = 8.8 Hz), 7.85 (1H, d d, J = 1.5, 8.8 Hz), 5.55 (2H, s), 3.92 (2H, s), 1.69 (6H, s)

Сполука номер 372 (MP: 157-159). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 162.9, 151.6, 146.5, 135.7, 133, 97.8, 87.1, 82.6, 79.6, 62.1, 56.2, 56.1, 23

1H: 7.14 (1H, s), 6.42 (1H, s), 5.50 (2H, s), 4.05 (3H, s), 3.91 (3H, s), 3.88 (2H, s), 1.67 (6H, s)

Сполука номер 373 (MP: 118-119). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 146.5, 145.1, 133.1, 129.4, 125.4, 119.8, 114.3, 96.5, 64, 49, 24.2

1H: 8.18 (1H, m, J = 8.3 Hz), 8.11 (1H, m, J = 8.3 Hz), 7.62 (1H, m, J = 7.7 Hz), 7.48 (1H, m, J = 7.7 Hz), 4.29 (2H, m, J = 6.2 Hz), 4.15 (2H, m, J = 6.2 Hz), 1.81 (6H, s)

Сполука номер 374 (MP: 143-144). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 149.8, 144.5, 134.9, 127.8 (q, J = 33.0 Hz), 125.7 (q, J = 3.3 Hz), 123.8 (q, J = 272.5 Hz), 117.9 (q, J = 4.5 Hz), 114.7, 58.9, 57.2, 32.5, 30.7, 30.2, 29.5, 25.5, 25.3

1H: 8.41 (1H, m), 8.12 (1H, d, J = 8.8 Hz), 7.83 (1H, d d, J = 1.5, 8.8 Hz), 4.28 (1H, m), 3.19 (3H, s), 2.0 (2H, d, br), 1.90 (2H, br), 1.73 (1H, br), 1.64 (2H, m), 1.46 (2H, br), 1.18 (1H, br)

Сполука номер 375 (MP: 102-104). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 150.7, 144.4, 139.6, 134.8, 132.2, 118.8, 113, 57.6, 32.4, 29.9, 25.5, 25.3, 20.9, 20.4

1H: 7.81 (1H, s), 7.75 (1H, s), 4.24 (1H, m), 3.15 (3H, s), 2.43 (3H, s), 2.41 (3H, s), 1.98 (2H, d br, J = 11.5 Hz), 1.87 (2H, br), 1.70 (1H, m), 1.61 (2H, d q, J = 3.7, 12.5 Hz), 1.40 (2H, br), 1.16 (1H, m)

Сполука номер 376 (MP: 220-221 (dec)). ЯМР розчинник: DMSO

13C: 150.6, 142.3, 139.3, 138.1, 136.7, 126.2, 124.9, 116.2, 56.9, 31.4, 29, 25.2, 24.9

1H: 8.19 (2H, s), 8.04 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.83 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.37 (2H, s), 3.83 (1H, m br), 2.95 (3H, s), 1.80 (4H, m), 1.60 (3H, m), 1.31 (2H, m), 1.14 (1H, m)

Сполука номер 377 (MP: 93-95). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 162.6, 151.6, 150.9, 136.1, 132.9, 97.3, 86.2, 58.9, 56.8, 56.2, 56, 32.7, 30.8, 29.5, 25.5, 25.3

1H: 6.89 (1H, d, J = 2.0 Hz), 6.39 (1H, d, J = 2.0 Hz), 4.25 (1H, m), 4.05 (3H, s), 3.88 (3H, s), 3.15 (3H, s), 1.98 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 1.87 (2H, br), 1.69 (1H, br), 1.60 (2H, d q, J = 3.4, 12.2 Hz), 1.43 (2H, br), 1.15 (1H, m)

Сполука номер 378 (MP: 118-119). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 145.4, 143.8, 139.8, 117.1, 82.4, 79.6, 62.3, 22.6, 21.1

- 1H: 7.61 (2H, s), 5.41 (2H, s), 3.88 (2H, s), 2.40 (6H, s), 1.67 (6H, s)
 Сполука номер 379 (MP: 175). ЯМР розчинник: DMSO
 13C: 150.9, 140.6, 139.2, 137.7, 133.4, 128.6, 128.3, 127.4, 127.3, 127.1, 124.7, 114.4, 75.6, 69.1, 56.1, 31.5, 30.8, 26.6
- 5 1H: 8.12 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.0 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.85 (2H, m d, J = 8.5 Hz), 7.39 (2H, t, J = 7.6 Hz), 7.35-7.29 (4H, m), 7.27 (1H, m), 7.25 (1H, m t, J = 7.3 Hz), 4.51 (2H, s), 3.86 (1H, m), 3.33 (1H, m), 2.91 (3H, s), 2.13 (2H, d br, J = 11.5 Hz), 1.81 (2H, d br, J = 12.5 Hz), 1.68 (2H, d q, J = 2.5, 12.5 Hz), 1.30 (2H, q br, J = 12.5 Hz)
 Сполука номер 380 (MP: 207). ЯМР розчинник: DMSO
- 10 13C: 155.1, 150.7, 139.6, 138, 136.2, 127.4, 125.5, 122.4, 115.9, 56.9, 31.4, 29, 25.2, 24.8
 1H: 16.76 (1H, br), 8.18 (2H, m), 8.07 (4H, m), 3.83 (1H, m), 2.94 (3H, s), 1.78 (4H, m), 1.60 (1H, m), 1.58 (2H, m), 1.30 (2H, q br, J = 13.0 Hz), 1.11 (1H, m, J = 12.9 Hz)
 Сполука номер 381 (MP: 102-103). ЯМР розчинник: CDCl₃
- 15 13C: 146.4, 144.5, 140.1, 135.3, 131.7, 118.9, 113.8, 82.5, 79.6, 62.1, 23, 20.9, 20.4
 1H: 7.99 (1H, s), 7.82 (1H, s), 5.53 (2H, s), 3.89 (2H, s), 2.44 (3H, s), 2.42 (3H, s), 1.68 (6H, s)
 Сполука номер 382 (MP: 112-114). ЯМР розчинник: CDCl₃
- 20 13C: 152.5, 149.2, 146.4, 139.7, 128.4, 98.6, 94.7, 82.6, 79.5, 62.1, 56.6, 56.2, 23
 1H: 7.63 (1H, s), 7.39 (1H, s), 5.55 (2H, s), 4.04 (3H, s), 4.0 (3H, s), 3.89 (2H, s), 1.68 (6H, s)
 Сполука номер 383 (MP: 139). ЯМР розчинник: CDCl₃
- 25 13C: 151.4, 142.2, 137, 132.8, 128.7, 127.6, 125.1, 113.1, 69.6, 56.4, 34.1, 31.7, 27.4
 1H: 7.92 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.80 (2H, m d, J = 8.0 Hz), 7.49 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.41 (2H, m t, J = 7.9 Hz), 7.30 (1H, m t, J = 7.5 Hz), 4.01 (1H, m), 3.62 (1H, m), 2.99 (3H, s), 2.11 (2H, d br, J = 12.5 Hz), 1.90 (2H, d br, J = 12.5 Hz), 1.71 (2H, d q, J = 3.0, 12.5 Hz), 1.46 (2H, d q, J = 3.5, 13.0 Hz)
 Сполука номер 384 (MP: 158-160). ЯМР розчинник: CDCl₃
- 30 13C: 163.3, 151.7, 149.2, 134.4, 133.9, 97.6, 86.7, 69.5, 56.3, 56.2, 56.1, 24.3
 1H: 7.43 (1H, s), 7.13 (1H, d, J = 2.0 Hz), 6.40 (1H, d, J = 2.0 Hz), 4.05 (3H, s), 3.90 (3H, s), 3.82 (2H, d, J = 5.5 Hz), 3.34 (1H, t, J = 5.5 Hz), 1.51 (6H, s)
 Сполука номер 385 (MP: 224-226). ЯМР розчинник: DMSO
- 35 13C: 167.6, 146.1, 140.1, 137.3, 136, 132.6, 128, 124.4, 114.7, 80.6, 79.3, 60.9, 22.4
 1H: 8.20 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.15 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.98 (1H, s br), 7.91 (4H, m), 7.36 (1H, s br), 5.19 (2H, s), 3.85 (2H, s), 1.50 (6H, s)
 Сполука номер 386 (MP: 183-185). ЯМР розчинник: DMSO
- 40 13C: 157.8, 144.5, 136.6, 136.3, 126.9, 122.5, 115.2, 113.8, 80.7, 79.3, 62.5, 61.3, 54.6, 52.6, 22.3, 22.3, 21.3
 1H: 10.83 (1H, s), 9.05 (1H, s br), 8.27 (1H, s), 7.89 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.10 (2H, d, J = 8.6 Hz), 5.21 (2H, s), 4.48 (2H, t, J = 5.0 Hz), 3.87 (2H, s), 3.49 (2H, m), 3.45 (2H, m), 2.99 (2H, m), 1.80 (4H, m), 1.69 (1H, d, J = 15.0 Hz), 1.51 (6H, s), 1.38 (1H, m)
 Сполука номер 387 (MP: 172-175). ЯМР розчинник: DMSO
- 45 13C: 157.9, 144.2, 136.6, 135.7, 127, 122, 115.2, 114, 80.7, 79.3, 63.2, 62.4, 61.3, 54.7, 51.7, 22.3
 1H: 11.69 (1H, s), 9.18 (1H, s), 8.31 (1H, s), 7.91 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.12 (2H, d, J = 8.6 Hz), 5.22 (2H, s), 4.51 (2H, t, J = 5.0 Hz), 3.96 (2H, d br, J = 12.6 Hz), 3.87 (2H, m), 3.87 (2H, s), 3.56 (2H, m), 3.49 (2H, d br, J = 12.4 Hz), 3.20 (2H, m), 1.51 (6H, s)
 Сполука номер 388 (MP: 218-220). ЯМР розчинник: DMSO
- 50 13C: 157.6, 144.6, 136.6, 136.6, 126.8, 122.9, 115.3, 113.7, 80.7, 79.3, 62.4, 61.3, 54.5, 48.5, 39.5, 22.3
 1H: 12.18 (1H, br), 9.89 (2H, s), 8.98 (1H, s), 8.24 (1H, s), 7.88 (2H, d, J = 8.9 Hz), 7.11 (2H, d, J = 8.9 Hz), 5.20 (2H, s), 4.48 (2H, t, J = 5.0 Hz), 3.86 (2H, s), 3.64 (2H, t, J = 5.0 Hz), 3.75 (4H, m), 2.50 (4H, br), 1.50 (6H, s)
 Сполука номер 389 (MP: 216-218). ЯМР розчинник: DMSO
- 55 13C: 166.9, 145.4, 144.6, 133.7, 131.9, 129.1, 119, 113.9, 81.7, 78.7, 61.7, 22.5
 1H: 8.71 (1H, d d, J = 0.8, 1.3 Hz), 8.26 (1H, s br), 8.21 (1H, d, J = 1.3, 8.6 Hz), 8.16 (1H, d d, J = 0.8, 8.6 Hz), 7.63 (1H, s br), 5.43 (2H, s), 3.90 (2H, s), 1.58 (6H, s)
 Сполука номер 390 (MP: 245-247). ЯМР розчинник: DMSO
- 60 13C: 167.6, 150.7, 139.8, 137.9, 136.1, 132.5, 128, 124.3, 115.6, 56.8, 31.3, 29, 25.1, 24.8
 1H: 8.15 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.13 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.97 (1H, s), 7.92 (2H, m), 7.89 (2H, m), 7.35 (1H, s), 3.82 (1H, m), 2.93 (3H, s), 1.78 (4H, m), 1.59 (3H, m), 1.30 (2H, q br, J = 12.7 Hz), 1.11 (1H, q br, J = 13.0 Hz)
 Сполука номер 391 (MP: 165 (dec)). ЯМР розчинник: CDCl₃
- 13C: 155.9, 154.1, 144.5, 137.7, 137.1, 136.9, 129.4, 128.9, 127.7, 124.7, 82.5, 79.6, 62.8, 22.6

- 1H: 9.21 (1H, d, J = 2.2 Hz), 8.40 (1H, d, J = 2.2 Hz), 7.68 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.56 (2H, t, J = 7.8 Hz), 7.50 (1H, t, J = 7.3 Hz), 5.50 (2H, s), 3.93 (2H, s), 1.71 (6H, s)
 Сполука номер 392 (MP: 120). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 156.2, 149.4, 145.6, 137.8, 136.8, 129.3, 128.9, 127.9, 126.1, 121, 82.5, 79.4, 62.6, 22.9
- 5 1H: 9.07 (1H, d, J = 2.2 Hz), 8.75 (1H, d, J = 2.2 Hz), 7.71 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.54 (2H, t, J = 7.6 Hz), 7.49 (1H, t, J = 7.4 Hz), 5.61 (2H, s), 3.92 (2H, s), 1.70 (6H, s)
 Сполука номер 393 (MP: 179-180). ЯМР розчинник: DMSO
 13C: 158.9, 144.2, 136.5, 135.9, 127, 121.3, 115, 113.7, 80.7, 79.3, 71.4, 61.3, 42.6, 33.1, 25.1, 22.2
- 10 1H: 9.25 (1H, d, J = 11.0 Hz), 9.17 (1H, s), 8.93 (1H, q, J = 9.5 Hz), 8.29 (1H, s), 7.88 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.06 (2H, d, J = 8.6 Hz), 5.22 (2H, s), 3.91 (2H, d, J = 6.2 Hz), 3.88 (2H, s), 3.28 (2H, d, J = 12.0 Hz), 2.89 (2H, q, J = 11.5 Hz), 2.08 (1H, m), 1.92 (2H, d, J = 13.0 Hz), 1.54 (2H, q, J = 12.5 Hz), 1.52 (6H, s)
 Сполука номер 394 (MP: 189-190). ЯМР розчинник: DMSO
- 15 13C: 157.9, 148.9, 137, 135.5, 127, 122, 115.2, 114.7, 62.5, 57.2, 54.6, 52.6, 31.5, 28.8, 25, 24.8, 22.3, 21.2
 1H: 10.86 (1H, br), 9.14 (1H, s), 8.28 (1H, s), 7.91 (2H, d, J = 9.0 Hz), 7.11 (2H, d, J = 9.0 Hz), 4.49 (2H, t, J = 5.2 Hz), 3.84 (1H, m), 3.48 (2H, m), 3.46 (2H, m), 2.99 (2H, m), 2.96 (3H, s), 1.80 (8H, m), 1.69 (1H, m), 1.58 (3H, m), 1.39 (1H, m), 1.30 (2H, m), 1.12 (1H, m)
- 20 Сполука номер 395 (MP: 74-76). ЯМР розчинник: DMSO
 13C: 158, 148.7, 136.9, 134.8, 127.1, 121.3, 115.3, 115, 63.2, 62.5, 57.2, 54.7, 51.7, 31.5, 28.8, 25, 24.8
 1H: 11.72 (1H, br), 9.32 (1H, s), 8.35 (1H, s), 7.94 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.15 (2H, d, J = 8.6 Hz), 4.53 (2H, t, J = 5.0 Hz), 3.97 (2H, d br, J = 13.0 Hz), 3.90 (1H, m), 3.88 (2H, t br, J = 11.8 Hz), 3.57 (2H, m), 3.50 (2H, d br, J = 12.4 Hz), 3.21 (2H, m), 2.98 (3H, s), 1.80 (4H, m), 1.61 (3H, m), 1.33 (2H, m, J = 12.5 Hz), 1.14 (1H, m)
- 25 Сполука номер 396 (MP: 180-181). ЯМР розчинник: DMSO
 13C: 159, 144.3, 136.5, 136, 127, 121.3, 115, 113.6, 80.7, 79.4, 65.3, 61.4, 43, 34.7, 30.4, 28.3, 22.3
- 30 1H: 9.13 (1H, d, J = 1.3 Hz), 9.04 (1H, m), 8.82 (1H, m), 8.25 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.85 (2H, d, J = 9.0 Hz), 7.03 (2H, d, J = 9.0 Hz), 5.21 (2H, s), 4.06 (2H, t, J = 6.1 Hz), 3.87 (2H, s), 3.22 (2H, d br, J = 12.5 Hz), 2.83 (2H, q br, J = 11.5 Hz), 1.85 (2H, d br, J = 14.0 Hz), 1.76 (1H, m), 1.68 (2H, m), 1.51 (6H, s), 1.41 (2H, d q, J = 4.0, 13.8 Hz)
 Сполука номер 397 (MP: 205-207). ЯМР розчинник: DMSO
- 35 13C: 157.8, 148.8, 137, 135.3, 127, 121.9, 115.3, 114.8, 62.4, 57.2, 54.4, 48.4, 39.7, 31.5, 28.8, 25, 24.8
 1H: 12.35 (1H, s br), 10.02 (2H, s), 9.21 (1H, s), 8.31 (1H, s), 7.92 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.14 (2H, d, J = 8.6 Hz), 4.50 (2H, t, J = 4.8 Hz), 3.81 (1H, m), 3.65 (2H, t, J = 4.8 Hz), 3.50 (8H, s br), 2.96 (3H, s), 1.79 (4H, m), 1.59 (3H, m), 1.31 (2H, q, J = 12.5 Hz), 1.12 (1H, q, J = 13.0 Hz)
- 40 Сполука номер 398 (MP: 201 (dec.)). ЯМР розчинник: DMSO
 13C: 156.7, 151.2, 141, 137.3, 126.1, 124.5, 115.3, 112.5, 66.3, 54.1, 31.5, 29.1
 1H: 9.46 (1H, s), 8.06 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.79 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.64 (2H, m d, J = 8.8 Hz), 6.77 (2H, m d, J = 8.8 Hz), 4.09 (1H, m), 3.93 (2H, d d, J = 4.3, 11.1 Hz), 3.73 (2H, t br, J = 12.0 Hz), 2.94 (3H, s), 1.85 (2H, d q, J = 4.5, 12.2 Hz), 1.69 (2H, m d, J = 12.3 Hz)
- 45 Сполука номер 399 (MP: 176-178). ЯМР розчинник: DMSO
 13C: 157.9, 144.9, 137.4, 136.9, 131.9, 130.2, 118.2, 114.9, 114.8, 111.1, 80.7, 79.3, 62.5, 61.2, 54.6, 52.6, 22.3, 22.3, 21.2
 1H: 10.80 (1H, s), 8.83 (1H, s), 8.35 (1H, s), 7.59 (1H, br), 7.54 (1H, d br, J = 7.5 Hz), 7.39 (1H, t, J = 7.9 Hz), 6.96 (1H, d d, J = 2.0, 8.2 Hz), 5.21 (2H, s), 4.50 (2H, t, J = 5.2 Hz), 3.87 (2H, s), 3.46 (4H, m), 3.0 (2H, m), 1.80 (4H, m), 1.69 (1H, m), 1.51 (6H, s), 1.38 (1H, m)
- 50 Сполука номер 400 (MP: 200-202). ЯМР розчинник: DMSO
 13C: 159, 148.8, 136.9, 135.3, 127, 121, 115, 114.6, 71.4, 57.2, 42.6, 33.1, 31.5, 28.8, 25.1, 25, 24.8
 1H: 9.24 (1H, m), 9.22 (1H, s), 8.93 (1H, m), 8.29 (1H, s), 7.88 (2H, d, J = 8.9 Hz), 7.06 (2H, d, J = 8.9 Hz), 3.91 (2H, d, J = 6.3 Hz), 3.85 (1H, m), 3.27 (2H, d br, J = 12.4 Hz), 2.96 (3H, s), 2.88 (2H, q, J = 11.0 Hz), 2.07 (1H, m), 1.91 (2H, d br, J = 13.0 Hz), 1.79 (4H, m), 1.58 (3H, m), 1.55 (2H, m), 1.31 (2H, m, J = 13.0 Hz), 1.12 (1H, m, J = 13.0 Hz)
- 55 Сполука номер 401 (MP: 160-162). ЯМР розчинник: DMSO
 13C: 157.8, 145.1, 138.1, 136.9, 132.5, 130.1, 118.2, 114.7, 114.6, 111.1, 80.6, 79.3, 62.4, 61.1, 54.4, 48.5, 25.5, 22.3
- 60

¹H: 12.23 (1H, s br), 9.84 (2H, s), 8.69 (1H, br), 8.29 (1H, s), 7.58 (1H, br), 7.53 (1H, d, J = 7.6 Hz), 7.38 (1H, t, J = 7.9 Hz), 6.97 (1H, d d, J = 1.8, 8.0 Hz), 5.20 (2H, s), 4.50 (2H, m), 3.86 (2H, s), 3.66 (2H, m), 3.50 (8H, br), 1.51 (6H, s)

Сполука номер 402 (MP: 137-140). ЯМР розчинник: DMSO

5 ¹³C: 157.9, 144.6, 136.8, 136.6, 131.1, 130.2, 118.3, 115.2, 115.1, 111.2, 80.7, 79.3, 63.2, 62.5, 61.3, 54.7, 51.7, 22.3

¹H: 11.70 (1H, s), 9.0 (1H, s), 8.41 (1H, s), 7.62 (1H, br), 7.56 (1H, d, J = 7.8 Hz), 7.40 (1H, t, J = 8.0 Hz), 7.0 (1H, d d, J = 2.0, 8.2 Hz), 5.22 (2H, s), 4.54 (2H, t, J = 4.7 Hz), 3.96 (2H, d br, J = 13.0 Hz), 3.87 (2H, s), 3.87 (2H, m), 3.57 (2H, m), 3.51 (2H, d br, J = 13.0 Hz), 3.22 (2H, m), 1.51 (6H, s)

10 Сполука номер 403 (MP: 204-206). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 167.9, 150.8, 140.1, 137.7, 134.7, 133.5, 128.6, 127.3, 126.1, 123.9, 114.9, 56.8, 31.4, 29, 25.2, 24.8

¹H: 8.35 (1H, t, J = 1.5 Hz), 8.15 (1H, d, J = 1.2 Hz), 8.06 (1H, d, J = 1.2 Hz), 8.03 (1H, s br), 7.98 (1H, d t, J = 1.5, 7.9 Hz), 7.75 (1H, d t, J = 1.5, 7.9 Hz), 7.47 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.42 (1H, s br), 3.83 (1H, m), 2.94 (3H, s), 1.78 (4H, m), 1.58 (3H, m), 1.29 (2H, m), 1.11 (1H, m)

15 Сполука номер 404 (MP: 198-200). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 150.9, 140.3, 137.9, 137.3, 133.3, 128.4, 125.5, 115.2, 66.1, 57.7, 46, 31.4, 30, 25.4, 25.2

¹H: 7.97 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.93 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.78 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.64 (1H, d, J = 1.3 Hz), 3.95 (1H, m, J = 11.5 Hz), 3.75 (4H, m, J = 5.0 Hz), 3.02 (4H, m, J = 5.0 Hz), 3.01 (3H, s), 1.87 (4H, m), 1.72 (1H, m), 1.59 (2H, d q, J = 3.5, 12.3 Hz), 1.38 (2H, t q, J = 3.3, 13.0 Hz), 1.14 (1H, t q, J = 3.5, 13.2 Hz)

20 Сполука номер 405 (MP: 152-154). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 159, 144.7, 137.2, 136.8, 131.5, 130.1, 117.6, 114.9, 114.9, 110.9, 80.7, 79.3, 71.4, 61.2, 42.6, 33.2, 25.2, 22.3

25 ¹H: 9.14 (1H, m), 8.89 (1H, s), 8.85 (1H, m), 8.34 (1H, s), 7.52 (1H, br), 7.49 (1H, m), 7.35 (1H, t, J = 7.8 Hz), 6.91 (1H, d d, J = 2.0, 8.3 Hz), 5.20 (2H, s), 3.92 (2H, d, J = 6.5 Hz), 3.86 (2H, s), 3.28 (2H, d br, J = 12.2 Hz), 2.89 (2H, q br, J = 11.5 Hz), 2.08 (1H, m), 1.93 (2H, d br, J = 13.0 Hz), 1.52 (2H, m), 1.51 (6H, s)

Сполука номер 406 (MP: 190-191). ЯМР розчинник: DMSO

30 ¹³C: 150.8, 150.6, 140.2, 137.7, 133.9, 131.8, 125.6, 124.4, 114.8, 56.8, 31.3, 29, 25.2, 24.8

¹H: 9.64 (1H, s), 8.12 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.04 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.84 (2H, m d, J = 8.5 Hz), 7.69 (2H, m d, J = 8.5 Hz), 5.82 (2H, s), 3.81 (1H, m), 2.93 (3H, s), 1.78 (4H, m), 1.59 (2H, m), 1.57 (1H, m), 1.29 (2H, q br, J = 12.8 Hz), 1.11 (1H, q br, J = 12.9 Hz)

35 Сполука номер 407 (MP: hygroscopic). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 157.9, 149.3, 137.4, 136.4, 131.1, 130.3, 118.4, 116, 115.2, 111.4, 62.6, 57.2, 54.5, 48.5, 39.7, 31.6, 28.9, 25.1, 24.8

¹H: 12.09 (1H, br), 9.87 (2H, s), 8.97 (1H, s), 8.37 (1H, s), 7.62 (1H, br), 7.55 (1H, d, J = 8.0 Hz), 7.41 (1H, t, J = 8.0 Hz), 7.01 (1H, d d, J = 2.0, 8.2 Hz), 4.50 (2H, m), 3.90 (1H, m), 3.70 (4H, br), 3.67 (2H, m), 3.50 (4H, m), 2.96 (3H, s), 1.79 (4H, m), 1.58 (3H, m), 1.31 (2H, m), 1.14 (1H, m)

40 Сполука номер 408 (MP: 124-127). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 158, 148.8, 137.3, 135.4, 130.3, 130.2, 118.4, 116.3, 115.5, 111.4, 63.2, 62.6, 57.2, 54.7, 51.7, 31.6, 28.8, 25, 24.8

¹H: 11.80 (1H, s), 9.21 (1H, s br), 8.48 (1H, s), 7.67 (1H, br), 7.58 (1H, d, J = 7.5 Hz), 7.42 (1H, t, J = 8.0 Hz), 7.02 (1H, d d, J = 1.5, 8.1 Hz), 4.55 (2H, m), 3.96 (2H, d br, J = 12.5 Hz), 3.90 (1H, m), 3.87 (2H, t br, J = 12.0 Hz), 3.58 (2H, m), 3.51 (2H, d br, J = 12.1 Hz), 3.22 (2H, m), 2.97 (3H, s), 1.79 (4H, m), 1.59 (3H, m), 1.32 (2H, m), 1.12 (1H, m)

45 Сполука номер 409 (MP: 183). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 164, 151.1, 140.7, 137.8, 133.3, 132.4, 130.6, 128.8, 128.7, 128.7, 127.1, 124.8, 114.4, 59.5, 53.1, 50.8, 31.6, 25.8

50 ¹H: 8.13 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.0 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.85 (2H, m d, J = 8.5 Hz), 7.49-7.40 (5H, m), 7.39 (2H, t, J = 7.7 Hz), 7.26 (1H, m t, J = 7.5 Hz), 4.05 (2H, s), 4.05 (1H, m), 3.26 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 2.94 (3H, s), 2.81 (2H, t br, J = 12.0 Hz), 2.08 (2H, d q, J = 3.3, 12.7 Hz), 1.90 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

Сполука номер 410 (MP: 177-178). ЯМР розчинник: DMSO

55 ¹³C: 149.6, 137.6, 136.6, 131.4, 129.9, 129.6, 129.5, 129, 128.8, 128.5, 125.3, 115.6, 58.7, 52.3, 50.2, 31.6, 24.6

¹H: 11.36 (1H, s br), 9.0 (1H, s), 8.31 (1H, s), 7.92 (2H, m d, J = 8.5 Hz), 7.64 (2H, m), 7.50-7.43 (5H, m), 7.37 (1H, m t, J = 7.7 Hz), 4.26 (2H, d, J = 5.0 Hz), 4.20 (1H, m), 3.39 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 3.09 (2H, q br, J = 12.0 Hz), 2.97 (3H, s), 2.43 (2H, d q, J = 3.3, 13.0 Hz), 1.95 (2H, d br, J = 13.0 Hz)

60 Сполука номер 411 (MP: 191-192). ЯМР розчинник: DMSO

13C: 151.2, 140.7, 137.8, 133.3, 131.3, 129.7, 129, 128.7, 127.2, 124.8, 114.4, 59.2, 52.2, 50.7, 39.8, 31.8, 25.2

1H: 9.42 (1H, s br), 8.14 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.0 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.85 (2H, m d, J = 8.3 Hz), 7.50 (5H, m), 7.39 (2H, t, J = 8.0 Hz), 7.26 (1H, m t, J = 7.3 Hz), 4.29 (1H, m), 4.29 (2H, s br), 3.44 (2H, m, J = 12.3 Hz), 3.13 (2H, m), 2.93 (3H, s), 2.35 (3H, s), 2.12 (2H, q br, J = 13.5 Hz), 2.0 (2H, d br, J = 12.5 Hz)

Сполука номер 412 (MP: 178). ЯМР розчинник: DMSO

13C: 175.7, 171.4, 151.1, 140.7, 137.7, 135.7, 133.4, 129.7, 128.7, 128.5, 127.9, 127.2, 124.8, 114.4, 72, 60.8, 54.5, 51.7, 43.4, 31.6, 27.2

1H: 8.13 (1H, s br), 8.00 (1H, s, br), 7.84 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.43-7.30 (7H, m), 7.26 (1H, t, J = 7.5 Hz), 3.93 (1H, m), 3.73 (2H, s), 3.07 (2H, d br, J = 11.0 Hz), 2.93 (3H, s), 2.68 (2H, d br, J = 15.3 Hz), 2.58 (2H, d, J = 15.3 Hz), 2.37 (2H, t br, J = 12.5 Hz), 1.92 (2H, q br, J = 12.5 Hz), 1.80 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

Сполука номер 413 (MP: 195). ЯМР розчинник: DMSO

13C: 173.4, 151, 140.6, 137.7, 137.3, 133.4, 129.2, 128.6, 128.3, 127.3, 127.1, 124.7, 114.4, 72.1, 61.4, 55, 52, 31.5, 27.8

1H: 8.12 (1H, s), 8.0 (1H, s), 7.84 (2H, d br, J = 7.7 Hz), 7.38 (2H, t, J = 7.6 Hz), 7.35-7.28 (5H, m), 7.25 (1H, m t, J = 7.5 Hz), 4.24 (2H, s), 3.87 (1H, m), 3.58 (2H, s), 2.96 (2H, m), 2.94 (3H, s), 2.15 (2H, t br, J = 11.0 Hz), 1.87 (2H, q br, J = 12.3 Hz), 1.76 (2H, d br, J = 11.0 Hz)

Сполука номер 414 (MP: 192). ЯМР розчинник: DMSO

13C: 151, 140.6, 137.7, 136.8, 133.4, 129.3, 128.6, 128.4, 127.5, 127.1, 124.8, 114.4, 61.2, 54.9, 51.8, 31.5, 27.6

1H: 8.12 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.0 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.85 (2H, m d, J = 8.3 Hz), 7.39 (2H, t, J = 7.5 Hz), 7.36-7.27 (5H, m), 7.23 (1H, m t, J = 7.4 Hz), 3.89 (1H, m), 3.62 (2H, s), 2.99 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 2.94 (3H, s), 2.21 (2H, t br, J = 12.0 Hz), 1.91 (2H, d q, J = 3.3, 12.2 Hz), 1.77 (2H, d br, J = 11.8 Hz)

Сполука номер 415 (MP: 175). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 151, 140.5, 138.3, 137.4, 137.3, 134.5, 128.4, 128.2, 127.6, 127.4, 125.4, 115, 71.9, 69.8, 57.7, 43.3, 31.4, 30.2, 30, 25.4, 25.2

1H: 7.95 (2H, m, J = 8.0 Hz), 7.93 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.78 (2H, m, J = 8.0 Hz), 7.62 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.34-7.21 (5H, m), 4.46 (2H, s), 3.95 (1H, m), 3.46 (1H, m), 3.29 (2H, m), 3.0 (3H, s), 2.96 (2H, m), 1.90 (2H, m), 1.87 (4H, m), 1.80 (2H, m), 1.71 (1H, d br, J = 13.3 Hz), 1.60 (2H, d q, J = 3.5, 13.5 Hz), 1.38 (2H, t q, J = 3.5, 13.3 Hz), 1.14 (1H, t q, J = 3.5, 13.2 Hz)

Сполука номер 416 (MP: 176-177). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 151.2, 148.6, 146.7, 139.3, 138, 137.3, 132.4, 129.1, 129, 128.3, 127.2, 123.6, 113.9, 62.8, 55.9, 52.5, 31.7, 28.9

1H: 9.0 (1H, d d, J = 0.7, 2.2 Hz), 8.53 (1H, d d, J = 1.7, 4.9 Hz), 8.12 (1H, d t, J = 1.7, 7.9 Hz), 7.94 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.58 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.35 (1H, m), 7.34-7.24 (5H, m), 4.02 (1H, m), 3.52 (2H, s), 3.03 (3H, s), 3.0 (2H, m), 2.11 (2H, t br, J = 12.0 Hz), 1.94 (2H, d q, J = 3.5, 12.0 Hz), 1.79 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

Сполука номер 417 (MP: 112-113). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 151.4, 148.5, 146.6, 139.2, 137.3, 132.4, 129, 123.6, 114, 59.4, 31.2, 28.9, 24.3

1H: 9.01 (1H, d, J = 1.7 Hz), 8.53 (1H, d d, J = 1.5, 4.8 Hz), 8.12 (1H, t d, J = 2.0, 7.9 Hz), 7.96 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.59 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.34 (1H, d d, J = 4.8, 7.9 Hz), 4.44 (1H, qt, J = 8.2 Hz), 3.0 (3H, s), 1.96 (2H, m), 1.77 (2H, m), 1.70 (2H, m), 1.63 (2H, m)

Сполука номер 418 (MP: 138-140). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 159.9, 151.5, 142.1, 138, 136.9, 134.3, 129.7, 129.1, 128.3, 127.2, 117.5, 113.7, 113.4, 110.1, 62.8, 55.8, 55.3, 52.5, 31.6, 28.9

1H: 7.92 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.49 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.40 (1H, d d, J = 1.4, 2.4 Hz), 7.38-7.24 (6H, m), 7.31 (1H, t, J = 7.6 Hz), 6.86 (1H, d d d, J = 1.2, 2.5, 7.9 Hz), 4.02 (1H, m), 3.88 (3H, s), 3.52 (2H, s), 3.02 (3H, s), 3.0 (2H, m), 2.10 (2H, t br, J = 11.5 Hz), 1.94 (2H, d q, J = 3.3, 12.0 Hz), 1.79 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

Сполука номер 419 (MP: 190-191). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 159.2, 151.6, 142.1, 138, 136.8, 129.1, 128.3, 127.2, 126.4, 125.8, 114.1, 112, 62.8, 55.8, 55.3, 52.5, 31.6, 28.9

1H: 7.90 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.73 (2H, m d, J = 9.0 Hz), 7.39 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.37-7.23 (5H, m), 6.85 (2H, m d, J = 9.0 Hz), 4.03 (1H, m), 3.84 (3H, s), 3.52 (2H, s), 3.02 (3H, s), 3.0 (2H, m), 2.10 (2H, t br, J = 12.0 Hz), 1.93 (2H, d q, J = 3.6, 12.0 Hz), 1.78 (2H, d br, J = 13.0 Hz)

Сполука номер 420 (MP: 190-191). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 158.4, 151.6, 142.1, 138, 136.9, 136.8, 129.1, 128.6, 128.3, 128, 127.5, 127.2, 126.4, 126, 115, 112.1, 70, 62.8, 55.8, 52.5, 31.6, 28.9

¹H: 7.89 (1H, s), 7.72 (2H, m d, J = 8.6 Hz), 7.45 (2H, d, J = 7.5 Hz), 7.40 (2H, m), 7.38 (1H, s), 7.37-7.23 (6H, m), 7.02 (2H, m d, J = 8.6 Hz), 5.10 (2H, s), 4.01 (1H, m), 3.52 (2H, s), 3.01 (3H, s), 2.99 (2H, m), 2.09 (2H, t br, J = 10.7 Hz), 1.93 (2H, q br, J = 12.5 Hz), 1.78 (2H, d br, J = 12.5 Hz)

Сполука номер 421 (MP: 165-166). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 150.9, 137.6, 137.6, 136.9, 136, 132.8, 125.9, 122.6, 115.3, 59.4, 31.2, 28.9, 24.3

¹H: 8.67 (1H, t br, J = 1.5 Hz), 8.13 (1H, d d d, J = 1.7, 6.5 Hz), 7.98 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.71 (1H, t d, J = 1.2, 8.0 Hz), 7.59 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.31 (1H, d d, J = 6.5, 8.0 Hz), 4.40 (1H, qt, J = 8.0 Hz), 3.0 (3H, s), 1.95 (2H, m), 1.77 (2H, m), 1.69 (2H, m), 1.63 (2H, m)

Сполука номер 422 (MP: 197). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 150.6, 139.0, 138.8, 138.4, 138.2, 127.5, 125.2, 116.8, 56.8, 43.6, 31.3, 29.0, 25.1, 24.8

¹H: 8.26 (1H, s), 8.20 (1H, s), 8.11 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.93 (2H, d, J = 8.5 Hz), 3.81 (1H, m), 3.22 (3H, s), 2.93 (3H, s), 1.78 (4H, m), 1.58 (3H, m), 1.30 (2H, q br, J = 12.7 Hz), 1.12 (1H, m)

Сполука номер 423 (MP: 179). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 164.1, 150.9, 140.1, 138.5, 137.8, 133.6, 133.5, 128.8, 128.7, 128.2, 127, 127, 125.4, 123.2, 114.9, 61.9, 55.5, 52.2, 31.5, 28.2

¹H: 11.20 (1H, br), 9.15 (1H, br), 8.23 (1H, br), 8.15 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.05 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.95 (1H, m d, J = 7.8 Hz), 7.62 (1H, d, J = 7.8 Hz), 7.45 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.36-7.21 (5H, m), 3.83 (1H, m), 3.47 (2H, s), 2.95 (3H, s), 2.90 (2H, d br, J = 11.2 Hz), 2.0 (2H, t br, J = 11.0 Hz), 1.83 (2H, d q, J = 3.3, 11.9 Hz), 1.73 (2H, d br, J = 12.3 Hz)

Сполука номер 424 (MP: 176). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 163.8, 149.2, 137.8, 136.1, 133.6, 130, 129.2, 127.8, 126.6, 124, 116.1, 57.1, 31.5, 28.8, 25.1, 24.8

¹H: 11.31 (1H, br), 9.0 (1H, s), 8.37 (1H, s), 8.27 (1H, t br, J = 1.5 Hz), 8.0 (1H, t d, J = 1.5, 7.7 Hz), 7.73 (1H, t d, J = 1.4, 7.8 Hz), 7.56 (1H, t, J = 7.7 Hz), 3.86 (1H, m), 2.98 (3H, s), 1.81 (4H, m), 1.60 (3H, m), 1.32 (2H, q br, J = 12.8 Hz), 1.13 (1H, q br, J = 13.0 Hz)

Сполука номер 425 (MP: 140-142). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 151.1, 144.6, 140.2, 137.2, 137, 133.6, 132.1, 129, 127.8, 127.1, 122.9, 121.2, 114.7, 112.5, 57.6, 47.2, 31.5, 30, 25.4, 25.2

¹H: 8.61 (1H, d, J = 2.2 Hz), 8.50 (1H, t, J = 5.7 Hz), 7.90 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.89 (1H, d d, J = 2.2, 9.0 Hz), 7.43 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.42-7.29 (5H, m), 6.89 (1H, d, J = 9.0 Hz), 4.61 (2H, d, J = 5.7 Hz), 3.96 (1H, m), 3.0 (3H, s), 1.87 (4H, m), 1.71 (1H, d br, J = 13.0 Hz), 1.60 (2H, m), 1.39 (2H, q br, J = 13.0 Hz), 1.13 (1H, m, J = 3.5, 13.2 Hz)

Сполука номер 426 (MP: 261). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 155.4, 151.1, 141.6, 137.1, 136.2, 130, 128.8, 128.4, 127.7, 127.3, 126.8, 118.5, 112.6, 108.6, 106.4, 57.6, 44.5, 31.5, 29.9, 25.4, 25.2

¹H: 9.87 (1H, s), 8.17 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.74 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.45 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.39 (1H, d d, J = 1.4, 8.2 Hz), 7.36-7.25 (5H, m), 6.87 (1H, d, J = 8.2 Hz), 5.10 (2H, s), 3.97 (1H, m), 3.02 (3H, s), 1.87 (4H, m), 1.70 (1H, m), 1.58 (2H, q br, J = 13.0 Hz), 1.38 (2H, q br, J = 13.0 Hz), 1.13 (1H, q br, J = 12.8 Hz)

Сполука номер 427 (MP: 204-205). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 150.6 (d d, J = 13.0, 247.5 Hz), 151.2, 149.8 (d d, J = 12.0, 248.0 Hz), 140.4, 138, 137, 130.2 (d d, J = 4.0, 6.5 Hz), 129.1, 128.3, 127.2, 121.0 (d d, J = 3.5, 6.2 Hz), 117.5 (d, J = 17.5 Hz), 114.2 (d, J = 19.0 Hz), 113.5, 62.8, 55.9, 52.5, 31.7, 28.9

¹H: 7.89 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.61 (1H, d d d, J = 2.2, 7.2, 11.5 Hz), 7.50 (1H, m), 7.46 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.37-7.25 (5H, m), 7.18 (1H, d t, J = 8.4, 10.2 Hz), 4.02 (1H, m), 3.53 (2H, s), 3.03 (3H, s), 3.01 (2H, m), 2.11 (2H, t br, J = 12.0 Hz), 1.93 (2H, d q, J = 3.5, 12.0 Hz), 1.78 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

Сполука номер 428 (MP: 222-223). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 151.3, 141.2, 138, 137, 133.1, 131.5, 129.1, 128.8, 128.3, 127.2, 126.4, 113.4, 62.8, 55.8, 52.5, 31.6, 28.9

¹H: 7.91 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.49 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.73 (2H, m d, J = 8.5 Hz), 7.37 (2H, m d, J = 8.5 Hz), 7.35-7.25 (5H, m), 4.02 (1H, m), 3.52 (2H, s), 3.02 (3H, s), 3.0 (2H, m), 2.10 (2H, t br, J = 11.5 Hz), 1.93 (2H, J = 3.5, 12.0 Hz), 1.78 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

Сполука номер 429 (MP: 203-204). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 151.4, 150.5, 141.2, 138, 137, 130.4, 129.1, 128.3, 127.2, 126.6, 119.7, 115.9, 113.2, 62.8, 55.9, 52.5, 31.6, 28.9

¹H: 7.91 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.79 (2H, m d, J = 8.8 Hz), 7.47 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.37-7.25 (5H, m), 7.16 (2H, m d, J = 8.8 Hz), 6.54 (1H, t, J = 74.0 Hz), 4.03 (1H, m), 3.53 (2H, s), 3.03 (3H, s), 3.01 (2H, m), 2.11 (2H, t br, J = 12.0 Hz), 1.93 (2H, d q, J = 3.5, 12.0 Hz), 1.79 (2H, d br, J = 12.5 Hz)

Сполука номер 430 (MP: 211-212). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 162.3 (d, J = 247.0 Hz), 151.4, 141.4, 138, 136.9, 129.2 (d, J = 3.5 Hz), 129.1, 128.3, 127.2, 126.8 (d, J = 8.0 Hz), 115.6 (d, J = 21.5 Hz), 112.9, 62.8, 55.8, 52.5, 31.6, 28.9

¹H: 7.90 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.76 (2H, m, J = 5.3, 8.8 Hz), 7.45 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.37-7.25 (5H, m), 7.10 (2H, m t, J = 8.9 Hz), 4.03 (1H, m), 3.52 (2H, s), 3.02 (3H, s), 3.0 (2H, m), 2.10 (2H, t br, J = 12.0 Hz), 1.93 (2H, d q, J = 3.5, 12.0 Hz), 1.78 (2H, d br, J = 10.5 Hz)

Сполука номер 431 (MP: 190-191). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 159.3, 151.2, 148.5, 146.7, 139.2, 137.2, 132.4, 129, 128.7, 123.6, 114, 113.7, 103.8, 56.2, 55.8, 52.1, 48.9, 31.5, 29.1

¹H: 9.0 (1H, d, J = 1.8 Hz), 8.53 (1H, d d, J = 1.5, 4.8 Hz), 8.11 (1H, t d, J = 1.8, 7.9 Hz), 7.92 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.57 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.34 (1H, d d, J = 4.8, 7.9 Hz), 7.22 (1H, t, J = 8.3 Hz), 6.57 (2H, d, J = 8.3 Hz), 3.91 (1H, m), 3.81 (6H, s), 3.71 (2H, s), 3.09 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 3.0 (3H, s), 2.20 (2H, t br, J = 11.6 Hz), 1.94 (2H, d q, J = 3.2, 12.0 Hz), 1.72 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

Сполука номер 432 (MP: 190 (dec)). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 150.4, 139.1, 137.9, 137.7, 133.4, 127.8, 125, 116.3, 63.8, 56.7, 43.1, 32.8, 31.2, 29, 25.1, 24.8

¹H: 8.24 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.19 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.09 (2H, m d, J = 8.5 Hz), 7.73 (2H, m d, J = 8.5 Hz), 4.68 (1H, d, J = 4.0 Hz), 3.81 (1H, m br), 3.51 (1H, m), 3.16 (2H, m), 2.93 (3H, s), 2.71 (2H, m), 1.78 (4H, m), 1.73 (2H, m), 1.58 (3H, m), 1.42 (2H, m), 1.30 (2H, q br, J = 12.8 Hz), 1.12 (1H, q br, J = 12.5 Hz)

Сполука номер 433 (MP: 161-162). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 151.6, 149.1, 148.6, 142.1, 138, 136.7, 129.1, 128.3, 127.2, 126.1, 117.4, 112.3, 111.3, 108.4, 62.8, 55.9, 55.9, 55.8, 52.5, 31.6, 28.9

¹H: 7.90 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.42 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.40 (1H, d, J = 1.9 Hz), 7.37-7.24 (5H, m), 7.30 (1H, d d, J = 1.9, 8.3 Hz), 6.91 (1H, d, J = 8.3 Hz), 4.03 (1H, m), 3.97 (3H, s), 3.92 (3H, s), 3.53 (2H, s), 3.03 (3H, s), 3.01 (2H, m), 2.11 (2H, t br, J = 11.5 Hz), 1.94 (2H, d q, J = 3.2, 11.8 Hz), 1.79 (2H, d br, J = 11.8 Hz)

Сполука номер 434 (MP: 126-128). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 150.7, 142.2, 136.8, 133, 128.7, 127.5, 125.1, 113.1, 56.2, 42.2, 35.3, 31, 25.9, 25.4, 24.4, 23.7, 19.9

¹H: 7.88 (1H, s), 7.81 (2H, d, J = 7.8 Hz), 7.46 (1H, s), 7.41 (2H, t, J = 7.7 Hz), 7.30 (1H, t, J = 7.4 Hz), 4.19 (1H, s br), 3.91 (1H, s br), 3.14 (1H, t, J = 12.7 Hz), 2.10-1.20 (13H, m)

Сполука номер 435 (MP: 127-128). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 151.2, 145.3, 140.4, 139.1, 137, 130, 123.4, 123.2, 118.3, 112.6, 57.5, 42.5, 31.4, 29.9, 25.4, 25.2

¹H: 8.18 (1H, d, J = 2.2 Hz), 7.89 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.85 (1H, d d, J = 2.2, 8.8 Hz), 7.43 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.06 (1H, d, J = 8.8 Hz), 3.95 (1H, m), 3.0 (3H, s), 2.93 (6H, s), 1.88 (2H, m), 1.85 (2H, m), 1.70 (1H, d br, J = 13.0 Hz), 1.58 (2H, d q, J = 3.4, 12.2 Hz), 1.38 (2H, t q, J = 3.0, 13.0 Hz), 1.13 (1H, t q, J = 3.5, 13.2 Hz)

Сполука номер 436 (MP: 215-217). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 166.6, 145.3, 144.6, 134.6, 130, 128.6, 121.5, 114.3, 81.7, 78.7, 61.7, 22.5

¹H: 13.38 (1H, br), 8.70 (1H, s), 8.24 (1H, d, J = 9.0 Hz), 8.19 (1H, d, J = 9.0 Hz), 5.43 (2H, s), 3.90 (2H, s), 1.58 (6H, s)

Сполука номер 437 (MP: 181). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 163.6, 144.4, 144.3, 142.8, 135.9, 132.7, 129.1, 128.4, 128.4, 127.3, 119.5, 118.7, 81.6, 78.7, 77.1, 61.8, 22.2

¹H: 12.06 (1H, br), 8.39 (1H, s), 8.11 (1H, d, J = 9.0 Hz), 7.87 (1H, d, J = 9.0 Hz), 7.49 (2H, d, J = 7.0 Hz), 7.41 (3H, m), 5.29 (2H, s), 4.98 (2H, s), 3.92 (2H, s), 1.57 (6H, s)

Сполука номер 438 (MP: 194). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 155.6, 151.2, 150.8, 139.6, 137.7, 129.3, 126.7, 125.6, 114, 112.5, 112.4, 56.8, 56, 31.4, 29, 25.2, 24.9

¹H: 16.04 (1H, br), 8.58 (1H, d, J = 2.2 Hz), 8.13 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.05 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.04 (1H, d d, J = 2.2, 8.9 Hz), 7.31 (1H, d, J = 8.9 Hz), 3.99 (3H, s), 3.82 (1H, m), 2.94 (3H, s), 1.78 (4H, m), 1.58 (3H, m), 1.30 (2H, q, J = 12.5 Hz), 1.11 (1H, q, J = 13.0 Hz)

Сполука номер 439 (MP: 226-228 (DEC.)). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 154.5, 151.9, 150.9, 139.9, 137.6, 129.1, 125.4, 125.2, 116.7, 113.4, 110.8, 56.8, 31.3, 29, 25.2, 24.9

¹H: 16.0 (1H, br), 11.14 (1H, br), 8.48 (1H, d, J = 2.2 Hz), 8.12 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.95 (1H, s br), 7.87 (1H, d d, J = 2.2, 8.5 Hz), 7.09 (1H, d, J = 8.5 Hz), 3.82 (1H, m), 2.94 (3H, s), 1.78 (4H, m), 1.57 (3H, m), 1.30 (2H, q, J = 12.5 Hz), 1.11 (1H, q, J = 13.0 Hz)

Сполука номер 440 (MP: 104-105). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 163.3, 144.4, 144.2, 142.9, 133.2, 127.4, 119.3, 118.1, 81.6, 78.7, 61.8, 22.2

¹H: 11.56 (1H, br), 9.27 (1H, s br), 8.39 (1H, s), 8.10 (1H, d, J = 9.1 Hz), 7.89 (1H, d, J = 9.1 Hz), 5.29 (2H, s), 3.92 (2H, s), 1.57 (6H, s)

5 Сполука номер 441 (MP: 169-170). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 152.2, 151.2, 139.9, 139.6, 138, 137.2, 130.7, 129.1, 128.3, 127.2, 126, 122.3, 113.8, 113.3, 62.8, 56.6, 55.9, 52.5, 31.7, 28.8

¹H: 8.24 (1H, d, J = 2.2 Hz), 8.0 (1H, d d, J = 2.2, 8.8 Hz), 7.91 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.49 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.37-7.25 (5H, m), 7.13 (1H, d, J = 8.8 Hz), 4.03 (1H, m), 4.0 (3H, s), 3.53 (2H, s), 3.03 (3H, s), 3.01 (2H, m), 2.11 (2H, t br, J = 11.5 Hz), 1.93 (2H, d q, J = 3.5, 12.0 Hz), 1.79 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

10 Сполука номер 442 (MP: 162). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 151.9 (d, J = 246.0 Hz), 151.4, 147.8 (d, J = 11.2 Hz), 141.5, 138, 136.8, 129.6 (d, J = 4.0 Hz), 129.1, 128.3, 127.2, 117.3 (d, J = 7.0 Hz), 116.2 (d, J = 18.5 Hz), 113.1, 110.4 (d, J = 1.7 Hz), 62.8, 56.2, 55.9, 52.5, 31.7, 28.9

¹H: 7.90 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.50 (1H, d d, J = 1.8, 8.3 Hz), 7.46 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.37-7.27 (5H, m), 7.24 (1H, m), 7.09 (1H, d d, J = 8.5, 11.0 Hz), 4.03 (1H, m), 3.97 (3H, s), 3.53 (2H, s), 3.03 (3H, s), 3.01 (2H, m), 2.10 (2H, t br, J = 11.8 Hz), 1.94 (2H, d q, J = 3.0, 12.0 Hz), 1.79 (2H, d br, J = 11.5 Hz)

20 Сполука номер 443 (MP: 188-189). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 152.5 (d, J = 245.0 Hz), 151.4, 147.1 (d, J = 11.0 Hz), 141.1 (d, J = 2.5 Hz), 138, 136.9, 129.1, 128.3, 127.2, 126.5 (d, J = 7.2 Hz), 120.9 (d, J = 3.5 Hz), 113.5 (d, J = 2.5 Hz), 113.1 (d, J = 19.7 Hz), 112.6, 62.8, 56.3, 55.8, 52.5, 31.6, 28.9

¹H: 7.89 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.53 (1H, m), 7.50 (1H, d d, J = 2.5, 8.5 Hz), 7.40 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.37-7.23 (5H, m), 6.99 (1H, t, J = 8.4 Hz), 4.02 (1H, m), 3.92 (3H, s), 3.52 (2H, s), 3.02 (3H, s), 3.0 (2H, m), 2.10 (2H, t br, J = 11.8 Hz), 1.93 (2H, d q, J = 3.5, 12.0 Hz), 1.78 (2H, m)

25 Сполука номер 444 (MP: 168). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 157.6, 153.8, 151.1, 140.6, 137.5, 137.1, 128.5, 127.9, 127.8, 126.3, 126.1, 114.9, 113.2, 78.8, 69.2, 55.1, 43, 42.2, 31.7, 28.1(2 sig.)

¹H: 8.09 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.88 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.77 (2H, m d, J = 8.7 Hz), 7.46 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.40 (2H, t, J = 7.4 Hz), 7.33 (1H, t, J = 7.3 Hz), 7.03 (2H, m d, J = 8.7 Hz), 5.12 (2H, s), 4.03 (3H, m), 2.92 (3H, s), 2.79 (2H, br), 1.76 (2H, d br, J = 11.5 Hz), 1.66 (2H, d q, J = 4.3, 12.1 Hz), 1.41 (9H, s)

30 Сполука номер 445 (MP: 170-171). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 160.4, 151.1, 140, 137.1, 131.1, 130.3, 126.5, 116.3, 113, 111.6, 102, 57.6, 56.2, 31.4, 30, 25.4, 25.2

¹H: 7.98 (1H, d d, J = 2.2, 8.5 Hz), 7.97 (1H, d, J = 2.2 Hz), 7.89 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.44 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.02 (1H, d, J = 8.5 Hz), 3.96 (3H, s), 3.95 (1H, m), 3.0 (3H, s), 1.87 (4H, m), 1.71 (1H, m), 1.58 (2H, d q, J = 3.5, 12.5 Hz), 1.38 (2H, t q, J = 3.0, 13.0 Hz), 1.13 (1H, t q, J = 3.5, 13 Hz)

40 Сполука номер 446 (MP: 176-177). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 160.5, 151.2, 140.1, 138, 137.1, 131.1, 130.3, 129.1, 128.3, 127.2, 126.4, 116.3, 112.9, 111.6, 102, 62.8, 56.2, 55.9, 52.5, 31.7, 28.9

¹H: 7.98 (1H, d d, J = 2.2, 8.5 Hz), 7.97 (1H, d, J = 2.2 Hz), 7.90 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.44 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.37-7.23 (5H, m), 7.01 (1H, d, J = 8.5 Hz), 4.01 (1H, m), 3.96 (3H, s), 3.53 (2H, s), 3.03 (3H, s), 3.01 (2H, m), 2.10 (2H, t br, J = 12.0 Hz), 1.94 (2H, d q, J = 3.5, 12.0 Hz), 1.79 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

45 Сполука номер 447 (MP: 103-105). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 151.5, 142.3, 141.4, 140.3, 136.8, 128.9, 119.4, 115.4, 112.4, 112, 57.5, 43.6, 31.3, 30, 25.4, 25.2

¹H: 7.89 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.38 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.22 (1H, d, J = 2.2 Hz), 7.15 (1H, d d, J = 2.2, 8.1 Hz), 7.03 (1H, d, J = 8.1 Hz), 4.03 (2H, br), 3.94 (1H, m), 2.99 (3H, s), 2.69 (6H, s), 1.85 (4H, m), 1.70 (1H, d br, J = 14.0 Hz), 1.58 (2H, d q, J = 3.5, 12.5 Hz), 1.37 (2H, m q, J = 13.0 Hz), 1.13 (1H, m q, J = 13.0 Hz)

50 Сполука номер 448 (MP: 180-182). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 155.1, 150.2, 137.9, 137.6, 137.5, 136.2, 132.5, 126, 122.7, 115, 62.1, 46.4, 43.3, 14.6

¹H: 8.68 (1H, s br), 8.15 (1H, d, J = 6.3 Hz), 7.94 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.71 (1H, d, J = 8.0 Hz), 7.57 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.33 (1H, d d, J = 6.3, 8.0 Hz), 4.20 (2H, q, J = 7.2 Hz), 3.64 (8H, m), 1.30 (3H, t, J = 7.2 Hz)

55 Сполука номер 449 (MP: 110-112). ЯМР розчинник: CDCl₃

60 ¹³C: 150.8, 137.6, 137.6, 136.9, 136, 132.7, 125.9, 122.7, 115.3, 50.6, 36.4, 29.3, 19.8, 13.7

¹H: 8.67 (1H, t, J = 1.5 Hz), 8.14 (1H, d d d, J = 1.0, 1.6, 6.4 Hz), 7.94 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.71 (1H, t d, J = 1.3, 8.1 Hz), 7.58 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.32 (1H, d d, J = 6.4, 8.1 Hz), 3.46 (2H, t, J = 7.6 Hz), 3.13 (3H, s), 1.68 (2H, m), 1.37 (2H, m), 0.97 (3H, t, J = 7.4 Hz)

Сполука номер 450 (MP: 122-123). ЯМР розчинник: DMSO

5 ¹³C: 151.1, 145.9, 141.4, 137.6, 137.2, 126.2, 113.2, 112.6, 110.7, 110.6, 55.7, 55.4, 45.4, 31.4, 29.5

¹H: 8.03 (1H, s), 7.68 (1H, s), 7.14 (1H, d, J = 1.8 Hz), 7.0 (1H, d d, J = 1.8, 8.2 Hz), 6.79 (1H, d, J = 8.2 Hz), 4.73 (2H, s br), 3.88 (1H, m), 3.76 (3H, s), 3.01 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 2.93 (3H, s), 2.47 (2H, m), 1.67 (4H, m)

10 Сполука номер 451 (MP: 170-172). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 157.6, 150.2, 138.3, 137.3, 131.4, 129.7, 129.7, 129, 126.7, 121.6, 115.7, 113.3, 59.1, 52.3, 50.6, 31.9, 25

¹H: 9.62 (2H, m br), 8.67 (1H, s), 8.0 (1H, s), 7.65 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.55 (2H, m), 7.49 (3H, m), 6.82 (2H, d, J = 8.2 Hz), 4.32 (2H, m), 4.18 (1H, m), 3.45 (2H, m), 3.16 (2H, m), 2.94 (3H, s), 2.19 (2H, q br, J = 12.0 Hz), 2.0 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

15 Сполука номер 452 (MP: 74-76). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 150.3, 137.6, 137.3, 136.9, 136, 132.7, 125.9, 122.8, 115.1, 42.8, 13.2

¹H: 8.67 (1H, t br, J = 1.3 Hz), 8.14 (1H, d, J = 6.4 Hz), 7.93 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.72 (1H, d, J = 8.0 Hz), 7.57 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.32 (1H, d d, J = 6.4, 8.0 Hz), 3.49 (4H, q, J = 7.2 Hz), 1.31 (6H, t, J = 7.2 Hz)

20 Сполука номер 453 (MP: 130-132). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 149.6, 147.8, 145.7, 142.8, 138.2, 137.1, 132.2, 129.9, 129, 127.7, 126.3, 124, 115.6, 39.6

¹H: 8.87 (1H, d d, J = 0.8, 2.2 Hz), 8.43 (1H, d d, J = 1.7, 4.9 Hz), 8.04 (1H, t d, J = 1.9, 8.0 Hz), 7.81 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.61 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.45-7.28 (6H, m), 3.43 (3H, s)

25 Сполука номер 454 (MP: 170-172). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 151.2 (d, J = 240.0 Hz), 151.1, 144.0 (d, J = 12.2 Hz), 140.0 (d, J = 2.5 Hz), 137.6, 131.4, 129.7 (2 sig.), 128.9, 125.2 (d, J = 7.0 Hz), 121.1 (d, J = 2.5 Hz), 117.9 (d, J = 3.0 Hz), 113.5, 112.5 (d, J = 20.0 Hz), 59.0, 52.1, 50.6, 31.7, 25.1

30 ¹H: 9.91 (1H, s), 9.57 (1H, m), 8.10 (1H, s), 7.90 (1H, s), 7.58 (1H, m), 7.55 (2H, m), 7.48 (4H, m), 6.96 (1H, t, J = 8.8 Hz), 4.31 (2H, s br), 4.16 (1H, m), 3.45 (2H, m), 3.15 (2H, m), 2.92 (3H, s), 2.17 (2H, q, J = 12.5 Hz), 1.98 (2H, d br, J = 12.5 Hz)

Сполука номер 455 (MP: 171-173). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 145.8, 137.7, 137.2, 136.8, 136.1, 132.6, 126, 122.7, 114.3, 81, 80.3, 62.1, 22.8

35 ¹H: 8.69 (1H, t br, J = 1.5 Hz), 8.14 (1H, d d d, J = 1.0, 1.5, 6.4 Hz), 7.96 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.70 (1H, t d, J = 1.2, 8.2 Hz), 7.63 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.31 (1H, d d, J = 6.4, 8.2 Hz), 5.12 (2H, s), 3.90 (2H, d), 1.62 (6H, s)

Сполука номер 456 (MP: 181-182). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 149.4, 142.6, 138.3, 137.1, 135.2, 134.6, 132.4, 129.9, 127.7, 126.6, 126.2, 121.1, 117.1, 39.6

40 ¹H: 8.50 (1H, t br, J = 1.5 Hz), 8.08 (1H, d d d, J = 1.0, 1.8, 6.4 Hz), 7.96 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.61 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.60 (1H, m), 7.38 (1H, m), 7.50-7.29 (5H, m), 3.43 (3H, s)

Сполука номер 457 (MP: 179 (dec.)). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 151.4, 150.6, 137.9, 137.7, 137, 131.7, 131.4, 129.7, 129.1, 128.9, 123.9, 121, 119.6, 114.7, 59, 52.2, 50.5, 31.9, 25

45 ¹H: 11.13 (1H, s br), 9.59 (1H, s), 8.39 (1H, s), 8.33 (1H, d, J = 2.0 Hz), 8.14 (1H, s), 8.02 (1H, d, J = 2.0, 8.6 Hz), 7.55 (2H, m), 7.49 (3H, m), 7.19 (1H, d, J = 8.6 Hz), 4.32 (2H, d, J = 4.9 Hz), 4.18 (1H, m), 3.46 (2H, d br, J = 11.5 Hz), 3.16 (2H, m), 2.93 (3H, s), 2.18 (2H, q br, J = 12.5 Hz), 1.99 (2H, d br, J = 12.3 Hz)

Сполука номер 458 (MP: 163-164). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 148.1, 147.7, 146.1, 138.3, 136.8, 131.9, 129.1, 123.9, 113.6, 50, 32.2, 25.1, 24.8

¹H: 9.02 (1H, d d, J = 0.8, 2.2 Hz), 8.46 (1H, d d, J = 1.7, 4.7 Hz), 8.38 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.33 (1H, d br, J = 7.3 Hz), 8.30 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.15 (1H, t d, J = 1.9, 7.9 Hz), 7.42 (1H, d d d, J = 0.8, 4.7, 7.9 Hz), 3.63 (1H, m), 1.90 (2H, m), 1.75 (2H, m), 1.61 (1H, d br, J = 12.7 Hz), 1.32 (4H, m), 1.14 (1H, m)

55 Сполука номер 459 (MP: 199-201). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 150.8, 137.9, 137.6, 137.6, 136.9, 136, 132.7, 129.1, 128.3, 127.2, 125.9, 122.6, 115.3, 62.8, 56, 52.4, 31.7, 28.9

¹H: 8.66 (1H, s br), 8.13 (1H, d, J = 6.3 Hz), 7.93 (1H, s br), 7.70 (1H, d, J = 8.1 Hz), 7.58 (1H, s br), 7.30 (6H, m), 3.99 (1H, m), 3.52 (2H, s), 3.02 (3H, s), 3.01 (2H, m), 2.10 (2H, t br, J = 10.9 Hz), 1.93 (2H, m), 1.78 (2H, d br, J = 10.9 Hz)

60

- Сполука номер 460 (MP: 148). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 165.8, 147.2, 145.6, 132.6, 131.5, 126.5, 119.6, 116.6, 82.4, 79.6, 62.4, 61.7, 23, 14.3
 1H: 8.91 (1H, d d, J = 0.8, 1.4 Hz), 8.17 (1H, d d, J = 1.4, 8.7 Hz), 8.12 (1H, d d, J = 0.8, 8.7 Hz), 5.53 (2H, s), 4.45 (2H, q, J = 7.2 Hz), 3.91 (2H, s), 1.70 (6H, s), 1.44 (3H, t, J = 7.2 Hz)
- 5 Сполука номер 461 (MP: 186). ЯМР розчинник: MeOD
 13C: 149.5, 138.8, 138.8, 137.7, 136.9, 135, 128.4, 127.1, 116.7, 52.2, 33.8, 26.7, 26.5
 1H: 8.75 (1H, br), 8.36 (1H, d, J = 1.2 Hz), 8.25 (1H, m), 8.24 (1H, m), 7.98 (1H, d, J = 8.2 Hz), 7.58 (1H, d d, J = 6.6, 8.2 Hz), 3.73 (1H, m), 2.02 (2H, m), 1.87 (2H, m), 1.70 (1H, d br, J = 13.5 Hz), 1.45 (2H, m), 1.38 (2H, m), 1.24 (1H, m)
- 10 Сполука номер 462 (MP: 125 (dec.)). ЯМР розчинник: DMSO
 13C: 167.1, 145.8, 145.4, 135.3, 132.2, 124.9, 119.4, 113.9, 81.7, 78.7, 61.6, 22.5
 1H: 8.63 (1H, s), 8.34 (1H, s br), 8.25 (1H, d, J = 8.5 Hz), 8.01 (1H, d d, J = 1.5, 8.7 Hz), 7.65 (1H, s br), 5.43 (2H, s), 3.91 (2H, s), 1.60 (6H, s)
- 15 Сполука номер 463 (MP: 181-183). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 151.2, 148.6, 146.7, 139.4, 137.3, 132.5, 128.9, 123.6, 113.9, 66.9, 54.5, 31.8, 29.5
 1H: 9.00 (1H, d d, J = 1.0, 2.2 Hz), 8.53 (1H, d d, J = 1.7, 4.8 Hz), 8.11 (1H, d d d, J = 1.8, 2.3, 7.9 Hz), 7.96 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.59 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.34 (1H, d d d, J = 1.0, 4.8, 7.9 Hz), 4.29 (1H, m), 4.09 (2H, d d, J = 4.6, 11.5 Hz), 3.50 (2H, d t, J = 2.2, 12.0 Hz), 3.04 (3H, s), 1.95 (2H, m), 1.78 (2H, m)
- 20 Сполука номер 464 (MP: 143-144). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 150.6, 148.5, 146.7, 139.3, 136.9, 132.4, 129.1, 123.6, 113.8, 59, 39.5, 31.4, 25.6, 25.1, 14.9
 1H: 9.01 (1H, d, J = 2.3 Hz), 8.53 (1H, d d, J = 1.7, 4.8 Hz), 8.12 (1H, t d, J = 2.0, 8.0 Hz), 7.91 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.56 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.34 (1H, d d d, J = 0.8, 4.8, 8.0 Hz), 3.75 (1H, m), 3.44 (2H, q, J = 7.0 Hz), 1.84 (4H, m), 1.66 (3H, m), 1.30 (2H, m, J = 13.0 Hz), 1.26 (3H, t, J = 7.0 Hz), 1.13 (1H, m, J = 13.0 Hz)
- 25 Сполука номер 465 (MP: 184-185). ЯМР розчинник: MeOD
 13C: 151.9, 147.7, 147.1, 140.6, 138.4, 132.6, 131.6, 130.6, 130.4, 123, 118.8, 116.9, 114.7, 114.1, 61.8, 54.7, 52.8, 33.5, 26.8
 1H: 8.64 (1H, s br), 7.82 (1H, s br), 7.58 (2H, m), 7.52 (3H, m), 7.18 (1H, d, J = 2.0 Hz), 7.11 (1H, d d, J = 2.0, 8.3 Hz), 6.83 (1H, d, J = 8.3 Hz), 4.36 (2H, s), 4.28 (1H, m), 3.63 (2H, d br, J = 12.5 Hz), 3.24 (2H, m, J = 12.5 Hz), 3.06 (3H, s), 2.30 (2H, m, J = 13.0 Hz), 2.17 (2H, d br, J = 13.0 Hz)
- 30 Сполука номер 466 (MP: 221-222). ЯМР розчинник: DMSO
 13C: 151.7 (d, J = 242.5 Hz), 151.0, 146.2 (d, J = 10.8 Hz), 139.6 (d, J = 2.5 Hz), 137.7, 126.7 (d, J = 7.5 Hz), 120.9 (d, J = 3.5 Hz), 114.1 (2 sig.), 112.3 (d, J = 19.7 Hz), 66.3, 56.0, 54.2, 31.6, 29.1
 1H: 8.11 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.98 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.66 (1H, m), 7.63 (1H, m), 7.19 (1H, t, J = 8.7 Hz), 4.09 (1H, m), 3.93 (2H, d d, J = 4.5, 12.3 Hz), 3.85 (3H, s), 3.38 (2H, m), 2.94 (3H, s), 1.85 (2H, d q, J = 4.5, 12.3 Hz), 1.69 (2H, d br, J = 12.3 Hz)
- 35 Сполука номер 467 (MP: 177). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 151.5, 142.3, 140, 137, 132.9, 128.7, 128.6, 128.4, 127.6, 126.1, 125.1, 113.1, 60.2, 55.7, 52.6, 33.8, 31.6, 28.9
 1H: 7.93 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.81 (2H, m d, J = 8.2 Hz), 7.51 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.41 (2H, t, J = 7.9 Hz), 7.30 (3H, t, J = 7.4 Hz), 7.22 (1H, m), 7.21 (2H, d, J = 7.4 Hz), 4.06 (1H, m), 3.13 (2H, d br, J = 11.8 Hz), 3.04 (3H, s), 2.82 (2H, m), 2.63 (2H, m), 2.17 (2H, d t, J = 2.4, 12.0 Hz), 1.96 (2H, d q, J = 3.6, 12.1 Hz), 1.85 (2H, d br, J = 12.0 Hz)
- 40 Сполука номер 468 (MP: 186-187). ЯМР розчинник: DMSO
 13C: 151.2, 145.9, 141.4, 137.5, 137.2, 126.2, 113.2, 112.6, 110.7, 110.6, 66.3, 55.3, 54.1, 31.6, 29.1
 1H: 8.05 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.69 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.15 (1H, d, J = 2.2 Hz), 7.0 (1H, d d, J = 2.2, 8.4 Hz), 6.79 (1H, d, J = 8.4 Hz), 4.73 (2H, s), 4.09 (1H, m), 3.93 (2H, d d, J = 4.3, 11.3 Hz), 3.77 (3H, s), 3.38 (2H, d t, J = 1.5, 12.0 Hz), 2.94 (3H, s), 1.84 (2H, d q, J = 4.5, 12.3 Hz), 1.69 (2H, d d, J = 2.8, 12.3 Hz)
- 45 Сполука номер 469 (MP: 111 (dec.)). ЯМР розчинник: DMSO
 13C: 156.7, 153.8, 151.1, 141, 137.3, 126.1, 124.4, 115.3, 112.5, 78.8, 55, 43, 42.2, 31.7, 28.1, 28.1
 1H: 9.46 (1H, s), 8.06 (1H, s), 7.78 (1H, s), 7.64 (2H, d, J = 8.7 Hz), 6.77 (2H, d, J = 8.7 Hz), 4.03 (3H, m), 2.91 (3H, s), 2.79 (2H, s br), 1.75 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 1.66 (2H, d q, J = 4.1, 12.2 Hz), 1.41 (9H, s)
- 50 Сполука номер 470 (MP: 217 (dec.)). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 150.8, 137.7, 137.6, 137, 136.1, 132.7, 126, 122.8, 115.3, 66.9, 54.6, 31.9, 29.5
- 55
60

¹H: 8.68 (1H, t, J = 1.3 Hz), 8.15 (1H, d d d, J = 1.0, 1.6, 6.4 Hz), 7.95 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.73 (1H, t d, J = 1.2, 8.1 Hz), 7.60 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.33 (1H, d d, J = 6.4, 8.1 Hz), 4.28 (1H, m), 4.10 (2H, d d, J = 4.5, 11.6 Hz), 3.51 (2H, d t, J = 1.8, 12.0 Hz), 3.04 (3H, s), 1.96 (2H, d q, J = 4.4, 12.2 Hz), 1.79 (2H, m)

5 Сполука номер 471 (MP: 205-207). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 150.1, 137.6, 137.2, 136.9, 136, 132.8, 125.9, 122.8, 115.1, 59.1, 39.6, 31.3, 25.5, 25, 14.9

¹H: 8.67 (1H, t, J = 1.6 Hz), 8.14 (1H, d d d, J = 1.0, 1.6, 6.4 Hz), 7.89 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.72 (1H, t d, J = 1.3, 8.1 Hz), 7.55 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.31 (1H, d d, J = 6.4, 8.1 Hz), 3.69 (1H, m), 3.42 (2H, q, J = 7.0 Hz), 1.84 (4H, m), 1.68 (3H, m), 1.27 (2H, m, J = 13.0 Hz), 1.25 (3H, t, J = 7.0 Hz), 1.12 (1H, m, J = 12.8 Hz)

10 Сполука номер 472 (MP: 153-154). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 162.3 (d, J = 246.7 Hz), 151.4, 141.5, 136.9, 129.1 (d, J = 3.6 Hz), 126.8 (d, J = 8.5 Hz), 115.6 (d, J = 21.7 Hz), 112.8, 67, 54.4, 31.8, 29.5

¹H: 7.91 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.76 (2H, m, J = 5.5, 8.9 Hz), 7.46 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.10 (2H, m t, J = 8.8 Hz), 4.28 (1H, m), 4.09 (2H, d d, J = 4.6, 11.6 Hz), 3.50 (2H, d t, J = 1.7, 11.9 Hz), 3.04 (3H, s), 1.95 (2H, d q, J = 4.6, 12.3 Hz), 1.77 (2H, d br, J = 11.0 Hz)

15 Сполука номер 473 (MP: 146-147). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 151.2, 150.6 (d d, J = 13.1, 247.3 Hz), 149.8 (d d, J = 12.8, 248.2 Hz), 140.5, 137.0, 130.1 (d d, J = 4.0, 6.5 Hz), 121.1 (d d, J = 3.8, 6.3 Hz), 117.5 (d, J = 17.6 Hz), 114.2 (d, J = 18.8 Hz), 113.4, 67.0, 54.5, 31.8, 29.5

¹H: 7.91 (1H, d, J = 1.1 Hz), 7.61 (1H, d d d, J = 2.1, 7.8, 11.6 Hz), 7.50 (1H, m), 7.46 (1H, s), 7.18 (1H, d t, J = 8.5, 10.0 Hz), 4.28 (1H, m), 4.09 (2H, d d, J = 4.5, 11.5 Hz), 3.50 (2H, d t, J = 1.3, 12.0 Hz), 3.04 (3H, s), 1.95 (2H, d q, J = 4.4, 12.2 Hz), 1.77 (2H, d br, J = 13.5 Hz)

20 Сполука номер 474 (MP: 148-149). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 151.4, 150.6 (t, J = 2.7 Hz), 141.3, 137, 130.3, 126.6, 119.7, 115.9 (t, J = 260.0 Hz), 113.1, 67, 54.4, 31.8, 29.5

¹H: 7.92 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.79 (2H, m d, J = 8.8 Hz), 7.48 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.16 (2H, m d, J = 8.8 Hz), 6.54 (1H, t, J = 74.0 Hz), 4.29 (1H, m), 4.09 (2H, d d, J = 4.5, 11.5 Hz), 3.50 (2H, d t, J = 2.0, 12.0 Hz), 3.04 (3H, s), 1.95 (2H, d q, J = 4.5, 12.3 Hz), 1.78 (2H, m)

30 Сполука номер 475 (MP: 183-184). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 159.2, 151.6, 142.2, 136.8, 126.4, 125.6, 114.1, 112, 67, 55.3, 54.3, 31.8, 29.5

¹H: 7.91 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.72 (2H, m d, J = 8.9 Hz), 7.40 (1H, d, J = 1.3 Hz), 6.94 (2H, m d, J = 8.9 Hz), 4.28 (1H, m), 4.08 (2H, d d, J = 4.4, 11.5 Hz), 3.84 (3H, s), 3.50 (2H, d t, J = 1.9, 11.8 Hz), 3.03 (3H, s), 1.94 (2H, d q, J = 4.5, 12.2 Hz), 1.76 (2H, m d, J = 12.3 Hz)

35 Сполука номер 476 (MP: 130). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 151.5, 149.1, 148.6, 142.2, 136.7, 125.9, 117.4, 112.3, 111.2, 108.4, 67, 55.9, 55.9, 54.4, 31.8, 29.5

¹H: 7.91 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.43 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.39 (1H, d, J = 2.0 Hz), 7.30 (1H, d d, J = 2.0, 8.3 Hz), 6.90 (1H, d, J = 8.3 Hz), 4.29 (1H, m), 4.09 (2H, d d, J = 4.3, 11.6 Hz), 3.96 (3H, s), 3.92 (3H, s), 3.50 (2H, d t, J = 1.7, 12.0 Hz), 3.04 (3H, s), 1.95 (2H, d q, J = 4.5, 12.4 Hz), 1.77 (2H, d br, J = 12.3 Hz)

40 Сполука номер 477 (MP: 174-176). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 151.3, 141.3, 137, 133.2, 131.4, 128.9, 126.4, 113.3, 67, 54.4, 31.8, 29.5

¹H: 7.92 (1H, s), 7.73 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.50 (1H, s), 7.37 (2H, d, J = 8.5 Hz), 4.28 (1H, m), 4.09 (2H, d d, J = 4.5, 11.5 Hz), 3.50 (2H, t, J = 11.5 Hz), 3.03 (3H, s), 1.95 (2H, d q, J = 4.5, 12.2 Hz), 1.77 (2H, d br, J = 12.5 Hz)

45 Сполука номер 478 (MP: 222-225). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 166.1, 146.3, 145.9, 137.5, 132.5, 125.2, 120, 112.4, 82.5, 79.5, 62.4, 52.1, 28.8, 23

¹H: 8.46 (1H, d d, J = 0.8, 1.5 Hz), 8.10 (1H, d d, J = 0.8, 8.7 Hz), 7.91 (1H, d d, J = 1.5, 8.7 Hz), 6.12 (1H, s), 5.53 (2H, s), 3.91 (2H, s), 1.69 (6H, s), 1.51 (9H, s)

50 Сполука номер 479 (MP: 193-195). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 170.3, 145.7, 145.3, 137.7, 132.4, 124.7, 120.2, 113.2, 82.4, 79.6, 62.3, 39.6, 35.4, 22.9

¹H: 8.30 (1H, s br), 8.14 (1H, d, J = 8.6 Hz), 7.53 (1H, d d, J = 1.4, 8.6 Hz), 5.53 (2H, s), 3.91 (2H, s), 3.16 (3H, s), 3.0 (3H, s), 1.68 (6H, s)

55 Сполука номер 480 (MP: 233-234). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 167, 149.8, 144.5, 134, 131.6, 128.8, 119, 113.1, 59, 31.9, 28.4, 24

¹H: 8.71 (1H, s), 8.25 (1H, s br), 8.18 (1H, d d, J = 1.4, 8.3 Hz), 7.94 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.61 (1H, s br), 4.57 (1H, br), 3.07 (3H, s), 1.93 (2H, m), 1.78 (2H, m), 1.72 (2H, m), 1.54 (2H, m)

Сполука номер 481 (MP: 171-172). ЯМР розчинник: CDCl₃

- 13C: 165, 145, 144.6, 143.5, 137.6, 135.9, 129.1, 127.5, 124.9, 120.4, 119.9, 118.7, 82.4, 79.6, 62.7, 22.6
 1H: 8.39 (1H, s), 8.21 (1H, s br), 7.95 (2H, m), 7.69 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.39 (2H, t, J = 7.9 Hz), 7.19 (1H, t, J = 7.3 Hz), 5.40 (2H, s), 3.92 (2H, s), 1.69 (6H, s)
- 5 Сполука номер 482 (MP: 185-186). ЯМР розчинник: DMSO
 13C: 166.4, 156.3, 150.9, 140, 137.6, 128.6, 127.1, 126, 123, 113.6, 112.3, 56.7, 56, 31.3, 29, 25.2, 24.9
 1H: 8.25 (1H, d, J = 2.3 Hz), 8.09 (1H, s br), 7.95 (1H, s br), 7.92 (1H, d d, J = 2.3, 8.7 Hz), 7.67 (1H, s br), 7.56 (1H, s br), 7.16 (1H, d, J = 8.7 Hz), 3.90 (3H, s), 3.81 (1H, m), 2.93 (3H, s), 1.78 (4H, m), 1.60 (1H, m), 1.56 (2H, m), 1.30 (2H, m, J = 13.0 Hz), 1.11 (1H, m)
- 10 Сполука номер 483 (MP: 117). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 150.6, 145.3, 133.2, 129.3, 125.2, 119.8, 113.6, 67.1, 54.6, 29.9 (2 sig.)
 1H: 8.10 (1H, m d, J = 8.4 Hz), 7.99 (1H, m d, J = 8.4 Hz), 7.61 (1H, m, J = 1.0, 7.0, 8.2 Hz), 7.47 (1H, m, J = 1.0, 7.1, 8.2 Hz), 4.54 (1H, m), 4.10 (2H, d br, J = 11.5 Hz), 3.51 (2H, s br), 3.21 (3H, s), 2.03 (2H, d q, J = 4.6, 12.3 Hz), 1.91 (2H, d br, J = 11.5 Hz)
- 15 Сполука номер 484 (MP: 119-120). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 151.9 (d, J = 246.5 Hz), 151.4, 147.8 (d, J = 11.2 Hz), 141.5, 136.8, 129.5 (d, J = 3.8 Hz), 117.3 (d, J = 6.9 Hz), 116.2 (d, J = 18.7 Hz), 113, 110.3 (d, J = 2.0 Hz), 67, 56.2, 54.4, 31.8, 29.5
 1H: 7.92 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.50 (1H, d d, J = 2.0, 8.3 Hz), 7.47 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.24 (1H, m), 7.09 (1H, d d, J = 8.3, 11.0 Hz), 4.29 (1H, m), 4.10 (2H, d d, J = 4.5, 11.5 Hz), 3.96 (3H, s), 3.50 (2H, d t, J = 1.8, 12.0 Hz), 3.04 (3H, s), 1.95 (2H, d q, J = 4.6, 12.4 Hz), 1.78 (2H, d br, J = 12.5 Hz)
- 20 Сполука номер 485 (MP: 181). ЯМР розчинник: DMSO
 13C: 153.2, 148.8, 137.1, 135, 126.4, 124.2, 123.2, 121.1, 115, 112.4, 57.2, 56.1, 40.7, 31.5, 28.8, 25, 24.8
 1H: 9.20 (1H, s br), 9.10 (1H, s), 8.31 (1H, s), 7.77 (1H, d d, J = 2.3, 8.2 Hz), 7.76 (1H, s), 7.20 (1H, d, J = 8.2 Hz), 3.87 (3H, s), 3.84 (1H, br), 3.03 (3H, s), 2.96 (3H, s), 1.79 (4H, m), 1.61 (1H, m), 1.57 (2H, m), 1.32 (2H, m), 1.12 (1H, m)
- 25 Сполука номер 486 (MP: 200-203 (dec.)). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 164.7, 145.6, 145, 137.7, 134.5, 132.8, 129.2, 128.6, 124.9, 120.4, 118.8, 115, 82.4, 79.5, 62.5, 23
- 30 1H: 8.61 (1H, s), 8.30 (1H, d, J = 8.6 Hz), 8.19 (1H, s br), 8.15 (1H, d d, J = 1.3, 8.6 Hz), 7.70 (2H, d, J = 8.0 Hz), 7.41 (2H, t, J = 8.3 Hz), 7.20 (1H, t, J = 7.5 Hz), 5.53 (2H, s), 3.92 (2H, s), 1.70 (6H, s)
 Сполука номер 487 (MP: 175-177). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 165.7, 145.7, 145.1, 134.2, 133.8, 128.4, 118.3, 114.6, 82.5, 79.5, 62.4, 52, 28.8, 23
- 35 1H: 8.42 (1H, d d, J = 0.5, 1.6 Hz), 8.25 (1H, d d, J = 0.5, 8.7 Hz), 8.03 (1H, d d, J = 1.6, 8.7 Hz), 6.09 (1H, s br), 5.54 (2H, s), 3.91 (2H, s), 1.69 (6H, s), 1.53 (9H, s)
 Сполука номер 488 (MP: 175). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 151.2, 148.6, 146.7, 140, 139.3, 137.3, 132.4, 128.9, 128.6, 128.4, 126.1, 123.6, 113.9, 60.2, 55.8, 52.6, 33.8, 31.7, 28.8
- 40 1H: 9.01 (1H, d d, J = 0.7, 2.2 Hz), 8.53 (1H, d d, J = 1.6, 4.8 Hz), 8.12 (1H, d d d, J = 1.7, 2.6, 8.0 Hz), 7.96 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.59 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.34 (1H, d d d, J = 1.0, 4.8, 8.0 Hz), 7.30 (2H, m, J = 7.5 Hz), 7.21 (1H, m), 7.20 (2H, m, J = 7.1 Hz), 4.05 (1H, m), 3.14 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 3.05 (3H, s), 2.81 (2H, m), 2.63 (2H, m), 2.17 (2H, d t, J = 2.0, 11.6 Hz), 1.97 (2H, d q, J = 3.7, 12.0 Hz), 1.85 (2H, d br, J = 12.0 Hz)
- 45 Сполука номер 489 (MP: 197). ЯМР розчинник: DMSO
 13C: 164.3, 145.4, 144.5, 133.6, 132.4, 129, 118.7, 113.9, 81.7, 78.7, 61.7, 48.7, 32.5, 25.3, 25, 22.5
 1H: 8.68 (1H, s), 8.49 (1H, d, J = 8.0 Hz), 8.18 (1H, d d, J = 1.4, 8.7 Hz), 8.15 (1H, d, J = 8.7 Hz), 5.44 (2H, s), 3.90 (2H, s), 3.80 (1H, m), 1.86 (2H, m), 1.75 (2H, m), 1.61 (1H, m), 1.58 (6H, s), 1.35 (2H, m), 1.30 (2H, m), 1.15 (1H, m)
- 50 Сполука номер 490 (MP: 194-196). ЯМР розчинник: DMSO
 13C: 164.6, 144.4, 144.2, 143, 135.2, 128, 118.9, 118.4, 81.7, 78.7, 61.8, 48.7, 32.4, 25.3, 25, 22.2
 1H: 8.52 (1H, s), 8.50 (1H, m), 8.07 (1H, d, J = 8.0 Hz), 7.97 (1H, d d, J = 1.4, 9.0 Hz), 5.31 (2H, s), 3.92 (2H, s), 3.79 (1H, m), 1.85 (2H, m), 1.75 (2H, m), 1.62 (1H, m), 1.58 (6H, s), 1.34 (2H, m), 1.31 (2H, m), 1.15 (1H, m)
- 55 Сполука номер 491 (MP: 254-256). ЯМР розчинник: DMSO
 13C: 167, 149.5, 144.5, 134.1, 131.6, 128.8, 119, 113.1, 58.4, 56.8, 32.3, 30.1, 28.9, 25.1, 24.8
 1H: 8.71 (1H, s), 8.24 (1H, s), 8.18 (1H, d, J = 8.8 Hz), 7.93 (1H, d, J = 8.8 Hz), 7.60 (1H, s), 4.0 (1H, m br), 3.06 (3H, s), 1.97-1.00 (10H, m)
- 60

Сполука номер 492 (MP: 223-224). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 150, 144.7, 132.6, 131.4, 129.9, 129.5, 129.5, 128.8, 125.5, 119.6, 113.5, 58.7, 52.8, 50.3, 32.5, 25.4

¹H: 11.21 (1H, s br), 8.19 (1H, m, J = 8.3 Hz), 7.91 (1H, m d, J = 8.3 Hz), 7.70 (1H, m, J = 1.0, 7.0 Hz), 7.63 (2H, m), 7.54 (1H, m, J = 1.0, 7.0 Hz), 7.45 (3H, m), 4.39 (1H, m br), 4.26 (2H, m br), 3.40 (2H, m), 3.06 (3H, s), 3.05 (2H, m br), 2.47 (2H, m), 2.05 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

Сполука номер 493 (MP: 140). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 150.8, 150.2, 140.4, 139.6, 137.3, 119.4, 115.7, 57.7, 31.4, 30, 25.4, 25.2

¹H: 8.62 (2H, m), 7.93 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.68 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.67 (2H, m), 3.94 (1H, m), 3.0 (3H, s), 1.86 (4H, m), 1.71 (1H, d br, J = 13.0 Hz), 1.59 (2H, d q, J = 3.4, 12.3 Hz), 1.38 (2H, m q, J = 13.0 Hz), 1.13 (1H, t q, J = 3.4, 13.0 Hz)

Сполука номер 494 (MP: 193-194). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 154.4, 151.2, 139.9, 137.2, 134.5, 133.7, 126, 121, 120.3, 113.4, 67, 54.5, 31.9, 29.5

¹H: 10.61 (1H, s), 8.51 (1H, d, J = 2.2 Hz), 8.02 (1H, d d, J = 2.2, 8.7 Hz), 7.93 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.52 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.21 (1H, d, J = 8.7 Hz), 4.29 (1H, m), 4.10 (2H, d d, J = 4.5, 11.5 Hz), 3.51 (2H, d t, J = 1.8, 12.0 Hz), 3.05 (3H, s), 1.95 (2H, d q, J = 4.6, 12.4 Hz), 1.78 (2H, d br, J = 12.5 Hz)

Сполука номер 495 (MP: 185-187). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 151.1 (d, J = 241.0 Hz), 149.2, 145.5 (d, J = 12.2 Hz), 137.2, 135.3, 122.0 (d, J = 3.0 Hz), 120.5, 118.2 (d, J = 3.5 Hz), 114.8, 113.4 (d, J = 20.5 Hz), 66.2, 54.5, 31.7, 28.9

¹H: 10.36 (1H, s br), 9.08 (1H, s), 8.23 (1H, s), 7.74 (1H, d d, J = 2.0, 12.4 Hz), 7.56 (1H, d d, J = 1.5, 8.3 Hz), 7.07 (1H, t, J = 8.7 Hz), 4.11 (1H, m), 3.94 (2H, d d, J = 4.0, 11.5 Hz), 3.39 (2H, t, J = 11.5 Hz), 2.97 (3H, s), 1.86 (2H, d q, J = 4.2, 12.2 Hz), 1.70 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

Сполука номер 496 (MP: 116-118). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 166.2, 145.6, 145.1, 137.8, 134.4, 132.2, 128.9, 128.4, 128, 127.8, 118.8, 114.8, 82.5, 79.5, 62.4, 44.5, 23

¹H: 8.52 (1H, s), 8.28 (1H, d, J = 8.8 Hz), 8.09 (1H, d d, J = 1.5, 8.7 Hz), 7.40-7.30 (5H, m), 6.56 (1H, t, J = 5.3 Hz), 5.54 (2H, s), 4.72 (2H, d, J = 5.3 Hz), 3.91 (2H, s), 1.69 (6H, s)

Сполука номер 497 (MP: 173 (dec.)). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 150.6, 139.3, 138.2, 137.5, 131.5, 121.8, 115.4, 57.7, 31.4, 29.9, 25.4, 25.1

¹H: 8.22 (2H, d, J = 7.0 Hz), 7.90 (1H, s), 7.68 (2H, d, J = 7.0 Hz), 7.61 (1H, s), 3.93 (1H, m), 3.0 (3H, s), 1.86 (4H, m), 1.71 (1H, d, J = 13.0 Hz), 1.59 (2H, d q, J = 2.8, 12.2 Hz), 1.38 (2H, q, J = 13.0 Hz), 1.13 (1H, q, J = 13.0 Hz)

Сполука номер 498 (MP: 109-110). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 159.6, 151.1, 141.7, 136.5, 133.9, 129.4, 117.2, 113.3, 113, 109.8, 60, 55.4, 54.9, 52.3, 31.2, 28.4, 19.8, 11.6

¹H: 7.92 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.49 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.39 (1H, d d, J = 1.4, 2.6 Hz), 7.35 (1H, d t, J = 1.4, 7.7 Hz), 7.31 (1H, t, J = 7.7 Hz), 6.85 (1H, d d d, J = 1.4, 2.6, 8.0 Hz), 4.02 (1H, m), 3.87 (3H, s), 3.06 (2H, d br, J = 11.7 Hz), 3.02 (3H, s), 2.32 (2H, m), 2.06 (2H, t br, J = 11.5 Hz), 1.95 (2H, d q, J = 3.4, 12.2 Hz), 1.80 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 1.52 (2H, m), 0.91 (3H, t, J = 7.4 Hz)

Сполука номер 499 (MP: 170-171). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 171.2, 160.9, 149, 137.2, 135.4, 130.8, 125.9, 119.6, 118, 115.2, 114.7, 57.2, 31.6, 28.8, 25, 24.8

¹H: 12.99 (1H, s br), 9.11 (1H, s), 8.42 (1H, s), 8.40 (1H, d, J = 2.2 Hz), 8.19 (1H, s), 8.06 (1H, s), 7.87 (1H, d d, J = 2.0, 8.6 Hz), 7.02 (1H, d, J = 8.5 Hz), 3.86 (1H, m), 2.98 (3H, s), 1.79 (4H, m), 1.60 (3H, m), 1.33 (2H, q, J = 12.8 Hz), 1.12 (1H, q, J = 13.0 Hz)

Сполука номер 500 (MP: 191-193 (dec.)). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 151.0, 150.3 (d, J = 240.0 Hz), 144.9 (d, J = 12.5 Hz), 140.0, 137.6, 130.1, 116.2 (d, J = 18.0 Hz), 115.9 (d, J = 6.3 Hz), 114.2 (d, J = 1.5 Hz), 114.1, 66.3, 54.2, 31.6, 29.1

¹H: 9.89 (1H, s), 8.10 (1H, s), 7.90 (1H, s), 7.46 (1H, d, J = 8.5 Hz), 7.24 (1H, m), 7.13 (1H, m, J = 9.2 Hz), 4.08 (1H, m), 3.93 (2H, d br, J = 10.0 Hz), 3.36 (2H, m), 2.94 (3H, s), 1.84 (2H, d q, J = 12.0 Hz), 1.69 (2H, d br, J = 11.0 Hz)

Сполука номер 501 (MP: 138-140). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 158.5, 151, 140.6, 137.4, 126.1, 126, 114, 113.1, 55.1, 55.1, 44.9, 31.5, 28.7

¹H: 8.08 (1H, s), 7.87 (1H, s), 7.77 (2H, d, J = 8.3 Hz), 6.96 (2H, d, J = 8.3 Hz), 3.95 (1H, m), 3.77 (3H, s), 3.07 (2H, d, J = 12.0 Hz), 2.93 (3H, s), 2.56 (2H, m), 1.73 (4H, m)

Сполука номер 502 (MP: 120-121). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 159.9, 151.5, 142.1, 136.9, 134.3, 129.7, 117.5, 113.7, 113.4, 110.2, 55.7, 55.3, 52.2, 52.1, 31.6, 28.8, 12.1

¹H: 7.92 (1H, s), 7.49 (1H, s), 7.39 (1H, t br), 7.36 (1H, d, J = 7.6 Hz), 7.30 (1H, t, J = 7.9 Hz), 6.85 (1H, d br, J = 8.1 Hz), 4.03 (1H, m), 3.87 (3H, s), 3.08 (2H, d br, J = 11.0 Hz), 3.02 (3H, s), 2.45

(2H, q, J = 7.3 Hz), 2.05 (2H, t br, J = 11.4 Hz), 1.96 (2H, d q, J = 2.5, 11.8 Hz), 1.85 (2H, d br, J = 11.0 Hz), 1.11 (3H, t, J = 7.3 Hz)

Сполука номер 503 (MP: 158-159). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 152.5 (d, J = 245.0 Hz), 151.4, 147.1 (d, J = 11.0 Hz), 141.1 (d, J = 2.5 Hz), 136.9, 126.4 (d, J = 7.0 Hz), 120.9 (d, J = 3.6 Hz), 113.5 (d, J = 2.5 Hz), 113.0 (d, J = 20.0 Hz), 112.6, 56.3, 55.7, 52.2, 52.1, 31.6, 28.7, 12.1

1H: 7.88 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.50 (2H, m), 7.40 (1H, d, J = 1.3 Hz), 6.99 (1H, t, J = 8.3 Hz), 4.03 (1H, m), 3.91 (3H, s), 3.09 (2H, d br, J = 11.5 Hz), 3.02 (3H, s), 2.45 (2H, q, J = 7.3 Hz), 2.06 (2H, t, J = 12.0 Hz), 1.96 (2H, d q, J = 3.5, 12.0 Hz), 1.83 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 1.11 (3H, t, J = 7.3 Hz)

Сполука номер 504 (MP: 183-184). ЯМР розчинник: DMSO

13C: 149.3, 137.5, 136.1, 129.1, 129, 128.7, 125.4, 115.8, 52.6, 42.3, 31.8, 24.6

1H: 9.33 (1H, q br, J = 10.0 Hz), 9.20 (1H, d br, J = 10.0 Hz), 9.13 (1H, s), 8.37 (1H, s), 7.94 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.48 (2H, t, J = 7.8 Hz), 7.39 (1H, t, J = 7.3 Hz), 4.23 (1H, m), 3.34 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 3.0 (2H, m), 2.98 (3H, s), 2.19 (2H, d q, J = 3.5, 12.8 Hz), 1.92 (2H, d br, J = 12.4 Hz)

Сполука номер 505 (MP: 143-144). ЯМР розчинник: DMSO

13C: 167.9, 163.8, 144.4, 143.5, 142.8, 135.5, 128, 119.7, 118, 81.6, 78.7, 63.9, 61.8, 47.7, 45.2, 26.8, 25.1, 24.8, 22.2

1H: 8.16 (1H, s br), 8.11 (1H, d, J = 9.0 Hz), 7.59 (1H, d d, J = 1.2, 8.9 Hz), 5.29 (2H, s), 3.92 (2H, m), 3.84 (2H, br), 3.59 (2H, br), 3.08 (4H, br), 2.93 (1H, m), 1.96 (2H, d br, J = 10.8 Hz), 1.80 (2H, d, J = 12.4 Hz), 1.58 (1H, m), 1.57 (6H, s), 1.29 (4H, m), 1.09 (1H, m)

Сполука номер 506 (MP: 133-135). ЯМР розчинник: DMSO

13C: 168, 162.4, 147.4, 147, 144.4, 143.4, 142.8, 135.9, 128.5, 127.9, 123.3, 119.7, 117.7, 109.8, 108.1, 101.1, 81.6, 78.7, 61.8, 60.6, 51.6, 46.1, 40.7, 22.2

1H: 8.10 (1H, d, J = 9.3 Hz), 8.09 (1H, s), 7.54 (1H, d, J = 9.3 Hz), 6.94 (1H, s), 6.90 (1H, d, J = 8.0 Hz), 6.83 (1H, d, J = 8.0 Hz), 6.01 (2H, s), 5.29 (2H, s), 3.92 (2H, s), 3.75 (2H, m), 3.72 (2H, s), 3.47 (2H, m), 2.69 (4H, m), 1.57 (6H, s)

Сполука номер 507 (MP: 213-214). ЯМР розчинник: DMSO

13C: 156.3, 150.9, 150.7, 140.2, 137.5, 126.5, 126.3, 125.7, 122.9, 113.3, 111.9, 56.7, 55.7, 31.3, 29, 25.2, 24.8

1H: 9.38 (1H, s), 8.07 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.91 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.84 (1H, d, J = 2.2 Hz), 7.82 (1H, d d, J = 2.2, 8.6 Hz), 7.08 (1H, d, J = 8.6 Hz), 5.63 (2H, s), 3.81 (1H, m), 3.81 (3H, s), 2.92 (3H, s), 1.78 (4H, m), 1.58 (3H, m), 1.29 (2H, q, J = 12.7 Hz), 1.11 (1H, q, J = 13.0 Hz)

Сполука номер 508 (MP: 172-173). ЯМР розчинник: DMSO

13C: 150.7, 147.4, 145.5, 138.1, 137.5, 132.5, 129.4, 124.1, 115.7, 67.9, 56.3, 34.2, 31.4, 26.8

1H: 9.08 (1H, s), 8.49 (1H, d, J = 4.8 Hz), 8.24 (1H, t d, J = 1.7, 8.0 Hz), 8.19 (1H, s), 8.18 (1H, s), 7.47 (1H, d d, J = 5.0, 8.0 Hz), 4.62 (1H, br), 3.79 (1H, m), 3.38 (1H, m), 2.92 (3H, s), 1.89 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 1.80-1.60 (4H, m), 1.23 (2H, q, J = 11.3 Hz)

Сполука номер 509 (MP: 137-139 (dec.)). ЯМР розчинник: DMSO

13C: 150.7, 148.4, 138.5, 138.2, 135.2, 131, 130.3, 121.6, 118.9, 116.3, 55.6, 51.9, 51.4, 31.5, 28.1, 12.2

1H: 8.66 (1H, t, J = 1.8 Hz), 8.31 (1H, s), 8.29 (1H, d t, J = 1.8, 8.0 Hz), 8.20 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.10 (1H, d br, J = 8.0 Hz), 7.69 (1H, t, J = 8.0 Hz), 3.83 (1H, m), 2.96 (2H, m), 2.95 (3H, s), 2.32 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.93 (2H, t br, J = 10.5 Hz), 1.82 (2H, d q, J = 3.0, 12.0 Hz), 1.73 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 0.99 (3H, t, J = 10.5 Hz)

Сполука номер 510 (MP: 133-134). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 151.5, 149.1, 148.6, 142.1, 136.7, 126, 117.4, 112.3, 111.2, 108.4, 55.9, 55.9, 55.6, 52.2, 52.1, 31.6, 28.7, 12.1

1H: 7.89 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.42 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.39 (1H, d, J = 2.0 Hz), 7.30 (1H, d d, J = 2.0, 8.4 Hz), 6.90 (1H, d, J = 8.4 Hz), 4.04 (1H, m), 3.96 (3H, s), 3.91 (3H, s), 3.08 (2H, d br, J = 11.5 Hz), 3.02 (3H, s), 2.44 (2H, q, J = 7.4 Hz), 2.05 (2H, t br, J = 11.5 Hz), 1.96 (2H, d q, J = 3.0, 11.8 Hz), 1.82 (2H, d br, J = 11.8 Hz), 1.10 (3H, t, J = 7.4 Hz)

Сполука номер 511 (MP: 142-144). ЯМР розчинник: DMSO

13C: 151.6, 146.7, 142.3, 136.8, 133.9, 129.6, 115.5, 114.4, 113.1, 111.9, 55.7, 52.2, 52.1, 31.6, 28.7, 12.1

1H: 7.90 (1H, s), 7.45 (1H, s), 7.20 (1H, s), 7.16 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.13 (1H, d, J = 7.8 Hz), 6.63 (1H, d, J = 7.0 Hz), 4.03 (1H, m), 3.73 (2H, s br), 3.08 (2H, d br, J = 11.0 Hz), 3.01 (3H, s), 2.45 (2H, t, J = 7.1 Hz), 2.05 (2H, t br, J = 11.5 Hz), 1.96 (2H, q, J = 12.0 Hz), 1.82 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 1.11 (3H, t, J = 7.1 Hz)

Сполука номер 512 (MP: 153-154). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 151.5, 149.1, 148.6, 142.1, 136.7, 126.1, 117.4, 112.3, 111.3, 108.4, 60.4, 55.9, 55.9, 55.8, 52.6, 31.6, 28.9, 20.3, 11.9

1H: 7.89 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.42 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.40 (1H, d, J = 2.0 Hz), 7.30 (1H, d d, J = 2.0, 8.3 Hz), 6.90 (1H, d, J = 8.3 Hz), 4.02 (1H, m), 3.96 (3H, s), 3.91 (3H, s), 3.04 (2H, d, J = 11.0 Hz), 3.02 (3H, s), 2.31 (2H, m), 2.05 (2H, d t, J = 1.8, 11.8 Hz), 1.93 (2H, d q, J = 3.7, 12.0 Hz), 1.80 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 1.51 (2H, m), 0.9 (3H, t, J = 7.3 Hz)

Сполука номер 513 (MP: 215-216 (dec.)). ЯМР розчинник: DMSO

13C: 172.1, 160.3, 151, 140.2, 137.5, 130.5, 124.4, 124.2, 117.7, 114.4, 113.3, 66.3, 54.2, 31.7, 29.1

10 1H: 13.02 (1H, s), 8.48 (1H, s), 8.32 (1H, d, J = 2.0 Hz), 8.14 (1H, s), 7.96 (1H, s), 7.89 (1H, d d, J = 2.2, 8.5 Hz), 7.86 (1H, s), 6.92 (1H, d, J = 8.5 Hz), 4.11 (1H, m), 3.94 (2H, d d, J = 3.5, 11.0 Hz), 3.38 (2H, m), 2.96 (3H, s), 1.96 (2H, d q, J = 4.6, 12.4 Hz), 1.70 (2H, d br, J = 12.3 Hz)

Сполука номер 514 (MP: 185-186). ЯМР розчинник: CDCl₃

15 13C: 152.5 (d, J = 245.0 Hz), 151.4, 147.0 (d, J = 11.0 Hz), 141.1 (d, J = 2.6 Hz), 136.9, 126.4 (d, J = 7.3 Hz), 120.9 (d, J = 3.5 Hz), 113.4 (d, J = 2.0 Hz), 113.0 (d, J = 20.0 Hz), 112.6, 60.4, 56.2, 55.8, 52.6, 31.6, 28.9, 20.3, 11.9

20 1H: 7.88 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.50 (2H, m), 7.40 (1H, d, J = 1.3 Hz), 6.99 (1H, t, J = 8.4 Hz), 4.0 (1H, m), 3.91 (3H, s), 3.04 (2H, d br, J = 11.7 Hz), 3.01 (3H, s), 2.31 (2H, m), 2.05 (2H, d t, J = 2.0, 12.0 Hz), 1.93 (2H, d q, J = 3.5, 12.0 Hz), 1.80 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 1.51 (2H, m), 0.9 (3H, t, J = 7.5 Hz)

Сполука номер 515 (MP: 171-172). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 154.5, 151.2, 148.6, 146.7, 139.4, 137.4, 132.5, 128.9, 123.6, 113.9, 80, 55.7, 42.9, 31.9, 28.7, 28.4

25 1H: 9.01 (1H, d, J = 2.2 Hz), 8.54 (1H, d d, J = 1.7, 4.8 Hz), 8.12 (1H, d d d, J = 1.7, 2.2, 8.0 Hz), 7.96 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.59 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.35 (1H, d d d, J = 0.9, 4.8, 8.0 Hz), 4.28 (2H, br), 4.20 (1H, m), 3.02 (3H, s), 2.81 (2H, br), 1.88-1.69 (4H, m), 1.48 (9H, s)

Сполука номер 516 (MP: hygroscopic). ЯМР розчинник: DMSO

13C: 150.1, 138.7, 137.4, 135.1, 134.4, 133, 127.6, 127.4, 118.1, 67.9, 56.4, 34.2, 31.5, 26.8

30 1H: 9.0 (1H, t, J = 1.5 Hz), 8.47 (1H, m d, J = 6.3 Hz), 8.42 (1H, s), 8.40 (1H, s), 8.19 (1H, m d, J = 8.1 Hz), 7.74 (1H, d d, J = 6.3, 8.1 Hz), 3.79 (1H, m br), 3.40 (1H, m), 2.91 (3H, s), 1.88 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 1.70 (4H, m), 1.23 (2H, q br, J = 12.0 Hz)

Сполука номер 517 (MP: 130-132). ЯМР розчинник: DMSO

35 13C: 168, 162.4, 145.4, 144.2, 135.1, 133, 132.7, 129.7, 128.8, 128.5, 128, 118.4, 114.5, 81.7, 78.7, 61.6, 61, 51.8, 46.3, 40.8, 22.5

1H: 8.21 (1H, s), 8.16 (1H, d, J = 8.5 Hz), 7.71 (1H, d d, J = 1.5, 8.5 Hz), 7.40-7.25 (5H, m), 5.42 (2H, s), 3.91 (2H, s), 3.65 (2H, s br), 3.43 (4H, m), 2.55 (4H, m), 1.60 (6H, s)

Сполука номер 518 (MP: 122). ЯМР розчинник: CDCl₃

40 13C: 152.2, 151.2, 149.3, 142.3, 137.5, 136.8, 122.2, 119.7, 115.9, 57.4, 31.4, 29.8, 25.4, 25.2

1H: 8.56 (1H, d d d, J = 1.0, 1.8, 4.8 Hz), 8.0 (1H, t d, J = 1.1, 8.0 Hz), 7.97 (1H, d, J = 1.5 Hz), 7.88 (1H, d, J = 1.5 Hz), 7.75 (1H, d t, J = 1.9, 7.7 Hz), 7.19 (1H, d d d, J = 1.2, 4.8, 7.6 Hz), 3.98 (1H, m), 3.0 (3H, s), 1.88 (2H, m), 1.85 (2H, m), 1.69 (1H, d, J = 13.0 Hz), 1.56 (2H, d q, J = 3.7, 12.2 Hz), 1.38 (2H, t q, J = 3.0, 13.0 Hz), 1.12 (1H, t q, J = 3.5, 13.0 Hz)

Сполука номер 519 (MP: 158-159). ЯМР розчинник: CDCl₃

45 13C: 150.8, 137.6, 137.6, 136.9, 136, 132.7, 125.9, 122.8, 115.3, 60.4, 56, 52.6, 31.7, 28.8, 20.2, 11.9

1H: 8.66 (1H, t, J = 1.6 Hz), 8.13 (1H, d d d, J = 1.0, 1.7, 6.4 Hz), 7.93 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.71 (1H, t d, J = 1.2, 7.9 Hz), 7.59 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.31 (1H, d d, J = 6.4, 7.9 Hz), 3.98 (1H, m), 3.04 (2H, m d, J = 12.0 Hz), 3.01 (3H, s), 2.30 (2H, m), 2.04 (2H, d t, J = 2.0, 12.0 Hz), 1.93 (2H, d q, J = 3.5, 12.0 Hz), 1.80 (2H, d br, J = 11.5 Hz), 1.50 (2H, m), 0.9 (3H, t, J = 7.4 Hz)

50 Сполука номер 520 (MP: 170). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 159.2, 151.6, 142.1, 136.8, 126.4, 125.7, 114.1, 112, 60.4, 55.8, 55.3, 52.6, 31.5, 28.9, 20.2, 11.9

55 1H: 7.90 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.72 (2H, m d, J = 8.9 Hz), 7.40 (1H, d, J = 1.3 Hz), 6.94 (2H, m d, J = 8.9 Hz), 4.01 (1H, m), 3.84 (3H, s), 3.04 (2H, m), 3.01 (3H, s), 2.30 (2H, m), 2.04 (2H, d t, J = 2.0, 12.0 Hz), 1.94 (2H, d q, J = 3.7, 12.0 Hz), 1.80 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 1.50 (2H, m), 0.9 (3H, t, J = 7.4 Hz)

Сполука номер 521 (MP: 163-164). ЯМР розчинник: CDCl₃

60 13C: 159.1, 151.6, 142.1, 136.8, 126.4, 125.7, 114.1, 112, 55.7, 55.3, 52.2, 52.1, 31.5, 28.8, 12.2

1H: 7.89 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.72 (2H, m d, J = 8.9 Hz), 7.39 (1H, d, J = 1.3 Hz), 6.94 (2H, m d, J = 8.9 Hz), 4.02 (1H, m), 3.84 (3H, s), 3.07 (2H, m d, J = 11.7 Hz), 3.01 (3H, s), 2.43 (2H, q, J = 7.3

Hz), 2.03 (2H, d t, J = 2.0, 12.0 Hz), 1.93 (2H, d q, J = 3.5, 12.0 Hz), 1.82 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 1.09 (3H, t, J = 7.2 Hz)

Сполука номер 522 (MP: 127). ЯМР розчинник: DMSO

13C: 150.7, 148.4, 138.5, 138.2, 135.2, 131, 130.3, 121.6, 118.9, 116.4, 59.6, 55.6, 52.4, 31.6, 28.2, 19.8, 11.9

1H: 8.66 (1H, t, J = 1.8 Hz), 8.32 (1H, s), 8.30 (1H, d br, J = 7.9 Hz), 8.20 (1H, s), 8.11 (1H, d d, J = 2.2, 8.1 Hz), 7.69 (1H, t, J = 8.1 Hz), 3.82 (1H, m), 2.95 (3H, s), 2.93 (2H, m), 2.21 (2H, t br, J = 7.5 Hz), 1.91 (2H, t br, J = 11.2 Hz), 1.81 (2H, d q, J = 3.0, 11.7 Hz), 1.72 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 1.41 (2H, m), 0.84 (3H, t, J = 7.5 Hz)

10 Сполука номер 523 (MP: 163-164 (dec.)). ЯМР розчинник: DMSO

13C: 151, 150.4 (d, J = 240.5 Hz), 144.9 (d, J = 12.5 Hz), 140, 138.5, 137.6, 130.2 (d, J = 3.2 Hz), 128.9, 128.3, 127, 116.3 (d, J = 19.0 Hz), 115.9 (d, J = 6.5 Hz), 114.2 (d, J = 2.5 Hz), 114.1, 61.8, 55.4, 52.2, 31.5, 28.2

1H: 9.20 (1H, s), 8.08 (1H, s), 7.89 (1H, s), 7.45 (1H, d d, J = 1.7, 8.7 Hz), 7.39-7.19 (6H, m), 7.13 (1H, d d, J = 8.7, 11.2 Hz), 3.82 (1H, m br), 3.47 (2H, s), 2.93 (3H, s), 2.90 (2H, m br), 2.0 (2H, m br), 1.83 (2H, m br), 1.72 (2H, m br)

Сполука номер 524 (MP: 124-125). ЯМР розчинник: DMSO

13C: 151.1, 148.8, 141.4, 137.3, 133.8, 129.1, 113.7, 113, 112.8, 110.4, 59.6, 55.6, 52.4, 31.4, 28.2, 19.8, 11.9

20 1H: 8.06 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.79 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.08 (1H, t, J = 2.0 Hz), 7.0 (1H, t, J = 7.6 Hz), 6.95 (1H, t d, J = 1.2, 7.5 Hz), 6.45 (1H, d d d, J = 1.4, 2.4, 7.8 Hz), 5.08 (2H, s), 3.79 (1H, m), 2.95 (2H, m), 2.92 (3H, s), 2.23 (2H, t, br, J = 7.5 Hz), 1.92 (2H, t br, J = 11.0 Hz), 1.81 (2H, d q, J = 3.0, 11.7 Hz), 1.71 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 1.42 (2H, m), 0.84 (3H, t, J = 7.3 Hz)

Сполука номер 525 (MP: 167-168). ЯМР розчинник: CDCl₃

25 13C: 151.2, 148.6, 146.7, 139.3, 137.3, 132.4, 128.9, 123.6, 113.9, 55.9, 52.2, 52.1, 31.6, 28.8, 12.2

30 1H: 9.0 (1H, d d, J = 1.0, 2.3 Hz), 8.52 (1H, d d, J = 1.7, 4.9 Hz), 8.11 (1H, d d d, J = 1.7, 2.2, 7.9 Hz), 7.94 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.58 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.34 (1H, d d d, J = 1.0, 4.9, 8.0 Hz), 4.03 (1H, m), 3.07 (2H, m d, J = 11.5 Hz), 3.03 (3H, s), 2.43 (2H, q, J = 7.3 Hz), 2.03 (2H, d t, J = 2.0, 11.7 Hz), 1.94 (2H, d q, J = 3.5, 12.0 Hz), 1.83 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 1.09 (3H, t, J = 7.3 Hz)

Сполука номер 526 (MP: 117). ЯМР розчинник: DMSO

13C: 167.9, 151, 140.5, 140.2, 140, 137.7, 135, 134.1, 129.6, 129.4, 129, 126.8, 125.8, 125.7, 124.2, 123.1, 115, 59.3, 55.2, 52.2, 31.6, 27.9, 19.5, 11.8

35 1H: 8.21 (1H, t, J = 1.7 Hz), 8.19 (1H, t, J = 1.7 Hz), 8.16 (3H, m), 7.88 (3H, m), 7.63 (1H, d d d, J = 1.2, 2.0, 7.8 Hz), 7.57 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.52 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.49 (1H, s br), 3.87 (1H, m br), 3.0 (2H, m br), 2.96 (3H, s), 2.31 (2H, m br), 2.05 (2H, m br), 1.86 (2H, q br, J = 12.0 Hz), 1.46 (2H, d br, J = 10.5 Hz), 1.45 (2H, m), 0.85 (3H, t, J = 7.4 Hz)

Сполука номер 527 (MP: 85-87). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 154.4, 150.3, 148.9, 132.3, 129, 126.2, 123, 58.8, 56.6, 31.1, 30.6, 29.4, 25.4, 25.3

40 1H: 7.90 (2H, m d, J = 8.4 Hz), 7.56 (1H, m t, J = 7.3 Hz), 7.49 (2H, m t, J = 7.8 Hz), 4.13, 3.70 (1H, 2 s br), 3.0 (3H, s), 1.87 (4H, m), 1.68 (1H, d, J = 12.0 Hz), 1.52 (2H, q, J = 12.0 Hz), 1.40 (2H, s br), 1.12 (1H, t q, J = , 3.2, 13.0 Hz)

Сполука номер 528 (MP: 138-140). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 153.3, 149.8, 144.2, 132.5, 129.1, 126.2, 122.7, 81, 79.8, 61.8, 22.8

45 1H: 7.87 (2H, m d, J = 8.7 Hz), 7.57 (1H, m t, J = 7.3 Hz), 7.50 (2H, m t, J = 7.2 Hz), 5.23 (2H, s), 3.83 (2H, s), 1.59 (6H, s)

Сполука номер 529 (MP: 154-155). ЯМР розчинник: CDCl₃

13C: 151.2, 148.6, 146.7, 139.3, 137.3, 132.4, 128.9, 123.6, 113.9, 60.4, 55.9, 52.6, 31.6, 28.9, 20.3, 11.9

50 1H: 9.0 (1H, d, J = 2.0 Hz), 8.52 (1H, d d, J = 1.6, 4.8 Hz), 8.11 (1H, t d, J = 2.0, 8.1 Hz), 7.94 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.57 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.33 (1H, d d, J = 4.8, 8.1 Hz), 4.01 (1H, m), 3.05 (2H, m), 3.02 (3H, s), 2.30 (2H, m), 2.04 (2H, t br, J = 11.5 Hz), 1.93 (2H, d q, J = 3.1, 12.0 Hz), 1.81 (2H, d br, J = 11.2 Hz), 1.50 (2H, m), 0.9 (3H, t, J = 7.4 Hz)

Сполука номер 530 (MP: 185-186 (dec.)). ЯМР розчинник: DMSO

13C: 151, 143.1, 140, 137.5, 132.9, 125.7, 124.2, 122.8, 121.8, 57.4, 31.4, 29.9, 25.4, 25.2

55 1H: 8.87 (1H, d, J = 1.3 Hz), 3.37 (1H, d d, J = 2.0, 8.3 Hz), 8.31 (1H, d, J = 6.0 Hz), 8.06 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.37 (1H, d t, J = 1.2, 8.4 Hz), 7.17 (1H, d t, J = 2.2, 7.1 Hz), 4.0 (1H, m), 3.0 (3H, s), 1.87 (4H, m), 1.69 (1H, d, J = 13.0 Hz), 1.57 (2H, d q, J = 3.5, 13.0 Hz), 1.39 (2H, m q, J = 13.0 Hz), 1.12 (1H, m q, J = 13.0 Hz)

60 Сполука номер 531 (MP: slow dec. >160). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 150.4, 140.2, 139.9, 139, 137.9, 134.8, 132.6, 127.4, 118.6, 52.4, 42.4, 31.8, 24.7

¹H: 9.33 (1H, s), 9.25 (1H, q, J = 10.0 Hz), 9.10 (1H, d, J = 10.0 Hz), 8.94 (1H, d, J = 8.2 Hz), 8.80 (1H, d, J = 5.3 Hz), 8.55 (1H, s), 8.38 (1H, s), 8.08 (1H, d d, J = 5.3, 8.2 Hz), 4.22 (1H, m), 3.34 (2H, d, J = 12.0 Hz), 3.01 (2H, q, J = 13.0 Hz), 2.96 (3H, s), 2.17 (2H, q, J = 13.2 Hz), 1.92 (2H, d, J = 12.0 Hz)

5

Сполука номер 532 (MP: 245-246 (dec.)). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 158.5, 151.2, 140.6, 137.5, 126.1, 126, 114, 113.1, 55.1, 54.5, 44.9, 34.3, 31.6, 27.7

¹H: 8.10 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.88 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.77 (2H, m d, J = 8.9 Hz), 6.96 (2H, m d, J = 8.9 Hz), 3.98 (1H, m), 3.77 (3H, s), 3.66 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 2.95 (3H, s), 2.88 (3H, s), 2.84 (2H, m), 1.87 (4H, m)

10

Сполука номер 533 (MP: 259-260). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 150.9, 148.1, 146.2, 138.2, 137.8, 131.9, 129.1, 123.8, 115.5, 54.5, 44.9, 34.4, 31.7, 27.7

¹H: 9.07 (1H, s), 8.46 (1H, s), 8.19 (3H, m), 7.42 (1H, s br), 3.98 (1H, m br), 3.66 (2H, m d, J = 10.0 Hz), 2.96 (3H, s), 2.88 (3H, s), 2.85 (2H, m br), 1.88 (4H, m br)

15

Сполука номер 534 (MP: 162). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 151.5 (d, J = 243.0 Hz), 149.4, 147.3 (d, J = 10.6 Hz), 137.4, 135.4, 122.4 (m), 121.9 (d, J = 2.8 Hz), 115.2, 114.3 (d, J = 1.5 Hz), 113.0 (d, J = 20.2 Hz), 56.2, 52.5, 42.3, 31.7, 24.6

¹H: 8.91 (2H, m), 8.49 (1H, s), 8.11 (1H, s), 7.71 (1H, d d, J = 2.0, 12.7 Hz), 7.67 (1H, m d, J = 8.8 Hz), 7.23 (1H, t, J = 8.8 Hz), 4.21 (1H, m), 3.86 (3H, s), 3.36 (2H, d br, J = 12.5 Hz), 3.02 (2H, m br), 2.95 (3H, s), 2.11 (2H, d q, J = 4.0, 12.8 Hz), 1.92 (2H, d br, J = 12.8 Hz)

20

Сполука номер 535 (MP: 141-142). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 149.6, 144.4, 137.9, 135.2, 131.4, 129.1, 128.3, 127.2, 125.6, 118.1, 115.3, 109.1, 62.8, 57.6, 55.6, 52.5, 32.8, 29.8, 28.5

¹H: 8.49 (1H, d d, J = 1.0, 1.4 Hz), 8.12 (1H, d d, J = 1.0, 8.7 Hz), 7.82 (1H, d d, J = 1.4, 8.7 Hz), 7.43-7.20 (5H, m), 4.32-4.20 (1H, 2s br), 3.54 (2H, s), 3.21 (3H, s), 3.03 (2H, s br), 2.18 (2H, s br), 2.01 (2H, m br), 1.94 (2H, m br)

25

Сполука номер 536 (MP: 173-174). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 151.2 (d, J = 240.0 Hz), 151, 144 (d, J = 12.5 Hz), 139.9 (d, J = 2.4 Hz), 137.5, 125.4 (d, J = 7.0 Hz), 121 (d, J = 3.0 Hz), 117.9 (d, J = 3.5 Hz), 113.4, 112.5 (d, J = 19.4 Hz), 55.2, 51.7, 51.3, 31.5, 27.8, 12

30

¹H: 9.88 (1H, s), 8.08 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.89 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.59 (1H, d d, J = 2.0, 12.5 Hz), 7.48 (1H, d d d, J = 1.0, 2.0, 8.5 Hz), 6.95 (1H, d d, J = 8.5, 9.2 Hz), 3.85 (1H, m br), 3.02 (2H, m br), 2.93 (3H, s), 2.40 (2H, m br), 1.98 (2H, m br), 1.85 (2H, m br), 1.77 (2H, m br), 1.02 (3H, m br)

Сполука номер 537 (MP: 144-146). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 151.9 (d, J = 246.2 Hz), 151.4, 147.8 (d, J = 11.0 Hz), 141.5, 136.8, 129.6 (d, J = 3.8 Hz), 117.3 (d, J = 6.8 Hz), 116.1 (d, J = 19.0 Hz), 113.1, 110.3 (d, J = 1.5 Hz), 56.2, 55.8, 52.2, 52.1, 31.6, 28.8, 12.2

35

¹H: 7.90 (1H, s), 7.49 (1H, d d, J = 1.7, 8.5 Hz), 7.45 (1H, s), 7.24 (1H, m), 7.08 (1H, d d, J = 8.6, 11.1 Hz), 4.03 (1H, m), 3.96 (3H, s), 3.08 (2H, d br, J = 11.2 Hz), 3.02 (3H, s), 2.44 (2H, q, J = 7.4 Hz), 2.05 (2H, t br, J = 11.0 Hz), 1.95 (2H, d q, J = 2.6, 11.9 Hz), 1.83 (2H, d br, J = 10.5 Hz), 1.10 (3H, t, J = 7.4 Hz)

40

Сполука номер 538 (MP: 44-46). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 150.7, 145.2, 133.1, 129.3, 125.2, 119.8, 113.6, 40, 38

¹H: 8.11 (1H, d, J = 8.4 Hz), 8.0 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.60 (1H, m t, J = 7.6 Hz), 7.46 (1H, m t, J = 7.7 Hz), 3.34 (6H, 2 s br)

45

Сполука номер 539 (MP: 90-91). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 156.8, 149.9, 149.2, 126, 123.9, 123, 40, 38.3

¹H: 8.82 (1H, d d, J = 1.6, 4.4 Hz), 8.42 (1H, d d, J = 1.6, 8.5 Hz), 7.57 (1H, d d, J = 4.4, 8.5 Hz), 3.49, 3.31 (6H, 2s)

50

Сполука номер 540 (MP: 164). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 151.7 (d, J = 242.5 Hz), 151, 146.2 (d, J = 10.5 Hz), 139.5 (d, J = 2.5 Hz), 137.6, 126.7 (d, J = 7.3 Hz), 120.9 (d, J = 3.0 Hz), 114 (2 C), 112.2 (d, J = 9.4 Hz), 60, 58.8, 56, 55.5, 52.8, 31.5, 28.2

¹H: 8.09 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.96 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.66 (1H, d d, J = 2.0, 13.5 Hz), 7.63 (1H, m), 7.19 (1H, t, J = 8.7 Hz), 4.41 (1H, t, J = 5.3 Hz), 3.85 (3H, s), 3.80 (1H, m), 3.48 (2H, m), 2.95 (2H, d br, J = 11.5 Hz), 2.93 (3H, s), 2.38 (2H, t, J = 6.4 Hz), 2.01 (2H, t br, J = 11.5 Hz), 1.81 (2H, d q, J = 3.6, 12.1 Hz), 1.69 (2H, d br, 12.0 Hz)

55

Сполука номер 541 (MP: 220-221). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 152.5 (d, J = 245.0 Hz), 151.5, 147.1 (d, J = 10.0 Hz), 141.2 (d, J = 3.0 Hz), 136.9, 126.4 (d, J = 7.0 Hz), 120.9 (d, J = 3.5 Hz), 118.7, 113.5 (d, J = 2.0 Hz), 113.1 (d, J = 19.0 Hz), 112.6, 56.3, 55.3, 53, 52.2, 31.7, 28.7, 16.3

60

¹H: 7.90 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.50 (2H, m), 7.40 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.0 (1H, t, J = 8.5 Hz), 4.04 (1H, m), 3.93 (3H, s), 3.03 (3H, s), 3.02 (2H, m), 2.71 (2H, t, J = 7.0 Hz), 2.52 (2H, t, J = 7.0 Hz), 2.22 (2H, d t, J = 2.0, 11.5 Hz), 1.94 (2H, d q, J = 3.5, 12.2 Hz), 1.83 (2H, d br, J = 12.2 Hz)

Сполука номер 542 (MP: 175). ЯМР розчинник: CDCl₃

5 ¹³C: 151, 150.3, 140.2, 139.8, 137.3, 119.4, 115.6, 66.9, 54.5, 31.9, 29.5

¹H: 8.63 (2H, m d, J = 4.6 Hz), 7.95 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.69 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.67 (2H, m d, J = 4.6 Hz), 4.28 (1H, m), 4.09 (2H, d d, J = 4.7, 11.5 Hz), 3.50 (2H, d t, J = 2.1, 12.0 Hz), 3.04 (3H, s), 1.95 (2H, d q, J = 4.9, 12.5 Hz), 1.78 (2H, m d, J = 12.3 Hz)

Сполука номер 543 (MP: 173-174 (dec.)). ЯМР розчинник: CDCl₃

10 ¹³C: 150.8, 139.3, 138.5, 137.5, 131.3, 121.8, 115.3, 66.9, 54.6, 31.9, 29.5

¹H: 8.22 (2H, d, J = 6.8 Hz), 7.93 (1H, s), 7.68 (2H, d, J = 6.8 Hz), 7.62 (1H, s), 4.28 (1H, m), 4.10 (2H, d d, J = 4.0, 11.7 Hz), 3.51 (2H, t, J = 11.7 Hz), 3.04 (3H, s), 1.95 (2H, d q, J = 4.5, 12.2 Hz), 1.78 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

Сполука номер 544 (MP: 163-164). ЯМР розчинник: CDCl₃

15 ¹³C: 159.1, 158.2, 151.6, 149.4, 142.1, 136.8, 136.4, 126.4, 125.7, 123.2, 122.1, 114.1, 112, 64.3, 55.6, 55.3, 52.8, 31.6, 28.8

¹H: 8.59 (1H, m d, J = 4.9 Hz), 7.89 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.72 (2H, m d, J = 8.9 Hz), 7.66 (1H, d t, J = 1.8, 7.7 Hz), 7.39 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.36 (1H, d, J = 8.0 Hz), 7.18 (1H, d d d, J = 1.0, 4.9, 7.4 Hz), 6.94 (2H, m d, J = 8.9 Hz), 4.04 (1H, m), 3.84 (3H, s), 3.66 (2H, s), 3.02 (2H, m), 3.01 (3H, s), 2.20 (2H, d t, J = 1.8, 12.0 Hz), 1.97 (2H, d q, J = 3.8, 12.2 Hz), 1.78 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

Сполука номер 545 (MP: 127-128). ЯМР розчинник: CDCl₃

20 ¹³C: 151.9 (d, J = 246.5 Hz), 151.4, 147.8 (d, J = 11.0 Hz), 141.4, 136.8, 129.6 (d, J = 4.0 Hz), 117.3 (d, J = 7.0 Hz), 116.1 (d, J = 18.8 Hz), 113.1, 110.3 (d, J = 2.0 Hz), 60.4, 56.2, 55.8, 52.6, 31.6, 28.8, 20.2, 11.9

25 ¹H: 7.89 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.49 (1H, d d, J = 2.0, 8.2 Hz), 7.45 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.24 (1H, m), 7.09 (1H, d d, J = 8.3, 11.0 Hz), 4.02 (1H, m), 3.96 (3H, s), 3.05 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 3.02 (3H, s), 2.31 (2H, m), 2.05 (2H, d t, J = 2.0, 12.0 Hz), 1.94 (2H, d q, J = 3.5, 12.0 Hz), 1.80 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 1.51 (2H, m), 0.91 (3H, t, J = 7.5 Hz)

Сполука номер 546 (MP: 240-241). ЯМР розчинник: DMSO

30 ¹³C: 163.6, 161.9, 158.5, 151.3, 151.1, 151, 147.1, 140.6, 137.5, 133.9, 128.6, 126.1, 126, 125, 124.4, 114, 113.1, 55.1, 55, 45.9, 41.3, 31.8, 28.9, 28.1

¹H: 9.18 (1H, d, J = 2.0 Hz), 8.71 (1H, d d, J = 1.6, 4.9 Hz), 8.35 (1H, t d, J = 1.8, 7.9 Hz), 8.27 (1H, s), 8.11 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.90 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.77 (2H, m d, J = 8.8 Hz), 7.58 (1H, d d, J = 4.9, 7.9 Hz), 6.96 (2H, m d, J = 8.8 Hz), 4.64 (1H, d br, J = 12.0 Hz), 4.37 (1H, d br, J = 12.0 Hz), 4.22 (1H, m), 3.77 (3H, s), 3.25 (1H, m), 2.97 (3H, s), 2.92 (1H, m), 1.88 (4H, m)

Сполука номер 547 (MP: 204-205). ЯМР розчинник: CDCl₃

35 ¹³C: 168.8, 159.2, 151.6, 142.3, 136.9, 126.4, 125.6, 114.1, 111.9, 55.3 (2 sig.), 45.5, 40.7, 31.9, 29.1, 28.4, 21.4

40 ¹H: 7.91 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.72 (2H, m d, J = 8.8 Hz), 7.40 (1H, d, J = 1.3 Hz), 6.94 (2H, m d, J = 8.8 Hz), 4.82 (1H, m d, J = 13.5 Hz), 4.27 (1H, m), 3.95 (1H, m d, J = 14.0 Hz), 3.84 (3H, s), 3.18 (1H, d t, J = 2.5, 13.5 Hz), 3.0 (3H, s), 2.61 (1H, d t, J = 2.5, 13.0 Hz), 2.13 (3H, s), 1.93 (1H, m), 1.88 (1H, m), 1.74 (2H, m)

Сполука номер 548 (MP: 196-197). ЯМР розчинник: CDCl₃

45 ¹³C: 168.8, 151.2, 148.6, 146.7, 139.4, 137.4, 132.5, 128.8, 123.6, 113.8, 55.4, 45.4, 40.6, 32, 29.1, 28.3, 21.4

¹H: 9.0 (1H, d, J = 2.0 Hz), 8.53 (1H, d d, J = 1.6, 4.9 Hz), 8.11 (1H, d d d, J = 1.8, 2.2, 7.9 Hz), 7.96 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.59 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.34 (1H, d d d, J = 0.9, 4.9, 8.0 Hz), 4.83 (1H, m d, J = 13.5 Hz), 4.28 (1H, m), 3.96 (1H, m d, J = 14.0 Hz), 3.19 (1H, m t, J = 2.7, 13.5 Hz), 3.01 (3H, s), 2.61 (1H, d t, J = 2.8, 13.2 Hz), 2.13 (3H, s), 1.94 (1H, m), 1.89 (1H, m), 1.75 (2H, m)

Сполука номер 549 (MP: 206-207). ЯМР розчинник: CDCl₃

50 ¹³C: 159.2, 151.6, 142.3, 137.3, 136.8, 132.0 (q, J = 34.0 Hz), 130.7, 130.1, 129.7 (q, J = 3.8 Hz), 126.4, 125.5, 124.5 (q, J = 3.8 Hz), 123.1 (q, J = 273.0 Hz), 114.1, 111.9, 55.3, 54.2, 45.6, 31.9, 28.0

¹H: 8.03 (1H, t br), 7.97 (1H, d, J = 7.9 Hz), 7.90 (1H, d, J = 8.0 Hz), 7.87 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.73 (1H, t, J = 7.9 Hz), 7.70 (2H, m d, J = 8.9 Hz), 7.36 (1H, d, J = 1.3 Hz), 6.93 (2H, m d, J = 8.9 Hz), 4.01 (3H, m), 3.84 (3H, s), 3.02 (3H, s), 2.42 (2H, d t, J = 2.8, 11.8 Hz), 2.0 (2H, d q, J = 4.0, 12.3 Hz), 1.93 (2H, d br)

Сполука номер 550 (MP: 89-101 (dec.)). ЯМР розчинник: DMSO

55 ¹³C: 167.9, 151, 140.5, 140.1, 140, 138.5, 137.7, 135, 134.1, 129.6, 129.4, 129, 128.8, 128.2, 127, 126.7, 125.8, 125.6, 124.2, 123.1, 114.9, 61.9, 55.5, 52.2, 31.6, 28.2

¹H: 8.20 (1H, t, J = 1.6 Hz), 8.18 (1H, t, J = 1.7 Hz), 8.15 (2H, s), 8.14 (1H, s br), 7.88 (3H, m), 7.62 (1H, d d d, J = 1.2, 1.8, 7.8 Hz), 7.57 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.51 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.47 (1H, s br), 7.37-7.20 (5H, m), 3.85 (1H, m), 3.47 (2H, s), 2.96 (3H, s), 2.90 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 2.01 (2H, t br, J = 12.0 Hz), 1.84 (2H, d q, J = 3.5, 12.0 Hz), 1.73 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

5 Сполука номер 551 (MP: 258-260 (dec)). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 160.1, 157.3, 150.6, 139.4, 138.1, 137.1, 126.5, 125.3, 121.5, 116.2, 56.9, 31.4, 29, 25.2, 24.8

¹H: 12.94 (1H, s br), 8.19 (1H, s), 8.18 (1H, s), 8.04 (2H, m d, J = 8.4 Hz), 7.83 (2H, m d, J = 8.4 Hz), 3.82 (1H, m br), 2.93 (3H, s), 1.78 (4H, m), 1.58 (3H, m), 1.30 (2H, q, J = 13.0 Hz), 1.11 (1H, q, J = 13.0 Hz)

10

Сполука номер 552 (MP: 126 (dec.)). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 164.2, 150.9, 140, 137.8, 133.6, 133.3, 128.7, 127.3, 125.4, 123.3, 115, 59.6, 55.6, 52.4, 31.5, 28.2, 19.8, 11.9

¹H: 11.25 (1H, s br), 9.09 (1H, s br), 8.23 (1H, t, J = 1.7 Hz), 8.15 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.05 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.97 (1H, m d, J = 7.9 Hz), 7.62 (1H, m d, J = 7.8 Hz), 7.46 (1H, t, J = 7.7 Hz), 3.81 (1H, m), 2.94 (3H, s), 2.93 (2H, m), 2.22 (2H, m), 1.91 (2H, t br, J = 11.0 Hz), 1.81 (2H, d q, J = 3.2, 11.7 Hz), 1.72 (2H, d br, J = 11.7 Hz), 1.42 (2H, m), 0.84 (3H, t, J = 7.5 Hz)

15

Сполука номер 553 (MP: 271-272). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 156.2, 150.7, 139.7, 137.8, 135.7, 134.9, 130, 123.1, 122.8, 120.7, 115.2, 56.8, 31.4, 29, 25.2, 24.8

20

¹H: 10.12 (1H, s), 8.16 (1H, s), 8.10 (1H, s), 7.77 (1H, d, J = 8.0 Hz), 7.71 (1H, t br), 7.60 (4H, s br), 7.45 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.11 (1H, d d, J = 1.3, 7.9 Hz), 3.81 (1H, m br), 2.93 (3H, s), 1.78 (4H, m), 1.58 (3H, m), 1.29 (2H, q, J = 12.5 Hz), 1.11 (1H, q, J = 13.0 Hz)

Сполука номер 554 (MP: 187-188). ЯМР розчинник: DMSO

25

¹³C: 172.1, 160.3, 151, 140.2, 137.4, 130.5, 124.4, 124.2, 117.7, 114.4, 113.3, 59.5, 55.4, 52.3, 31.6, 28, 19.7, 11.9

¹H: 13.03 (1H, s), 8.50 (1H, s br), 8.32 (1H, d, J = 2.0 Hz), 8.12 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.97 (1H, s br), 7.88 (1H, d d, J = 2.0, 8.5 Hz), 7.86 (1H, d, J = 1.3 Hz), 6.91 (1H, d, J = 8.5 Hz), 3.84 (1H, m), 2.98 (2H, m), 2.95 (3H, s), 2.26 (2H, m), 1.97 (2H, br), 1.84 (2H, q, J = 12.5 Hz), 1.73 (2H, d, J = 11.5 Hz), 1.44 (2H, m), 0.84 (3H, t, J = 7.3 Hz)

30

Сполука номер 555 (MP: 219-222). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 158.4, 149, 137, 135.4, 127.2, 118.7, 115.9, 114.2, 52.7, 42.5, 32, 24.8

¹H: 9.89 (1H, br), 9.3 (1H, s), 8.7 (1H, d, J = 10.5 Hz), 8.42 (1H, q, J = 10.5 Hz), 8.24 (1H, s), 7.68 (2H, m d, J = 8.7 Hz), 6.88 (2H, m d, J = 8.7 Hz), 4.22 (1H, m), 3.40 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 3.06 (2H, q br, J = 11.5 Hz), 2.97 (3H, s), 2.09 (2H, d q, J = 3.5, 12.5 Hz), 1.96 (2H, d br, J = 12.5 Hz)

35

Сполука номер 556 (MP: 141). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 151.7, 142.4, 141.4, 140.3, 138.1, 136.8, 129.1, 128.8, 128.3, 127.1, 119.4, 115.4, 112.3, 111.9, 62.8, 55.8, 52.5, 43.5, 31.6, 28.9

¹H: 7.89 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.38 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.36-7.23 (5H, m), 7.21 (1H, d, J = 2.0 Hz), 7.15 (1H, d d, J = 2.0, 8.2 Hz), 7.03 (1H, d, J = 8.2 Hz), 4.01 (3H, m), 3.52 (2H, s), 3.0 (3H, s), 2.99 (2H, m), 2.69 (6H, s), 2.09 (2H, t br, J = 12.0 Hz), 1.92 (2H, d q, J = 3.5, 12.0 Hz), 1.77 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

40

Сполука номер 557 (MP: 183-184). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 170.5, 163.9, 159.3, 151.7, 142.4, 136.9, 126.5, 125.5, 114.1, 111.9, 55.3, 54.9, 43.4, 32.1, 28.3

45

¹H: 7.93 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.72 (2H, m d, J = 8.9 Hz), 7.41 (1H, d, J = 1.3 Hz), 6.95 (2H, m d, J = 8.9 Hz), 4.97 (2H, m d, J = 13.5 Hz), 4.38 (1H, m), 3.84 (3H, s), 3.05 (2H, d t, J = 2.7, 13.5 Hz), 3.02 (3H, s), 2.02 (2H, d br, J = 13.0 Hz), 1.82 (2H, d q, J = 4.5, 12.5 Hz)

Сполука номер 558 (MP: 179 (dec.)). ЯМР розчинник: DMSO

50

¹³C: 169.4, 150.9, 148.1, 146.2, 138.2, 137.8, 131.9, 129.1, 123.8, 115.5, 58.1, 54.1, 51.5, 31.5, 26.9

¹H: 9.07 (1H, s), 8.46 (1H, m), 8.18 (3H, m), 7.43 (1H, m), 3.95 (1H, m), 3.31 (2H, s), 3.18 (2H, m), 2.96 (3H, s), 2.58 (2H, m), 2.0 (2H, q br, J = 12.0 Hz), 1.81 (2H, d br, J = 11.0 Hz)

Сполука номер 559 (MP: 194-195). ЯМР розчинник: CDCl₃

55

¹³C: 159.1, 156.1, 151.2, 148.6, 146.7, 144, 139.3, 137.3, 132.4, 128.9, 123.6, 118.8, 113.9, 110.9, 55.4, 54.5, 52.2, 51.9, 31.7, 28.6

¹H: 9.0 (1H, d, J = 1.8 Hz), 8.52 (1H, d d, J = 1.5, 4.7 Hz), 8.10 (1H, t d, J = 1.8, 7.9 Hz), 7.93 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.57 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.33 (1H, d d, J = 4.9, 7.9 Hz), 7.14 (1H, d, J = 3.5 Hz), 6.35 (1H, d, J = 3.5 Hz), 4.0 (1H, m), 3.88 (3H, s), 3.64 (2H, s), 3.04 (2H, m), 3.02 (3H, s), 2.21 (2H, t br, J = 12.0 Hz), 1.96 (2H, d q, J = 3.6, 12.0 Hz), 1.81 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

60

Сполука номер 560 (MP: 165). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 152.1, 151.5, 149.3, 142.6, 137.6, 136.9, 122.4, 119.8, 115.8, 67, 54.4, 31.8, 29.5

¹H: 8.57 (1H, d d d, J = 1.0, 2.0, 4.8 Hz), 8.01 (1H, t d, J = 1.1, 8.1 Hz), 8.0 (1H, d, J = 1.5 Hz), 7.89 (1H, d, J = 1.5 Hz), 7.76 (1H, t d, J = 1.8, 7.7 Hz), 7.20 (1H, d d d, J = 1.1, 4.8, 7.4 Hz), 4.31 (1H, m), 4.09 (2H, d d, J = 4.7, 11.6 Hz), 3.51 (2H, d t, J = 2.1, 12.0 Hz), 3.05 (3H, s), 1.94 (2H, d q, J = 4.5, 12.0 Hz), 1.78 (2H, m d, J = 12.3 Hz)

Сполука номер 561 (MP: 201-202). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 151.1, 150.4 (d, J = 240.5 Hz), 144.9 (d, J = 12.5 Hz), 140, 137.7, 130.1 (d, J = 3.5 Hz), 116.3 (d, J = 18.5 Hz), 116.0 (d, J = 6.5 Hz), 114.3 (d, J = 2.5 Hz), 114.1, 52.1, 50.9, 50.2, 31.8, 25.3, 9.2

¹H: 9.90 (1H, s), 9.36 (1H, s br), 8.13 (1H, s), 7.92 (1H, s), 7.46 (1H, d d, J = 2.0, 8.7 Hz), 7.25 (1H, m), 7.14 (1H, d d, J = 8.5, 11.3 Hz), 4.19 (1H, m), 3.58 (2H, m d, J = 11.5 Hz), 3.10 (4H, m), 2.94 (3H, s), 2.18 (2H, m q, J = 12.5 Hz), 2.0 (2H, d br, J = 12.5 Hz), 1.24 (3H, t, J = 7.2 Hz)

Сполука номер 562 (MP: 190-192 (dec.)). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 151.3, 149.5, 137.2, 135.8, 126.5, 121.4, 121, 119.7, 116.7, 114.6, 58.7, 31.4, 28.2, 24.1
¹H: 11.26 (1H, s br), 10.14 (3H, br), 8.96 (1H, s), 8.10 (1H, s), 7.84 (1H, d, J = 2.2 Hz), 7.74 (1H, d, J = 2.2, 8.5 Hz), 7.19 (1H, d, J = 8.6 Hz), 4.36 (1H, m), 2.95 (3H, s), 1.88 (2H, m), 1.69 (4H, m), 1.53 (2H, m)

Сполука номер 563 (MP: 250-252). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 155.3, 150.8, 140.1, 138.9, 137.7, 134.8, 129.8, 122.9, 121.7, 120.5, 114.9, 56.8, 31.3, 29, 25.2, 24.8

¹H: 8.12 (1H, s), 8.03 (1H, s), 7.63 (1H, d, J = 7.8 Hz), 7.57 (1H, t br), 7.37 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.0 (3H, br), 6.98 (1H, d, J = 8.2 Hz), 3.8 (1H, m), 2.93 (3H, s), 1.78 (4H, m), 1.58 (3H, m), 1.29 (2H, m q, J = 12.5 Hz), 1.11 (1H, m q, J = 12.5 Hz)

Сполука номер 564 (MP: 250). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 154.7, 151.1, 142.6, 140.3, 137.6, 130.8, 129.6, 118.6, 114.2, 109.6, 106, 58.4, 31.3, 28.2, 24

¹H: 11.71 (1H, br), 8.10 (1H, d, J = 1.2 Hz), 8.0 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.59 (1H, d d, J = 1.7, 8.3 Hz), 7.53 (1H, d, J = 1.7 Hz), 7.29 (1H, d, J = 8.3 Hz), 4.36 (1H, m), 2.93 (3H, s), 1.87 (2H, m), 1.68 (4H, m), 1.53 (2H, m)

Сполука номер 565 (MP: 188-189). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 151.5, 146.7, 142.2, 138, 136.8, 133.9, 129.6, 129.1, 128.3, 127.2, 115.5, 114.4, 113.1, 111.9, 62.8, 55.8, 52.5, 31.6, 28.9

¹H: 7.90 (1H, s), 7.45 (1H, s), 7.38-7.24 (5H, m), 7.21 (1H, t br), 7.17 (1H, m), 7.16 (1H, m), 6.63 (1H, m d, J = 7.5 Hz), 4.02 (1H, m), 3.74 (2H, s), 3.52 (2H, s), 3.01 (3H, s), 3.0 (2H, m), 2.10 (2H, t br, J = 11.5 Hz), 1.93 (2H, d q, J = 3.3, 12.0 Hz), 1.78 (2H, d br, J = 11.0 Hz)

Сполука номер 566 (MP: 196). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 163.9, 149.6, 137.8, 136.9, 133.5, 130.7, 129.1, 127.7, 126.4, 123.9, 115.9, 67.9, 56.5, 34.1, 31.5, 26.7

¹H: 11.30 (1H, br), 8.81 (1H, s), 8.29 (1H, s), 8.25 (1H, s), 7.98 (1H, t d, J = 1.4, 7.9 Hz), 7.70 (1H, t d, J = 1.2, 7.9 Hz), 7.54 (1H, t, J = 7.8 Hz), 3.85 (1H, m), 3.41 (1H, m), 2.94 (3H, s), 1.90 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 7.71 (4H, m), 1.25 (2H, q br, J = 12.3 Hz)

Сполука номер 567 (MP: 219-220). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 150.7, 139, 138.8, 138.5, 138.4, 138.3, 128.8, 128.2, 127.6, 127, 125.2, 116.8, 61.9, 55.6, 52.2, 43.7, 31.6, 28.2

¹H: 8.25 (1H, d, J = 1.1 Hz), 8.20 (1H, d, J = 1.1 Hz), 8.10 (2H, m d, J = 8.7 Hz), 7.93 (2H, m d, J = 8.7 Hz), 7.36-7.20 (5H, m), 3.83 (1H, m), 3.46 (2H, s), 3.22 (3H, s), 2.95 (3H, s), 2.90 (2H, m d, J = 11.0 Hz), 2.0 (2H, t br, J = 11.0 Hz), 1.83 (2H, d q, J = 3.5, 12.0 Hz), 1.72 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

Сполука номер 568 (MP: 193-194). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 158.3, 148.9, 137.0, 136.9, 135.3, 131.6, 131.3, 130.1 (q, J = 33.0 Hz), 130.0 (q, J = 3.5 Hz), 127.1, 123.8 (q, J = 4.2 Hz), 123.4 (q, J = 273.0 Hz), 118.8, 115.9, 114.2, 54.3, 45.2, 31.9, 27.3

¹H: 9.88 (1H, br), 9.21 (1H, s), 8.17 (1H, s), 8.14 (1H, d br, J = 7.8 Hz), 8.10 (1H, d br, J = 8.0 Hz), 7.99 (1H, t br), 7.92 (1H, t, J = 7.9 Hz), 7.64 (2H, m d, J = 8.7 Hz), 6.86 (2H, m d, J = 8.7 Hz), 3.91 (1H, m), 3.84 (2H, m), 2.94 (3H, s), 2.48 (2H, m), 1.86 (4H, m)

Сполука номер 569 (MP: 157-158). ЯМР розчинник: CDCl₃

¹³C: 157.9, 151.2, 149.5, 148.5, 146.7, 139.3, 137.3, 136.4, 132.4, 128.9, 123.6, 123.3, 122.2, 113.9, 64.2, 55.7, 52.7, 31.7, 28.7

¹H: 9.0 (1H, d, J = 2.2 Hz), 8.59 (1H, d d d, J = 1.0, 1.8, 4.9 Hz), 8.53 (1H, d d, J = 1.6, 4.8 Hz), 8.11 (1H, d d d, J = 1.8, 2.2, 7.9 Hz), 7.94 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.67 (1H, d t, J = 1.9, 7.7 Hz), 7.57 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.37 (1H, d, J = 7.7 Hz), 7.34 (1H, d d d, J = 0.8, 4.8, 7.9 Hz), 7.19 (1H, d d d, J = 1.0,

4.9, 7.7 Hz), 4.05 (1H, m), 3.68 (2H, s), 3.04 (2H, m d, J = 12.0 Hz), 3.03 (3H, s), 2.23 (2H, t br, J = 11.5 Hz), 2.01 (2H, d q, J = 3.5, 12.0 Hz), 1.79 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

Сполука номер 570 (MP: 206-207). ЯМР розчинник: MeOD

13C: 153.2, 152.8 (d, J = 241.0 Hz), 146.6 (d, J = 13.5 Hz), 142.5, 139.2, 131.0 (d, J = 3.5 Hz), 118.0 (d, J = 6.5 Hz), 117.3 (d, J = 19.3 Hz), 116.0 (d, J = 3.0 Hz), 115.1, 60.0, 55.2, 53.3, 33.3, 27.4, 19.5, 11.6

1H: 8.12 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.75 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.36 (1H, d d, J = 2.3, 8.5 Hz), 7.22 (1H, m), 7.06 (1H, d d, J = 8.4, 11.0 Hz), 4.22 (1H, m), 3.60 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 3.07 (3H, s), 2.98 (4H, m), 2.25 (2H, d q, J = 3.0, 13.0 Hz), 2.12 (2H, d br, J = 13.0 Hz), 1.76 (2H, m), 1.02 (3H, t, J = 7.5 Hz)

10 Сполука номер 571 (MP: 182). ЯМР розчинник: DMSO

13C: 163.7, 150.3, 138.1, 138, 134.1, 131.7, 131.4, 129.7, 129.7, 129, 127.5, 124.8, 116.1, 59, 52.3, 50.5, 31.9, 25

1H: 11.29 (1H, br), 9.65 (1H, s br), 8.59 (1H, s), 8.27 (1H, s), 7.93 (2H, m d, J = 8.5 Hz), 7.81 (2H, m d, J = 8.6 Hz), 7.56 (2H, m), 7.48 (3H, m), 4.32 (2H, d, J = 5.0 Hz), 4.19 (1H, m), 3.46 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 3.17 (2H, m), 3.95 (3H, s), 2.21 (2H, q br, J = 13.0 Hz), 2.0 (2H, d br, J = 12.5 Hz)

15 Сполука номер 572 (MP: 223). ЯМР розчинник: DMSO

13C: 171.3, 160.9, 149.5, 137.4, 136, 131.5, 130.8, 129.7, 129.7, 128.9, 125.9, 120, 118, 115.1, 114.7, 59, 52.4, 50.5, 32, 24.9

20 1H: 13.0 (1H, br), 9.77 (1H, s), 9.06 (1H, s), 8.47 (1H, s), 8.44 (1H, s), 8.23 (1H, s), 8.08 (1H, s), 7.89 (1H, d, J = 8.5 Hz), 7.59 (2H, m), 7.49 (3H, m), 7.02 (1H, d, J = 8.5 Hz), 4.35 (2H, d, J = 4.0 Hz), 4.26 (1H, m), 3.48 (2H, d br, J = 11.0 Hz), 3.18 (2H, m), 3.0 (3H, s), 2.26 (2H, q br, J = 12.0 Hz), 2.02 (2H, d br, J = 12.5 Hz)

Сполука номер 573 (MP: 173-174). ЯМР розчинник: CDCl₃

25 13C: 165.1, 164.9, 159.2, 151.7, 151.6, 150.4, 150.2, 147.1, 146.8, 142.3, 142.3, 136.9, 136.9, 136.8, 132, 131.8, 126.4, 125.5, 125.5, 122.8, 122.8, 114.1, 111.9, 111.8, 55.3, 55.2, 54.9, 46.4, 45.6, 41, 40.9, 32.3, 32, 28.9, 28.9, 28.3, 28.2

30 1H: 8.48 (1H, d d, J = 1.8, 4.8 Hz), 7.91 (1H, m), 7.71 (2H, m d, J = 8.8 Hz), 7.71 and 7.64 (1H, 2 m), 7.40 (1H, m), 7.35 (1H, d d, J = 4.9, 7.5 Hz), 6.94 (2H, m d, J = 8.8 Hz), 4.98 (1H, m), 4.32 (1H, m), 3.84 (3H, s), 3.54 (1H, m), 3.34 and 3.15 (1H, 2 m), 3.04 and 3.03 (3H, 2 s), 2.89 (1H, m), 2.11-1.58 (4H, m)

Сполука номер 574 (MP: 242-243). ЯМР розчинник: DMSO

13C: 168.1, 156.7, 151.2, 141, 137.4, 126.1, 124.5, 115.4, 112.5, 55.1, 44.9, 40, 31.6, 28.6, 28, 21.4

35 1H: 9.46 (1H, s), 8.07 (1H, s), 7.79 (1H, s), 7.64 (2H, d, J = 8.0 Hz), 6.77 (2H, d, J = 8.0 Hz), 4.50 (1H, d, J = 12.5 Hz), 4.09 (1H, m br), 3.90 (1H, d, J = 12.5 Hz), 3.10 (1H, m), 2.91 (3H, s), 2.50 (1H, m), 2.01 (3H, s), 1.78 (3H, m), 1.61 (1H, m)

Сполука номер 575 (MP: 233-234). ЯМР розчинник: DMSO

40 13C: 156.2, 153.3, 150.9, 139.8, 137.6, 126.6, 125.2, 124.2, 123.1, 113.8, 112.8, 56.8, 55.9, 31.3, 29, 25.2, 24.8

1H: 9.13 (1H, s), 8.10 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.97 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.83 (1H, d d, J = 2.3, 8.6 Hz), 7.69 (1H, d, J = 2.3 Hz), 7.21 (3H, s br), 7.19 (1H, d, J = 8.6 Hz), 3.85 (3H, s), 3.80 (1H, m), 2.92 (3H, s), 1.77 (4H, m), 1.59 (3H, m), 1.29 (2H, q br, J = 12.5 Hz), 1.11 (1H, q br, J = 12.5 Hz)

Сполука номер 576 (MP: 137-138). ЯМР розчинник: DMSO

45 13C: 155.8, 150.7, 139.7, 137.9, 134.5, 129.7, 127.1, 125.4, 125.2, 123.1, 115.3, 56.8, 31.4, 29, 25.2, 24.9

1H: 8.56 (1H, s br), 8.19 (1H, s), 8.13 (1H, s), 8.02 (1H, m d, J = 7.9 Hz), 7.91 (1H, m d, J = 7.8 Hz), 7.61 (1H, t, J = 7.9 Hz), 3.83 (1H, m), 2.95 (3H, s), 1.79 (4H, m), 1.58 (3H, m), 1.30 (2H, q br, J = 13.0 Hz), 1.12 (1H, q br, J = 13.0 Hz)

Сполука номер 577 (MP: 146-147). ЯМР розчинник: DMSO

50 13C: 151.3, 148, 141.7, 138.5, 137.1, 128.8, 128.2, 127, 125.8, 121.2, 113.9, 111.4, 61.9, 55.5, 52.3, 31.4, 28.3

1H: 8.0 (1H, s), 7.65 (1H, s), 7.49 (2H, m d, J = 8.5 Hz), 7.36-7.21 (5H, m), 6.56 (2H, m d, J = 8.5 Hz), 5.13 (2H, s), 3.80 (1H, m), 3.46 (2H, s), 2.92 (3H, s), 2.88 (2H, d br, J = 13.0 Hz), 1.99 (2H, t br, J = 11.0 Hz), 1.81 (2H, d q, J = 3.0, 12.0 Hz), 1.70 (2H, d br, J = 11.5 Hz)

55 Сполука номер 578 (MP: 167-168). ЯМР розчинник: DMSO

13C: 150.8, 142.3, 139.3, 138.1, 136.6, 129, 128.7, 128.3, 127.1, 126.2, 124.9, 116.2, 61.8, 55.4, 52.1, 31.6, 28

1H: 8.18 (2H, 2 s), 8.03 (2H, m d, J = 8.6 Hz), 7.83 (2H, m d, J = 8.6 Hz), 7.40-7.20 (5H, m), 7.28 (2H, s br), 3.86 (1H, m br), 3.49 (2H, br), 2.95 (5H, m), 2.02 (2H, br), 1.87 (2H, br), 1.76 (2H, br)

60 Сполука номер 579 (MP: 168). ЯМР розчинник: DMSO

- 13C: 151.1, 148, 141.7, 137, 125.8, 121.3, 113.9, 111.4, 56.8, 31.3, 29.1, 25.2, 24.9
 1H: 8.0 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.64 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.48 (2H, m d, J = 8.5 Hz), 6.56 (2H, m d, J = 8.5 Hz), 5.13 (2H, s), 3.80 (1H, m), 2.91 (3H, s), 1.77 (4H, m), 1.58 (3H, m), 1.29 (2H, m, J = 12.6 Hz), 1.11 (1H, m, J = 12.6 Hz)
- 5 Сполука номер 580 (MP: 183-184). ЯМР розчинник: DMSO
 13C: 150.9, 140.6, 138.5, 137.4, 127.3, 125.3, 118, 113.4, 56.8, 31.3, 29, 25.2, 24.9
 1H: 9.55 (1H, s br), 8.07 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.88 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.73 (2H, m d, J = 8.7 Hz), 7.16 (2H, m d, J = 8.7 Hz), 7.13 (2H, s br), 3.81 (1H, m), 2.92 (3H, s), 1.78 (4H, m), 1.57 (3H, m), 1.29 (2H, q br, J = 12.7 Hz), 1.11 (1H, m q, J = 12.5 Hz)
- 10 Сполука номер 581 (MP: 182 (dec.)). ЯМР розчинник: DMSO
 13C: 155.7, 153, 151, 140.1, 138.5, 137.5, 128.8, 128.2, 127, 126.5, 123.6 (2 sig.), 113.5, 112.6, 61.9, 55.7, 55.5, 52.2, 31.5, 28.2
 1H: 8.09 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.93 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.72 (1H, d d, J = 1.7, 8.6 Hz), 7.59 (1H, s br), 7.36-7.21 (5H, m), 7.12 (1H, d, J = 8.6 Hz), 7.01 (4H, br), 3.81 (1H, m), 3.81 (3H, s), 3.47 (2H, s), 2.93 (3H, s), 2.90 (2H, d br, J = 11.5 Hz), 1.99 (2H, t br, J = 11.2 Hz), 1.83 (2H, d q, J = 3.5, 12.1 Hz), 1.71 (2H, d br, J = 12.5 Hz)
- 15 Сполука номер 582 (MP: 199-200). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 159.3, 151.7, 142.4, 136.9, 126.5, 125.5, 117.4, 114.1, 111.8, 55.3, 53.8, 49, 32.2, 27.7
 1H: 7.91 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.72 (2H, m d, J = 8.8 Hz), 7.39 (1H, d, J = 1.3 Hz), 6.95 (2H, m d, J = 8.8 Hz), 4.19 (1H, m), 3.85 (3H, s), 3.59 (2H, m d, J = 13.5 Hz), 3.19 (2H, d t, J = 2.9, 12.9 Hz), 3.06 (3H, s), 2.0 (2H, d q, J = 4.4, 12.3 Hz), 1.91 (2H, d br, J = 12.0 Hz)
- 20 Сполука номер 583 (MP: 166-167). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 159.2, 151.6, 142.2, 136.8, 126.5, 125.6, 114.5, 114.1, 112, 55.3, 54.5, 51.5, 46, 31.9, 28.3
 1H: 7.90 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.72 (2H, m d, J = 9.0 Hz), 7.40 (1H, d, J = 1.3 Hz), 6.94 (2H, m d, J = 9.0 Hz), 4.07 (1H, m), 3.84 (3H, s), 3.54 (2H, s), 3.03 (3H, s), 2.94 (2H, m d, J = 11.5 Hz), 2.51 (2H, d t, J = 3.0, 11.5 Hz), 1.97 (2H, d q, J = 4.0, 12.0 Hz), 1.90 (2H, m)
- 25 Сполука номер 584 (MP: 189-191). ЯМР розчинник: CDCl₃
 13C: 151.2, 148.6, 146.7, 139.4, 137.3, 132.5, 128.9, 123.6, 114.5, 113.8, 54.7, 51.4, 45.9, 32, 28.3
 1H: 9.02 (1H, d, J = 2.0 Hz), 8.55 (1H, d d, J = 1.7, 4.9 Hz), 8.13 (1H, t d, J = 1.9, 8.0 Hz), 7.96 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.59 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.35 (1H, d d, J = 4.9, 8.0 Hz), 4.08 (1H, m), 3.55 (2H, s), 3.05 (3H, s), 2.96 (2H, d br, J = 11.4 Hz), 2.53 (2H, d t, J = 3.0, 11.5 Hz), 1.98 (2H, d q, J = 3.9, 12.0 Hz), 1.92 (2H, m)
- 30 Сполука номер 585 (MP: 197-198 (dec.)). ЯМР розчинник: DMSO
 13C: 157.8, 149.8, 137.6, 137.1, 131.1, 130, 116.1, 115.4, 115.3, 112.1, 57.3, 52.3, 50.7, 31.9, 25.1, 17, 11
 1H: 9.39 (1H, s), 8.90 (1H, s), 8.21 (1H, s), 7.26 (3H, m), 6.78 (1H, m), 4.22 (1H, m), 3.59 (2H, d br, J = 11.5 Hz), 3.12 (2H, q br, J = 11.5 Hz), 3.0 (2H, m), 2.97 (3H, s), 2.23 (2H, d q, J = 3.0, 13.0 Hz), 2.0 (2H, d br, J = 12.5 Hz), 1.70 (2H, m), 0.91 (3H, t, J = 7.5 Hz)
- 40 Сполука номер 586 (MP: 183 (dec.)). ЯМР розчинник: MeOD
 13C: 150.1, 149.1, 147.6, 137.9, 136.6, 119.3, 118.8, 117.1, 116, 114.4, 59.8, 55.1, 53, 33.7, 26.9, 18.9, 11.4
 1H: 9.31 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.09 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.17 (1H, d, J = 2.2 Hz), 7.10 (1H, d d, J = 2.2, 8.2 Hz), 6.90 (1H, d, J = 8.2 Hz), 4.33 (1H, m), 3.74 (2H, d br, J = 12.5 Hz), 3.19 (2H, d t, J = 2.8, 13.0 Hz), 3.11 (3H, s), 3.11 (2H, m), 2.36 (2H, d q, J = 3.2, 12.8 Hz), 2.23 (2H, d br, J = 13.5 Hz), 1.82 (2H, m), 1.04 (3H, t, J = 7.5 Hz)
- 45 Сполука номер 587 (MP: 153-156 (dec.)). ЯМР розчинник: MeOD
 13C: 158.7, 153.4, 152.4, 151.1, 143.5, 139.3, 139, 127.9, 125.6, 125.6, 125.5, 116.6, 113.8, 61.5, 54.8, 53.6, 33.3, 26.9
 1H: 8.69 (1H, d, J = 5.0 Hz), 8.11 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.92 (1H, d t, J = 1.7, 7.6 Hz), 7.67 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.61 (2H, m d, J = 8.7 Hz), 7.52 (1H, d, J = 7.9 Hz), 7.47 (1H, d d, J = 5.0, 7.6 Hz), 6.81 (2H, m d, J = 8.7 Hz), 4.45 (2H, s), 4.28 (1H, m), 3.65 (2H, d br, J = 11.5 Hz), 3.25 (2H, m), 3.09 (3H, s), 2.31 (2H, q br, J = 13.0 Hz), 2.14 (2H, d br, J = 12.5 Hz)
- 50 Сполука номер 588 (MP: 184). ЯМР розчинник: DMSO
 13C: 151.1, 140.6, 138.5, 138.5, 137.4, 128.8, 128.2, 127.3, 127, 125.3, 118, 113.3, 61.9, 55.5, 52.2, 31.5, 28.2
 1H: 9.55 (1H, s br), 8.08 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.88 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.73 (2H, m d, J = 8.7 Hz), 7.36-7.20 (5H, m), 7.16 (2H, m d, J = 8.7 Hz), 7.13 (2H, s br), 3.81 (1H, m), 3.46 (2H, s), 2.94 (3H, s), 2.89 (2H, m d, J = 11.0 Hz), 2.0 (2H, t br, J = 11.0 Hz), 1.83 (2H, d q, J = 3.0, 12.0 Hz), 1.71 (2H, d br, J = 12.0 Hz)
- 60

Сполука номер 589 (MP: 126-129 (dec.)). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 152.8, 151.1, 148.9, 141.1, 138.5, 137.5, 134, 129.1, 128.8, 128.2, 127, 122, 119.6, 117.8, 114.1, 61.9, 55.5, 52.2, 31.5, 28.3

¹H: 8.08 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.91 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.37 (1H, t d, J = 1.3, 7.8 Hz), 7.33-7.23 (6H, m), 7.21 (1H, t, J = 7.7 Hz), 6.72 (1H, d, J = 7.9 Hz), 5.58 (4H, s br), 3.81 (1H, m), 3.46 (2H, s), 2.93 (3H, s), 2.89 (2H, m d, J = 11.5 Hz), 2.0 (2H, t br, J = 11.5 Hz), 1.82 (2H, d q, J = 3.3, 12.0 Hz), 1.71 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

Сполука номер 590 (MP: 179-180). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 155.6, 150.9, 139.7, 138, 134.5, 129.8, 127.2, 125.5, 125, 123.1, 115.3, 66.3, 54.2, 31.7, 29.1

¹H: 8.57 (1H, s), 8.22 (1H, s), 8.16 (1H, s), 8.04 (1H, d, J = 7.7 Hz), 7.92 (1H, d, J = 7.8 Hz), 7.62 (1H, t, J = 7.6 Hz), 4.12 (1H, m), 3.94 (2H, d d, J = 3.7, 11.2 Hz), 3.39 (2H, t, J = 11.5 Hz), 2.98 (3H, s), 1.87 (2H, d q, J = 4.3, 12.2 Hz), 1.71 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

Сполука номер 591 (MP: 187-188). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 160.1, 157.5, 150.7, 139.4, 138, 134.5, 129.7, 128.2, 124.5, 123.8, 122.2, 115.5, 56.8, 31.4, 29, 25.1, 24.8

¹H: 13.0 (1H, s br), 8.32 (1H, t, J = 1.5 Hz), 8.19 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.11 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.06 (1H, t d, J = 1.5, 7.8 Hz), 7.68 (1H, t d, J = 1.5, 7.8 Hz), 7.59 (1H, t, J = 7.8 Hz), 3.83 (1H, m), 2.94 (3H, s), 1.79 (4H, m), 1.58 (3H, m), 1.30 (2H, q br, J = 13.5 Hz), 1.58 (1H, m)

Сполука номер 592 (MP: 148-149). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 158.5, 155.6, 151, 140.6, 137.5, 126.1, 126, 114, 113.1, 55.5, 55.1, 45.7, 31.6, 27.6

¹H: 8.31 (1H, s), 8.09 (1H, s), 7.88 (1H, s), 7.77 (2H, m d, J = 8.5 Hz), 6.95 (2H, m d, J = 8.5 Hz), 5.20 (2H, s), 3.95 (1H, m br), 3.78 (3H, s), 3.69 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 2.92 (3H, s), 2.53 (2H, m), 1.78 (2H, q br, J = 12.5 Hz), 1.70 (2H, m)

Сполука номер 593 (MP: 100-103 (dec.)). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 150.9, 140.2, 138.8, 138.4, 137.7, 134.5, 129.6, 128.9, 128.2, 127, 120.5, 118.6, 116.2, 114.8, 61.8, 55.5, 52.2, 39.2, 31.5, 28.1

¹H: 9.78 (1H, s), 8.12 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.96 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.73 (1H, t br, J = 1.8 Hz), 7.56 (1H, m d, J = 8.0 Hz), 7.33 (1H, t, J = 8.0 Hz), 7.38-7.20 (5H, m), 7.11 (1H, m d, J = 8.0 Hz), 3.83 (1H, m br), 3.48 (2H, br), 3.0 (3H, s), 2.94 (3H, s), 2.90 (2H, m br), 2.01 (2H, m br), 1.84 (2H, q br, J = 11.0 Hz), 1.73 (2H, d br, J = 11.0 Hz)

Сполука номер 594 (MP: 138-140). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 160.1, 157.6, 151, 139.4, 138, 134.4, 129.7, 128.2, 124.5, 123.9, 122.2, 115.4, 58.4, 31.3, 28.2, 24

¹H: 13.02 (1H, s br), 8.32 (1H, t br, J = 1.6 Hz), 8.19 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.10 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.08 (1H, m d, J = 8.0 Hz), 7.69 (1H, m d, J = 8.0 Hz), 7.60 (1H, t, J = 8.0 Hz), 4.38 (1H, m), 2.94 (3H, s), 1.88 (2H, m), 1.69 (4H, m), 1.54 (2H, m)

Сполука номер 595 (MP: 228-229). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: 159.1, 158.5, 151.1, 140.6, 137.5, 126.1, 126.0, 114.0, 113.1, 55.1, 54.6, 46.4, 31.7, 27.2

¹H: 14.96 (1H, br), 8.10 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.89 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.77 (2H, m d, J = 9.0 Hz), 6.96 (2H, m d, J = 9.0 Hz), 4.12 (1H, m br), 3.95 (2H, m d, J = 13.0 Hz), 3.77 (3H, s), 3.13 (2H, d t, J = 3.5, 12.5 Hz), 2.93 (3H, s), 1.90 (2H, m), 1.86 (2H, m)

Сполука номер 596 (MP: 178-180 (dec.)). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: No data

¹H: 8.09 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.88 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.77 (2H, m d, J = 9.0 Hz), 6.95 (2H, m d, J = 9.0 Hz), 5.99 (2H, s), 4.06 (2H, d br, J = 13.5 Hz), 4.02 (1H, m), 3.77 (3H, s), 2.91 (3H, s), 2.71 (2H, t br, J = 12.0 Hz), 1.71 (2H, m), 1.64 (2H, d q, J = 4.0, 12.0 Hz)

Сполука номер 597 (MP: 162-163). ЯМР розчинник: DMSO

¹³C: No data

¹H: 8.08 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.87 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.76 (2H, m d, J = 9.0 Hz), 6.95 (2H, m d, J = 9.0 Hz), 4.51 (1H, s br), 3.85 (1H, m br), 3.77 (3H, s), 3.51 (2H, s br), 3.05 (2H, br), 2.93 (3H, s), 2.48 (2H, m), 2.10 (2H, br), 1.88 (2H, s br), 1.75 (2H, s br).

3. Біологічна ефективність сполук за винаходом

Випробування *in vitro* здійснювали у відповідності до протоколу, описаного нижче. Засоби контролю, як *in vitro*, так і *in vivo*, являли собою реакційну суміш мінус досліджувані сполуки. Таким чином, низьке значення в табл. 1 нижче для досліджуваних сполук вказує на потужний інгібітор. Значення 100 вказує на відсутність інгібування, що піддавалося б вимірюванню.

Випробування *in vivo* здійснювали у відповідності до протоколу, описаного нижче. BRh показує інгібування в тканині центральної нервової системи, і LVh показує інгібування в периферичній тканині, в даному випадку, в печінці.

Протокол in vitro

Фармацевтичну активність FAАН in vitro визначали у відповідності до наступного способу:

Використовували заморожений мозок (без мозочка) щурів Wistar, і кожен мозок гомогенізували в 15 мл 1 мМ розчину $MgCl_2$ з вмістом 20 нМ HEPES (pH 7,0) за допомогою Potter Elvehjem (8 ударів при 500 об/хв.). Гомогенати центрифугували протягом 20 хв. при 36000g і температурі 4°C (Beckman, ротор 70Ti). Гранули повторно суспендували в 15 мл такого ж буферного розчину і центрифугували в таких же умовах. Далі гранули знову суспендували в 15 мл такого ж буферного розчину та інкубували протягом 15 хв. при температурі 37°C, після чого їх центрифугували протягом 20 хв. при 36000g і температурі 4°C. Кожну гранулу далі повторно суспендували в 15 мл 3 мМ розчину $MgCl_2$ з вмістом 1 мМ ЕДТА, 50 мМ Трис (pH 7,4), і білок визначали за допомогою BioRad Protein Assay (BioRad) з використанням стандартної кривої альбуміну телячої сироватки (50–250 мкг/мл). Відбирали аліквати суспензії мембран і зберігали при температурі -80°C.

Активність FAАН визначали, застосовуючи АЕА (мічений ^3H в етаноламіному фрагменті молекули) як субстрат і вимірюючи утворений ^3H -етаноламін. Реакційну суміш (загальний об'єм 200 мкл), що містила: 2 мкМ АЕА (2 мкМ АЕА + 5 нм ^3H -АЕА), 0,1 % вільної від жирних кислот альбумін телячої сироватки, 5 мкг білка, в 1 мМ розчині ЕДТА, що містив 10 мМ Трис (pH 7,6) і 10 мкМ або 0,1 мкМ сполук. Запасні розчини сполук для тестування (10 мМ) готували в 100 % ДМСО, і концентрація ДМСО в аналізі становила 0,1 %. Після періоду попередньої інкубації протягом 15 хв. при температурі 37°C, реакцію ініціювали додаванням розчину субстрату (холодний ЕАЕ + мічений радіоізотопом ЕАЕ + альбумін телячої сироватки). Реакцію здійснювали протягом 10 хв. перед зупинкою шляхом додавання 400 мкл суспензії активованого деревного вугілля (8 г деревного вугілля в 32 мл 0,5 М HCl при безперервному збовтуванні). Після інкубації протягом 30 хв. при кімнатній температурі із збовтуванням, деревне вугілля осаджували центрифугуванням в мікроцентрифузі (10 хв. при 13000 об/хв.). 200 мкл супернатанту додавали до 800 мкл сцинтиляційного коктейлю Optiphas Supermix, попередньо вміщеного в лунки 24-лункових планшетів. Кількість імпульсів на хвилину визначали за допомогою сцинтиляційного лічильника Microbeta TriLux (підррахунок протягом 10 хв., або до $s = 2$).

В кожному аналізі використовували холостий розчин (відсутній білок, звичайно, менше 200 імпульсів на хвилину) і засобах контролю (відсутня сполука). Результати наведені в табл. 1 як % контролю після віднімання показників холостого розчину.

Протокол in vivo

Лікування тварин

Тварини, яких використовували для експериментів, були мишами-самцями NMRI (масою 27–44 г), одержаними від Interfauna Iberica (Іспанія). Мишей утримували в кількості 5 на клітку, в умовах контрольованого середовища (12-годинний цикл світла/темряви і кімнатна температура $22 \pm 1^\circ C$). Їжа і питна вода надавалися ad libitum, і всі експерименти здійснювали протягом годин денного освітлення.

Тваринам перорально вводили 30 мг/кг або 3 мг/кг сполуки за винаходом (8 мл/кг; сполуку суспендували в 0.5 % розчині карбоксиметилцелюлози (КМЦ) або солюбілізували у воді) або розчинник (засоби контролю), з використанням кривої голки для годування тварин з неіржавіючої сталі (Perfectum, U.S.A.). За 15 хв. перед умертвленням тваринам здійснювали анестезію за допомогою 60 мг/кг пентобарбіталу, який вводили інтраперитонеально. Фрагмент печінки, ліву частку легені і мозок без мозочка витягали і вміщували в пластикові флакони, що містили буферний розчин для мембран (3 мМ $MgCl_2$, 1 мМ ЕДТА, 50 мМ Трис HCl, pH 7,4). Тканини зберігали при температурі -30°C до аналізу.

Тварини завжди голодували протягом ночі перед введенням сполук, за винятком точок часу > 18 год, де їжу забирали вранці дня введення, і сполуку вводили після 12 годин в той же день. Далі тваринам давали тільки воду.

Всі процедури з використанням тварин здійснювали в суворій відповідності до Європейської Директиви із захисту хребетних тварин, використовуваних для експериментальних та інших наукових цілей (86/609CEE) і португальського законодавства (Decreto-Lei 129/92, Portaria 1005/92 e 1131/97). Кількість використовуваних тварин була мінімально можливою у відповідності до діючих правил і наукової доцільності.

Реактиви і розчини

Анандамід [етаноламін -1- ^3H -] (40–60 Ки/ммоль) був одержаний від американської компанії Radiochemicals. Всі інші реактиви були одержані від Sigma-Aldrich. Optiphas Supermix була одержана від Perkin Elmer, і активоване деревне вугілля було одержане від Sigma-Aldrich.

Одержання тканини

Тканини розморожували на льоду і гомогенізували в 10 об'ємах буферного розчину для мембран (3 мМ $MgCl_2$, 1 мМ ЕДТА, 50 мМ Трис HCl, pH 7,4) або за допомогою Potter Elvehjem (мозок — 8 ударів при 500 об/хв.), або Heidolph Diax (печінка — 2 удари в положенні 5 протягом 20 с, з паузами 30 с).

- 5 Загальний білок в тканинах визначали за допомогою BioRad Protein Assay (BioRad), з використанням стандартної кривої альбуміну телячої сироватки (50–250 мкг/мл).

Ферментний аналіз

- 10 Реакційну суміш (загальний об'єм 200 мкл), що містила: 2 мМ АЕА (2 мМ АЕА + 5 нМ ^3H -АЕА), 0,1 % вільного від жирних кислот альбуміну телячої сироватки, 15 мкг (мозок), 5 мкг (печінка) або 50 мкг (легеня) білка, в 1 мМ розчині ЕДТА з вмістом 10 мМ Трис pH 7,6. Після періоду попередньої інкубації протягом 15 хв. при температурі 37°C, реакцію ініціювали додаванням розчину субстрату (холодний АЕА + мічений радіоізотопом АЕА + альбумін телячої сироватки). Реакцію здійснювали протягом 10 хв. (мозок і легеня) або 7 хв. (печінка), після чого зупиняли додаванням 400 мкл суспензії активованого деревного вугілля (8 г деревного вугілля в 32 мл 0,5 М HCl при безперервному збовтуванні). Після періоду інкубації протягом 30 хв. при кімнатній температурі із збовтуванням, деревне вугілля осаджували центрифугуванням в мікроцентрифугу (10 хв. при 13000 об/хв.). 200 мкл супернатанту додавали до 800 мкл сцинтиляційного коктейлю Optiphas Supermix, попередньо вміщеного в лунки 24-лункових планшетів. Кількість імпульсів на хвилину визначали за допомогою сцинтиляційного лічильника Microbeta TriLux.

Для кожного аналізу готували холостий розчин (без білка).

Відсоток залишкової ферментної активності обчислювали з урахуванням засобів контролю після віднімання показників холостого розчину.

Таблиця 1

	Назва	Клас	In Vitro			In Vivo		
			10 мМ	100 нМ	BRh 30 мг.кг, 1 год	LVh 30 мг.кг, 1 год	BRh 3 мг.кг, 8 год	LVh 3 мг.кг, 8 год
1	(1H-імідазол-1-іл)(морфоліно)метанон	Імідазоли	62,6					
2	N-метил-N-феніл-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли	11,7					
3	морфоліно(4-феніл-1H-імідазол-1-іл)метанон	Імідазоли	4,8					
4	N-метил-N,4-дифеніл-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли	0,1	83,6	14,3	10,6		
5	N,3-дифеніл-1H-піразол-1-карбоксамід	Піразоли	91,3					
6	N-(4-метоксифеніл)-3-феніл-1H-піразол-1-карбоксамід	Піразоли	91,1					
7	N-метил-N-феніл-1H-1,2,4-триазол-1-карбоксамід	1,2,4-Триазоли	0	17				
8	N-метил-N-феніл-1H-піразол-1-карбоксамід	Піразоли	13,2					
9	N-феніл-1H-піразол-1-карбоксамід	Піразоли	78,6					
10	N-(4-феноксифеніл)-3-феніл-1H-піразол-1-карбоксамід	Піразоли	55					
11	N-(4-(бензилокси)феніл)-3-феніл-1H-піразол-1-карбоксамід	Піразоли	82,6					
12	N-метил-N,3-дифеніл-1H-піразол-1-карбоксамід	Піразоли	86					
13	морфоліно(3-феніл-1H-піразол-1-іл)метанон	Піразоли	89,7					
14	N-метил-4-(нафталін-2-іл)-N-феніл-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли	0	68,3	96,7	77,3		
15	N-(біфеніл-4-іл)-3-феніл-1H-піразол-1-карбоксамід	Піразоли	66,9	103,8				
16	N-(4-метоксифеніл)-N-метил-4-(нафталін-2-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли	24,7					
17	N-(4-метоксифеніл)-N-метил-4-феніл-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли	65					
18	N-метил-N-феніл-1H-бензо[d]імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли	67,9					
19	(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(морфоліно)метанон	Бензотриазоли	0,1	3,1	46,6	41,1		
20	3-(біфеніл-4-іл)-N-феніл-1H-піразол-1-карбоксамід	Піразоли	97,3					
21	морфоліно(3-(піридин-3-іл)-1H-піразол-1-іл)метанону гідрохлорид	Піразоли	79,1					
22	3-(біфеніл-4-іл)-N-(3-метоксифеніл)-1H-піразол-1-карбоксамід	Піразоли	95,8					

Таблиця 1

	Назва	Клас	In Vitro			In Vivo		
			10 мкМ	100 нМ	BRh 30 мг.кг, 1 год	LVh 30 мг.кг, 1 год	BRh 3 мг.кг, 8 год	LVh 3 мг.кг, 8 год
23	3-(біфеніл-4-іл)-N-(4-метоксифеніл)-1H-піразол-1-карбоксамід	Піразоли	93					
24	N-метил-N-феніл-3-(піридин-3-іл)-1H-піразол-1-карбоксамід	Піразоли	22,9					
25	3-(біфеніл-4-іл)-N-метил-N-феніл-1H-піразол-1-карбоксамід	Піразоли	99					
26	N-метил-N,2-дифеніл-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли	92,6					
27	4-(4-хлорфеніл)-N-метил-N-феніл-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли	0,2	71,4				
28	4-(4-метоксифеніл)-N-метил-N-феніл-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли	0,7	85,1				
29	4-(4-фторфеніл)-N-метил-N-феніл-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли	0	52,5	10,7	17,2		
30	4-(2-фторфеніл)-N-метил-N-феніл-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли	0,1	72,5				
31	4-(3-метоксифеніл)-N-метил-N-феніл-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли	0	69				
32	6-хлор-N-метил-N-феніл-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазоли	0	0,1	85,9	64,9		
33	5-хлор-N-метил-N-феніл-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазоли	0	6,2	82,3	76,7		
34	N-метил-N-феніл-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазоли	0	0,6	33,6	34,3		
35	4-(біфеніл-4-іл)-N-метил-N-феніл-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли	103,1					
36	N-(4-фторфеніл)-4-(4-метоксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли	5					
37	(3,4-дигідрохінолін-1(2H)-іл)(4-феніл-1H-імідазол-1-іл)метанон	Імідазоли	51,7					
38	4-(4-гідроксифеніл)-N-метил-N-феніл-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли	0	83,9				
39	(3,4-дигідрохінолін-1(2H)-іл)(4-(3-метоксифеніл)-1H-імідазол-1-іл)метанон	Імідазоли	16				120,6	101,1
40	4-(3-гідроксифеніл)-N-метил-N-феніл-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли	0,1	88,8	81,5	4,5	102,8	25,6
41	(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(4-фенілпіперазин-1-іл)метанон	Бензотриазоли	0	0	87,6	30		
42	(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(4-бензилпіперазин-1-іл)метанон	Бензотриазоли	0	0	8,4	6,4		
43	4-(4-хлорфеніл)-N-(4-фторфеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли	0,1	88				
44	(3,4-дигідрохінолін-1(2H)-іл)(4-(4-фторфеніл)-1H-імідазол-1-іл)метанон	Імідазоли		97,8				
45	4-(2-фторфеніл)-N-(4-фторфеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		83				
46	(5-фтор-1H-індол-1-іл)(морфоліно)метанон	Індоли		104,3				
47	(5-метокси-1H-індол-1-іл)(морфоліно)метанон	Індоли		97,2				
48	(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(4-(бензо[d][1,3]діоксол-5-ілметил)піперазин-1-іл)метанону оксалат	Бензотриазоли		0,1	21,8	20,1		
49	(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(4-(піридин-2-іл)піперазин-1-іл)метанон	Бензотриазоли		0,1	16,9	14,9		
50	(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(3,4-дигідроізохінолін-2(1H)-іл)метанон	Бензотриазоли		0	32,6	7,8		
51	(3,4-дигідрохінолін-1(2H)-іл)(4-(3-гідроксифеніл)-1H-імідазол-1-іл)метанон	Імідазоли		100,8			130,4	132,3
52	(5-гідрокси-1H-індол-1-іл)(морфоліно)метанон	Індоли		102,7				
53	N-бензил-N-метил-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазоли		0	1,4	6,3		
54	N-(4-фторфеніл)-4-(4-гідроксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		91				
55	1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл(1,4-диокса-8-азаспіро[4,5]дец-8-ил)метанон	Бензотриазоли		0,2	2,2	2,5	42,6	37,8
56	N-(4-феноксифеніл)-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазоли		90,7				

Таблиця 1

	Назва	Клас	In Vitro			In Vivo		
			10 мкМ	100 нМ	BRh 30 мг.кг, 1 год	LVh 30 мг.кг, 1 год	BRh 3 мг.кг, 8 год	LVh 3 мг.кг, 8 год
57	N-(4-метоксифеніл)-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазолі		96,9				
58	N-циклогексил-N-метил-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазолі		1	0,3	0,9	0,5	0,3
59	N-(2,4-дифторфеніл)-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазолі		100,4				
60	N-феніл-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазолі		93,8				
61	N-бензил-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазолі		2,2	87,5	83,9		
62	N-(4-хлорфеніл)-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазолі		93,7				
63	N-(4-хлорфеніл)-N-метил-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазолі		12,6	57	49,7		
64	3-(4-метоксифеніл)-N-метил-N-феніл-1H-1,2,4-триазол-1-карбоксамід	1,2,4-Триазолі		67,9				
65	(3-(4-метоксифеніл)-1H-1,2,4-триазол-1-іл)(морфоліно)метанон	1,2,4-Триазолі		86,5				
66	N-(4-фторфеніл)-3-(4-метоксифеніл)-N-метил-1H-1,2,4-триазол-1-карбоксамід	1,2,4-Триазолі		80,9				
67	3-(4-хлорфеніл)-N-метил-N-феніл-1H-1,2,4-триазол-1-карбоксамід	1,2,4-Триазолі		61				
68	(3-(4-хлорфеніл)-1H-1,2,4-триазол-1-іл)(морфоліно)метанон	1,2,4-Триазолі		73,5				
69	3-(4-хлорфеніл)-N-(4-фторфеніл)-N-метил-1H-1,2,4-триазол-1-карбоксамід	1,2,4-Триазолі		80,8				
70	N-(2,4-дифторфеніл)-N-метил-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазолі		1,9	52	42,5		
71	(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(4,4-диметилпексазолідин-3-іл)метанон	Бензотриазолі	0,1	2,3	0,3	2,2	1,8	2,5
72	(3-хлор-1H-індазол-1-іл)(морфоліно)метанон	Індазол		87,6				
73	морфоліно(3-феніл-1H-1,2,4-триазол-1-іл)метанон	1,2,4-Триазолі		85,8				
74	N-(2,4-дифторфеніл)-N-метил-3-феніл-1H-1,2,4-триазол-1-карбоксамід	1,2,4-Триазолі		73,2				
75	N-бутил-N-метил-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазолі		0	0,4	2,7		
76	N-метил-N-(4-морфолінофеніл)-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазолі		97,1				
77	N-(3,5-диметоксифеніл)-N-метил-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазолі		76,3				
78	(3-(2,4-дифторфеніл)-1H-1,2,4-триазол-1-іл)(морфоліно)метанон	1,2,4-Триазолі		81,9				
79	(4-бензилпіперидин-1-іл)(3-(2,4-дифторфеніл)-1H-1,2,4-триазол-1-іл)метанон	1,2,4-Триазолі		0,8	10,3	9,8	70	45,2
80	N,3-біс(2,4-дифторфеніл)-N-метил-1H-1,2,4-триазол-1-карбоксамід	1,2,4-Триазолі		89,5				
81	N-(4-(диметиламіно)феніл)-N-метил-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазолі		49,2				
82	1,4'-біпіперидин-1'-іл(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)метанону гідрохлорид	Бензотриазолі		69,3				
83	(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(4-метилпіперазин-1-іл)метанону гідрохлорид	Бензотриазолі		2,5				
84	N-метил-N-(піридин-2-іл)-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазолі		62,5				
85	N-(4-фенілбутил)-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазолі		0,1				
86	N-dodecyl-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазолі		0				
87	N-циклогексил-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазолі		0			3,4	4
88	N-(біфеніл-4-іл)-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазолі		105,4				
89	морфоліно(4-феніл-1H-1,2,3-триазол-1-іл)метанон	1,2,3-Триазолі		4,5				

Таблиця 1

	Назва	Клас	In Vitro			In Vivo		
			10 мкМ	100 нМ	BRh 30 мг.кг, 1 год	LVh 30 мг.кг, 1 год	BRh 3 мг.кг, 8 год	LVh 3 мг.кг, 8 год
90	(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(4-морфолінопіперидин-1-іл)метанону гідрохлорид	Бензотриазоли		38,6				
91	(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(4-(4-бензилокси)феніл)піперазин-1-іл)метанон	Бензотриазоли		0				
92	(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(4-(піролідин-1-іл)піперидин-1-іл)метанону гідрохлорид	Бензотриазоли		96				
93	(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(4-бензилпіперазин-1-іл)метанону гідрохлорид	Бензотриазоли		0				
94	(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(4-фенілпіперидин-1-іл)метанон	Бензотриазоли		0				
95	5-(3-ціанофеніл)-N-циклогексил-N-метил-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазоли		0,7				
96	N-циклогексил-5-(4-фторфеніл)-N-метил-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазоли		14,3				
97	5-бром-N-циклогексил-N-метил-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазоли		0				
98	(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(піролідин-1-іл)метанон	Бензотриазоли		0,6				
99	(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(4-(p-толілокси)піперидин-1-іл)метанон	Бензотриазоли		0,2			99,1	71,4
100	(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(4-фенетилпіперидин-1-іл)метанон	Бензотриазоли		0,2			68,1	40,5
101	(4-феніл-1H-імідазол-1-іл)(4-фенілпіперазин-1-іл)метанон	Імідазоли		0,5				
102	(4-бензилпіперазин-1-іл)(4-феніл-1H-імідазол-1-іл)метанон	Імідазоли		0,9				
103	N-циклогексил-N-метил-4-феніл-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли	0	37,5				
104	N-циклогексил-N-етил-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазоли		94,2				
105	(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(4-(2-(піролідин-1-іл)етил)піперидин-1-іл)метанону гідрохлорид	Бензотриазоли		64,7				
106	N-циклогексил-6-(4-фторфеніл)-N-метил-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазоли		2,3				
107	3-(1-(циклогексил(метил)карбамоїл)-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-5-іл)бензойна кислота	Бензотриазоли		13,5				
108	5-(3-карбамоїлфеніл)-N-циклогексил-N-метил-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазоли		7,4				
109	6-(3-карбамоїлфеніл)-N-циклогексил-N-метил-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазоли		0				
110	(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(4-(3-фенілпропіл)піперидин-1-іл)метанон	Бензотриазоли		0,1			51,7	10,2
111	(3-феніл-1H-1,2,4-триазол-1-іл)(4-фенілпіперазин-1-іл)метанон	1,2,4-Триазоли		1,5				
112	4-(1-(4-бензилпіперазин-1-карбоніл)-1H-імідазол-4-іл)бензамід	Імідазоли		7,2				
113	4-(4-карбамоїлфеніл)-N-метил-N-феніл-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		90,3			84,1	32,3
114	(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(4-(піридин-4-іл)піперидин-1-іл)метанон	Бензотриазоли		0,1			102,9	109,9
115	N-метил-N-фенетил-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазоли		0				
116	(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(4-(3-(піридин-3-іл)-1,2,4-оксадіазол-5-іл)піперидин-1-іл)метанон	Бензотриазоли		0,5			126,2	113,2
117	(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(4-(4-хлорфенокси)піперидин-1-іл)метанон	Бензотриазоли		0,1				
118	N-метил-N-(3-фенілпропіл)-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазоли		0				
119	N-(3-метоксибензил)-N-метил-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазоли		0				
120	(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(4-феноксипіперидин-1-іл)метанон	Бензотриазоли		0,1				

Таблиця 1

	Назва	Клас	In Vitro			In Vivo		
			10 мкМ	100 нМ	BRh 30 мг.кг, 1 год	LVh 30 мг.кг, 1 год	BRh 3 мг.кг, 8 год	LVh 3 мг.кг, 8 год
121	(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(4-(4-фторбензил)піперазин-1-іл)метанон	Бензотриазолі		0			118,6	116,1
122	(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(4-(4-метилпіперазин-1-іл)піперидин-1-іл)метанону гідрохлорид	Бензотриазолі		93				
123	N-(3-хлорбензил)-N-метил-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазолі		0				
124	(4-бензилпіперазин-1-іл)(3-феніл-1H-1,2,4-триазол-1-іл)метанону гідрохлорид	1,2,4-Триазолі		1,5				
125	(3-(4-(бензилокси)феніл)-1H-1,2,4-триазол-1-іл)(4-бензилпіперазин-1-іл)метанону гідрохлорид	1,2,4-Триазолі		53,5				
126	N-адамантил-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазолі		0			0,2	2,2
127	(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(4-циклогексилпіперазин-1-іл)метанон	Бензотриазолі		0,1			111,5	107,3
128	(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(4-(бензилокси)піперидин-1-іл)метанон	Бензотриазолі		0				
129	N-метил-N-(5-фенілпентил)-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазолі		0			2,5	2
130	N-(4-фторбензил)-N-метил-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазолі		0				
131	N-метил-N-(нафталін-2-ілметил)-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазолі		0				
132	(3-(4-(4-метилпіперазин-1-іл)феніл)-1H-1,2,4-триазол-1-іл)(4-(п-толілокси)піперидин-1-іл)метанону гідрохлорид	1,2,4-Триазолі		85,1				
133	(3-(4-(4-бензилпіперазин-1-іл)феніл)-1H-1,2,4-триазол-1-іл)(морфоліно)метанон	1,2,4-Триазолі		90,7				
134	(3-(2,4-дифторфеніл)-1H-1,2,4-триазол-1-іл)(4-(p-толілокси)піперидин-1-іл)метанон	1,2,4-Триазолі		34,5				
135	(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(4-(3-фенілпропокси)піперидин-1-іл)метанон	Бензотриазолі		0,1			26,5	30,1
136	(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(4-(4-гідроксифеніл)піперазин-1-іл)метанон	Бензотриазолі		0,2				
137	(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(4-(4-метоксифенокси)піперидин-1-іл)метанон	Бензотриазолі		0,1				
138	N,N-диметил-3-(4-(4-фенілпіперазин-1-іл)феніл)-1H-1,2,4-триазол-1-карбоксамід	1,2,4-Триазолі		83,8				
139	(3-(4-(4-метилпіперазин-1-іл)феніл)-1H-1,2,4-триазол-1-іл)(морфоліно)метанон	1,2,4-Триазолі		80,2			97,1	105,7
140	3-(4-(4-ціанофенокси)феніл)-N,N-диметил-1H-1,2,4-триазол-1-карбоксамід	1,2,4-Триазолі		58,6				
141	4-(4-(1-(морфолін-4-карбоніл)-1H-1,2,4-триазол-3-іл)фенокси)бензонітрил	1,2,4-Триазолі		15,9				
142	(R)-N-(хінуклідин-3-іл)-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід гідрохлорид	Бензотриазолі		101,8				
143	N-(3,3-диметил-1,5-диоксаспіро[5,5]ундец-9-іл)-N-метил-1H-бензотриазол-1-карбоксамід	Бензотриазолі		2,5			0,4	0,7
144	(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(4-(2-(4-метоксифенокси)етил)піперидин-1-іл)метанон	Бензотриазолі		0,1			68,2	17,6
145	4-(4-(1-(4-фенілпіперазин-1-карбоніл)-1H-1,2,4-триазол-3-іл)фенокси)бензонітрил гідрохлорид	1,2,4-Триазолі		0,3			89,9	116,5
146	3-(4-(4-карбамоїлфенокси)феніл)-N,N-диметил-1H-1,2,4-триазол-1-карбоксамід	1,2,4-Триазолі		77,1				
147	4-(4-(1-(морфолін-4-карбоніл)-1H-1,2,4-триазол-3-іл)фенокси)бензамід	1,2,4-Триазолі		55,1			124,4	103
148	4-(4-(1-(4-фенілпіперазин-1-карбоніл)-1H-1,2,4-триазол-3-іл)фенокси)бензамід	1,2,4-Триазолі		0,3			113,7	87,6
149	3-(4-(4-карбамоїлфенокси)феніл)-N-метил-N-феніл-1H-1,2,4-триазол-1-карбоксамід	1,2,4-Триазолі		49,9				
150	N-бензил-4-(4-фторфеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазолі		1,2			5,6	3,8
151	N-бензил-3-(4-(4-карбамоїлфенокси)феніл)-N-метил-1H-1,2,4-триазол-1-карбоксамід	1,2,4-Триазолі		0,4			116,7	65,8

Таблиця 1

	Назва	Клас	In Vitro			In Vivo		
			10 мкМ	100 нМ	BRh 30 мг.кг, 1 год	LVh 30 мг.кг, 1 год	BRh 3 мг.кг, 8 год	LVh 3 мг.кг, 8 год
152	N-((1r,4r)-4-(бензилокси)циклогексил)-N-метил-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазолі		1,3				
153	(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(4-((3-метоксифенокси)метил)піперидин-1-іл)метанон	Бензотриазолі		0				
154	(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(4-циклопентилпіперазин-1-іл)метанон	Бензотриазолі		0,2				
155	(4-фенілпіперазин-1-іл)(3-(тіофен-2-іл)-1H-1,2,4-триазол-1-іл)метанон	1,2,4-Триазолі		0,4			144,1	108,2
156	N-(2-(бензилокси)етил)-N-метил-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазолі		0,1			67,2	24,4
157	N-(2-(4-метоксифенокси)етил)-N-метил-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазолі		0			5,2	3,5
158	(4-бензилпіперазин-1-іл)(3-(тіофен-2-іл)-1H-1,2,4-триазол-1-іл)метанону гідрохлорид	1,2,4-Триазолі		0,3			92	85,6
159	(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(4-гідроксипіперидин-1-іл)метанон	Бензотриазолі		4,8				
160	3-бензил-N-метил-N-феніл-1H-1,2,4-триазол-1-карбоксамід	1,2,4-Триазолі		18,8				
161	(4,4-диметиллоксазолідин-3-іл)(4-феніл-1H-імідазол-1-іл)метанон	Імідазолі	3,3	93,6				
162	(6-бром-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(4,4-диметиллоксазолідин-3-іл)метанон	Бензотриазолі		0			0,9	3,1
163	3-(3-(4,4-диметиллоксазолідин-3-карбоніл)-3H-бензо[d][1,2,3]триазол-5-іл)бензамід	Бензотриазолі		0,6			6,3	2,4
164	(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(4-(4-(бензилокси)фенокси)піперидин-1-іл)метанон	Бензотриазолі		0,3				
165	(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(4-((4-метоксифенокси)метил)піперидин-1-іл)метанон	Бензотриазолі		0				
166	(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(4-(3-метоксифенокси)піперидин-1-іл)метанон	Бензотриазолі		0				
167	1-[(1,1-диоксидо-1,3-тіазолідин-3-іл)карбоніл]-1H-бензотриазол	Бензотриазолі		96,2			99,9	104
168	(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(4-(4-бутоксифенокси)піперидин-1-іл)метанон	Бензотриазолі		0				
169	N-метокси-N-метил-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазолі		73,6				
170	(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(тіазолідин-3-іл)метанон	Бензотриазолі		2,1				
171	азосап-1-іл(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)метанон	Бензотриазолі		15,2				
172	азепан-1-іл(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)метанон	Бензотриазолі		0,3				
173	(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)((2R,6S)-2,6-диметилпіперидин-1-іл)метанон	Бензотриазолі		70,6				
174	(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(ізоіндолін-2-іл)метанон	Бензотриазолі		0,7				
175	(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(3,5-диметилпіперидин-1-іл)метанон	Бензотриазолі		21				
176	етил 1-(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоніл) піперидин-4-карбоксилат	Бензотриазолі		0,2				
177	етил 4-(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоніл) піперазин-1-карбоксилат	Бензотриазолі		6,9				
178	1-(4-(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоніл)піперазин-1-іл)етанон	Бензотриазолі		94,5				
179	1-(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоніл)піперидин-4-карбоксамід	Бензотриазолі		49				
180	N-метил-N-феніл-3-(тіофен-2-іл)-1H-1,2,4-триазол-1-карбоксамід	1,2,4-Триазолі		57,5				
181	N-бензил-N-метил-3-(тіофен-2-іл)-1H-1,2,4-триазол-1-карбоксамід	1,2,4-Триазолі		0,9				
182	(3-бензил-1H-1,2,4-триазол-1-іл)(4-фенілпіперазин-1-іл)метанон	1,2,4-Триазолі		0,6			90,6	111
183	(3-(2,4-дифторфеніл)-1H-1,2,4-триазол-1-іл)(4,4-диметиллоксазолідин-3-іл)метанон	1,2,4-Триазолі		102			92,4	78,1

Таблиця 1

	Назва	Клас	In Vitro			In Vivo		
			10 мкМ	100 нМ	BRh 30 мг.кг, 1 год	LVh 30 мг.кг, 1 год	BRh 3 мг.кг, 8 год	LVh 3 мг.кг, 8 год
184	(3,4-дигідроізохінолін-2(1H)-іл)(4-феніл-1H-імідазол-1-іл)метанон	Імідазоли		30,2				
185	(3-(4-хлорфеніл)-1H-1,2,4-триазол-1-іл)(3,4-дигідроізохінолін-2(1H)-іл)метанон	1,2,4-Триазоли		71,8				
186	(4-(4-хлорфеніл)-1H-імідазол-1-іл)(4,4-диметиллоксазолідин-3-іл)метанон	Імідазоли		96,5			78,7	37,7
187	4-(4-(1-(4,4-диметиллоксазолідин-3-карбоніл)-1H-1,2,4-триазол-3-іл)фенокси)бензамід	1,2,4-Триазоли		92,8			85,6	108,6
188	(4,4-диметиллоксазолідин-3-іл)(3-(4-метоксифеніл)-1H-1,2,4-триазол-1-іл)метанон	1,2,4-Триазоли		103,3			78,7	89
189	(3-(4-хлорфеніл)-1H-1,2,4-триазол-1-іл)(4,4-диметиллоксазолідин-3-іл)метанон	1,2,4-Триазоли		98,5			105,9	87,6
190	N-бензил-N-метил-3-(нафталін-2-іл)-1H-1,2,4-триазол-1-карбоксамід	1,2,4-Триазоли		20,7				
191	N-бензил-N-метил-3-(нафталін-1-іл)-1H-1,2,4-триазол-1-карбоксамід	1,2,4-Триазоли		21			60	20,8
192	N-метил-3-(нафталін-1-іл)-N-феніл-1H-1,2,4-триазол-1-карбоксамід	1,2,4-Триазоли		64,6				
193	(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)((2R,6R)-2,6-диметилморфоліно)метанон	Бензотриазоли		110,2				
194	(1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)((2S,6R)-2,6-диметилморфоліно)метанон	Бензотриазоли		64,2				
195	(S)-N-метил-N-(1-фенілетил)-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазоли		15,7			9,1	5,7
196	(4-(біфеніл-3-іл)-1H-імідазол-1-іл)(4-фенілпіперазин-1-іл)метанон	Імідазоли		2,5			88,1	78,3
197	(4-(4-хлорфеніл)-1H-імідазол-1-іл)(4-(3-фенілпропіл)піперидин-1-іл)метанон	Імідазоли		0,3				
198	(4-(3,4-дихлорфеніл)-1H-імідазол-1-іл)(1,4-диокса-8-азаспіро[4,5]декан-8-іл)метанон	Імідазоли		33				
199	4-(4-амінофеніл)-N-метил-N-феніл-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		89			45,9	19,7
200	N-метил-N-феніл-4-(3-(2-(піперазин-1-іл)етокси)феніл)-1H-імідазол-1-карбоксаміду дигідрохлорид	Імідазоли		100,1				
201	(4-циклогексилпіперазин-1-іл)(4-(3,4-дифторфеніл)-1H-імідазол-1-іл)метанон	Імідазоли		0,3				
202	N-(2-(бензилокс)етил)-N-етил-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазоли		0,1				
203	N-метил-N-феніл-4-(4-(2-(піперазин-1-іл)етокси)феніл)-1H-імідазол-1-карбоксамід дигідрохлорид	Імідазоли		93,5			101,8	64,3
204	(3-(4-хлорфеніл)-1H-1,2,4-триазол-1-іл)(1,4-диокса-8-азаспіро[4,5]декан-8-іл)метанон	1,2,4-Триазоли		15,8				
205	(3-(4-метоксифеніл)-1H-1,2,4-триазол-1-іл)(4-(3-фенілпропіл)піперидин-1-іл)метанон	1,2,4-Триазоли		0,2				
206	(3-(нафталін-1-іл)-1H-1,2,4-триазол-1-іл)(4-фенілпіперазин-1-іл)метанон	1,2,4-Триазоли		3,3				
207	4-(3-(1-(1,2,3,4-тетрагідроізохінолін-2-карбоніл)-1H-1,2,4-триазол-3-іл)фенокси)бензамід	1,2,4-Триазоли		31,6				
208	4-(3-(1-(4-фенілпіперазин-1-карбоніл)-1H-1,2,4-триазол-3-іл)фенокси)бензамід	1,2,4-Триазоли		0,2			97,2	96,7
209	4-(3-(1-(4,4-диметиллоксазолідин-3-карбоніл)-1H-1,2,4-триазол-3-іл)фенокси)бензамід	1,2,4-Триазоли		101,5			99,8	70,1
210	4-(3-(1-(морфолін-4-карбоніл)-1H-1,2,4-триазол-3-іл)фенокси)бензамід	1,2,4-Триазоли		73,3				
211	(4-(4-фторфеніл)піперазин-1-іл)(3-(4-метоксифеніл)-1H-1,2,4-триазол-1-іл)метанон	1,2,4-Триазоли		1,9				
212	(3-(4-хлорфеніл)-1H-1,2,4-триазол-1-іл)(4-циклогексилпіперазин-1-іл)метанону гідрохлорид	1,2,4-Триазоли		0,8				
213	(4,4-диметиллоксазолідин-3-іл)(3-(тіофен-2-іл)-1H-1,2,4-триазол-1-іл)метанон	1,2,4-Триазоли		105,6			53,7	6,9
214	(3-(4-хлорфеніл)-1H-1,2,4-триазол-1-іл)(тіазолідин-3-іл)метанон	1,2,4-Триазоли		23,7				

Таблиця 1

	Назва	Клас	In Vitro			In Vivo		
			10 мкМ	100 нМ	BRh 30 мг.кг, 1 год	LVh 30 мг.кг, 1 год	BRh 3 мг.кг, 8 год	LVh 3 мг.кг, 8 год
215	(4-(3,4-дифторфеніл)-1Н-імідазол-1-іл)(тіазолідин-3-іл)метанон	Імідазоли		16,7				
216	(4-(3,4-диметоксифеніл)-1Н-імідазол-1-іл)(4,4-диметиллоксазолідин-3-іл)метанон	Імідазоли	38,3	108,6			29,3	13,3
217	N-циклогексил-4-(3,4-диметоксифеніл)-N-метил-1Н-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли	0	80,5			6	4,2
218	(4-(3,4-дихлорфеніл)-1Н-імідазол-1-іл)(піролідин-1-іл)метанон	Імідазоли		31,6				
219	(1Н-бензо[d]імідазол-1-іл)(4,4-диметиллоксазолідин-3-іл)метанон	Імідазоли	50,6	111,6			86,8	89
220	(2,2-диметиллоксазолідин-3-іл)(4-феніл-1Н-імідазол-1-іл)метанон	Імідазоли		103,7			31,5	20
221	((2R,6S)-2,6-диметилпіперидин-1-іл)(4-феніл-1Н-імідазол-1-іл)метанон	Імідазоли		105,8			104,5	44,9
222	N-циклогексил-N-метил-1Н-бензо[d]імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		102,9			111,5	59,2
223	(4-(4-хлорфеніл)-1Н-імідазол-1-іл)(4-(4-фторфеніл)піперазин-1-іл)метанон	Імідазоли		1,1				
224	N-метил-N-феніл-4-(4-(2-піперидин-1-іл)етокси) феніл-1Н-імідазол-1-карбоксамід у гідробромід	Імідазоли		90				
225	(4-(4-(бензилокси)-3-метоксифеніл)-1Н-імідазол-1-іл)(4,4-диметиллоксазолідин-3-іл)метанон	Імідазоли		79				
226	(4,4-диметиллоксазолідин-3-іл)(4-(піридин-3-іл)-1Н-імідазол-1-іл)метанону дигідрохлорид	Імідазоли		76,6			8,4	5,1
227	(2-метиллоксазолідин-3-іл)(4-феніл-1Н-імідазол-1-іл)метанон	Імідазоли		64,7				
228	(4,4-диметиллоксазолідин-3-іл)(4-(4-гідрокси-3-метоксифеніл)-1Н-імідазол-1-іл)метанон	Імідазоли		78,1			56,4	31,9
229	N-АДАМАНТИЛ-N-МЕТИЛ-4-ФЕНІЛ-1Н-ІМІДАЗОЛ-1-КАРБОКСАМІД	Імідазоли		99,2				
230	N-метил-4-(4-(2-морфоліноетокси)феніл)-N-феніл-1Н-імідазол-1-карбоксамід у гідрохлорид	Імідазоли		96,1				
231	(4-(біфеніл-3-іл)-1Н-імідазол-1-іл)(4,4-диметиллоксазолідин-3-іл)метанон	Імідазоли		54,2			3,9	3,6
232	3'-(1-(4,4-диметиллоксазолідин-3-карбоніл)-1Н-імідазол-4-іл)біфеніл-3-карбоксамід	Імідазоли	0	84,7			82,8	6,5
233	(4-(4-хлорфеніл)-1Н-імідазол-1-іл)(2-етил-2-метиллоксазолідин-3-іл)метанон	Імідазоли		74,1			33,5	21,1
234	2-(N-циклопентеніл-4-феніл-1Н-імідазол-1-карбохамід)етил 4-феніл-1Н-імідазол-1-карбоксилат	Імідазоли		78,2				
235	(4-(4-хлорфеніл)-1Н-імідазол-1-іл)(2,4,4-триметиллоксазолідин-3-іл)метанон	Імідазоли		76,2			108,5	80,1
236	(4,4-диметиллоксазолідин-3-іл)(4-(3'-метоксибіфеніл-3-іл)-1Н-імідазол-1-іл)метанон	Імідазоли		75,4			67,7	37,7
237	N-АДАМАНТИЛ-4-ФЕНІЛ-1Н-ІМІДАЗОЛ-1-КАРБОКСАМІД	Імідазоли		91,6				
238	4-(3'-карбамоїлбіфеніл-3-іл)-N-циклогексил-N-метил-1Н-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		1,2			67,9	2,8
239	4-(біфеніл-3-іл)-N-циклогексил-N-метил-1Н-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		4			16,4	4,6
240	N-циклогексил-4-(3'-метоксибіфеніл-3-іл)-N-метил-1Н-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		22,4			99	39,5
241	(4-(4-хлорфеніл)-1Н-імідазол-1-іл)(2-фенілоксазолідин-3-іл)метанон	Імідазоли		76,5				
242	N-циклогексил-6-гідрокси-N-метил-1Н-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазоли		0				
243	3-(1-(4,4-диметиллоксазолідин-3-карбоніл)-1Н-бензо[d][1,2,3]триазол-5-іл)бензамід	Бензотриазоли		39,7				
244	4-(4-хлорфеніл)-N-циклопентил-N-метил-1Н-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		5,4				
245	4-(4'-карбамоїлбіфеніл-3-іл)-N-циклогексил-N-метил-1Н-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		0,4			90,6	15,8

Таблиця 1

	Назва	Клас	In Vitro			In Vivo		
			10 мкМ	100 нМ	BRh 30 мг.кг, 1 год	LVh 30 мг.кг, 1 год	BRh 3 мг.кг, 8 год	LVh 3 мг.кг, 8 год
246	N-циклогексил-4-(3'-фторбіфеніл-3-іл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		2,9				
247	N-циклогексил-4-(3'-гідроксибіфеніл-3-іл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		0,5			131,7	85,5
248	N-циклогексил-N-метил-4-(3'-(трифторметокси)біфеніл-3-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		68,9			104,2	57
249	N-бензил-4-(4-хлорфеніл)-N-ізопропіл-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		95,8				
250	N-бензил-N-ізопропіл-4-феніл-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		90,5			102,1	52,6
251	N-бензил-N-трет-бутил-4-феніл-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		91,7				
252	N-бензил-N-трет-бутил-4-(4-хлорфеніл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		83,6				
253	3-(4-хлорфеніл)-1-[(1,1-диоксидо-1,3-тіазолідин-3-іл)карбоніл]-1H-1,2,4-триазол	1,2,4-Триазоли		107,7				
254	N-циклогексил-N,5-диметил-4-феніл-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли	109	81			98,3	89,9
255	N-бензил-N-ізопропіл-4-(3-метоксифеніл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		96,7				
256	N-бензил-N-трет-бутил-4-(3-метоксифеніл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		105,6				
257	4-(3'-хлорбіфеніл-3-іл)-N-циклогексил-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		65,6			60,1	12,2
258	N-циклогексил-4-(3'-етоксибіфеніл-3-іл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		39,9				
259	4-(5'-хлор-2'-фторбіфеніл-3-іл)-N-циклогексил-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		33,7				
260	(4,4-диметиллоксазолідин-3-іл)(4-(4-гідроксифеніл)-1H-імідазол-1-іл)метанон	Імідазоли	37,3	95,3			8,1	7,8
261	N-циклогексил-4-(4-гідроксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли	0	54,1			1,2	1,2
262	N-циклопентил-4-(3-гідроксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		7,5				
263	(4,4-диметиллоксазолідин-3-іл)(5-метил-4-феніл-1H-імідазол-1-іл)метанон	Імідазоли		92,1			98,1	98,8
264	N-бензил-N,5-диметил-4-феніл-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		88			115	76,6
265	N-бензил-4-(3-гідроксифеніл)-N-ізопропіл-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		99,6				
266	N-циклопентил-N-метил-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазоли		0,2				
267	(4-(4-хлорфеніл)-1H-імідазол-1-іл)(5-етил-2,2-диметиллоксазолідин-3-іл)метанон	Імідазоли		84,1			79,4	83,7
268	(5-хлор-4-феніл-1H-імідазол-1-іл)(2,2-диметиллоксазолідин-3-іл)метанон	Імідазоли		104,1				
269	(2,5-дихлор-4-(4-хлорфеніл)-1H-імідазол-1-іл)(4,4-диметиллоксазолідин-3-іл)метанон	Імідазоли		106,2				
270	(5-етил-2,2-диметиллоксазолідин-3-іл)(4-феніл-1H-імідазол-1-іл)метанон	Імідазоли		113,1				
271	N-циклогексил-4-(2-метоксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		55,8				
272	N-циклогексил-4-(3,4-дифторфеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		63,6			19	7,1
273	N-циклогексил-4-(4-фторфеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		65,1			3,4	2,6
274	N-циклогексил-4-(3,4-дихлорфеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		85				
275	N-циклогексил-N-метил-4-(3-нітрофеніл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		43,8			12,8	2,4
276	N-циклогексил-4-(4-(дифторметокси)феніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		71,5			1,4	2
277	4-(4-хлорфеніл)-N-циклогексил-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		72,1				
278	N-метил-4-феніл-N-(тетрагідро-2H-піран-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		103,5			1,6	1,8

Таблиця 1

	Назва	Клас	In Vitro			In Vivo		
			10 мкМ	100 нМ	BRh 30 мг.кг, 1 год	LVh 30 мг.кг, 1 год	BRh 3 мг.кг, 8 год	LVh 3 мг.кг, 8 год
279	N-циклогексил-N,2-диметил-4-феніл-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		87,3			91,6	94,1
280	(5-хлор-4-(4-хлорфеніл)-1H-імідазол-1-іл)(4,4-диметилпексазолідин-3-іл)метанон	Імідазоли		111,8				
281	N-циклопентил-4-(3,4-диметоксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		25,5				
282	N-(1-бензилпіперидин-4-іл)-N-метил-4-феніл-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		40,9			0,5	1,6
283	N-циклогексил-N-метил-3-феніл-1H-1,2,4-триазол-1-карбоксамід	1, 2, 4 -Триазоли		75,1				
284	N-циклогексил-N,5-диметил-3-феніл-1H-1,2,4-триазол-1-карбоксамід	1, 2, 4 -Триазоли		146,2			130,7	145,6
285	(4,4-диметилпексазолідин-3-іл)(3-феніл-1H-1,2,4-триазол-1-іл)метанон	1, 2, 4 -Триазоли		85,4				
286	(4,4-диметилпексазолідин-3-іл)(5-метил-3-феніл-1H-1,2,4-триазол-1-іл)метанон	1, 2, 4 -Триазоли		112,8			104	93
287	4-(3'-карбамоїлбифеніл-3-іл)-N-метил-N-трицикло [3,3,1,13,7]дец-1-ил-1H-імідазол-1-карбоксамід - пропан-2-ол (1:1)	Імідазоли		127,3			105,8	85,7
288	4-[3-(бензилокси)феніл]-N-метил-N-трицикло [3,3,1,13,7]дец-1-ил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		114,8				
289	N-метил-4-піридин-3-іл-N-трицикло[3,3,1,13,7]дец-1-ил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		109,8			113,2	96,1
290	4-біфеніл-3-іл-N-метил-N-трицикло[3,3,1,13,7]дец-1-ил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					115	112,4
291	N-метил-4-(3-піридин-4-ілфеніл)-N-трицикло [3,3,1,13,7]дец-1-ил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
292	(4-(4-хлорфеніл)-1H-імідазол-1-іл)(2,2-диметил-5-фенілоксазолідин-3-іл)метанон	Імідазоли						
293	(4,4-диметилпексазолідин-3-іл)(6-метокси-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)метанон	Бензотриазоли					3,5	1,7
294	N-циклопентил-4-(4-гідроксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					1,4	1,4
295	(5-хлор-4-феніл-1H-імідазол-1-іл)(4,4-диметилпексазолідин-3-іл)метанон	Імідазоли		99,2			77,9	32,4
296	4-(3-гідроксифеніл)-N-метил-N-трицикло [3,3,1,13,7]дец-1-ил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
297	N-((1r,4r)-4-гідроксициклогексил)-N-метил-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазоли						
298	(2,2-диметил-5-фенілоксазолідин-3-іл)(4-феніл-1H-імідазол-1-іл)метанон	Імідазоли					74,4	59,2
299	(4-(4-хлорфеніл)-1H-імідазол-1-іл)(2,2-диметилпексазолідин-3-іл)метанон	Імідазоли						
300	5-хлор-N-циклогексил-N-метил-4-феніл-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
301	(5-бром-4-(4-хлорфеніл)-1H-імідазол-1-іл)(4,4-диметилпексазолідин-3-іл)метанон	Імідазоли						
302	(4-етилпексазолідин-3-іл)(4-феніл-1H-імідазол-1-іл)метанон	Імідазоли						
303	(4-(3,4-дифторфеніл)-1H-імідазол-1-іл)(4-етилпексазолідин-3-іл)метанон	Імідазоли						
304	(4-етилпексазолідин-3-іл)(4-(3-метоксифеніл)-1H-імідазол-1-іл)метанон	Імідазоли						
305	N-метил-4-(3-піридин-3-ілфеніл)-N-трицикло [3,3,1,13,7]дец-1-ил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
306	N-метил-4-(3-піримідин-5-ілфеніл)-N-трицикло [3,3,1,13,7]дец-1-ил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
307	N-циклогексил-4-(3-гідроксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		56,2			137,6	10,1
308	(4-(3,4-дифторфеніл)-1H-імідазол-1-іл)(5-фенілоксазолідин-3-іл)метанон	Імідазоли		2,5				

Таблиця 1

	Назва	Клас	In Vitro			In Vivo		
			10 мкМ	100 нМ	BRh 30 мг.кг, 1 год	LVh 30 мг.кг, 1 год	BRh 3 мг.кг, 8 год	LVh 3 мг.кг, 8 год
309	(4-феніл-1Н-імідазол-1-іл)(5-фенілоксазолідин-3-іл) метанон	Імідазоли						
310	(4-метилоксазолідин-3-іл)(4-феніл-1Н-імідазол-1-іл) метанон	Імідазоли						
311	(4-(3,4-дифторфеніл)-1Н-імідазол-1-іл)(4-метилоксазолідин-3-іл)метанон	Імідазоли						
312	N-циклогексил-N-етил-4-феніл-1Н-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
313	N-циклогексил-4-(3,4-диметоксифеніл)-N-етил-1Н-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
314	N-циклогексил-4-(3-фтор-4-метоксифеніл)-N-метил-1Н-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		84,3			84,3	48
315	N-циклопентил-4-(3-фтор-4-метоксифеніл)-N-метил-1Н-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
316	(4,4-диметилоксазолідин-3-іл)(4-(3-фтор-4-метоксифеніл)-1Н-імідазол-1-іл)метанон	Імідазоли						
317	4-[4'-(диметиламіно)біфеніл-3-іл]-N-метил-N-трицикло [3,3,1,13,7]дец-1-ил-1Н-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
318	4-[3-(2,4-диметоксипіримідин-5-іл)феніл]-N-метил-N-трицикло[3,3,1,13,7]дец-1-ил-1Н-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
319	N-циклогексил-4-(4-фтор-3-метоксифеніл)-N-метил-1Н-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		19,2			5,9	2
320	4-[3-(6-фторпіридин-3-іл)феніл]-N-метил-N-трицикло [3,3,1,13,7]дец-1-ил-1Н-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
321	N-циклопентил-4-(4-фтор-3-метоксифеніл)-N-метил-1Н-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					1,4	1,2
322	4-(3'-гідроксибіфеніл-3-іл)-N-метил-N-трицикло [3,3,1,13,7]дец-1-ил-1Н-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
323	4-[3-(6-метоксипіридин-3-іл)феніл]-N-метил-N-трицикло[3,3,1,13,7]дец-1-ил-1Н-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
324	4-[4'-(ацетиламіно)біфеніл-3-іл]-N-метил-N-трицикло [3,3,1,13,7]дец-1-ил-1Н-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
325	4-(3-фуран-3-ілфеніл)-N-метил-N-трицикло[3,3,1,13,7] дец-1-ил-1Н-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
326	N-циклопентил-4-(4-метоксифеніл)-N-метил-1Н-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
327	N-циклопентил-4-(3-метоксифеніл)-N-метил-1Н-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
328	(4,4-диметилоксазолідин-3-іл)(4-(4-метоксифеніл)-1Н-імідазол-1-іл)метанон	Імідазоли						
329	(4,4-диметилоксазолідин-3-іл)(4-(3-метоксифеніл)-1Н-імідазол-1-іл)метанон	Імідазоли		99,5			83,3	18,5
330	N-циклогексил-4-(3-фтор-4-гідроксифеніл)-N-метил-1Н-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		29,7			22,8	11,1
331	N-циклопентил-4-(3-фтор-4-гідроксифеніл)-N-метил-1Н-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		3,6			4	4,9
332	(4,4-диметилоксазолідин-3-іл)(4-(3-фтор-4-гідроксифеніл)-1Н-імідазол-1-іл)метанон	Імідазоли		88,5			60	19,5
333	(4,4-диметилоксазолідин-3-іл)(4-(4-фтор-3-гідроксифеніл)-1Н-імідазол-1-іл)метанон	Імідазоли		81,9			119	81,5
334	4-(бензофуран-2-іл)-N-циклогексил-N-метил-1Н-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		58,2			9,9	5,1
335	N-циклогексил-N-метил-4-(піридин-3-іл)-1Н-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		75,4			3,1	1
336	4-[3-(6-хлорпіридин-3-іл)феніл]-N-метил-N-трицикло [3,3,1,13,7]дец-1-ил-1Н-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
337	(4,4-диметилоксазолідин-3-іл)(2-метил-4-феніл-1Н-імідазол-1-іл)метанон	Імідазоли						
338	(4-(бензофуран-2-іл)-1Н-імідазол-1-іл)(4,4-диметилоксазолідин-3-іл)метанон	Імідазоли						

Таблиця 1

	Назва	Клас	In Vitro			In Vivo		
			10 мкМ	100 нМ	BRh 30 мг.кг, 1 год	LVh 30 мг.кг, 1 год	BRh 3 мг.кг, 8 год	LVh 3 мг.кг, 8 год
339	оксазолідин-3-іл(4-феніл-1Н-імідазол-1-іл)метанон	Імідазоли						
340	(4-(3-метоксифеніл)-1Н-імідазол-1-іл)(5-фенілоксазолідин-3-іл)метанон	Імідазоли						
341	N-циклогексил-4-(4-метоксифеніл)-N-метил-1Н-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
342	N-циклогексил-4-(3-метоксифеніл)-N-метил-1Н-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
343	N-циклогексил-4-(4-фтор-3-гідроксифеніл)-N-метил-1Н-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		44,7			95,5	19,7
344	N-циклопентил-4-(4-фтор-3-гідроксифеніл)-N-метил-1Н-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли		1,7			121,1	2,1
345	N-циклогексил-4-(4-(дифторметокси)феніл)-N-етил-1Н-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
346	N-циклогексил-4-(3,4-дифторфеніл)-N-етил-1Н-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
347	(4,4-диметилотксазолідин-3-іл)(4-(3-гідроксифеніл)-1Н-імідазол-1-іл)метанон	Імідазоли		109,6			76,6	24,5
348	(4,4-диметилотксазолідин-3-іл)(4-(3-(3-гідрокси-3-метилbut-1-уну)феніл)-1Н-імідазол-1-іл)метанон	Імідазоли						
349	N-циклогексил-4-(3,4-дихлорфеніл)-N-етил-1Н-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
350	N-циклогексил-N-етил-4-(4-метоксифеніл)-1Н-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
351	(4,4-диметилотксазолідин-3-іл)(4-(4-фтор-3-метоксифеніл)-1Н-імідазол-1-іл)метанон	Імідазоли		95,6			7,1	11,7
352	(4,4-диметилотксазолідин-3-іл)(4-(3-(3-гідрокси-3-метилбутил)феніл)-1Н-імідазол-1-іл)метанон	Імідазоли						
353	N-метил-4-(1-оксидопіридин-3-іл)-N-трицикло [3,3,1,13,7]дец-1-ил-1Н-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
354	N-метил-4-[3-(1-оксидопіридин-3-іл)феніл]-N-трицикло [3,3,1,13,7]дец-1-ил-1Н-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
355	N-циклогексил-N-етил-4-(3-метоксифеніл)-1Н-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
356	(4-(3-аміно-4-метоксифеніл)-1Н-імідазол-1-іл)(4,4-диметилотксазолідин-3-іл)метанон	Імідазоли					6,5	9,4
357	4-(3-аміно-4-гідроксифеніл)-N-циклогексил-N-метил-1Н-імідазол-1-карбоксамід гідрохлорид	Імідазоли		93,9			111,9	10,4
358	(4-(3-аміно-4-гідроксифеніл)-1Н-імідазол-1-іл)(4,4-диметилотксазолідин-3-іл)метанону гідрохлорид	Імідазоли					117,1	81,2
359	(5-хлор-1Н-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(4,4-диметилотксазолідин-3-іл)метанон	Бензотриазоли		1,4			2,5	1,7
360	(4,6-дифтор-1Н-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(4,4-диметилотксазолідин-3-іл)метанон	Бензотриазоли		1,6			3,1	3,7
361	(4,4-диметилотксазолідин-3-іл)(6-феніл-1Н-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)метанон	Бензотриазоли		1,3			6,3	1,4
362	3-(1-(циклогексил(метил)карбамоїл)-1Н-імідазол-4-іл)піридин 1-оксид	Імідазоли		78,2			1,6	1,7
363	4-(3-(4-ціанофенокси)феніл)-N-циклогексил-N-метил-1Н-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
364	4-(3-(1-(4,4-диметилотксазолідин-3-карбоніл)-1Н-імідазол-4-іл)фенокси)бензонітрил	Імідазоли						
365	4-(3-аміно-4-метоксифеніл)-N-циклогексил-N-метил-1Н-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
366	(1Н-[1,2,3]триазоло[4,5-b]піридин-1-іл)(4,4-диметилотксазолідин-3-іл)метанон	Триазолопіридин						
367	(4,4-диметилотксазолідин-3-іл)(6-метил-1Н-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)метанон	Бензотриазоли						
368	(3Н-[1,2,3]триазоло[4,5-b]піридин-3-іл)(4,4-диметилотксазолідин-3-іл)метанон	Триазолопіридин					4,9	9,6
369	(1Н-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(оксазолідин-3-іл)метанон	Бензотриазоли						

Таблиця 1

	Назва	Клас	In Vitro			In Vivo		
			10 мкМ	100 нМ	BRh 30 мг.кг, 1 год	LVh 30 мг.кг, 1 год	BRh 3 мг.кг, 8 год	LVh 3 мг.кг, 8 год
370	(4,4-диметиллоксазолідин-3-іл)(6-(2-метоксифеніл)-1Н-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)метанон	Бензотриазоли						
371	(4,4-диметиллоксазолідин-3-іл)(5-(трифторметил)-1Н-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)метанон	Бензотриазоли						
372	(4,6-диметокси-1Н-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(4,4-диметиллоксазолідин-3-іл)метанон	Бензотриазоли						
373	(1Н-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(2,2-диметиллоксазолідин-3-іл)метанон	Бензотриазоли						
374	N-циклогексил-N-метил-5-(трифторметил)-1Н-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазоли						
375	N-циклогексил-N,5,6-триметил-1Н-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазоли						
376	N-циклогексил-N-метил-4-(4-сульфамойлфеніл)-1Н-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					95,3	5,7
377	N-циклогексил-4,6-диметокси-N-метил-1Н-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазоли						
378	(5,6-диметил-2Н-бензо[d][1,2,3]триазол-2-іл)(4,4-диметиллоксазолідин-3-іл)метанон	Бензотриазоли						
379	N-((1г, 4г)-4-(бензилокси)циклогексил)-N-метил-4-феніл-1Н-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
380	4-(4-(2Н-тетразол-5-іл)феніл)-N-циклогексил-N-метил-1Н-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					77,3	51,3
381	(5,6-диметил-1Н-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(4,4-диметиллоксазолідин-3-іл)метанон	Бензотриазоли						
382	(5,6-диметокси-1Н-бензо[d][1,2,3]триазол-1-іл)(4,4-диметиллоксазолідин-3-іл)метанон	Бензотриазоли						
383	N-((1г, 4г)-4-гідроксициклогексил)-N-метил-4-феніл-1Н-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
384	N-(1-гідрокси-2-метилпропан-2-іл)-4,6-диметокси-1Н-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазоли						
385	4-(1-(4,4-диметиллоксазолідин-3-карбоніл)-1Н-імідазол-4-іл)бензамід	Імідазоли						
386	(4,4-диметиллоксазолідин-3-іл)(4-(4-(2-(піперидин-1-іл)етокси)феніл)-1Н-імідазол-1-іл)метанону гідрохлорид	Імідазоли						
387	(4,4-диметиллоксазолідин-3-іл)(4-(4-(2-морфоліноетокси) феніл)-1Н-імідазол-1-іл)метанону гідрохлорид	Імідазоли						
388	(4,4-диметиллоксазолідин-3-іл)(4-(4-(2-(піперазин-1-іл)етокси)феніл)-1Н-імідазол-1-іл)метанону дигідрохлорид	Імідазоли						
389	1-(4,4-диметиллоксазолідин-3-карбоніл)-1Н-бензо[d][1,2,3]триазол-5-карбоксамід	Бензотриазоли						
390	4-(4-карбамоїлфеніл)-N-циклогексил-N-метил-1Н-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
391	(4,4-диметиллоксазолідин-3-іл)(6-феніл-3Н-[1,2,3]триазоло[4,5-b]піридин-3-іл)метанон	Триазолопіридин						
392	(4,4-диметиллоксазолідин-3-іл)(6-феніл-1Н-[1,2,3]триазоло[4,5-b]піридин-1-іл)метанон	Триазолопіридин						
393	(4,4-диметиллоксазолідин-3-іл)(4-(4-(піперидин-4-ілметокси)феніл)-1Н-імідазол-1-іл)метанону гідрохлорид	Імідазоли						
394	N-циклогексил-N-метил-4-(4-(2-(піперидин-1-іл)етокси) феніл)-1Н-імідазол-1-карбоксаміду гідрохлорид	Імідазоли						
395	N-циклогексил-N-метил-4-(4-(2-морфоліноетокси) феніл)-1Н-імідазол-1-карбоксамід гідрохлорид	Імідазоли						
396	(4,4-диметиллоксазолідин-3-іл)(4-(4-(2-(піперидин-4-іл)етокси)феніл)-1Н-імідазол-1-іл)метанону гідрохлорид	Імідазоли						

Таблиця 1

	Назва	Клас	In Vitro			In Vivo		
			10 мкМ	100 нМ	BRh 30 мг.кг, 1 год	LVh 30 мг.кг, 1 год	BRh 3 мг.кг, 8 год	LVh 3 мг.кг, 8 год
397	N-циклогексил-N-метил-4-(4-(2-(піперазин-1-іл)етокси) феніл)-1H-імідазол-1-карбоксаміду дигідрохлорид	Імідазоли						
398	4-(4-гідроксифеніл)-N-метил-N-(тетрагідро-2H-піран-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
399	(4,4-диметиллоксазолідин-3-іл)(4-(3-(2-(піперидин-1-іл) етокси)феніл)-1H-імідазол-1-іл)метанону гідрохлорид	Імідазоли						
400	N-циклогексил-N-метил-4-(4-(піперидин-4-ілметокси) феніл)-1H-імідазол-1-карбоксаміду гідрохлорид	Імідазоли						
401	(4,4-диметиллоксазолідин-3-іл)(4-(3-(2-(піперазин-1-іл) етокси)феніл)-1H-імідазол-1-іл)метанону дигідрохлорид	Імідазоли						
402	(4,4-диметиллоксазолідин-3-іл)(4-(3-(2-морфоліноетокси) феніл)-1H-імідазол-1-іл)метанону гідрохлорид	Імідазоли						
403	4-(3-карбамоїлфеніл)-N-циклогексил-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
404	N-циклогексил-N-метил-4-(4-(морфоліносульфоніл) феніл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
405	(4,4-диметиллоксазолідин-3-іл)(4-(3-(піперидин-4-ілметокси)феніл)-1H-імідазол-1-іл)метанону гідрохлорид	Імідазоли						
406	(Z)-N-циклогексил-4-(4-(N'-гідроксикарбаімідоїл) феніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					66,8	16,3
407	N-циклогексил-N-метил-4-(3-(2-(піперазин-1-іл)етокси) феніл)-1H-імідазол-1-карбоксаміду дигідрохлорид	Імідазоли						
408	N-циклогексил-N-метил-4-(3-(2-морфоліноетокси) феніл)-1H-імідазол-1-карбоксаміду гідрохлорид	Імідазоли						
409	N-(1-бензилпіперидин-4-іл)-N-метил-4-феніл-1H-імідазол-1-карбоксаміду оксалат	Імідазоли						
410	N-(1-бензилпіперидин-4-іл)-N-метил-4-феніл-1H-імідазол-1-карбоксаміду гідрохлорид	Імідазоли						
411	N-(1-бензилпіперидин-4-іл)-N-метил-4-феніл-1H-імідазол-1-карбоксамід метансульфонат	Імідазоли						
412	N-(1-бензилпіперидин-4-іл)-N-метил-4-феніл-1H-імідазол-1-карбоксамід 2-гідроксипропан-1,2,3-трикарбоксилат	Імідазоли						
413	N-(1-бензилпіперидин-4-іл)-N-метил-4-феніл-1H-імідазол-1-карбоксамід (2R,3R)-2,3-дигідроксисукцинат	Імідазоли						
414	N-(1-бензилпіперидин-4-іл)-N-метил-4-феніл-1H-імідазол-1-карбоксаміду фосфат	Імідазоли						
415	4-(4-(4-(бензилокси)піперидин-1-ілсульфоніл)феніл)-N-циклогексил-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					109,1	95,4
416	N-(1-бензилпіперидин-4-іл)-N-метил-4-(піридин-3-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
417	N-циклопентил-N-метил-4-(піридин-3-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
418	N-(1-бензилпіперидин-4-іл)-4-(3-метоксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
419	N-(1-бензилпіперидин-4-іл)-4-(4-метоксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					0,8	1
420	4-(4-(бензилокси)феніл)-N-(1-бензилпіперидин-4-іл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
421	3-(1-(циклопентил(метил)карбаіміл)-1H-імідазол-4-іл)піридин 1-оксид	Імідазоли						

Таблиця 1

	Назва	Клас	In Vitro			In Vivo		
			10 мкМ	100 нМ	BRh 30 мг.кг, 1 год	LVh 30 мг.кг, 1 год	BRh 3 мг.кг, 8 год	LVh 3 мг.кг, 8 год
422	N-циклогексил-N-метил-4-(4-(метилсульфоніл)феніл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					1,7	2,7
423	N-(1-бензилпіперидин-4-іл)-4-(3-(гідроксикарбамоїл)феніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					90	2,1
424	N-циклогексил-4-(3-(гідроксикарбамоїл)феніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					1	0,5
425	4-(4-(бензиламіно)-3-нітрофеніл)-N-циклогексил-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					111,4	104,6
426	4-(1-бензил-2-оксо-2,3-дигідро-1H-бензо[d]імідазол-5-іл)-N-циклогексил-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					96,9	115,8
427	N-(1-бензилпіперидин-4-іл)-4-(3,4-дифторфеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
428	N-(1-бензилпіперидин-4-іл)-4-(4-хлорфеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
429	N-(1-бензилпіперидин-4-іл)-4-(4-(дифторметокси)феніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
430	N-(1-бензилпіперидин-4-іл)-4-(4-фторфеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
431	N-(1-(2,6-диметоксибензил)піперидин-4-іл)-N-метил-4-(піридин-3-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
432	N-циклогексил-4-(4-(4-гідроксипіперидин-1-ілсульфоніл)феніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					96,1	65,5
433	N-(1-бензилпіперидин-4-іл)-4-(3,4-диметоксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
434	(оксагідроізохінолін-2(1H)-іл)(4-феніл-1H-імідазол-1-іл)метанон	Імідазоли						
435	N-циклогексил-4-(4-(диметиламіно)-3-нітрофеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					4,3	4,9
436	1-(4,4-диметиллоксазолідин-3-карбоніл)-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-5-карбонова кислота	Бензотриазоли						
437	N-(бензилокси)-1-(4,4-диметиллоксазолідин-3-карбоніл)-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-5-карбоксамід	Бензотриазоли						
438	N-циклогексил-4-(4-метокси-3-(2H-тетразол-5-іл)феніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					92,4	6,1
439	N-циклогексил-4-(4-гідрокси-3-(2H-тетразол-5-іл)феніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					94,4	58,6
440	1-(4,4-диметиллоксазолідин-3-карбоніл)-N-гідрокси-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-5-карбоксамід	Бензотриазоли					23,2	3,3
441	N-(1-бензилпіперидин-4-іл)-4-(4-метокси-3-нітрофеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
442	N-(1-бензилпіперидин-4-іл)-4-(4-фтор-3-метоксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
443	N-(1-бензилпіперидин-4-іл)-4-(3-фтор-4-метоксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
444	трет-бутил-4-(4-(4-(бензилокси)феніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамідо)піперидин-1-карбоксилат	Імідазоли						
445	4-(3-ціано-4-метоксифеніл)-N-циклогексил-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						

Таблиця 1

	Назва	Клас	In Vitro			In Vivo		
			10 мкМ	100 нМ	BRh 30 мг.кг, 1 год	LVh 30 мг.кг, 1 год	BRh 3 мг.кг, 8 год	LVh 3 мг.кг, 8 год
446	N-(1-бензилпіперидин-4-іл)-4-(3-ціано-4-метоксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
447	4-(3-аміно-4-(диметиламіно)феніл)-N-циклогексил-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					11,8	6,5
448	3-(1-(4-(етоксикарбоніл)піперазин-1-карбоніл)-1H-імідазол-4-іл)піридин 1-оксид	Імідазоли						
449	3-(1-(бутил(метил)карбамоїл)-1H-імідазол-4-іл)піридин 1-оксид	Імідазоли						
450	4-(3-аміно-4-метоксифеніл)-N-метил-N-(піперидин-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					114,2	65,4
451	N-(1-бензилпіперидин-4-іл)-4-(4-гідроксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					1,1	0,3
452	3-(1-(діетилкарбамоїл)-1H-імідазол-4-іл)піридин 1-оксид	Імідазоли						
453	N-метил-N-феніл-4-(піридин-3-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
454	N-(1-бензилпіперидин-4-іл)-4-(3-фтор-4-гідроксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід гідробромід	Імідазоли					3,1	3
455	3-(1-(4,4-диметиллоксазолідин-3-карбоніл)-1H-імідазол-4-іл)піридин 1-оксид	Імідазоли						
456	3-(1-(метил(феніл)карбамоїл)-1H-імідазол-4-іл)піридин 1-оксид	Імідазоли						
457	N-(1-бензилпіперидин-4-іл)-4-(4-гідрокси-3-нітрофеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					28,1	10,6
458	N-циклогексил-4-(піридин-3-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
459	3-(1-((1-бензилпіперидин-4-іл)(метил)карбамоїл)-1H-імідазол-4-іл)піридину 1-оксид	Імідазоли					1,3	1,9
460	Етил-1-(4,4-диметиллоксазолідин-3-карбоніл)-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-6-карбоксилат	Бензотриазоли						
461	3-(1-(циклогексилкарбамоїл)-1H-імідазол-4-іл)піридин 1-оксид	Імідазоли						
462	1-(4,4-диметиллоксазолідин-3-карбоніл)-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-6-карбоксамід	Бензотриазоли						
463	N-метил-4-(піридин-3-іл)-N-(тетрагідро-2H-піран-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
464	N-циклогексил-N-етил-4-(піридин-3-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
465	N-(1-бензилпіперидин-4-іл)-4-(3,4-дигідроксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід гідробромід	Імідазоли					3,8	3,1
466	4-(3-фтор-4-метоксифеніл)-N-метил-N-(тетрагідро-2H-піран-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
467	N-метил-N-(1-фенетилпіперидин-4-іл)-4-феніл-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
468	4-(3-аміно-4-метоксифеніл)-N-метил-N-(тетрагідро-2H-піран-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					4,7	4,3
469	трет-бутил 4-(4-(4-гідроксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамідо)піперидин-1-карбоксилат	Імідазоли					1,4	0,7
470	3-(1-(метил(тетрагідро-2H-піран-4-іл)карбамоїл)-1H-імідазол-4-іл)піридин 1-оксид	Імідазоли						
471	3-(1-(циклогексил(етил)карбамоїл)-1H-імідазол-4-іл)піридин 1-оксид	Імідазоли						
472	4-(4-фторфеніл)-N-метил-N-(тетрагідро-2H-піран-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
473	4-(3,4-дифторфеніл)-N-метил-N-(тетрагідро-2H-піран-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						

Таблиця 1

	Назва	Клас	In Vitro			In Vivo		
			10 мкМ	100 нМ	BRh 30 мг.кг, 1 год	LVh 30 мг.кг, 1 год	BRh 3 мг.кг, 8 год	LVh 3 мг.кг, 8 год
474	4-(4-(дифторметокси)феніл)-N-метил-N-(тетрагідро-2H-піран-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
475	4-(4-метоксифеніл)-N-метил-N-(тетрагідро-2H-піран-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
476	4-(3,4-диметоксифеніл)-N-метил-N-(тетрагідро-2H-піран-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
477	4-(4-хлорфеніл)-N-метил-N-(тетрагідро-2H-піран-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
478	N-трет-бутил-1-(4,4-диметиллоксазолідин-3-карбоніл)-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-6-карбоксамід	Бензотриазоли						
479	1-(4,4-диметиллоксазолідин-3-карбоніл)-N,N-диметил-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-6-карбоксамід	Бензотриазоли						
480	N1-циклопентил-N1-метил-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1,5-дикарбоксамід	Бензотриазоли						
481	1-(4,4-диметиллоксазолідин-3-карбоніл)-N-феніл-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-6-карбоксамід	Бензотриазоли						
482	4-(3-карбамоїл-4-метоксифеніл)-N-циклогексил-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					83,2	16,7
483	N-метил-N-(тетрагідро-2H-піран-4-іл)-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазоли						
484	4-(4-фтор-3-метоксифеніл)-N-метил-N-(тетрагідро-2H-піран-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
485	N-циклогексил-4-(4-метокси-3-(метилсульфонамідо) феніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					92,1	15,1
486	1-(4,4-диметиллоксазолідин-3-карбоніл)-N-феніл-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-5-карбоксамід	Бензотриазоли						
487	N-трет-бутил-1-(4,4-диметиллоксазолідин-3-карбоніл)-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-5-карбоксамід	Бензотриазоли						
488	N-метил-N-(1-фенетилпіперидин-4-іл)-4-(піридин-3-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					3,8	2
489	N-циклогексил-1-(4,4-диметиллоксазолідин-3-карбоніл)-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-5-карбоксамід	Бензотриазоли						
490	N-циклогексил-1-(4,4-диметиллоксазолідин-3-карбоніл)-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-6-карбоксамід	Бензотриазоли						
491	N1-циклогексил-N1-метил-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1,5-дикарбоксамід	Бензотриазоли						
492	N-(1-бензилпіперидин-4-іл)-N-метил-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксаміду гідрохлорид	Бензотриазоли					0,9	0,7
493	N-циклогексил-N-метил-4-(піридин-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
494	4-(4-гідрокси-3-нітрофеніл)-N-метил-N-(тетрагідро-2H-піран-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					48,9	22,9
495	4-(3-фтор-4-гідроксифеніл)-N-метил-N-(тетрагідро-2H-піран-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					2,1	2,3
496	N-бензил-1-(4,4-диметиллоксазолідин-3-карбоніл)-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-5-карбоксамід	Бензотриазоли						
497	4-(1-(циклогексил(метил)карбамоїл)-1H-імідазол-4-іл)піридин 1-оксид	Імідазоли						
498	4-(3-метоксифеніл)-N-метил-N-(1-пропілпіперидин-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					21,4	12,6

Таблиця 1

	Назва	Клас	In Vitro			In Vivo		
			10 мкМ	100 нМ	BRh 30 мг.кг, 1 год	LVh 30 мг.кг, 1 год	BRh 3 мг.кг, 8 год	LVh 3 мг.кг, 8 год
499	4-(3-карбамоїл-4-гідроксифеніл)-N-циклогексил-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					120,6	44,1
500	4-(4-фтор-3-гідроксифеніл)-N-метил-N-(тетрагідро-2H-піран-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					75,1	21,8
501	4-(4-метоксифеніл)-N-метил-N-(піперидин-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					108,5	67,4
502	N-(1-етилпіперидин-4-іл)-4-(3-метоксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					50,2	11,5
503	N-(1-етилпіперидин-4-іл)-4-(3-фтор-4-метоксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					78,8	25,1
504	N-метил-4-феніл-N-(піперидин-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід у гідрохлорид	Імідазоли					112,5	51,2
505	(4-циклогексилпіперазин-1-іл)(2-(4,4-диметиллоксазолідин-3-карбоніл)-2H-бензо[d][1,2,3]триазол-5-іл)метанону оксалат	Бензотриазоли						
506	(4-(бензо[d][1,3]діоксол-5-ілметил)піперазин-1-іл)(2-(4,4-диметиллоксазолідин-3-карбоніл)-2H-бензо[d][1,2,3]триазол-	Бензотриазоли						
507	(E)-N-циклогексил-4-(3-(N'-гідроксикарбамімідоїл)-4-метоксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					101,7	34
508	N-((1r,4r)-4-гідроксициклогексил)-N-метил-4-(піридин-3-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
509	N-(1-етилпіперидин-4-іл)-N-метил-4-(3-нітрофеніл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					78,3	17,2
510	4-(3,4-диметоксифеніл)-N-(1-етилпіперидин-4-іл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
511	4-(3-амінофеніл)-N-(1-етилпіперидин-4-іл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
512	4-(3,4-диметоксифеніл)-N-метил-N-(1-пропілпіперидин-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
513	4-(3-карбамоїл-4-гідроксифеніл)-N-метил-N-(тетрагідро-2H-піран-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					90,3	14,4
514	4-(3-фтор-4-метоксифеніл)-N-метил-N-(1-пропілпіперидин-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
515	трет-бутил 4-(N-метил-4-(піридин-3-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамідо)піперидин-1-карбоксилат	Імідазоли						
516	3-(1-(((1r,4r)-4-гідроксициклогексил)(метил)карбамоїл)-1H-імідазол-4-іл)піридин 1-оксид	Імідазоли						
517	(4-бензилпіперазин-1-іл)(1-(4,4-диметиллоксазолідин-3-карбоніл)-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-5-іл)метанону оксалат	Бензотриазоли						
518	N-циклогексил-N-метил-4-(піридин-2-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
519	3-(1-(метил(1-пропілпіперидин-4-іл)карбамоїл)-1H-імідазол-4-іл)піридин 1-оксид	Імідазоли					82	4,4
520	4-(4-метоксифеніл)-N-метил-N-(1-пропілпіперидин-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
521	N-(1-етилпіперидин-4-іл)-4-(4-метоксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
522	N-метил-4-(3-нітрофеніл)-N-(1-пропілпіперидин-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						

Таблиця 1

	Назва	Клас	In Vitro			In Vivo		
			10 мкМ	100 нМ	BRh 30 мг.кг, 1 год	LVh 30 мг.кг, 1 год	BRh 3 мг.кг, 8 год	LVh 3 мг.кг, 8 год
523	N-(1-бензилпіперидин-4-іл)-4-(4-фтор-3-гідроксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
524	4-(3-амінофеніл)-N-метил-N-(1-пропілпіперидин-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
525	N-(1-етилпіперидин-4-іл)-N-метил-4-(піридин-3-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
526	4-(3'-карбамоілбифеніл-3-іл)-N-метил-N-(1-пропілпіперидин-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
527	N-циклогексил-N-метил-2-оксо-5-феніл-1,3,4-оксадіазол-3(2H)-карбоксамід	Оксадіазол						
528	3-(4,4-диметилпексазолідин-3-карбоніл)-5-феніл-1,3,4-оксадіазол-2(3H)-он	Оксадіазол						
529	N-метил-N-(1-пропілпіперидин-4-іл)-4-(піридин-3-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
530	2-(1-(циклогексил(метил)карбамоїл)-1H-імідазол-4-іл)піридин 1-оксид	Імідазоли						
531	N-метил-N-(піперидин-4-іл)-4-(піридин-3-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід дигідрохлорид	Імідазоли						
532	4-(4-метоксифеніл)-N-метил-N-(1-(метилсульфоніл)піперидин-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
533	N-метил-N-(1-(метилсульфоніл)піперидин-4-іл)-4-(піридин-3-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					12	0,2
534	4-(3-фтор-4-метоксифеніл)-N-метил-N-(піперидин-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксаміду дигідрохлорид	Імідазоли						
535	N-(1-бензилпіперидин-4-іл)-5-ціано-N-метил-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазоли						
536	N-(1-етилпіперидин-4-іл)-4-(3-фтор-4-гідроксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					74,6	18,3
537	N-(1-етилпіперидин-4-іл)-4-(4-фтор-3-метоксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
538	N,N-диметил-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід	Бензотриазоли						
539	N,N-диметил-1H-[1,2,3]триазоло[4,5-b]піридин-1-карбоксамід	Бензотриазоли						
540	4-(3-фтор-4-метоксифеніл)-N-(1-(2-гідроксипропіл) піперидин-4-іл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					89,7	33,7
541	N-(1-(2-ціаноетил)піперидин-4-іл)-4-(3-фтор-4-метоксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
542	N-метил-4-(піридин-4-іл)-N-(тетрагідро-2H-піран-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
543	4-(1-(метил(тетрагідро-2H-піран-4-іл)карбамоїл)-1H-імідазол-4-іл)піридин 1-оксид	Імідазоли						
544	4-(4-метоксифеніл)-N-метил-N-(1-(піридин-2-ілметил)піперидин-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
545	4-(4-фтор-3-метоксифеніл)-N-метил-N-(1-пропілпіперидин-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
546	4-(4-метоксифеніл)-N-метил-N-(1-(2-(піридин-3-іл) тiazол-4-карбоніл)піперидин-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
547	N-(1-ацетилпіперидин-4-іл)-4-(4-метоксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
548	N-(1-ацетилпіперидин-4-іл)-N-метил-4-(піридин-3-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						

Таблиця 1

	Назва	Клас	In Vitro			In Vivo		
			10 мкМ	100 нМ	BRh 30 мг.кг, 1 год	LVh 30 мг.кг, 1 год	BRh 3 мг.кг, 8 год	LVh 3 мг.кг, 8 год
549	4-(4-метоксифеніл)-N-метил-N-(1-(3-(трифторметил)фенілсульфоніл)піперидин-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
550	N-(1-бензилпіперидин-4-іл)-4-(3'-карбамоїлбифеніл-3-іл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					94,3	5,7
551	N-циклогексил-N-метил-4-(4-(5-оксо-4,5-дигідро-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					85,2	3,8
552	4-(3-(гідроксикарбамоїл)феніл)-N-метил-N-(1-пропілпіперидин-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					90,2	45
553	N-циклогексил-4-(3-гуанідинофеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід гідрохлорид	Імідазоли					72,3	15,4
554	4-(3-карбамоїл-4-гідроксифеніл)-N-метил-N-(1-пропілпіперидин-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					102,2	85,6
555	4-(4-гідроксифеніл)-N-метил-N-(піперидин-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксаміду гідробромід	Імідазоли						
556	4-(3-аміно-4-(диметиламіно)феніл)-N-(1-бензилпіперидин-4-іл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
557	N-(1-(4,6-дихлор-1,3,5-триазин-2-іл)піперидин-4-іл)-4-(4-метоксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
558	2-(4-(N-метил-4-(піридин-3-іл)-1H-імідазол-1-карбоксаміду)піперидин-1-іл)оцтова кислота	Імідазоли					83,1	91,1
559	метил-5-((4-(N-метил-4-(піридин-3-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід)піперидин-1-іл)метил)фуран-2-карбоксилат	Імідазоли						
560	N-метил-4-(піридин-2-іл)-N-(тетрагідро-2H-піран-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
561	N-(1-етилпіперидин-4-іл)-4-(4-фтор-3-гідроксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксаміду гідробромід	Імідазоли					82,2	78,6
562	4-(3-аміно-4-гідроксифеніл)-N-циклопентил-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксаміду гідрохлорид	Імідазоли						
563	N-циклогексил-4-(3-гуанідинофеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
564	N-циклопентил-N-метил-4-(2-оксо-2,3-дигідробензо[d]оксазол-5-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					37,6	2,3
565	4-(3-амінофеніл)-N-(1-бензилпіперидин-4-іл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
566	4-(3-(гідроксикарбамоїл)феніл)-N-((1r,4r)-4-гідроксициклогексил)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					88,5	69,8
567	N-(1-бензилпіперидин-4-іл)-N-метил-4-(4-(метилсульфоніл)феніл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли					87,8	6,3
568	4-(4-гідроксифеніл)-N-метил-N-(1-(3-(трифторметил)фенілсульфоніл)піперидин-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
569	N-метил-N-(1-(піридин-2-ілметил)піперидин-4-іл)-4-(піридин-3-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
570	4-(4-фтор-3-гідроксифеніл)-N-метил-N-(1-пропілпіперидин-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксаміду гідробромід	Імідазоли						
571	N-(1-бензилпіперидин-4-іл)-4-(4-(гідроксикарбамоїл)феніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксаміду гідробромід	Імідазоли						
572	N-(1-бензилпіперидин-4-іл)-4-(3-карбамоїл-4-гідроксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксаміду гідробромід	Імідазоли						

Таблиця 1

	Назва	Клас	In Vitro			In Vivo		
			10 мкМ	100 нМ	BRh 30 мг.кг, 1 год	LVh 30 мг.кг, 1 год	BRh 3 мг.кг, 8 год	LVh 3 мг.кг, 8 год
573	N-(1-(2-хлорнікотиноіл)піперидин-4-іл)-4-(4-метоксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
574	N-(1-ацетилпіперидин-4-іл)-4-(4-гідроксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
575	N-циклогексил-4-(3-гуанідино-4-метоксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід гідрохлорид	Імідазоли						
576	4-(3-(2H-тетразол-5-іл)феніл)-N-циклогексил-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
577	4-(4-амінофеніл)-N-(1-бензилпіперидин-4-іл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
578	N-(1-бензилпіперидин-4-іл)-N-метил-4-(4-сульфамойлфеніл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
579	4-(4-амінофеніл)-N-циклогексил-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
580	N-циклогексил-N-метил-4-(4-(сульфамойламіно)феніл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
581	N-(1-бензилпіперидин-4-іл)-4-(3-гуанідино-4-метоксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
582	N-(1-ціанопіперидин-4-іл)-4-(4-метоксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
583	N-(1-ціанометил)піперидин-4-іл)-4-(4-метоксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
584	N-(1-ціанометил)піперидин-4-іл)-N-метил-4-(піридин-3-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
585	4-(3-гідроксифеніл)-N-метил-N-(1-пропілпіперидин-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід гідробромід	Імідазоли						
586	4-(3,4-дигідроксифеніл)-N-метил-N-(1-пропілпіперидин-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід гідробромід	Імідазоли						
587	4-(4-гідроксифеніл)-N-метил-N-(1-(піридин-2-ілметил) піперидин-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід гідробромід	Імідазоли						
588	N-(1-бензилпіперидин-4-іл)-N-метил-4-(4-(сульфамойламіно)феніл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
589	N-(1-бензилпіперидин-4-іл)-4-(3-гуанідинофеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
590	4-(3-(2H-тетразол-5-іл)феніл)-N-метил-N-(тетрагідро-2H-піран-4-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
591	N-циклогексил-N-метил-4-(3-(5-оксо-4,5-дигідро-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
592	(E)-N-(1-(N'-гідроксикарбамімідоіл)піперидин-4-іл)-4-(4-метоксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
593	N-(1-бензилпіперидин-4-іл)-N-метил-4-(3-(метилсульфонамідо)феніл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
594	N-циклопентил-N-метил-4-(3-(5-оксо-4,5-дигідро-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						
595	N-(1-(2H-тетразол-5-іл)піперидин-4-іл)-4-(4-метоксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						

Таблиця 1

	Назва	Клас	In Vitro			In Vivo		
			10 мкМ	100 нМ	BRh 30 мг.кг, 1 год	LVh 30 мг.кг, 1 год	BRh 3 мг.кг, 8 год	LVh 3 мг.кг, 8 год
596	4-(4-(4-метоксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-carboxамідо)піперидин-1-карбоксамід	Імідазоли						
597	N-(1-(2-гідроксиетил)піперидин-4-іл)-4-(4-метоксифеніл)-N-метил-1H-імідазол-1-карбоксамід	Імідазоли						

4. Біологічна селективність сполук за винаходом

Інгібування FAAH визначали, як викладено вище. Інгібування моноацилгліцеринліпази (МАГЛ) і карбоксилестерази (СЕ) здійснювали у відповідності до протоколів, описаних нижче. Засобами контролю, як in vitro, так і in vivo була реакційна суміш мінус досліджувані сполуки. Таким чином, низьке значення для досліджуваних сполук в табл. 2 нижче вказує на потужний інгібітор. Значення 100 показує відсутність інгібування, що піддавалося б вимірюванню.

МАГЛ

Вимірювання активності МАГЛ базувалося на швидкості гідролізу [³H] 2-OG (мічений гліцерин) як субстрату. Якщо коротко, фракції цитозолу (CRBcyt) мозочків, попередньої одержаного від дорослих щурів WISTAR, розбавляли до відповідної концентрації білка в аналізі буферним розчином Трис-HCl (10 мМ, рН 7,2) з вмістом 1 мМ ЕДТА, і додавали в пробірки аналізу, що містили досліджувану сполуку. Холості розчину, що містили буферний розчин для аналізу замість зразків цитозолу, використовували як контроль. Далі додавали субстрат (кінцева концентрація 2 мкМ OG), і зразки інкубували протягом 10 хв. при температурі 37°C. Кінцева суміш для аналізу містила 0,125 %, об/об вільного від жирних кислот альбуміну телячої сироватки. Після фази інкубації реакцію зупиняли, додаючи 400 мкл суміші хлороформ/метанол (об/об, 1:1), двічі перемішували вміст пробірок за допомогою вихрового перемішування та вміщували їх на лід. Фракції розділяли центрифугуванням, відбирали аліквоти по 200 мкл фракції метанолу/буферного розчину та аналізували вміст тритію методом рідинної сцинтиляційної спектроскопії з урахуванням гасіння.

СЕ

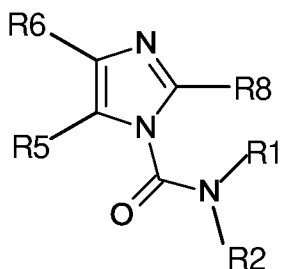
Вимірювання активності СЕ базувалося на утворенні п-нітрофенолу з п-нітрофенілацетату. Якщо коротко, в 96-лункових планшетах 8 мкг/мл мікросомів печінки щура або миші (LVms) інкубували з 10 мкМ інгібіторів FAAH протягом 15 хв., а потім додавали субстрат, п-нітрофенілацетат, до кінцевої концентрації 1 мМ. Планшет зчитували на довжині хвилі 405 нм через 10 хв. після додавання субстрату щодо утворення п-нітрофенолу за допомогою спектрофотометра. Активність карбоксилестерази в мікросомальних екстрактах без доданого інгібітору приймали як контроль за 100%, і залишкову активність KE після інкубації з інгібіторами обчислювали по відношенню до контролю.

Таблиця 2

	Назва	In Vitro		In Vivo		In Vitro		
		ГАЗЖ 10 мкМ	ГАЗЖ 100 нМ	ГАЗЖ BRh 3 мг.кг, 8 год.	ГАЗЖ LVh 3 мг.кг, 8 год.	CE Mou LVms 10 мкМ 10 хв.	CE Rat LVms 10 мкМ 10 хв.	MAGL Rat CRBcyto 12,5 мкМ 8 год.
16	N-(4-метоксифеніл)-N-метил-4-(нафталін-2-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід	24,7				95,4	87,5	
39	(3,4-дигідрохінолін-1(2H)-іл)(4-(3-метоксифеніл)-1H-імідазол-1-іл)метанон	16		120,6	101,1	84,3	94,7	87
85	N-(4-фенілбутил)-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід		0,1			31	33	
97	5-бром-N-циклогексил-N-метил-1H-бензо[d][1,2,3]триазол-1-карбоксамід		0			50,7	41,1	
564	N-циклопентил-N-метил-4-(2-оксо-2,3-дигідробензо[d]оксазол-5-іл)-1H-імідазол-1-карбоксамід			37,6	2,3	87,4	96,1	91,6
567	N-(1-бензилпіперидин-4-іл)-N-метил-4-(4-(метилсульфоніл)феніл)-1H-імідазол-1-карбоксамід			87,8	6,3	88,6	97,8	94,2

ФОРМУЛА ВИНАХОДУ

5 1. Сполука Формули:



де:

R1 є C₁₋₄алкіл;

- 10 R2 вибраний з H, C₁₋₂₀алкілу, C₁₋₆алкокси, арилу, гетероарилу, частково або повністю насиченого гетероциклілу, C₃₋₁₀циклоалкілу, арилC₁₋₆алкілу, гетероарилC₁₋₆алкілу, гетероциклілC₁₋₆алкілу, C₃₋₁₀циклоалкілC₁₋₆алкілу, R1a, галогену, OH, OR1a, OCOR1a, SH, SR1a, SCOR1a, NH₂, NHR1a, NHSO₂NH₂, NHSO₂R1a, NR1aCOR1b, NHCOR1a, NR1aR1b, COR1a, CSR1a, CN, COOH, COOR1a, CONH₂, CONHOH, CONHR1a, CONHOR1a, SO₂R1a, SO₃H, SO₂NH₂, CONR1aR1b, SO₂NR1aR1b, де R1a та R1b незалежно вибрані з C₁₋₆алкілу, заміщеного
- 15 C₁₋₆алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈циклоалкілу та гетероциклілу, або R1a та R1b, з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл, де, якщо R2 являє собою C₁₋₂₀алкіл, алкокси, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₃₋₁₀циклоалкіл, арилC₁₋₆алкіл, гетероарилC₁₋₆алкіл, гетероциклілC₁₋₆алкіл, C₃₋₁₀циклоалкілC₁₋₆алкіл, C₁₋₆алкіл, C₃₋₈циклоалкіл або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із
- 20 вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше групами, вибраними з R1c, галогену, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₁₋₆алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, арилC₁₋₆алкілу, гетероарилC₁₋₆алкілу, гетероциклілC₁₋₆алкілу,

арилC₁₋₆алкокси, гетероарилC₁₋₆алкокси, гетероциклілC₁₋₆алкокси, C₁₋₆алкіламіно, C₁₋₆діалкіламіно, C₁₋₁₀алкілу, OH, OR1c, OCOR1c, SH, SR1c, SCOR1c, NH₂, NO₂, NHR1c, NHSO₂NH₂, NHSO₂R1c, NR1cCOR1d, NHC(NH)NH₂, NHCOR1c, NR1cR1d, COR1c, CSR1c, CN, COOH, COOR1c, CONH₂, CONHOH, CONHR1c, CONHOR1c, C(NOH)NH₂, CONR1cR1d, SO₂R1c, SO₃H, SO₂NH₂, SO₂NR1cR1d, де R1c та R1d незалежно вибрані з C₁₋₆алкілу, заміщеного C₁₋₆алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈циклоалкілу та гетероциклілу, або R1c та R1d, з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл, де, якщо замісник в R2 являє собою C₁₋₁₀алкіл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₁₋₆алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, арилC₁₋₆алкіл, гетероарилC₁₋₆алкіл, гетероциклілC₁₋₆алкіл, арилC₁₋₆алкокси, гетероарилC₁₋₆алкокси, гетероциклілC₁₋₆алкокси, C₁₋₆алкіламіно, C₁₋₆діалкіламіно, C₁₋₆алкіл, C₃₋₈циклоалкіл або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше групами, вибраними з R1e, галогену, C₁₋₁₀алкілу, OH, OR1e, OCOR1e, SH, SR1e, SCOR1e, NH₂, NO₂, NHR1e, NHSO₂NH₂, NHSO₂R1e, NR1eCOR1f, NHC(NH)NH₂, NHCOR1e, NR1eR1f, COR1e, CSR1e, CN, COOH, COOR1e, CONH₂, CONHOH, CONHR1e, CONHOR1e, C(NOH)NH₂, CONR1eR1f, SO₂R1e, SO₃H, SO₂NH₂, SO₂NR1eR1f, де R1e та R1f незалежно вибрані з C₁₋₆алкілу, заміщеного C₁₋₆алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈циклоалкілу та гетероциклілу, або R1e та R1f, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл, за винятком того, що R1 та R2 не являють собою обидва метил, або R1 та R2, разом з N, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероарильну або гетероциклільну групу, кожна з яких необов'язково може бути заміщена одним або більше атомами кисню або однією або більше групами, вибраними з арилу, гетероарилу, частково або повністю насиченого гетероциклілу, C₃₋₈циклоалкілу, C₁₋₆алкілу, арилC₁₋₆алкілу, гетероарилC₁₋₆алкілу, гетероциклілC₁₋₆алкілу, C₃₋₈циклоалкілC₁₋₆алкілу, C₁₋₆алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, R2a, галогену, OH, OR2a, OCOR2a, SH, SR2a, SCOR2a, NH₂, NO₂, NHR2a, NHSO₂NH₂, NHSO₂R2a, NR2aCOR2b, NHC(NH)NH₂, NHCOR2a, NR2aR2b, COR2a, CSR2a, CN, COOH, COOR2a, CONH₂, CONHOH, CONHR2a, CONHOR2a, C(NOH)NH₂, CONR2aR2b, SO₂R2a, SO₃H, SO₂NH₂, SO₂NR2aR2b, де R2a та R2b незалежно вибрані з C₁₋₆алкілу, заміщеного C₁₋₆алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈циклоалкілу та гетероциклілу, або R2a та R2b, з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл, де, якщо замісник в гетероарилі або гетероциклілі, утворений R1 та R2 разом, являє собою арил, гетероарил, гетероцикліл, C₃₋₈циклоалкіл, C₁₋₆алкіл, арилC₁₋₆алкіл, гетероарилC₁₋₆алкіл, гетероциклілC₁₋₆алкіл, C₃₋₈циклоалкіл C₁₋₆алкіл, C₁₋₆алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси або являє собою групу, що містить один або більше із вказаних фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше групами, вибраними з галогену, гідроксилу, C₁₋₆алкілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, C₃₋₈циклоалкілу, C₁₋₄алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, C₃₋₈циклоалкілокси, арилC₁₋₄алкокси, гетероарилC₁₋₆алкокси, гетероциклілC₁₋₄алкокси, C₃₋₈циклоалкілC₁₋₄алкокси, R2c, OR2c, OCOR2c, SH, SR2c, SCOR2c, NH₂, NO₂, NHR2c, NHSO₂NH₂, NHSO₂R2c, NR2cCOR2d, NHC(NH)NH₂, NHCOR2c, NR2cR2d, COR2c, CSR2c, CN, COOH, COOR2c, CONH₂, CONHOH, CONHR2c, CONHOR2c, C(NOH)NH₂, CONR2cR2d, SO₂R2c, SO₃H, SO₂NH₂, SO₂NR2cR2d, де R2c та R2d незалежно вибрані з C₁₋₆алкілу, заміщеного C₁₋₆алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈циклоалкілу та гетероциклілу, або R2c та R2d, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл, де, якщо замісник в заміснику в гетероарилі або гетероциклілі, утворений R1 та R2 разом, являє собою C₁₋₆алкіл, арил, гетероарил, гетероцикліл, C₃₋₈циклоалкіл, C₁₋₆алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, C₃₋₈циклоалкілокси, арилC₁₋₄алкокси, гетероарилC₁₋₄алкокси, гетероциклілC₁₋₄алкокси, C₃₋₈циклоалкілC₁₋₄алкокси або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше групами, вибраними з C₁₋₄алкокси, R2e, галогену, OH, OR2e, OCOR2e, SH, SR2e, SCOR2e, NH₂, NO₂, NHR2e, NHSO₂NH₂, NHSO₂R2e, NR2eCOR2f, NHC(NH)NH₂, NR2eR2f, NHCOR2e, COR2e, CSR2e, CN, COOH, COOR2e, CONH₂, CONHOH, CONHR2e, CONHOR2e, C(NOH)NH₂, CONR2eR2f, SO₂R2e, SO₃H, SO₂NH₂, SO₂NR2eR2f, де R2e та R2f незалежно вибрані з C₁₋₆алкілу, заміщеного C₁₋₆алкілу, арилу, гетероарилу, C₃₋₈циклоалкілу та гетероциклілу, або R2e та R2f, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл; R5 вибраний з H, C₁₋₂алкілу; та R6 вибраний з арилу та гетероарилу,

- де, якщо R6 являє собою гетероарил, вказаний фрагмент необов'язково може бути заміщений одним або більше атомами кисню, та, якщо R6 являє собою арил або гетероарил, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше групами, вибраними з галогену, R6с, С₁₋₆алкілу, С₁₋₆алкінілу, арилу, гетероарилу, гетероциклілу, С₁₋₆алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, арилС₁₋₆алкілу, гетероарилС₁₋₆алкілу, гетероциклілС₁₋₆алкілу, арилС₁₋₆алкокси, гетероарилС₁₋₆алкокси, гетероциклілС₁₋₆алкокси, ОН, OR6с, OCOR6с, SH, SR6с, SCOR6с, NH₂, NO₂, NHR6с, NHSO₂NH₂, NHC(NH)NH₂, NHSO₂R6с, NR6сCOR6d, NHCOR6с, NR6сR6d, COR6с, CSR6с, CN, COOH, COOR6с, CONH₂, CONHR6с, CONHOR6с, CONHOH, C(NOH)NH₂, CONR6сR6d, SO₂R6с, SO₃H, SO₂NH₂, SO₂NR6сR6d, де R6с та R6d незалежно вибрані з С₁₋₆алкілу, заміщеного С₁₋₆алкілу, арилу, гетероарилу, С₃₋₈циклоалкілу та гетероциклілу, або R6с та R6d, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл,
- де, якщо замісник в R6 являє собою гетероарил або гетероцикліл, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений одним або більше атомами кисню, або, якщо замісник в R6 являє собою С₁₋₆алкіл, С₁₋₆алкініл, арил, гетероарил, гетероцикліл, С₁₋₆алкокси, арилокси, гетероарилокси, гетероциклілокси, арилС₁₋₆алкіл, гетероарилС₁₋₆алкіл, гетероциклілС₁₋₆алкіл, арилС₁₋₆алкокси, гетероарилС₁₋₆алкокси, гетероциклілС₁₋₆алкокси, С₃₋₈циклоалкіл або являє собою групу, що містить один або більше із цих фрагментів, кожен із вказаних фрагментів необов'язково може бути заміщений однією або більше групами, вибраними з галогену, R6е, С₁₋₆алкілу, С₁₋₄алкокси, ОН, OR6е, OCOR6е, SH, SR6е, SCOR6е, NH₂, NO₂, NHR6е, NHSO₂NH₂, NHC(NH)NH₂, NHSO₂R6е, NR6еCOR6f, NHCOR6е, NR6еR6f, COR6е, CSR6е, CN, COOH, COOR6е, CONH₂, CONHOH, CONHR6е, CONHOR6е, C(NOH)NH₂, CONR6еR6f, SO₂R6е, SO₃H, SO₂NH₂, SO₂NR6еR6f, де R6е та R6f незалежно вибрані з С₁₋₆алкілу, заміщеного С₁₋₆алкілу, арилу, гетероарилу, С₃₋₈циклоалкілу та гетероциклілу, або R6е та R6f, разом з гетероатомом, до якого вони приєднані, можуть утворювати гетероцикліл;
- R8 являє собою Н;
- або її фармацевтично прийнятна сіль або естер;
- за умови, що, якщо R1 являє собою метил, R2 не являє собою 4-хлорбутил, 4-азидобутил або 4-ізотіоціанатобутил, та
- за умови, що сполука не являє собою (4-феніл-1Н-імідазол-1-іл)(4-(хінолін-2-ілметил)піперазин-1-іл)метанон.
2. Сполука за п. 1, в якій R1 та R2 разом з N, до якого вони приєднуються, утворюють гетероциклільну групу, яка необов'язково може бути заміщена.
3. Сполука за п. 1 або п. 2, в якій R5 являє собою Н.
4. Сполука за п. 1 або п. 3, в якій
- R1 являє собою метил;
- R2 вибраний з моноциклічного С₅₋₈циклоалкілу або моноциклічного 6-членного насиченого гетероциклілу, що містять один гетероатом азоту або кисню, де гетероатом знаходиться в 4-положенні по відношенню до положення кріплення гетероциклільної групи R2 до азоту сечовини, в якому, якщо гетероатом являє собою атом азоту, атом азоту є необов'язково заміщений бензилом;
- R5 являє собою Н;
- R6 вибраний з фенілу або піридилу, в якому атом азоту піридилгрупи може бути заміщений атомом кисню, і де феніл необов'язково може бути заміщений однією або більше групами, вибраними з галогену, метокси, ОН, CONH₂, NH₂ та фенілу; і
- R8 являє собою Н.
5. Сполука за п. 1 або п. 3, в якій
- R1 являє собою метил;
- R2 вибраний з моноциклічного С₅₋₈циклоалкілу, тетрагідропіранілу і піперидинілу, де гетероатом в групах тетрагідропіранілу і піперидину знаходиться в 4-положенні по відношенню до положення кріплення гетероциклільної групи R2 до азоту сечовини, і в якому атом азоту з піперидинільної групи заміщений бензилом;
- R5 являє собою Н;
- R6 вибраний з фенілу або піридилу, в якому атом азоту піридилгрупи заміщений атомом кисню, і де феніл необов'язково може бути заміщений однією або більше групами, вибраними з галогену, метокси, ОН, CONH₂, NH₂ та фенілу; і
- R8 являє собою Н.
6. Сполука за п. 1 або п. 3, в якій
- R1 являє собою метил;

R2 являє собою моноциклічний насичений гетероцикліл, що містить гетероатом нітрогену, де гетероатом нітрогену заміщений групою CONR1cR1d.

7. Сполука за п. 1 або п. 3, в якій

R6 являє собою феніл, заміщений більше ніж однією групою, вибраною з OH та C₁₋₆алкілу.

5 8. Сполука за п. 1 або п. 3, в якій

R6 є фенілом, заміщеним NHSO₂NH₂.

9. Сполука за п. 1 або п. 3, в якій

R1 являє собою метил;

10 R2 є моноциклічним насиченим гетероциклілом, що містить гетероатом нітрогену, де гетероатом нітрогену заміщений групою, вибраною з арилу та SO₂R1c.

10. Сполука за п. 1 або п. 3, в якій

R6 являє собою піридил, заміщений групою, вибраною з NHR6c, NR6cR6d, NHSO₂NH₂, NHCOR6c та NHSO₂R6c.

11. Сполука за п. 1 або п. 3, в якій

15 R6 являє собою піразиніл або піримідил.

12. Сполука за будь-яким одним з пп. 1, 3 та 5, в якій

R1 являє собою C₁₋₆алкіл.

13. Сполука за будь-яким одним з пп. 1, 3 та 5, в якій

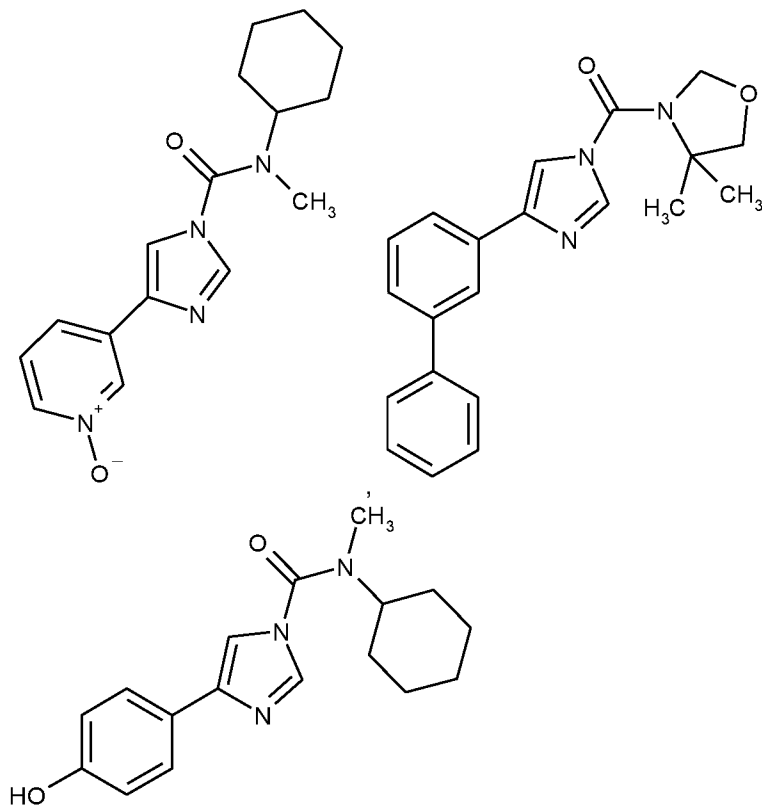
R1 являє собою C₃₋₈циклоалкіл.

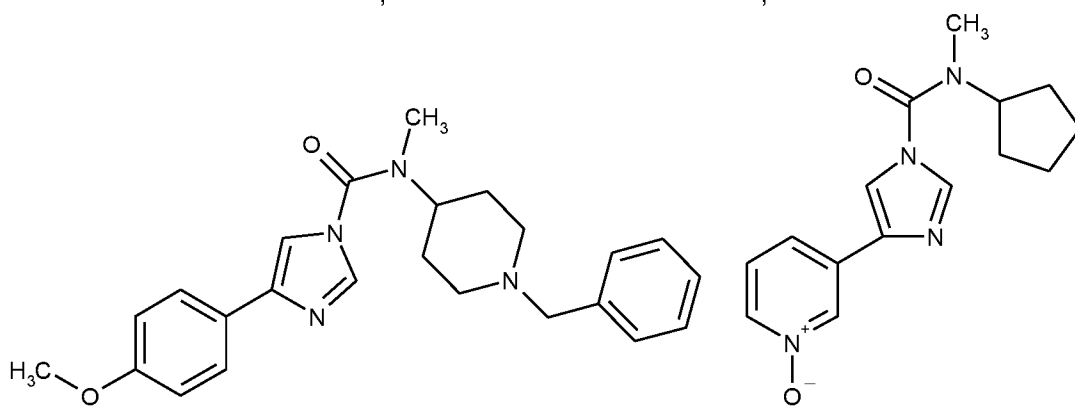
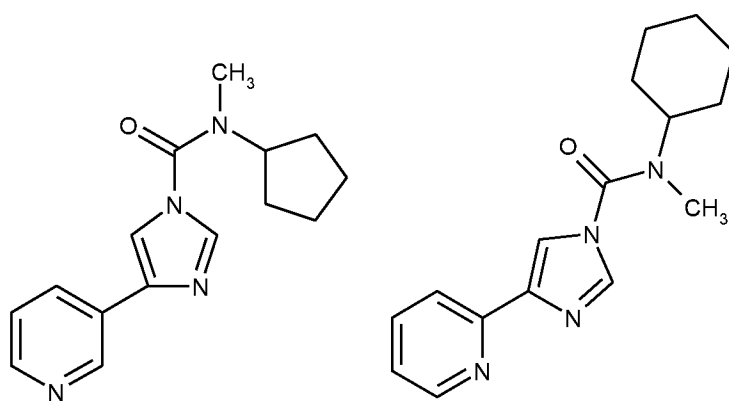
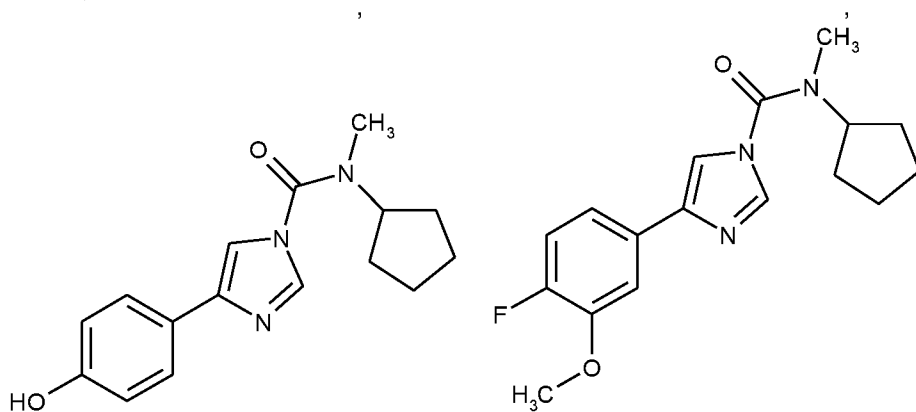
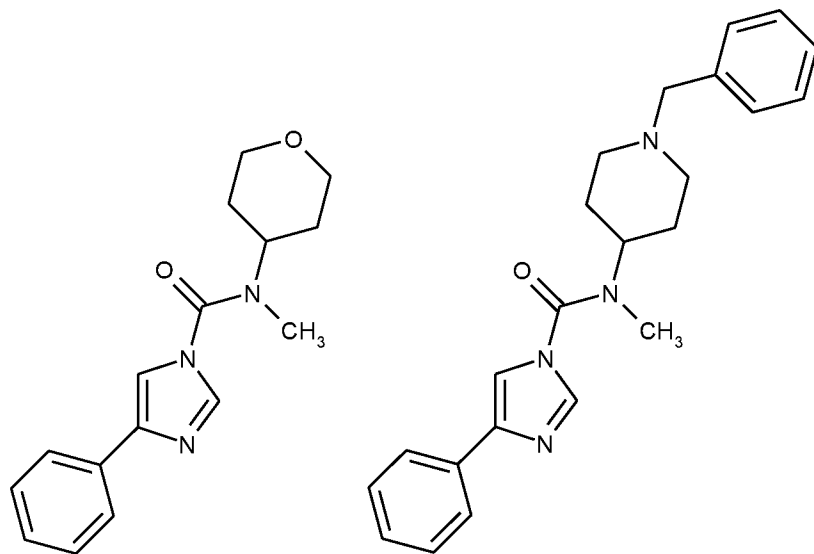
20 14. Сполука за п. 1 або п. 3, в якій

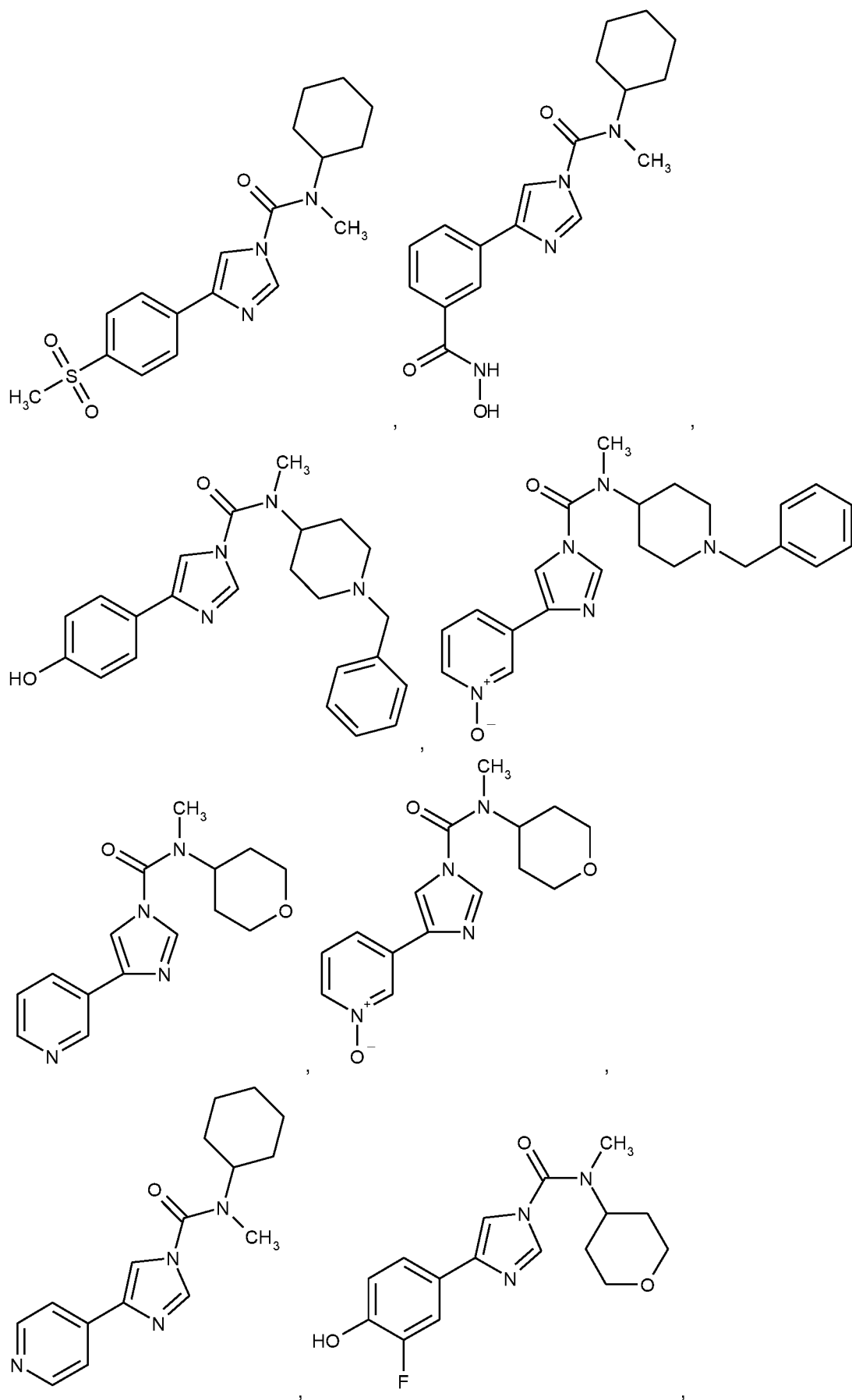
R1 являє собою метил;

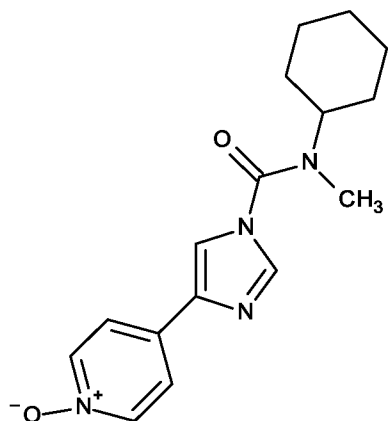
R2 являє собою моноциклічний 6-членний насичений гетероцикліл, що містить один гетероатом азоту, заміщений арилC₁₋₄алкілом, який може бути заміщений або незаміщений, де переважно гетероатом азоту заміщений фенілC₁₋₂алкілом, який може бути заміщений або незаміщений.

25 15. Сполука за п. 1, вибрана з групи наступних сполук:









16. Сполука за п. 1, в якій R1 вибраний з метилу та етилу.

17. Сполука за п. 16, в якій R2 вибраний з арилу, гетероарилу, гетероциклілу та C₃₋₁₀циклоалкілу, кожен з яких може бути заміщений або незаміщений.

5 18. Фармацевтична композиція, яка **відрізняється** тим, що містить сполуку, у відповідності до будь-якого з попередніх пунктів, разом з однією або більше фармацевтично прийнятними допоміжними речовинами.

19. Фармацевтична композиція за п. 18, яка **відрізняється** тим, що додатково містить один або більше додаткових активних фармацевтичних інгредієнтів.

10 20. Сполука за будь-яким одним з пп. 1-17 для застосування в терапії.

21. Застосування сполуки за будь-яким з пп. 1-17 у приготуванні медикаменту для лікування або профілактики стану, розвиток або симптоми якого поєднані з субстратом ферменту ГАЖК, за єдиної умови, що i) якщо R1 являє собою метил, R2 не являє собою 4-хлорбутил, 4-азидобутил або 4-ізотіоціанатобутил, та ii) сполука не являє собою (4-феніл-1H-імідазол-1-іл)(4-(хінолін-2-ілметил)піперазин-1-іл)метанон,

15 де переважно стан являє собою розлад, пов'язаний з ендоканабіноїдною системою, де переважно розлад вибраний з регуляції апетиту, ожиріння, метаболічних розладів, кахексії, анорексії, болю, запалення, нейротоксичності, нейротравми, інсульту, множинного склерозу, пошкодження спинного мозку, хвороби Паркінсона, індукованої леводопою дискінезії, хвороби Хантінгтона, синдрому Жіля де ла Туретта, тардивної дискінезії, дистонії, аміотрофного латерального склерозу, хвороби Альцгеймера, епілепсії, шизофренії, тривожності, депресії, безсоння, нудоти, блювання, алкогольних розладів, зловживання наркотичними речовинами, такими як опіати, нікотин, кокаїн, алкоголь та психостимулятори, гіпертензії, циркуляторного шоку, реперфузійного пошкодження міокарда, атеросклерозу, астми, глаукоми, ретинопатії, раку, запального захворювання кишечника, гострого та хронічного захворювання печінки, такого як гепатит і цироз печінки, артрити та остеопорозу.

Комп'ютерна верстка О. Рябко

Державна служба інтелектуальної власності України, вул. Василя Липківського, 45, м. Київ, МСП, 03680, Україна

ДП "Український інститут інтелектуальної власності", вул. Глазунова, 1, м. Київ – 42, 01601