



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(19) **RU** (11) **2 415 854** (13) **C2**

(51) МПК

C07D 409/12 (2006.01)

C07D 333/54 (2006.01)

C07D 407/12 (2006.01)

C07D 413/12 (2006.01)

A61K 31/559 (2006.01)

A61P 25/00 (2006.01)

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ

(21)(22) Заявка: 2008112224/04, 31.08.2006

(24) Дата начала отсчета срока действия патента:
31.08.2006

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
31.08.2005 JP 2005-251055

(43) Дата публикации заявки: 10.10.2009 Бюл. № 28

(45) Опубликовано: 10.04.2011 Бюл. № 10

(56) Список документов, цитированных в отчете о
поиске: WO 2005/019215 A, 03.03.2005. RU 2141474
C1, 20.11.1999.

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 31.03.2008

(86) Заявка РСТ:
JP 2006/317704 (31.08.2006)

(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2007/026959 (08.03.2007)

Адрес для переписки:
129090, Москва, ул.Б.Спасская, 25, стр.3,
ООО "Юридическая фирма Городисский и
Партнеры", пат.пов. Е.Е.Назиной

(72) Автор(ы):

ЯМАСИТА Хироси (JP),
КУРОДА Хидеаки (JP),
ИТО Нобуаки (JP),
МИЯМУРА Син (JP),
ОСИМА Кунио (JP),
МАЦУБАРА Дзун (JP),
ТАКАХАСИ Харука (JP),
ФУКУСИМА Тае (JP),
СИМИЗУ Сатоси (JP),
КОНДО Казуми (JP),
САКУРАЙ Йохдзи (JP),
КУРОДА Такеси (JP),
ТАИРА Синити (JP),
ИТОТАНИ Мотохиро (JP),
ТАНАКА Тацуеси (JP)

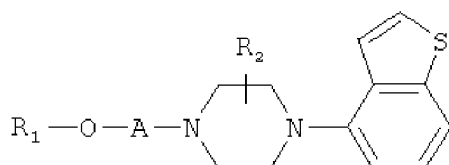
(73) Патентообладатель(и):

ОЦУКА ФАРМАСЬЮТИКАЛ КО., ЛТД.
(JP)

(54) ПРОИЗВОДНЫЕ 4-ПИПЕРАЗИН-1-ИЛ-4-БЕНЗО[Ь]ТИОФЕНА, ПОДХОДЯЩИЕ ДЛЯ
ЛЕЧЕНИЯ РАССТРОЙСТВ ЦНС

(57) Реферат:

Изобретение относится к
гетероциклическому соединению или его соли,
представленному формулой (1):



где R^2 представляет собой атом водорода или
низшую алкильную группу; А представляет
собой низшую алкиленовую группу или низшую
алкениленовую группу и R^1 представляет собой

цикло(C_3 - C_8)алкильную группу, ароматическую
группу или гетероциклическую группу,
выбранную из группы, состоящей из групп (I)-
(IV), определенных в формуле изобретения.
Также изобретение относится к
фармацевтической композиции, обладающей
активностью в качестве частичного агониста
допаминовых D_2 рецепторов, и/или антагониста
серотониновых $5-HT_{2A}$ рецепторов, и/или
антагониста адреналиновых α_1 рецепторов,
и/или ингибитора поглощения серотонина, и/или
ингибитора обратного захвата серотонина, на
основе этих соединений, к способу получения
фармацевтической композиции, к применению

данных соединений, в качестве частичного агониста допаминовых D_2 рецепторов, и/или антагониста серотониновых $5-HT_{2A}$ рецепторов, и/или антагониста адреналиновых α_1 рецепторов, и/или ингибитора поглощения серотонина, и/или ингибитора обратного захвата серотонина, а также к способу

получения соединения формулы 1. Технический результат: получены и описаны новые соединения, которые обладают широким спектром лечебного действия в отношении ментальных расстройств, включая расстройства центральной нервной системы, без побочных эффектов и с высокой степенью безопасности. 5 н. и 17 з.п. ф-лы, 324 табл.

RU 2 4 1 5 8 5 4 C 2

RU 2 4 1 5 8 5 4 C 2



FEDERAL SERVICE
FOR INTELLECTUAL PROPERTY,
PATENTS AND TRADEMARKS

(51) Int. Cl.

C07D 409/12 (2006.01)*C07D 333/54* (2006.01)*C07D 407/12* (2006.01)*C07D 413/12* (2006.01)*A61K 31/559* (2006.01)*A61P 25/00* (2006.01)(12) **ABSTRACT OF INVENTION**(21)(22) Application: **2008112224/04, 31.08.2006**(24) Effective date for property rights:
31.08.2006

Priority:

(30) Priority:
31.08.2005 JP 2005-251055(43) Application published: **10.10.2009 Bull. 28**(45) Date of publication: **10.04.2011 Bull. 10**(85) Commencement of national phase: **31.03.2008**(86) PCT application:
JP 2006/317704 (31.08.2006)(87) PCT publication:
WO 2007/026959 (08.03.2007)Mail address:
**129090, Moskva, ul.B.Spaskaja, 25, str.3, OOO
"Juridicheskaja firma Gorodisskij i Partnery",
pat.pov. E.E.Nazinoj**

(72) Inventor(s):

**JaMASITA Khirosi (JP),
KURODA Khideaki (JP),
ITO Nobuaki (JP),
MIJaMURA Sin (JP),
OSIMA Kunio (JP),
MATsUBARA Dzun (JP),
TAKAKhASI Kharuka (JP),
FUKUSIMA Tae (JP),
SIMIZU Satosi (JP),
KONDO Kazumi (JP),
SAKURAJ Jokhdzi (JP),
KURODA Takesi (JP),
TAIRA Siniti (JP),
ITOTANI Motokhiro (JP),
TANAKA Tatsuesi (JP)**

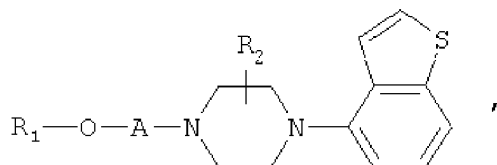
(73) Proprietor(s):

OTsUKA FARMAS'JuTIKAL KO., LTD. (JP)(54) **4-PIPERAZIN-1-YL-4-BENZO[b]THIOPHENE DERIVATIVES, SUITABLE FOR TREATING CENTRAL NERVOUS SYSTEM DISORDERS**

(57) Abstract:

FIELD: chemistry.

SUBSTANCE: invention relates to a heterocyclic compound or salt thereof, having formula (1):



where R^2 is hydrogen or a lower alkyl group; A is a lower alkylene group or a lower alkenylene group and R^1 is a cyclo(C_3 - C_8)alkyl group, an aromatic group or a heterocyclic group selected from a group consisting of groups (I)-(IV), defined in the formula of invention. The invention also relates to a pharmaceutical composition, having activity as a

partial agonist of dopamine D_2 receptors and/or a serotonin $5-HT_{2A}$ receptor antagonist and/or an adrenalin α_1 receptor antagonist and/or a serotonin absorption inhibitor and/or serotonin reuptake inhibitor based on said compounds, a method of preparing a pharmaceutical composition, use of said compounds as a partial agonist of dopamine D_2 receptors and/or a serotonin $5-HT_{2A}$ receptor antagonist and/or an adrenalin α_1 receptor antagonist and/or a serotonin absorption inhibitor and/or serotonin reuptake inhibitor, as well as a method of producing formula I compounds.

EFFECT: novel compounds are obtained and described, which have a wide range of curative effect on mental disorders, including central nervous system disorders, without side effects and with high degree of safety.

22 cl, 3110 ex, 314 tbl

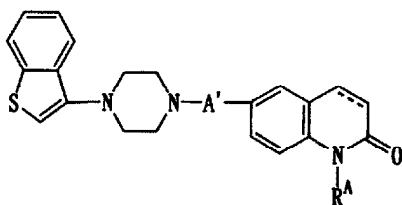
ОБЛАСТЬ ТЕХНИКИ, К КОТОРОЙ ОТНОСИТСЯ ИЗОБРЕТЕНИЕ

Настоящее изобретение относится к новому гетероциклическому соединению.

УРОВЕНЬ ТЕХНИКИ

Поскольку причины шизофрении, а также биполярного расстройства, расстройств настроения и эмоциональных расстройств различны, является желательным, чтобы лекарственное вещество обладало множественными фармакологическими эффектами, обеспечивающими широкий спектр лечебного действия.

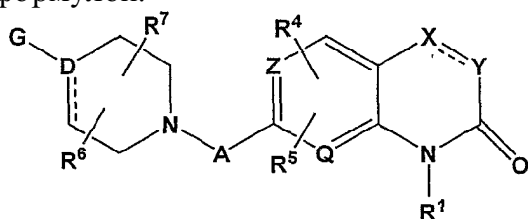
В WO 2004/026864A1 раскрыто, что производное карбостирила, представленное общей формулой



(где A' представляет собой $-(CH_2)_mCH_2-$, $-(CH_2)_mO-$ и т.д., m представляет собой целое число от 1 до 4 и R^A представляет собой атом водорода, C_{1-4} алкильную группу, которая может быть замещенной 1-3 атомами фтора, и т.д.), обладает антагонистической активностью по отношению к D_2 рецепторам и антагонистической активностью по отношению к серотониновым $2A$ ($5-HT_{2A}$) рецепторам и эффективно в лечении шизофрении и других расстройств центральной нервной системы.

Однако в WO 2004/026864A1 не сказано, что производные карбостирила, описанные в документе, обладают также активностью частичных агонистов D_2 рецепторов, активностью антагонистов $5-HT_{2A}$ рецепторов, активностью антагонистов α_1 рецепторов и активностью ингибиторов поглощения серотонина и имеют широкий спектр лечебного действия.

В WO 2005/019215 A1 раскрыты соединения, представленные следующей формулой:



(где A представляет собой $-(CH_2)_mCH_2-$, $-(CH_2)_mO-$ или тому подобное; m представляет собой целое число от 2 до 5; D представляет собой N, C или тому подобное; Z и Q независимо представляют собой N, C или CH, при условии, что по крайней мере один из Z и Q представляет собой N; X и Y независимо представляют собой C, N или тому подобное и связь между X и Y является одинарной или двойной связью; R^1 представляет собой водород, (C_1-C_3) алкильную группу или тому подобное; каждый из R^4 , R^5 , R^6 и R^7 представляет собой водород, алкильную группу или тому подобное и G представляет собой группу моноциклического или бициклического соединения), которые связываются с допаминовыми D_2 рецепторами. В WO 2005/019215 A1 указано, что некоторые соединения, раскрытые в описании к ней, обладают активностью частичных агонистов D_2 рецепторов или активностью антагонистов D_2 рецепторов и могут быть эффективными в лечении

шизофрении и других расстройств центральной нервной системы.

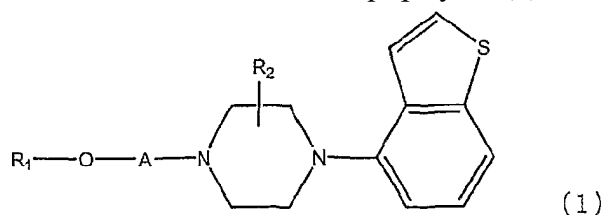
Однако в WO 2005/019215 A1 конкретно не раскрыты соединения по настоящему изобретению.

РАСКРЫТИЕ СУЩНОСТИ ИЗОБРЕТЕНИЯ

Целью настоящего изобретения является создание антипсихотического лекарственного средства, которое обладает более широким спектром лечебного действия, меньшими побочными эффектами и превосходными толерантностью и безопасностью по сравнению с хорошо известными типичными и атипичными антипсихотическими лекарственными средствами.

Авторы настоящего изобретения провели интенсивные исследования указанной выше проблемы и в результате получили новое соединение, которое в дополнение к указанным эффектам обладает также активностью частичного агониста допаминовых D_2 рецепторов (активностью частичного агониста D_2 рецепторов), активностью антагониста серотониновых $5-HT_{2A}$ рецепторов (активностью антагониста $5-HT_{2A}$ рецепторов) и активностью антагониста адреналиновых α_1 рецепторов (активностью антагониста α_1 рецепторов) и, кроме того, обладает эффектом ингибирования поглощения серотонина (или эффектом ингибирования обратного захвата серотонина). На основе полученных результатов и было создано настоящее изобретение.

В соответствии с настоящим изобретением предлагается гетероциклическое соединение или его соль формулы (1):



где R^2 представляет собой атом водорода или низшую алкильную группу;

A представляет собой низшую алкиленовую группу или низшую алкениленовую группу и

R^1 представляет собой цикло(C_3 - C_8)алкильную группу, ароматическую группу или гетероциклическую группу, выбранную из группы, состоящей из групп (I)-(IV), определенных ниже:

(I) цикло(C_3 - C_8)алкильная группа;

(II) ароматическая группа, выбранная из фенильной группы, нафтильной группы, дигидроинденильной группы и тетрагидронафтильной группы;

(III) насыщенная или ненасыщенная гетеромоноциклическая группа, содержащая 1-4 гетероатома, выбранных из группы, состоящей из атома азота, атома кислорода и атома серы; и

(IV) конденсированная с бензолом гетероциклическая группа, которая содержит 1-4 гетероатома, выбранных из группы, состоящей из атома азота, атома кислорода и атома серы, и которая выбрана из группы, состоящей из (1)

тетрагидрохиноксалинильной группы, (2) тетрагидрохиназолинильной группы, (3)

дигидрохиназолинильной группы, (4) индолинильной группы, (5) индолильной

группы, (6) изоиндолинильной группы, (7) бензимидазолильной группы, (8)

дигидробензимидазолильной группы, (9) тетрагидробензазепинильной группы, (10)

тетрагидробензодиазепинильной группы, (11) гексагидробензазоцинильной группы,

(12) дигидробензоксазинильной группы, (13) дигидробензоксазолильной группы,

- (14) бензизоксазолильной группы, (15) бензоксадиазолильной группы, (16) тетрагидробензоксазепинильной группы, (17) дигидробензотиазинильной группы, (18) бензотиазолильной группы, (19) бензоксатиолильной группы, (20) хроменильной группы, (21) дигидробензофурильной группы, (22) карбазолильной группы, (23) дибензофурильной группы и (24) хиноксалинильной группы; причем в качестве заместителя в цикло(C₃-C₈)алкильной группе, ароматической группе и гетероциклической группе, представленных символом R¹, может присутствовать по крайней мере одна группа, выбранная из группы, состоящей из групп (1)-(66), определенных ниже:
- (1) низшая алкильная группа,
 - (2) низшая алкенильная группа,
 - (3) галогензамещенная низшая алкильная группа,
 - (4) низшая алкоксигруппа,
 - (5) арилоксигруппа,
 - (6) низшая алкилтиогруппа,
 - (7) галогензамещенная низшая алкоксигруппа,
 - (8) гидроксигруппа,
 - (9) защищенная гидроксигруппа,
 - (10) гидрокси(низшая)алкильная группа,
 - (11) защищенная гидрокси(низшая)алкильная группа,
 - (12) атом галогена,
 - (13) цианогруппа,
 - (14) арильная группа,
 - (15) нитрогруппа,
 - (16) аминогруппа,
 - (17) аминогруппа, содержащая в качестве заместителя группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алканоильной группы, низшей алкоксикарбонильной группы, низшей алкилсульфонильной группы, карбамоильной группы, низшей алкилкарбамоильной группы, амино(низшей)алканоильной группы, низшей алканоиламино(низшей)алканоильной группы и низшей алкоксикарбониламино(низшей)алканоильной группы,
 - (18) низшая алканоильная группа,
 - (19) арилсульфонильная группа, которая может содержать низшую алкильную группу(ы) в арильной группе,
 - (20) карбоксигруппа,
 - (21) низшая алкоксикарбонильная группа,
 - (22) карбокси(низшая)алкильная группа,
 - (23) низшая алкоксикарбонил(низшая)алкильная группа,
 - (24) низшая алканоиламино(низшая)алканоильная группа,
 - (25) карбокси(низшая)алкенильная группа,
 - (26) низшая алкоксикарбонил(низшая)алкенильная группа,
 - (27) карбамоил(низшая)алкенильная группа, которая может содержать в качестве заместителя группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алкильной группы и галогензамещенной низшей алкильной группы,
 - (28) карбамоильная группа, которая может содержать в качестве заместителя группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из групп (i)-(lxxviii), определенных ниже:
 - (i) низшая алкильная группа,

- (ii) низшая алкоксигруппа,
 (iii) гидроксизамещенная алкильная группа,
 (iv) низшая алкоксизамещенная алкильная группа,
 (v) арилоксизамещенная алкильная группа,
 5 (vi) галогензамещенная низшая алкильная группа,
 (vii) амино(низшая)алкильная группа, которая может содержать группу(ы),
 выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей
 алканоильной группы, ароильной группы и карбамоильной группы,
 10 (viii) цикло(C₃-C₈)алкильная группа, которая может содержать группу(ы),
 выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алкильной группы,
 гидроксигруппы, низшей алкоксикарбонильной группы и
 фенил(низшей)алкоксигруппы, в качестве заместителя,
 (ix) цикло(C₃-C₈)алкилзамещенная низшая алкильная группа,
 15 (x) низшая алкенильная группа,
 (xi) карбамоил(низшая)алкильная группа, которая может содержать группу(ы),
 выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алкильной группы, фенильной
 группы, которая может содержать низшую алкильную группу(ы), и фенильной
 20 группы (или групп), которая(ые) может(могут) содержать низшую алкоксигруппу(ы)
 в качестве заместителя,
 (xii) низшая алкоксикарбонил(низшая)алкильная группа,
 (xiii) фурил(низшая)алкильная группа (которая может содержать низшую
 алкильную группу(ы) в качестве заместителя в фурильной группе),
 25 (xiv) тетрагидрофурил(низшая)алкильная группа,
 (xv) 1,3-диоксоланил(низшая)алкильная группа,
 (xvi) тетрагидропиранил(низшая)алкильная группа,
 (xvii) пирролил(низшая)алкильная группа (которая может содержать низшую
 30 алкильную группу(ы) в качестве заместителя в пирролильной группе),
 (xviii) низшая алкильная группа, замещенная дигидропиразолильной группой,
 которая может содержать оксогруппу(ы),
 (xix) пиразолил(низшая)алкильная группа (которая может содержать низшую
 алкильную группу(ы) в качестве заместителя в пиразолильной группе),
 35 (xx) имидазолил(низшая)алкильная группа,
 (xxi) пиридил(низшая)алкильная группа,
 (xxii) пиразинил(низшая)алкильная группа (которая может содержать низшую
 алкильную группу(ы) в качестве заместителя в пиразинильной группе),
 40 (xxiii) пирролидинил(низшая)алкильная группа (которая может содержать
 группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из оксогруппы (или -групп) и
 низшей алкильной группы, в качестве заместителя в пирролидинильной группе),
 (xxiv) пиперидил(низшая)алкильная группа (которая может содержать группу(ы),
 выбранную(ые) из группы, состоящей из бензоильной группы и низшей
 45 алканоильной группы, в качестве заместителя в пиперидильной группе),
 (xxv) пиперазинил(низшая)алкильная группа (которая может содержать низшую
 алкильную группу(ы) в качестве заместителя в пиперазинильной группе),
 (xxvi) морфолинил(низшая)алкильная группа,
 50 (xxvii) тиенил(низшая)алкильная группа (которая может содержать низшую
 алкильную группу(ы) в качестве заместителя в тиенильной группе),
 (xxviii) тиазолил(низшая)алкильная группа,
 (xxix) дигидробензофурил(низшая)алкильная группа,

(xxx) бензопиранил(низшая)алкильная группа (которая может содержать оксогруппу(ы) в качестве заместителя в бензопиранильной группе),

(xxxi) бензимидазолил(низшая)алкильная группа,

5 (xxxii) индолил(низшая)алкильная группа (которая может содержать низшую алкоксикарбонильную группу(ы) в низшей алкильной группе),

(xxxiii) имидазолил(низшая)алкильная группа, которая содержит заместитель(и), выбранный(е) из группы, состоящей из карбамоильной группы и низшей алкоксикарбонильной группы, в низшей алкильной группе,

10 (xxxiv) пиридилная группа, которая может содержать группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алкоксигруппы и низшей алкилтио(низшей)алкильной группы, в качестве заместителя,

(xxxv) пирролидинильная группа, которая может содержать группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алкоксикарбонильной группы, низшей алканоильной группы и ароильной группы, в качестве заместителя,

(xxxvi) пиперидильная группа, которая может содержать группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алкоксикарбонильной группы, низшей алканоильной группы и ароильной группы, которая может содержать группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алкильной группы и атома галогена, в качестве заместителя,

(xxxvii) тетрагидрофурильная группа, которая может содержать оксогруппу(ы),

25 (xxxviii) гексагидроазепинильная группа, которая может содержать оксогруппу(ы),

(xxxix) пиразолильная группа, которая может содержать группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алкильной группы, арильной группы и фурильной группы, в качестве заместителя,

(xl) тиазолильная группа,

30 (xli) тиадиазолильная группа, которая может содержать низшую алкильную группу(ы),

(xlii) изоксазолильная группа, которая может содержать низшую алкильную группу(ы),

(xliii) индазолильная группа,

35 (xliv) индолильная группа,

(xlv) тетрагидробензотиазолильная группа,

(xlv) тетрагидрохинолильная группа, которая может содержать группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алкоксигруппы, атома галогена и оксогруппы, в качестве заместителя,

40 (xlvii) хинолильная группа, которая может содержать низшую алкильную группу(ы),

(xlviii) бензодиоксилил(низшая)алкильная группа,

45 (xlix) арильная группа, которая может содержать в качестве заместителя группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из атома галогена; низшей алкильной группы; низшей алкоксигруппы; галогензамещенной низшей алкильной группы; галогензамещенной низшей алкоксигруппы; низшей алкенильной группы; аминогруппы, которая может содержать группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алканоильной группы, низшей алкилсульфонильной группы, низшей алкильной группы и арильной группы; сульфоамойльной группы; низшей алкилтиогруппы; низшей алканоильной группы; низшей алкоксикарбонильной группы; пирролильной группы; низшей алкинильной группы; цианогруппы;

нитрогруппы; арилоксигруппы; арил(низшей)алкоксигруппы; гидроксигруппы; гидроксид(низшей)алкильной группы; карбамоильной группы, которая может содержать группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алкильной группы и арильной группы; пиразолильной группы; пирролидинильной группы, которая может содержать оксогруппу(ы); оксазолильной группы; имидазолильной группы, которая может содержать низшую алкильную группу(ы); дигидрофурильной группы, которая может содержать оксогруппу(ы); тиазолидинил(низшей)алкильной группы, которая может содержать оксогруппу(ы);

имидазолил(низшей)алканоильной группы и пиперидинилкарбонильной группы,

(I) циано(низшая)алкильная группа,

(Ii) дигидрохинолильная группа, которая может содержать группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алкильной группы и оксогруппы,

(Iii) галогензамещенная низшая алкиламиногруппа,

(Iiii) низшая алкилтио(низшая)алкильная группа,

(Iiv) амидиногруппа, которая может содержать низшую алкильную группу(ы),

(Iv) амидино(низшая)алкильная группа,

(Ivi) низшая алкенилокси(низшая)алкильная группа,

(Ivii) ариламиногруппа, которая может содержать заместитель(и), выбранный(е) из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алкоксигруппы, галогензамещенной низшей алкильной группы и галогензамещенной низшей алкоксигруппы, в арильной группе,

(Iviii) арил(низшая)алкенильная группа,

(Iix) пиридиламиногруппа, которая может содержать низшую алкильную группу(ы),

(Ix) арил(низшая)алкильная группа (которая может содержать в арильной группе и/или низшей алкильной группе группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из атома галогена, низшей алкильной группы, галогензамещенной низшей алкильной группы, галогензамещенной низшей алкоксигруппы, низшей алкоксигруппы, карбамоильной группы и низшей алкоксикарбонильной группы, в качестве заместителя),

(Ixi) низшая алкинильная группа,

(Ixii) арилокси(низшая)алкильная группа (которая может содержать в качестве заместителя в арильной группе группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алкоксигруппы; карбамоильной группы, которая может содержать группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алкоксигруппы и низшей алкильной группы; и пирролидинильной группы, которая может содержать оксогруппу(ы)),

(Ixiiii) изоксазолидинильная группа, которая может содержать оксогруппу(ы),

(Ixiv) дигидроинденильная группа,

(Ixv) арил(низшая)алкокси(низшая)алкильная группа,

(Ixvi) тетрагидропиранильная группа,

(Ixvii) азетидинильная группа, которая может содержать группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алканоильной группы и ароильной группы,

(Ixviii) азетидинил(низшая)алкильная группа, которая может содержать группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алканоильной группы и ароильной группы,

(Ixix) тетразолильная группа,

(Ixx) индолинильная группа, которая может содержать оксогруппу(ы),
 (Ixxi) триазилильная группа, которая может содержать группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алкильной группы и низшей алкилтиогруппы,
 (Ixxii) имидазолильная группа, которая может содержать карбамоильную
 5 группу(ы),
 (Ixxiii) оксазолильная группа, которая может содержать низшую алкильную группу(ы),
 (Ixxiv) изотиазолильная группа, которая может содержать низшую алкильную
 10 группу(ы),
 (Ixxv) бензимидазолильная группа,
 (Ixxvi) дигидробензотиазолильная группа, которая может содержать оксогруппу(ы),
 (Ixxvii) тиенильная группа, которая может содержать низшую
 15 алкоксикарбонильную группу(ы), и
 (Ixxviii) оксазол(низшая)алкильная группа, которая может содержать низшую алкильную группу(ы),
 (29) амино(низшая)алкильная группа, которая может содержать группу(ы),
 20 выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алкильной группы, галогензамещенной низшей алкильной группы, низшей алкоксикарбонильной группы, низшей алканоильной группы, арильной группы, арил(низшей)алкильной группы, ароильной группы и аминзамещенной алкильной группы (которая может
 25 содержать низшую алкильную группу(ы) в качестве заместителя в аминогруппе), в аминогруппе,
 (30) низшая алкильная группа, замещенная карбамоильной группой, которая может содержать группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алкильной группы и галогензамещенной низшей алкильной группы,
 30 (31) тиокарбамоильная группа, которая может содержать низшую алкильную группу(ы),
 (32) сульфамойльная группа,
 (33) оксазолидинильная группа, которая может содержать оксогруппу(ы),
 (34) имидазолидинильная группа, которая может содержать заместитель(и),
 35 выбранный(е) из группы, состоящей из оксогруппы и низшей алкильной группы,
 (35) пирролидинильная группа, которая может содержать оксогруппу(ы),
 (36) имидазолильная группа,
 (37) триазилильная группа,
 40 (38) изоксазолильная группа,
 (39) пиперидильная группа, которая может содержать заместитель(и), выбранный(е) из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алканоильной группы, арилсульфонильной группы, оксогруппы, гидроксигруппы и аминогруппы, которая может содержать группу(ы), выбранную(ые) из группы,
 45 состоящей из низшей алкильной группы, низшей алканоильной группы, низшей алкоксикарбонильной группы и низшей алканоиламино(низшей)алканоильной группы,
 (40) пиперидилкарбонильная группа, которая может содержать заместитель(и),
 50 выбранный(е) из группы, состоящей из низшей алкильной группы, гидроксигруппы, гидрокс(низшей)алкильной группы, низшей алканоильной группы, карбокси(низшей)алкильной группы, низшей алкилкарбамоил(низшей)алкильной группы, карбамоильной группы, низшей алкоксигруппы, карбоксигруппы, низшей

алкоксикарбонильной группы, аминогруппы (в которой могут присутствовать 1-2 группы, выбранные из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алканоильной группы, низшей алкоксикарбонильной группы и ароильной группы), пиперидильной группы (в которой может(могут) присутствовать группа(ы),
 5 выбранная(ые) из группы, состоящей из низшей алканоильной группы, низшей алкоксикарбонильной группы и ароильной группы), пиперазинильной группы (в которой может(могут) присутствовать низшая алкильная группа(ы) в качестве заместителя), 1,4-диокса-8-азаспиро[4.5]децильной группы, морфолинийной
 10 группы, гексагидро-1,4-дiazепинильной группы (в которой может(могут) присутствовать низшая алкильная группа(ы) в качестве заместителя), пиридинильной группы, пиридилоксигруппы, пиридил(низшей)алкоксигруппы, тетрагидрохинолильной группы (в которой может(могут) присутствовать оксогруппа(ы)), бензодиоксолильной группы, арил(низшей)алкоксигруппы (которая
 15 может содержать группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из атома галогена, низшей алкильной группы, низшей алкоксигруппы и галогензамещенной низшей алкоксигруппы, в арильной группе), арильной группы (в которой может(могут) присутствовать группа(ы), выбранная(ые) из группы, состоящей из
 20 атома галогена, низшей алкоксигруппы, гидроксигруппы), арилоксигруппы (которая может содержать в арильной группе группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из цианогруппы, атома галогена, низшей алкильной группы, низшей алкоксигруппы и галогензамещенной низшей алкильной группы),
 25 арил(низшей)алкильной группы (которая может содержать в арильной группе группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из атома галогена, низшей алкильной группы, низшей алкоксигруппы и галогензамещенной низшей алкильной группы) и ароильной группы (которая может содержать в арильной группе группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из атома галогена и низшей
 30 алкоксигруппы),

(41) пирролидинилкарбонильная группа, которая может содержать в качестве заместителя группу, выбранную из группы, состоящей из
 гидрокси(низшей)алкильной группы, карбамоильной группы, гидроксигруппы, аминогруппы (которая может содержать в аминогруппе группу(ы), выбранную(ые)
 35 из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алканоильной группы и ароильной группы), морфолинил(низшей)алкильной группы, пирролидинил(низшей)алкильной группы, пиперидил(низшей)алкильной группы, пиперазинил(низшей)алкильной группы (которая может содержать в качестве заместителя в пиперазинильной группе низшую алкильную группу(ы)),
 40 амино(низшей)алкильной группы (которая может содержать в качестве заместителя в аминогруппе низшую алкильную группу(ы)), арилоксигруппы (которая может содержать галогензамещенную низшую алкоксигруппу(ы) в арильной группе), арилокси(низшей)алкильной группы (которая может содержать галогензамещенную
 45 низшую алкоксигруппу(ы) в арильной группе) и тетрагидрохинолильной группы (в которой может присутствовать оксогруппа(ы)),

(42) пиперазинилкарбонильная группа, которая может содержать в качестве заместителя группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алкильной
 50 группы, цикло(C₃-C₈)алкильной группы, низшей алканоильной группы, гидрокси(низшей)алкильной группы, низшей алкокси(низшей)алкильной группы, низшей алкоксикарбонильной группы, амино(низшей)алкильной группы (которая может содержать низшую алкильную группу(ы) в качестве заместителя в

- аминогруппе), пиперидил(низшей)алкильной группы (которая может содержать низшую алкильную группу(ы) в качестве заместителя в пиперидильной группе), морфолинил(низшей)алкильной группы, пирролидинил(низшей)алкильной группы, 1,3-диоксоланил(низшей)алкильной группы, тетрагидрофурил(низшей)алкильной группы, пиридил(низшей)алкильной группы (которая может содержать фенильную группу(ы) в качестве заместителя в низшей алкильной группе), имидазолил(низшей)алкильной группы, фурил(низшей)алкильной группы, пирролидинилкарбонил(низшей)алкильной группы, пиперидильной группы, которая может содержать низшую алкильную группу(ы) в качестве заместителя, пиридийной группы (которая может содержать в качестве заместителя в пиридийной группе группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алкильной группы, цианогруппы и галогензамещенной низшей алкильной группы), тиено[2,3-b]пиридийной группы, арильной группы (в которой может(могут) присутствовать группа(ы), выбранная(ые) из группы, состоящей из атома галогена и низшей алкильной группы), ароильной группы, фурилкарбонильной группы, арил(низшей)алкоксикарбонильной группы и оксогруппы,
- (43) гексагидроазепинилкарбонильная группа,
- (44) гексагидро-1,4-дiazепинилкарбонильная группа, которая может содержать заместитель(и), выбранный(е) из группы, состоящей из низшей алкильной группы и пиридийной группы,
- (45) дигидропирролилкарбонильная группа, которая может содержать низшую алкильную группу(ы),
- (46) тиоморфолинилкарбонильная группа,
- (47) морфолинилкарбонильная группа, которая может содержать группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алкильной группы, пиперидил(низшей)алкильной группы и арильной группы,
- (48) тиазолидинилкарбонильная группа, которая может содержать арильную группу(ы), которая может содержать группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алкоксигруппы и цианогруппы,
- (49) азабицикло[3.2.2]нонилкарбонильная группа,
- (50) 8-азабицикло[3.2.1]октилкарбонильная группа, которая может содержать галогензамещенную или незамещенную арилоксигруппу(ы),
- (51) индолинилкарбонильная группа,
- (52) тетрагидрохинолилкарбонильная группа,
- (53) тетрагидропиридо[3.4-b]индолилкарбонильная группа,
- (54) морфолинил(низшая)алкильная группа,
- (55) пиперазинил(низшая)алкильная группа, которая может содержать низшую алкильную группу(ы) в пиперазинильной группе,
- (56) морфолинилкарбонил(низшая)алкильная группа,
- (57) пиперазинилкарбонил(низшая)алкильная группа, которая может содержать низшую алкильную группу(ы) в пиперазинильной группе,
- (58) оксогруппа,
- (59) амино(низшая)алкоксигруппа (которая может содержать низшую алкильную группу(ы) в аминогруппе),
- (60) низшая алкокси(низшая)алкоксигруппа,
- (61) пиперазинильная группа, которая может содержать группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из оксогруппы, низшей алкильной группы, низшей алканойльной группы и низшей алкоксикарбонильной группы,

(62) морфолинильная группа,
 (63) 1,3,8-триазаспиро[4.5]деканилкарбонильная группа, которая может
 содержать группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из оксогруппы и
 арильной группы,

(64) тетрагидропиридилкарбонильная группа, которая может содержать
 пиридиную группу(ы),

(65) имидазолидинилкарбонильная группа, которая может содержать
 тиоксогруппу(ы), и

(66) 1,4-диокса-8-азаспиро[4.5]деканильная группа.

В соответствии с настоящим изобретением предлагается соединение,
 представленное общей формулой (1),

где R^1 представляет собой цикло(C_5 - C_6)алкильную группу, ароматическую группу
 или гетероциклическую группу, выбранную из группы, состоящей из групп (I)-(IV),
 определенных ниже:

(I) цикло(C_5 - C_6)алкильная группа;

(II) ароматическая группа, выбранная из фенильной группы, нафтильной группы,
 дигидроинденильной группы и тетрагидронафтильной группы;

(III) насыщенная или ненасыщенная гетеромоноциклическая группа, которая
 содержит 1-2 гетероатома, выбранных из группы, состоящей из атома азота, атома
 кислорода и атома серы, и которая выбрана из группы, состоящей из
 пирролидинильной группы, пиперидильной группы, пиразолильной группы,
 пиридинильной группы, пиримидинильной группы, пиразинильной группы,
 изоксазолильной группы, тиазолильной группы, пиранильной группы и тиенильной
 группы; и

(IV) конденсированная с бензолом гетероциклическая группа, которая содержит 1-
 4 гетероатома, выбранных из группы, состоящей из атома азота, атома кислорода и
 атома серы, и которая выбрана из группы, состоящей из (1)

тетрагидрохиноксалинильной группы, (2) тетрагидрохиназолинильной группы, (3)
 дигидрохиназолинильной группы, (4) индолинильной группы, (5) индолильной
 группы, (6) изоиндолинильной группы, (7) бензимидазолинильной группы, (8)

дигидробензимидазолильной группы, (9) тетрагидробензазепинильной группы, (10)
 тетрагидробензодиазепинильной группы, (11) гексагидробензасоцинильной группы,
 (12) дигидробензоксазинильной группы, (13) дигидробензоксазолильной группы,
 (14) бензизоксазолильной группы, (15) бензоксадиазолильной группы, (16)

тетрагидробензоксазепинильной группы, (17) дигидробензотиазинильной группы,
 (18) бензотиазолильной группы, (19) бензоксатиолильной группы, (20)

хроменильной группы, (21) дигидробензофурильной группы, (22) карбазолильной
 группы, (23) дибензофурильной группы и (24) хиноксалинильной группы; причем в
 ароматической группе и гетероциклической группе, представленных символом R^1 ,
 могут присутствовать в качестве заместителя(ей) 1-5 групп, выбранных из группы,
 состоящей из групп (1)-(66), определенных ниже:

(1) низшая алкильная группа,

(2) низшая алкенильная группа,

(3) галогензамещенная низшая алкильная группа,

(4) низшая алкоксигруппа,

(5) феноксигруппа,

(6) низшая алкилтиогруппа,

(7) галогензамещенная низшая алкоксигруппа,

- (8) гидроксигруппа,
 (9) фенил(низшая)алкоксигруппа,
 (10) гидроксид(низшая)алкильная группа,
 (11) низшая алкоксид(низшая)алкильная группа,
 5 (12) атом галогена,
 (13) цианогруппа,
 (14) фенильная группа,
 (15) нитрогруппа,
 10 (16) аминогруппа,
 (17) аминогруппа, содержащая в качестве заместителя(ей) 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алканойльной группы, низшей алкоксикарбонильной группы, низшей алкилсульфонильной группы, карбамоильной группы, низшей алкилкарбамоильной группы,
 15 аминод(низшей)алканойльной группы, низшей алканойламинод(низшей)алканойльной группы и низшей алкоксикарбонилламинод(низшей)алканойльной группы,
 (18) низшая алканойльная группа,
 (19) фенилсульфонильная группа, которая может содержать одну низшую алкильную группу в фенильной группе,
 20 (20) карбоксигруппа,
 (21) низшая алкоксикарбонильная группа,
 (22) карбоксид(низшая)алкильная группа,
 (23) низшая алкоксикарбонил(низшая)алкильная группа,
 25 (24) низшая алканойламинод(низшая)алканойльная группа,
 (25) карбоксид(низшая)алкильная группа,
 (26) низшая алкоксикарбонил(низшая)алкильная группа,
 (27) карбамоил(низшая)алкильная группа, которая может содержать в качестве заместителя(ей) 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы и низшей алкильной группы, замещенной 1-3 атомами галогена,
 30 (28) карбамоильная группа, которая может содержать в качестве заместителя(ей) 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из групп (i)-(lxxviii), определенных ниже:
 35 (i) низшая алкильная группа,
 (ii) низшая алкоксигруппа,
 (iii) гидроксид(низшая)алкильная группа,
 (iv) низшая алкоксид(низшая)алкильная группа,
 40 (v) феноксид(низшая)алкильная группа,
 (vi) галогензамещенная низшая алкильная группа,
 (vii) аминод(низшая)алкильная группа, которая может содержать 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алканойльной группы, бензоильной группы и карбамоильной группы,
 45 (viii) цикло(C₃-C₈)алкильная группа, которая может содержать 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, гидроксигруппы, низшей алкоксикарбонильной группы и фенил(низшей)алкоксигруппы, в качестве заместителя(ей),
 50 (ix) цикло(C₃-C₈)алкилзамещенная низшая алкильная группа,
 (x) низшая алкильная группа,
 (xi) низшая алкильная группа, содержащая 1-2 карбамоильных группы, которые могут содержать в качестве заместителя(ей) 1-2 группы, выбранных из группы,

состоящей из низшей алкильной группы, фенильной группы, которая может содержать одну низшую алкильную группу, и фенильной группы, которая может содержать одну низшую алкоксигруппу,

(xii) низшая алкильная группа, содержащая 1-2 низших алкоксикарбонильных групп,

(xiii) фурил(низшая)алкильная группа (которая может содержать 1-2 низших алкильных группы в качестве заместителя(ей) в фурильной группе),

(xiv) тетрагидрофурил(низшая)алкильная группа,

(xv) 1,3-диоксоланил(низшая)алкильная группа,

(xvi) тетрагидропиранил(низшая)алкильная группа,

(xvii) пирролил(низшая)алкильная группа (которая может содержать 1-2 низших алкильных группы в качестве заместителя(ей) в пирролильной группе),

(xviii) низшая алкильная группа, замещенная дигидропиразолильной группой, которая может содержать одну оксогруппу,

(xix) пиразолил(низшая)алкильная группа (которая может содержать 1-3 низших алкильных группы в качестве заместителя(ей) в пиразолильной группе),

(xx) имидазолил(низшая)алкильная группа,

(xxi) пиридил(низшая)алкильная группа,

(xxii) пиразинил(низшая)алкильная группа (которая может содержать 1-3 (предпочтительно 1) низших алкильных группы в качестве заместителя(ей) в пиразинильной группе),

(xxiii) пирролидинил(низшая)алкильная группа (которая может содержать 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из оксогруппы и низшей алкильной группы, в качестве заместителя(ей) в пирролидинильной группе),

(xxiv) пиперидил(низшая)алкильная группа (которая может содержать 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из бензоильной группы и низшей алканоильной группы, в качестве заместителя(ей) в пиперидильной группе),

(xxv) пиперазинил(низшая)алкильная группа (которая может содержать 1-3 низших алкильных группы в качестве заместителя(ей) в пиперазинильной группе),

(xxvi) морфолинил(низшая)алкильная группа,

(xxvii) тиенил(низшая)алкильная группа (которая может содержать 1-3 низших алкильных группы в качестве заместителя(ей) в тиенильной группе),

(xxviii) тиазолил(низшая)алкильная группа,

(xxix) дигидробензофурил(низшая)алкильная группа,

(xxx) бензопиранил(низшая)алкильная группа (которая может содержать одну оксогруппу в качестве заместителя в бензопиранильной группе),

(xxxi) бензимидазолил(низшая)алкильная группа,

(xxxii) индолил(низшая)алкильная группа, которая может содержать 1-3 низших алкоксикарбонильных группы в низшей алкильной группе),

(xxxiii) имидазолил(низшая)алкильная группа, которая содержит 1-3 заместителя, выбранных из группы, состоящей из карбамоильной группы и низшей алкоксикарбонильной группы, в низшей алкильной группе,

(xxxiv) пиридинильная группа, которая может содержать 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алкоксигруппы и низшей алкилтио(низшей)алкильной группы, в качестве заместителя(ей),

(xxxv) пирролидинильная группа, которая может содержать 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алкоксикарбонильной группы, низшей алканоильной группы и бензоильной группы,

в качестве заместителя(ей),

(xxxvi) пиперидильная группа, которая может содержать 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алкоксикарбонильной группы, низшей алканоильной группы и бензоильной группы (которая может
5 содержать 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы и атома галогена, в качестве заместителя(ей) в фенильной группе,

(xxvii) тетрагидрофурильная группа, которая может содержать одну оксогруппу,

(xxviii) гексагидроазепинильная группа, которая может содержать одну

10 оксогруппу,

(xxix) пиразолильная группа, которая может содержать 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, фенильной группы и фурильной группы, в качестве заместителя(ей),

(xl) тиазолильная группа,

15 (xli) тиадиазолильная группа, которая может содержать 1-3 низших алкильных группы,

(xlii) изоксазолильная группа, которая может содержать 1-3 низших алкильных группы,

20 (xliii) индазолильная группа,

(xliv) индолильная группа,

(xlv) тетрагидробензотиазолильная группа,

(xlv) тетрагидрохинолильная группа, которая может содержать 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей
25 алкоксигруппы, атома галогена и оксогруппы, в качестве заместителя(ей),

(xlvii) хинолильная группа, которая может содержать 1-3 низших алкильных группы,

(xlviii) бензодиоксолил(низшая)алкильная группа,

30 (xlix) фенильная группа или нафтильная группа, которая может содержать в качестве заместителя(ей) 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из атома галогена; низшей алкильной группы; низшей алкоксигруппы; галогензамещенной низшей алкильной группы; галогензамещенной низшей алкоксигруппы; низшей алкенильной группы; аминогруппы, которая может содержать 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алканоильной группы, низшей
35 алкилсульфонильной группы, низшей алкильной группы и арильной группы; сульфоамонийной группы; низшей алкилтиогруппы; низшей алканоильной группы; низшей алкоксикарбонильной группы; пирролильной группы; низшей алкинильной группы; цианогруппы; нитрогруппы; фенилоксигруппы;

40 фенил(низшей)алкоксигруппы; гидроксигруппы; гидроксиз(низшей)алкильной группы; карбамоильной группы, которая может содержать 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы и фенильной группы;

45 пиразолильной группы; пирролидинильной группы, которая может содержать одну оксогруппу; оксазолильной группы; имидазолильной группы, которая может содержать 1-3 низших алкильных группы; дигидрофурильной группы, которая может содержать одну оксогруппу; тиазолидинил(низшей)алкильной группы, которая может содержать две оксогруппы; имидазолил(низшей)алканоильной
50 группы и пиперидинилкарбонильной группы,

(l) циано(низшая)алкильная группа,

(li) дигидрохинолильная группа, которая может содержать 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы и оксогруппы,

- (lii) галогензамещенная низшая алкиламиногруппа,
 (liii) низшая алкилтио(низшая)алкильная группа,
 (liv) амидиногруппа, которая может содержать низшую алкильную группу,
 (lv) амидино(низшая)алкильная группа,
 5 (lvi) низшая алкенилокси(низшая)алкильная группа,
 (lvii) фениламиногруппа, которая может содержать 1-3 заместителя, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алкоксигруппы, галогензамещенной низшей алкильной группы и галогензамещенной низшей алкоксигруппы, в фенильной группе,
 10 (lviii) фенил(низшая)алкенильная группа,
 (lix) пиридиламиногруппа, которая может содержать 1-3 низших алкильных группы,
 (lx) фенил(низшая)алкильная группа (которая может содержать в качестве заместителя(ей) в фенильной группе и/или низшей алкильной группе 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из атома галогена, низшей алкильной группы, галогензамещенной низшей алкильной группы, галогензамещенной низшей алкоксигруппы, низшей алкоксигруппы, карбамоильной группы и низшей алкоксикарбонильной группы),
 15 (lxi) низшая алкинильная группа,
 (lxii) фенилокси(низшая)алкильная группа (которая может содержать в качестве заместителя(ей) в фенильной группе 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкоксигруппы, N-низший алкокси-N-низшей алкилкарбамоильной группы и оксопирролидинильной группы),
 20 (lxiii) изоксазолидинильная группа, которая может содержать одну оксогруппу,
 (lxiv) дигидроинденильная группа,
 (lxv) фенил(низшая)алкокси(низшая)алкильная группа,
 25 (lxvi) тетрагидропиранильная группа,
 (lxvii) азетидинильная группа, которая может содержать 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алканоильной группы и бензоильной группы,
 (lxviii) азетидинил(низшая)алкильная группа, которая может содержать 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алканоильной группы и бензоильной группы,
 30 (lxix) тетразолильная группа,
 (lxx) индолинильная группа, которая может содержать одну оксогруппу,
 (lxxi) триазолильная группа, которая может содержать 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы и низшей алкилтиогруппы,
 35 (lxxii) имидазолильная группа, которая может содержать 1-3 карбамоильных группы,
 (lxxiii) оксазолильная группа, которая может содержать 1-3 низших алкильных группы,
 40 (lxxiv) изотиазолильная группа, которая может содержать 1-3 низших алкильных группы,
 (lxxv) бензимидазолильная группа,
 (lxxvi) дигидробензотиазолильная группа, которая может содержать одну оксогруппу,
 45 (lxxvii) тиенильная группа, которая может содержать 1-3 низших алкоксикарбонильных группы, и
 (lxxviii) оксазолил(низшая)алкильная группа, которая может содержать 1-3

низших алкильных группы,

(29) амино(низшая)алкильная группа, которая может содержать 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, галогензамещенной низшей алкильной группы, низшей алкоксикарбонильной группы, низшей алканоильной группы, фенильной группы, фенил(низшей)алкильной группы, бензоильной группы и аминзамещенной алкильной группы (которая может содержать 1-2 низших алкильных группы в качестве заместителя(ей) в аминогруппе), в аминогруппе,

(30) низшая алкильная группа, замещенная одной карбамоильной группой, которая может содержать 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы и галогензамещенной низшей алкильной группы,

(31) тиокарбамоильная группа, которая может содержать 1-2 низших алкильных группы,

(32) сульфамойльная группа,

(33) оксазолидинильная группа, которая может содержать одну оксогруппу,

(34) имидазолидинильная группа, которая может содержать 1-2 заместителя, выбранных из группы, состоящей из оксогруппы и низшей алкильной группы,

(35) пирролидинильная группа, которая может содержать одну оксогруппу,

(36) имидазолильная группа,

(37) триазиольная группа,

(38) изоксазолильная группа,

(39) пиперидильная группа, которая может содержать 1-3 заместителя, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алканоильной группы, низшей алкилфенилсульфонильной группы, оксогруппы, гидроксигруппы и аминогруппы, которая может содержать 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алканоильной группы, низшей алкоксикарбонильной группы и низшей алканоиламино(низшей)алканоильной группы,

(40) пиперидилкарбонильная группа, которая может содержать 1-3 заместителя, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, гидроксигруппы, гидрокси(низшей)алкильной группы, низшей алканоильной группы,

карбокси(низшей)алкильной группы, низшей алкилкарбамоил(низшей)алкильной группы, карбамоильной группы, низшей алкоксигруппы, карбоксигруппы, низшей алкоксикарбонильной группы, аминогруппы (в которой могут присутствовать 1-2 группы, выбранные из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алканоильной группы, низшей алкоксикарбонильной группы и бензоильной

группы), пиперидильной группы (в которой могут присутствовать 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алканоильной группы, низшей алкоксикарбонильной группы и бензоильной группы), пиперазинильной группы (в которой могут присутствовать 1-3 низших алкильных группы в качестве

заместителя(ей)), 1,4-диокса-8-азаспиро[4.5]децильной группы, морфолинийной группы, гексагидро-1,4-дiazепинильной группы (в которой может присутствовать одна низшая алкильная группа в качестве заместителя), пиридинильной группы, пиридилоксигруппы, пиридил(низшей)алкоксигруппы, тетрагидрохинолильной группы (в которой может присутствовать одна оксогруппа), бензодиоксолильной группы, фенил(низшей)алкоксигруппы (которая может содержать в фенильной группе 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из атома галогена, низшей алкильной группы, низшей алкоксигруппы и галогензамещенной низшей

алкоксигруппы), фенильной группы (в которой могут присутствовать 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из атома галогена, низшей алкоксигруппы и гидроксигруппы), фенилоксигруппы (которая может содержать в фенильной группе 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из цианогруппы, атома галогена, низшей алкильной группы, низшей алкоксигруппы и галогензамещенной низшей алкильной группы), фенил(низшей)алкильной группы (в фенильной группе могут присутствовать 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из атома галогена, низшей алкильной группы, низшей алкоксигруппы и галогензамещенной низшей алкильной группы) и бензоильной группы (которая может содержать в фенильной группе 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из атома галогена и низшей алкоксигруппы),

(41) пирролидинилкарбонильная группа, которая может содержать в качестве заместителя(ей) 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из гидроксид(низшей)алкильной группы, карбамоильной группы, гидроксигруппы, аминогруппы (которая может содержать в аминогруппе 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алканоильной группы и бензоильной группы), морфолинил(низшей)алкильной группы, пирролидинил(низшей)алкильной группы, пиперидил(низшей)алкильной группы, пиперазинил(низшей)алкильной группы (которая может содержать в качестве заместителя в пиперазинильной группе одну низшую алкильную группу), амин(низшей)алкильной группы (которая может содержать в качестве заместителя в аминогруппе 1-2 низших алкильных группы), фенилоксигруппы (которая может содержать 1-3 галогензамещенных низших алкоксигруппы в фенильной группе), фенилоксид(низшей)алкильной группы (которая может содержать 1-3 галогензамещенных низших алкоксигруппы в фенильной группе) и тетрагидрохинолильной группы (в которой может присутствовать оксогруппа),

(42) пиперазинилкарбонильная группа, которая может содержать в качестве заместителя(ей) 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, цикло(C₃-C₈)алкильной группы, низшей алканоильной группы, гидроксид(низшей)алкильной группы, низшей алкоксид(низшей)алкильной группы, низшей алкоксикарбонильной группы, амин(низшей)алкильной группы (которая может содержать 1-2 низших алкильных группы в качестве заместителя(ей) в аминогруппе), пиперидил(низшей)алкильной группы (которая может содержать 1-2 низших алкильных группы в качестве заместителя(ей) в пиперидильной группе), морфолинил(низшей)алкильной группы, пирролидинил(низшей)алкильной группы, 1,3-диоксоранил(низшей)алкильной группы, тетрагидрофурил(низшей)алкильной группы, пиридил(низшей)алкильной группы (которая может содержать 1-2 фенильные группы в качестве заместителя(ей) в низшей алкильной группе), имидазолил(низшей)алкильной группы, фурил(низшей)алкильной группы, пирролидинилкарбонил(низшей)алкильной группы, пиперидильной группы, которая может содержать 1-2 низших алкильных группы в качестве заместителя(ей), пиридил(низшей)алкильной группы (которая может содержать в качестве заместителя(ей) в пиридил(низшей)алкильной группе 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, цианогруппы и галогензамещенной низшей алкильной группы), тиено[2,3-b]пиридил(низшей)алкильной группы, фенильной группы (в которой могут присутствовать 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из атома галогена и низшей алкильной группы), бензоильной группы, фурилкарбонильной группы, фенил(низшей)алкоксикарбонильной группы и оксогруппы,

- (43) гексагидроазепинилкарбонильная группа,
 (44) гексагидро-1,4-дiazепинилкарбонильная группа, которая может содержать 1-3 заместителя, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы и пиридинильной группы,
 (45) дигидропирролилкарбонильная группа, которая может содержать 1-3 низших алкильных группы,
 (46) тиоморфолинилкарбонильная группа,
 (47) морфолинилкарбонильная группа, которая может содержать 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, пиперидил(низшей)алкильной группы и фенильной группы,
 (48) тиазолидинилкарбонильная группа, которая может содержать 1-3 фенильных группы, которые могут содержать 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкоксигруппы и цианогруппы,
 (49) азабицикло[3.2.2]нонилкарбонильная группа,
 (50) 8-азабицикло[3.2.1]октилкарбонильная группа, которая может содержать 1-3 галогензамещенных или незамещенных фенилоксигруппы,
 (51) индолинилкарбонильная группа,
 (52) тетрагидрохинолилкарбонильная группа,
 (53) тетрагидропиридо[3.4-b]индолилкарбонильная группа,
 (54) морфолинил(низшая)алкильная группа,
 (55) пиперазинил(низшая)алкильная группа, которая может содержать 1-3 низших алкильных группы в пиперазинильной группе,
 (56) морфолинилкарбонил(низшая)алкильная группа,
 (57) пиперазинилкарбонил(низшая)алкильная группа, которая может содержать 1-3 низших алкильных группы в пиперазинильной группе,
 (58) оксогруппа,
 (59) аминоксигруппа (низшая)алкоксигруппа (которая может содержать 1-2 низших алкильных группы в аминоксигруппе),
 (60) низшая алкокси(низшая)алкоксигруппа,
 (61) пиперазинильная группа, которая может содержать 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из оксогруппы, низшей алкильной группы, низшей алканоильной группы и низшей алкоксикарбонильной группы,
 (62) морфолинильная группа,
 (63) 1,3,8-триазаспиро[4.5]деканилкарбонильная группа, которая может содержать 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из оксогруппы и фенильной группы,
 (64) тетрагидропиридилкарбонильная группа, которая может содержать 1-3 пиридинильных группы,
 (65) имидазолидинилкарбонильная группа, которая может содержать одну тиоксогруппу, и
 (66) 1,4-диокса-8-азаспиро[4.5]деканильная группа.

В соответствии с настоящим изобретением предлагается соединение, представленное общей формулой (1), где А представляет собой низшую алкиленовую группу.

В соответствии с настоящим изобретением предлагается соединение, представленное общей формулой (1), где R¹ представляет собой цикло(C₅-C₆)алкильную группу, ароматическую группу или гетероциклическую группу, выбранную из группы, состоящей из групп (I)-(III), определенных ниже:

(I) цикло(C₅-C₆)алкильная группа,
 (II) фенильная группа и
 (III) насыщенная или ненасыщенная гетеромоноциклическая группа,
 содержащая 1-2 атома азота, выбранная из группы, состоящей из пирролидинильной
 группы, пиперидильной группы, пиразолильной группы, пиридинильной группы,
 пиримидинильной группы и тиазолильной группы, причем
 в цикло(C₅-C₆)алкильной группе, ароматической группе и гетероциклической
 группе, представленных символом R¹, могут присутствовать в качестве
 заместителя(ей) 1-5 групп, выбранных из группы, состоящей из групп (1)-(66),
 определенных в пункте 2.

В соответствии с настоящим изобретением предлагается соединение,
 представленное общей формулой (1), где R¹ представляет собой (I) цикло(C₅-
 C₆)алкильную группу, причем в цикло(C₅-C₆)алкильной группе, представленной
 символом R¹, могут присутствовать в качестве заместителя(ей) 1-5 групп, выбранных
 из группы, состоящей из групп (1)-(66), определенных в пункте 2.

В соответствии с настоящим изобретением предлагается соединение,
 представленное общей формулой (1), где R¹ представляет собой (II) фенильную
 группу, причем в ароматической группе, представленной символом R¹, могут
 присутствовать в качестве заместителя(ей) 1-5 групп, выбранных из группы,
 состоящей из групп (1)-(66), определенных в пункте 2.

В соответствии с настоящим изобретением предлагается соединение,
 представленное общей формулой (1), где R¹ представляет собой (III) насыщенную
 или ненасыщенную гетеромоноциклическую группу, содержащую 1-2 атома азота,
 выбранную из пирролидинильной группы, пиперидильной группы, пиразолильной
 группы, пиридинильной группы, пиримидинильной группы и тиазолильной группы,
 причем в гетероциклической группе, представленной символом R¹, могут
 присутствовать в качестве заместителя(ей) 1-5 групп, выбранных из группы,
 состоящей из групп (1)-(66), определенных в пункте 2.

В соответствии с настоящим изобретением предлагается соединение,
 представленное общей формулой (1), где R¹ представляет собой цикло(C₅-
 C₆)алкильную группу, ароматическую группу или гетероциклическую группу,
 выбранную из группы, состоящей из групп (I)-(III), определенных ниже:

(I) цикло(C₅-C₆)алкильная группа,
 (II) фенильная группа и
 (III) насыщенная или ненасыщенная гетеромоноциклическая группа,
 содержащая 1-2 атома азота, выбранная из пирролидинильной группы,
 пиперидильной группы, пиразолильной группы, пиридинильной группы,
 пиримидинильной группы и тиазолильной группы, причем
 в цикло(C₅-C₆)алкильной группе, ароматической группе и гетероциклической
 группе, представленных символом R¹, могут присутствовать в качестве
 заместителя(ей) 1-5 групп, выбранных из группы, состоящей из групп (1), (4), (10),
 (17), (18), (21), (28), (29), (30), (33), (34), (35), (36), (39), (61) и (62), определенных ниже:
 (1) низшая алкильная группа,
 (4) низшая алкоксигруппа,
 (10) гидроксизаместительная алкильная группа,
 (17) аминогруппа, содержащая 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из

низшей алкильной группы, низшей алканоильной группы, низшей алкоксикарбонильной группы, низшей алкилсульфонильной группы, карбамоильной группы, низшей алкилкарбамоильной группы, amino(низшей)алканоильной группы, низшей алканоиламино(низшей)алканоильной группы и низшей

алкоксикарбониламино(низшей)алканоильной группы, в качестве заместителя(ей),

(18) низшая алканоильная группа,

(21) низшая алкоксикарбонильная группа,

(28) карбамоильная группа, которая может содержать в качестве заместителя(ей)

1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из групп (i), (ii), (iv), (xii) и (xxi), определенных ниже:

(i) низшая алкильная группа,

(ii) низшая алкоксигруппа,

(iv) низшая алкокси(низшая)алкильная группа,

(xii) низшая алкильная группа, содержащая 1-2 низших алкоксикарбонильных групп,

(xxi) пиридил(низшая)алкильная группа,

(29) amino(низшая)алкильная группа, которая может содержать в аминогруппе 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, галогензамещенной низшей алкильной группы, низшей алкоксикарбонильной группы, низшей алканоильной группы, фенильной группы, фенил(низшей)алкильной группы, бензоильной группы и aminoзамещенной низшей алкильной группы (которая может содержать 1-2 низших алкильных группы в качестве заместителя(ей) в аминогруппе),

(30) низшая алкильная группа, замещенная одной карбамоильной группой, которая может содержать 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы и галогензамещенной низшей алкильной группы,

(33) оксазолидинильная группа, которая может содержать одну оксогруппу,

(34) имидазолидинильная группа, которая может содержать 1-2 заместителя, выбранных из группы, состоящей из оксогруппы и низшей алкильной группы,

(35) пирролидинильная группа, которая может содержать одну оксогруппу,

(36) имидазолильная группа,

(39) пиперидильная группа, которая может содержать 1-3 заместителя, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алканоильной группы, низшей алкилфенилсульфонильной группы, оксогруппы, гидроксигруппы и аминогруппы, которая может содержать 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алканоильной группы, низшей алкоксикарбонильной группы и низшей алканоиламино(низшей)алканоильной группы,

(61) пиперазинильная группа, которая может содержать 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из оксогруппы, низшей алкильной группы, низшей алканоильной группы и низшей алкоксикарбонильной группы, и

(62) морфолинийная группа.

В соответствии с настоящим изобретением предлагается соединение, представленное общей формулой (1), где R^1 представляет собой (I) циклогексильную группу, причем в цикло(C_5 - C_6)алкильной группе, представленной символом R^1 , могут присутствовать в качестве заместителя(ей) 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из групп (1), (4), (10), (17), (18), (21), (28), (29), (30), (33), (34), (35), (36), (39), (61) и (62), определенных в пункте 8.

В соответствии с настоящим изобретением предлагается соединение, представленное общей формулой (1), где R^1 представляет собой (II) фенильную группу, причем в ароматической группе, представленной символом R^1 , могут присутствовать в качестве заместителя(ей) 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из групп (1), (4), (10), (17), (18), (21), (28), (29), (30), (33), (34), (35), (36), (39), (61) и (62), определенных в пункте 8.

В соответствии с настоящим изобретением предлагается соединение, представленное общей формулой (1), где R^1 представляет собой (II) фенильную группу, причем в ароматической группе, представленной символом R^1 , могут присутствовать в качестве заместителя(ей) 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из групп (1), (4), (10), (17), (18), (28), (33), (35), (39) и (61), определенных ниже:

(1) низшая алкильная группа,
 (4) низшая алкоксигруппа,
 (10) гидрокси(низшая)алкильная группа,
 (17) аминокгруппа, содержащая в качестве заместителя(ей) 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, амино(низшей)алканоильной группы, низшей алканоиламино(низшей)алканоильной группы и низшей алкоксикарбониламино(низшей)алканоильной группы,
 (18) низшая алканоильная группа,
 (28) карбамоильная группа, содержащая одну низшую алкокси(низшую)алкильную группу,
 (33) оксазолидинильная группа, которая может содержать одну оксогруппу,
 (35) пирролидинильная группа, которая может содержать одну оксогруппу,
 (39) пиперидильная группа и
 (61) пиперазинильная группа, которая может содержать 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из оксогруппы, низшей алканоильной группы и низшей алкоксикарбонильной группы.

Соединение по пункту 11, где R^1 представляет собой фенильную группу, содержащую, в фенильной группе, одну низшую алкильную группу, одну низшую алкоксигруппу и одну аминокгруппу, содержащую 1 или 2 низших алкильных группы в аминокгруппе;

фенильную группу, содержащую, в фенильной группе, одну низшую алкильную группу, одну низшую алкоксигруппу и одну карбамоильную группу, содержащую одну низшую алкильную группу, которая содержит две низших алкоксигруппы в низшей алкильной группе;

фенильную группу, содержащую, в фенильной группе, одну гидрокси(низшую)алкильную группу, одну низшую алкоксигруппу и одну оксазолидинильную группу, содержащую одну оксогруппу в оксазолидинильной группе;

фенильную группу, содержащую, в фенильной группе, одну низшую алкильную группу, одну низшую алкоксигруппу и одну пирролидинильную группу;

фенильную группу, содержащую, в фенильной группе, одну низшую алкильную группу, одну низшую алкоксигруппу и одну пиперидильную группу;

фенильную группу, содержащую, в фенильной группе, одну низшую алкильную группу, одну низшую алкоксигруппу и одну пиперазильную группу, содержащую одну низшую алканоильную группу в пиперазильной группе;

фенильную группу, содержащую, в фенильной группе, одну низшую алкильную

группу, одну низшую алкоксигруппу и одну пиперазильную группу, содержащую одну низшую алканоильную группу и одну оксогруппу в пиперазильной группе;

фенильную группу, содержащую, в фенильной группе, одну низшую алкильную группу, одну низшую алкоксигруппу и одну пиперазильную группу, содержащую одну низшую алкоксикарбонильную группу и одну оксогруппу в пиперазильной группе;

фенильную группу, содержащую, в фенильной группе, одну низшую алкильную группу, одну низшую алкоксигруппу и одну N-[(N-низший алкоксикарбониламино)низший алканоил]аминогруппу;

фенильную группу, содержащую, в фенильной группе, одну низшую алкильную группу, одну низшую алкоксигруппу и одну N-(амино(низший)алканоил)аминогруппу;

фенильную группу, содержащую, в фенильной группе, одну низшую алкильную группу, одну низшую алкоксигруппу и одну N-[(N-низший алканоиламино)низший алканоил]аминогруппу;

фенильную группу, содержащую, в фенильной группе, одну низшую алкоксигруппу, одну низшую алканоильную группу и одну пиперазильную группу, содержащую одну низшую алкоксикарбонильную группу в пиперазильной группе; или

фенильную группу, содержащую, в фенильной группе, одну низшую алкоксигруппу, одну гидрокси(низшую)алкильную группу и одну пиперазильную группу, содержащую одну низшую алкоксикарбонильную группу в пиперазильной группе.

В соответствии с настоящим изобретением предлагается соединение, представленное общей формулой (1), где R^1 представляет собой насыщенную или ненасыщенную гетеромоноциклическую группу, содержащую 1-2 атома азота, выбранную из пиперидильной группы, пиразолильной группы и тиазолильной группы, причем в гетероциклической группе, представленной символом R^1 , могут присутствовать в качестве заместителя(ей) 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из групп (1), (4), (10), (17), (18), (21), (28), (29), (30), (33), (34), (35), (36), (39), (61) и (62), определенных в пункте 8.

В соответствии с настоящим изобретением предлагается соединение, представленное общей формулой (1), где R^1 представляет собой (III) насыщенную или ненасыщенную гетеромоноциклическую группу, содержащую 1-2 атома азота, выбранную из пиперидильной группы, пиразолильной группы и тиазолильной группы, причем в гетероциклической группе, представленной символом R^1 , могут присутствовать в качестве заместителя(ей) 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из групп (1), (17) и (28), определенных ниже:

(1) низшая алкильная группа;

(17) аминогруппа, содержащая 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы и низшей алканоильной группы, в качестве заместителя(ей); и

(28) карбамоильная группа, которая может содержать 1-2 низших алкильных группы.

В соответствии с настоящим изобретением предлагается соединение, представленное общей формулой (1), где R^1 представляет собой

пиразолильную группу, содержащую одну низшую алкильную группу и одну низшую алканоиламиногруппу;

пиразолильную группу, содержащую одну низшую алкильную группу и одну N,N-ди(низшую)алкиламиногруппу;

пиперидильную группу, содержащую одну N,N-ди(низшую)алкилкарбамоильную группу; или

тиазолильную группу, содержащую одну N,N-ди(низшую)алкилкарбамоильную группу.

В соответствии с настоящим изобретением предлагается фармацевтическая композиция, содержащая гетероциклическое соединение общей формулы (1) или его соль по настоящему изобретению в качестве активного компонента и фармацевтически приемлемый носитель.

В соответствии с настоящим изобретением предлагается применение фармацевтической композиции по настоящему изобретению как фармацевтической композиции для лечения или предотвращения расстройств центральной нервной системы.

В соответствии с настоящим изобретением предлагается фармацевтическая композиция по настоящему изобретению, которая может быть применена в качестве фармацевтической композиции для лечения или предотвращения расстройств центральной нервной системы, выбранных из группы, состоящей из шизофрении; резистентной, трудноизлечимой или хронической шизофрении; эмоционального расстройства; психотического расстройства; расстройства настроения; биполярного расстройства I типа; биполярного расстройства II типа; депрессии; эндогенной депрессии; классической депрессии; меланхолической и резистентной депрессии; дистимического расстройства; циклотимического расстройства; панической атаки; панического расстройства; агорафобии; социальной фобии; обсессивно-компульсивного расстройства; посттравматического стрессового расстройства; расстройства генерализованной тревоги; острого стрессового расстройства; истерии; соматизированного расстройства; конверсивного расстройства; болевого расстройства; ипохондрии; искусственного расстройства; диссоциативного расстройства; сексуальной дисфункции; расстройства полового влечения; расстройства полового возбуждения; эректильной дисфункции; нервно-психической анорексии; нервно-психической булимии; расстройства сна; регулируемого расстройства; злоупотребления алкоголем; алкогольной интоксикации; лекарственной аддикции; интоксикации стимуляторами; наркомании; ангедонии; ятрогенной ангедонии; ангедонии психического или ментального происхождения; ангедонии, связанной с депрессией; ангедонии, связанной с шизофренией; делирия; когнитивного расстройства; когнитивного расстройства, связанного с болезнью Альцгеймера, болезнью Паркинсона и другими нейродегенеративными заболеваниями; когнитивного расстройства, вызванного болезнью Альцгеймера, болезнью Паркинсона и сопутствующими нейродегенеративными заболеваниями; когнитивного расстройства из-за шизофрении; когнитивного расстройства, вызванного резистентной, трудноизлечимой или хронической шизофренией; рвоты; болезни движения; ожирения; мигрени; боли (в том числе продолжительной, тупой); задержки умственного развития; аутичного расстройства (аутизма); болезни Туретта; расстройства, выражающегося в тике; расстройства, проявляющегося в дефиците внимания и гиперактивности; кондуктивного расстройства и синдрома Дауна.

В соответствии с настоящим изобретением предлагается способ получения фармацевтической композиции, включающий смешивание гетероциклического

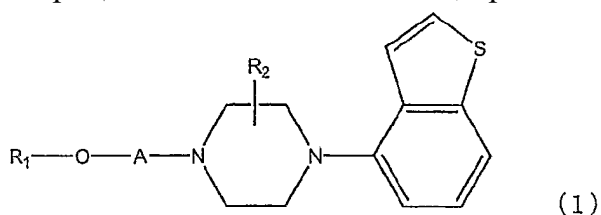
соединения, представленного формулой (1), или его соли с фармацевтически приемлемым носителем.

В соответствии с настоящим изобретением предлагается применение гетероциклического соединения, представленного формулой (1), или его соли в качестве лекарственного средства.

В частности, предлагается гетероциклическое соединение, представленное формулой (1), или его соль, в качестве частичного агониста допаминовых D₂ рецепторов, и/или антагониста серотониновых 5-HT_{2A} рецепторов, и/или антагониста адреналиновых α₁ рецепторов, и/или ингибитора поглощения серотонина (или ингибитора обратного захвата серотонина).

В соответствии с настоящим изобретением предлагается способ лечения или предотвращения расстройства центральной нервной системы, включающий введение гетероциклического соединения формулы (1) или его соли человеку или животному.

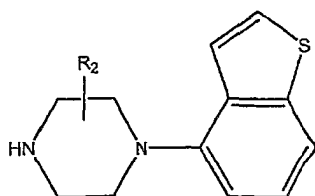
В соответствии с настоящим изобретением предлагается способ получения гетероциклического соединения, представленного формулой (1):



[где R₁, R₂ и A - такие, как определено в пункте 1] или его соли, отличающийся тем, что включает взаимодействие соединения, представленного формулой:



[где R₁ и A - такие, как определено выше, и X₁ представляет собой атом галогена или группу, которая вызывает реакцию замещения, такую же, как при атоме галогена], или его соли с соединением, представленным формулой:



[где R₂ - такой, как определено выше] или его солью.

НАИЛУЧШИЙ СПОСОБ ОСУЩЕСТВЛЕНИЯ ИЗОБРЕТЕНИЯ

Конкретными примерами каждой из групп, показанных в общей формуле (1), являются следующие.

Примеры низшей алкильной группы включают неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов. Ее конкретные примеры включают метильную группу, этильную группу, н-пропильную группу, изопропильную группу, н-бутильную группу, изобутильную группу, трет-бутильную группу, втор-бутильную группу, н-пентильную группу, 1-этилпропильную группу, изопентильную группу, неопентильную группу, н-гексильную группу, 1,2,2-триметилпропильную группу, 3,3-диметилбутильную группу, 2-этилбутильную группу, изогексильную группу и 3-метилпентильную группу.

Примеры низшей алкиленовой группы включают неразветвленную или разветвленную алкиленовую группу, содержащую 1-6 углеродных атомов. Ее

конкретные примеры включают метиленовую группу, этиленовую группу, триметиленовую группу, 2-метилтриметиленовую группу, 2,2-диметилэтиленовую группу, 2,2-диметилтриметиленовую группу, 1-метилтриметиленовую группу, метилметиленовую группу, этилметиленовую группу, тетраметиленовую группу, пентаметиленовую группу и гексаметиленовую группу.

Примеры низшей алкениленовой группы включают неразветвленную или разветвленную алкениленовую группу, содержащую 1-3 двойных связи и 2-6 углеродных атомов. Ее конкретные примеры включают виниленовую группу, 1-пропениленовую группу, 1-метил-1-пропениленовую группу, 2-метил-1-пропениленовую группу, 2-пропениленовую группу, 2-бутениленовую группу, 1-бутениленовую группу, 3-бутениленовую группу, 2-пентениленовую группу, 1-пентениленовую группу, 3-пентениленовую группу, 4-пентениленовую группу, 1,3-бутадиениленовую группу, 1,3-пентадиениленовую группу, 2-пентен-4-иниленовую группу, 2-гексениленовую группу, 1-гексениленовую группу, 5-гексениленовую группу, 3-гексениленовую группу, 4-гексениленовую группу, 3,3-диметил-1-пропениленовую группу, 2-этил-1-пропениленовую группу, 1,3,5-гексатриениленовую группу, 1,3-гексадиениленовую группу и 1,4-гексадиениленовую группу.

Примеры низшей алкенильной группы включают неразветвленную или разветвленную алкенильную группу, содержащую 1-3 двойных связи и 2-6 углеродных атомов, включая и транс-, и цис-конфигурации. Ее конкретные примеры включают винильную группу, 1-пропенильную группу, 2-пропенильную группу, 1-метил-1-пропенильную группу, 2-метил-1-пропенильную группу, 2-метил-2-пропенильную группу, 2-пропенильную группу, 2-бутенильную группу, 1-бутенильную группу, 3-бутенильную группу, 2-пентенильную группу, 1-пентенильную группу, 3-пентенильную группу, 4-пентенильную группу, 1,3-бутадиенильную группу, 1,3-пентадиенильную группу, 2-пентен-4-ильную группу, 2-гексенильную группу, 1-гексенильную группу, 5-гексенильную группу, 3-гексенильную группу, 4-гексенильную группу, 3,3-диметил-1-пропенильную группу, 2-этил-1-пропенильную группу, 1,3,5-гексатриенильную группу, 1,3-гексадиенильную группу и 1,4-гексадиенильную группу.

Примеры атома галогена включают атом фтора, атом хлора, атом брома и атом йода.

Примеры галогензамещенной низшей алкильной группы включают указанную выше низшую алкильную группу, замещенную 1-7, более предпочтительно 1-3, атомами галогена. Ее конкретные примеры включают фторметильную группу, дифторметильную группу, трифторметильную группу, хлорметильную группу, дихлорметильную группу, трихлорметильную группу, бромметильную группу, дибромметильную группу, дихлорфторметильную группу, 2,2-дифторэтильную группу, 2,2,2-трифторэтильную группу, пентафторэтильную группу, 2-фторэтильную группу, 2-хлорэтильную группу, 3,3,3-трифторпропильную группу, гептафторпропильную группу, 2,2,3,3,3-пентафторпропильную группу, гептафторизопротильную группу, 3-хлорпропильную группу, 2-хлорпропильную группу, 3-бромпропильную группу, 4,4,4-трифторбутильную группу, 4,4,4,3,3-пентафторбутильную группу, 4-хлорбутильную группу, 4-бромбутильную группу, 2-хлорбутильную группу, 5,5,5-трифторпентильную группу, 5-хлорпентильную группу, 6,6,6-трифторгексильную группу, 6-хлоргексильную группу и перфторгексильную группу.

Примеры низшей алкоксигруппы включают неразветвленную или разветвленную алкоксигруппу, содержащую 1-6 углеродных атомов. Ее конкретные примеры включают метоксигруппу, этоксигруппу, н-пропоксигруппу, изопропоксигруппу, н-бутоксигруппу, изобутоксигруппу, трет-бутоксигруппу, втор-бутоксигруппу, н-пентилоксигруппу, изопентилоксигруппу, неопентилоксигруппу, н-гексилоксигруппу, изогексилоксигруппу и 3-метилпентилоксигруппу.

Примеры арильной группы включают фенильную группу, замещенную фенильную группу, бифенильную группу, замещенную бифенильную группу, нафтильную группу и замещенную нафтильную группу. Примеры заместителя для арильной группы включают низшую алкильную группу, указанную выше (предпочтительно неразветвленную или разветвленную низшую алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов), атом галогена, указанный выше, и аминоксигруппу. В арильной группе могут присутствовать 1-7, предпочтительно 1-5, более предпочтительно 1-2, заместителей по крайней мере одного из указанных типов. Конкретные примеры арильной группы могут включать фенильную группу, (2-, 3-, или 4-)бифенильную группу, (1- или 2-)нафтильную группу, (2-, 3- или 4-)метилфенильную группу, (2-, 3- или 4-)этилфенильную группу, (2-, 3- или 4-)н-пропилфенильную группу, (2-, 3- или 4-)н-бутилфенильную группу, (2-, 3- или 4-)н-пентилфенильную группу, (2-, 3- или 4-)н-гексилфенильную группу, (2-, 3- или 4-)изобутилфенильную группу, (2-, 3- или 4-)трет-бутилфенильную группу, (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)метил-2-бифенильную группу, (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)метил-3-бифенильную группу, (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)метил-4-бифенильную группу, (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)этил-2-бифенильную группу, (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)этил-3-бифенильную группу, (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)этил-4-бифенильную группу, (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)н-пропил-2-бифенильную группу, (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)н-пропил-3-бифенильную группу, (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)н-пропил-4-бифенильную группу, (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)н-бутил-2-бифенильную группу, (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)н-бутил-3-бифенильную группу, (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)н-бутил-4-бифенильную группу, (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)н-пентил-2-бифенильную группу, (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)н-пентил-3-бифенильную группу, (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)н-пентил-4-бифенильную группу, (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)н-гексил-2-бифенильную группу, (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)н-гексил-3-бифенильную группу, (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)н-гексил-4-бифенильную группу, (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)изобутил-2-бифенильную группу, (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)изобутил-3-бифенильную группу, (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)изобутил-4-бифенильную группу, (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)трет-бутил-2-бифенильную группу, (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)трет-бутил-3-бифенильную группу, (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)трет-бутил-4-бифенильную группу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)метил-1-нафтильную группу, (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)метил-2-нафтильную группу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)этил-1-нафтильную группу, (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)этил-2-нафтильную группу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-пропил-1-нафтильную группу, (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-пропил-2-нафтильную группу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-бутил-1-нафтильную группу, (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-бутил-2-нафтильную группу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-пентил-1-нафтильную группу, (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-пентил-2-нафтильную группу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-гексил-1-нафтильную группу, (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-гексил-2-нафтильную группу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)изобутил-1-нафтильную

группу, (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)изобутил-2-нафтильную группу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)трет-бутил-1-нафтильную группу, (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)трет-бутил-2-нафтильную группу, (2-, 3- или 4-)хлорфенильную группу, (2-, 3- или 4-)фторфенильную группу, (2-, 3- или 4-)бромфенильную группу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)хлор-1-нафтильную группу, (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)хлор-2-нафтильную группу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)фтор-1-нафтильную группу, (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)фтор-2-нафтильную группу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)бром-1-нафтильную группу, (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)бром-2-нафтильную группу, (2-, 3- или 4-)аминофенильную группу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)амино-1-нафтильную группу, (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)амино-2-нафтильную группу, 2,3-диметилфенильную группу, 3,4-диметилфенильную группу, 2,4-диметилфенильную группу, 2,5-диметилфенильную группу, 2,6-диметилфенильную группу, 2,4,6-триметилфенильную группу, 3,4,5-триметилфенильную группу, 2,3,4,5-тетраэтилфенильную группу, пентаметилфенильную группу, 2,4-диметил-1-нафтильную группу, 2,3-диметил-1-нафтильную группу, 3,4-диметил-1-нафтильную группу, 3,5,7-триэтилнафтильную группу, 3,4,5,7-тетраметил-1-нафтильную группу, 2,3,4,5,7-пентаметил-1-нафтильную группу, 2,3,4,5,6,7-гексаэтил-1-нафтильную группу, гептаметил-1-нафтильную группу, 2,3-диаминофенильную группу, 2,4,6-триаминофенильную группу и 2-метил-5-хлор-1-нафтильную группу.

Примеры арилоксигруппы включают фенилоксигруппу, замещенную фенилоксигруппу, бифенилоксигруппу, замещенную бифенилоксигруппу, нафтилоксигруппу и замещенную нафтилоксигруппу. Примеры заместителя для арилоксигруппы включают низшую алкильную группу, указанную выше (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов), атом галогена, указанный выше, и аминогруппу. В арильной группе могут присутствовать 1-7, предпочтительно 1-5, более предпочтительно 1-2, заместителей по крайней мере одного из указанных типов. Конкретные примеры арилоксигрупп включают фенилоксигруппу, (2-, 3- или 4-)бифенилоксигруппу, (1- или 2-)нафтилоксигруппу, (2-, 3- или 4-)метилфенилоксигруппу, (2-, 3- или 4-)этилфенилоксигруппу, (2-, 3- или 4-)н-пропилфенилоксигруппу, (2-, 3- или 4-)н-бутилфенилоксигруппу, (2-, 3- или 4-)н-пентилфенилоксигруппу, (2-, 3- или 4-)н-гексилфенилоксигруппу, (2-, 3- или 4-)изобутилфенилоксигруппу, (2-, 3- или 4-)трет-бутилфенилоксигруппу, (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)метил-2-бифенилоксигруппу, (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)метил-3-бифенилоксигруппу, (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)метил-4-бифенилоксигруппу, (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)этил-2-бифенилоксигруппу, (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)этил-3-бифенилоксигруппу, (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)этил-4-бифенилоксигруппу, (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)н-пропил-2-бифенилоксигруппу, (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)н-пропил-3-бифенилоксигруппу, (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)н-пропил-4-бифенилоксигруппу, (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)н-бутил-2-бифенилоксигруппу, (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)н-бутил-3-бифенилоксигруппу, (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)н-бутил-4-бифенилоксигруппу, (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)н-пентил-2-бифенилоксигруппу, (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)н-пентил-3-бифенилоксигруппу, (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)н-пентил-4-бифенилоксигруппу, (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)н-гексил-2-бифенилоксигруппу, (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)н-гексил-3-бифенилоксигруппу, (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)н-гексил-4-

бифенилоксигруппу, (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)изобутил-2-
 бифенилоксигруппу, (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)изобутил-3-
 бифенилоксигруппу, (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)изобутил-4-
 бифенилоксигруппу, (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)трет-бутил-2-
 бифенилоксигруппу, (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)трет-бутил-3-
 бифенилоксигруппу, (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)трет-бутил-4-
 бифенилоксигруппу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)метил-1-нафтилоксигруппу, (1-, 3-, 4-,
 5-, 6-, 7- или 8-)метил-2-нафтилоксигруппу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)этил-1-
 нафтилоксигруппу, (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)этил-2-нафтилоксигруппу, (2-, 3-, 4-, 5-,
 6-, 7- или 8-)н-пропил-1-нафтилоксигруппу, (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-пропил-2-
 нафтилоксигруппу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-бутил-1-нафтилоксигруппу, (1-, 3-, 4-,
 5-, 6-, 7- или 8-)н-бутил-2-нафтилоксигруппу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-пентил-1-
 нафтилоксигруппу, (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-пентил-2-нафтилоксигруппу, (2-, 3-,
 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-гексил-1-нафтилоксигруппу, (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-гексил-2-
 нафтилоксигруппу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)изобутил-1-нафтилоксигруппу, (1-, 3-,
 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)изобутил-2-нафтилоксигруппу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)трет-
 бутил-1-нафтилоксигруппу, (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)трет-бутил-2-
 нафтилоксигруппу, (2-, 3- или 4-)хлорфенилоксигруппу, (2-, 3- или 4-
)фторфенилоксигруппу, (2-, 3- или 4-)бромфенилоксигруппу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-
)хлор-1-нафтилоксигруппу, (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)хлор-2-нафтилоксигруппу, (2-,
 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)фтор-1-нафтилоксигруппу, (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)фтор-2-
 нафтилоксигруппу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)бром-1-нафтилоксигруппу, (1-, 3-, 4-,
 5-, 6-, 7- или 8-)бром-2-нафтилоксигруппу, (2-, 3- или 4-)аминофенилоксигруппу, (2-,
 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)амино-1-нафтилоксигруппу, (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)амино-2-
 нафтилоксигруппу, 2,3-диметилфенилоксигруппу, 3,4-диметилфенилоксигруппу, 2,4-
 диметилфенилоксигруппу, 2,5-диметилфенилоксигруппу, 2,6-
 диметилфенилоксигруппу, 2,4,6-триметилфенилоксигруппу, 3,4,5-
 триметилфенилоксигруппу, 2,3,4,5-тетраэтилфенилоксигруппу,
 пентаметилфенилоксигруппу, 2,4-диметил-1-нафтилоксигруппу, 2,3-диметил-1-
 нафтилоксигруппу, 3,4-диметил-1-нафтилоксигруппу, 3,5,7-триэтил-1-
 нафтилоксигруппу, 3,4,5,7-тетраметил-1-нафтилоксигруппу, 2,3,4,5,7-пентаметил-1-
 нафтилоксигруппу, 2,3,4,5,6,7-гексаэтил-1-нафтилоксигруппу, гептаметил-1-
 нафтилоксигруппу, 2,3-диаминофенилоксигруппу, 2,4,6-триаминофенилоксигруппу
 и 2-метил-5-хлор-1-нафтилоксигруппу.

Примеры низшей алкилтиогруппы включают неразветвленную или разветвленную
 алкилтиогруппу, содержащую 1-6 углеродных атомов. Ее конкретные примеры
 включают метилтиогруппу, этилтиогруппу, н-пропилтиогруппу,
 изопропилтиогруппу, н-бутилтиогруппу, трет-бутилтиогруппу, н-пентилтиогруппу и
 н-гексилтиогруппу.

Примеры галогензамещенной низшей алкоксигруппы включают указанную выше
 низшую алкоксигруппу, замещенную 1-7, предпочтительно 1-3, атомами галогена.
 Ее конкретные примеры включают фторметоксигруппу, дифторметоксигруппу,
 трифторметоксигруппу, хлорметоксигруппу, дихлорметоксигруппу,
 трихлорметоксигруппу, бромметоксигруппу, дибромметоксигруппу,
 дихлорфторметоксигруппу, 2,2,2-трифторэтоксигруппу, пентафторэтоксигруппу, 2-
 хлорэтоксигруппу, 3,3,3-трифторпропоксигруппу, гептафторпропоксигруппу,
 гептафторизопропоксигруппу, 3-хлорпропоксигруппу, 2-хлорпропоксигруппу, 3-
 бромпропоксигруппу, 4,4,4-трифторбутоксигруппу, 4,4,4,3,3-

пентафторбутоксигруппу, 4-хлорбутоксигруппу, 4-бромбутоксигруппу, 2-хлорбутоксигруппу, 5,5,5-трифторпентоксигруппу, 5-хлорпентоксигруппу, 6,6,6-трифторгексилоксигруппу и 6-хлоргексилоксигруппу.

5 Примеры защитной группы гидроксигруппы включают неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов, низшую алканоильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алканоильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов) и фенил(низшую)алкильную группу, низшая алкильная часть которой представляет собой неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов.

10 Примеры защищенной гидроксигруппы включают метоксигруппу, этоксигруппу, н-пропоксигруппу, изопропоксигруппу, н-бутоксигруппу, изобутоксигруппу, трет-бутоксигруппу, втор-бутоксигруппу, н-пентилоксигруппу, изопентилоксигруппу, неопентилоксигруппу, н-гексилоксигруппу, изогексилоксигруппу, 3-метилпентилоксигруппу, низшую алканоилоксигруппу и фенил(низшую)алкоксигруппу. Конкретные примеры включают формилоксигруппу, ацетилоксигруппу, пропионилоксигруппу, бутирилоксигруппу, 20 изобутирилоксигруппу, пентаноилоксигруппу, трет-бутилкарбонилоксигруппу, гексаноилоксигруппу, бензилоксигруппу, 2-фенилэтоксигруппу, 1-фенилэтоксигруппу, 3-фенилпропоксигруппу, 4-фенилбутоксигруппу, 5-фенилпентилоксигруппу, 6-фенилгексилоксигруппу, 1,1-диметил-2-фенилэтоксигруппу и 2-метил-3-фенилпропоксигруппу.

25 Примеры гидроксид(низшей)алкильной группы включают указанную выше низшую алкильную группу, содержащую 1-5, предпочтительно 1-3, гидроксигрупп (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов). Ее конкретные примеры включают гидроксиметильную группу, 2-гидроксиэтильную группу, 1-гидроксиэтильную 30 группу, 3-гидроксипропильную группу, 2,3-дигидроксипропильную группу, 4-гидроксibuтильную группу, 3,4-дигидроксibuтильную группу, 1,1-диметил-2-гидроксиэтильную группу, 5-гидроксипентильную группу, 6-гидроксигексильную группу, 3,3-диметил-3-гидроксипропильную группу, 2-метил-3-гидроксипропильную 35 группу, 2,3,4-тригидроксibuтильную группу и пергидроксигексильную группу.

Примеры защитной группы гидроксид(низшей)алкильной группы включают неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов, низшую алканоильную группу (предпочтительно 40 неразветвленную или разветвленную алканоильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов) и фенил(низшую)алкильную группу, низшая алкильная часть которой представляет собой неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов.

45 Примеры защищенной гидроксид(низшей)алкильной группы включают указанную выше низшую алкильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов), содержащую 1-5, предпочтительно 1-3, указанных выше защищенных гидроксигрупп (предпочтительно низшую алкоксигруппу, низшую алканоилоксигруппу или фенил(низшую)алкоксигруппу). Ее конкретные примеры 50 включают метоксиметильную группу, 2-метоксиэтильную группу, 2-этоксиэтильную группу, 2-н-пропоксиэтильную группу, 2-изопропоксиэтильную группу, 2-н-бутоксиэтильную группу, 2-изобутоксиэтильную группу, 2-трет-бутоксиэтильную

группу, 2-втор-бутоксипентильную группу, 2-н-пентилоксипентильную группу, 2-изопентилоксипентильную группу, 2-неопентилоксипентильную группу, 2-н-гексилоксипентильную группу, 2-изогексилоксипентильную группу, 2-(3-метилпентилокси)пентильную группу, 2-формилоксипентильную группу, 2-ацетилоксипентильную группу, 2-пропионилоксипентильную группу, 2-бутирилоксипентильную группу, 2-изобутирилоксипентильную группу, 2-пентаноилоксипентильную группу, 2-трет-бутилкарбонилоксипентильную группу, 2-гексаноилоксипентильную группу, 2-бензилоксипентильную группу, 2-(2-фенилэтокси)пентильную группу, 2-(1-фенилэтокси)пентильную группу, 2-(3-фенилпропокси)пентильную группу, 2-(4-фенилбутокси)пентильную группу, 2-(5-фенилпентилокси)пентильную группу, 2-(6-фенилгексилокси)пентильную группу, 2-(1,1-диметил-2-фенилэтокси)пентильную группу, 2-(2-метил-3-фенилпропокси)пентильную группу, 3-этоксипропильную группу, 2,3-диэтоксипропильную группу, 4-этоксипентильную группу, 3,4-диэтоксипентильную группу, 1,1-диметил-2-этоксипентильную группу, 5-этоксипентильную группу, 6-этоксигексильную группу, 3,3-диметил-3-этоксипропильную группу, 2-метил-3-этоксипропильную группу и 2,3,4-триэтоксипентильную группу.

Примеры низшей алканоильной группы включают неразветвленную или разветвленную алканоильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов. Ее конкретные примеры включают формильную группу, ацетильную группу, пропионильную группу, бутирильную группу, изобутирильную группу, пентаноильную группу, трет-бутилкарбонильную группу и гексаноильную группу.

Примеры низшей алкоксикарбонильной группы включают неразветвленную или разветвленную алкоксикарбонильную группу, низший алкоксифрагмент которой является таким, как указано выше, и предпочтительно содержит 1-6 углеродных атомов. Ее конкретные примеры включают метоксикарбонильную группу, этоксикарбонильную группу, н-пропоксикарбонильную группу, изопропоксикарбонильную группу, н-бутоксикарбонильную группу, изобутоксикарбонильную группу, трет-бутоксикарбонильную группу, втор-бутоксикарбонильную группу, н-пентилоксикарбонильную группу, неопентилоксигруппу, н-гексилоксикарбонильную группу, изогексилоксикарбонильную группу и 3-метилпентилоксикарбонильную группу.

Примеры низшей алкилсульфонильной группы включают неразветвленную или разветвленную алкилсульфонильную группу, низшая алкильная часть которой является такой, как указано выше, и предпочтительно содержит 1-6 углеродных атомов. Ее конкретные примеры включают метилсульфонильную группу, этилсульфонильную группу, н-пропилсульфонильную группу, изопропилсульфонильную группу, н-бутилсульфонильную группу, изобутилсульфонильную группу, трет-бутилсульфонильную группу, втор-бутилсульфонильную группу, н-пентилсульфонильную группу, изопентилсульфонильную группу, неопентилсульфонильную группу, н-гексилсульфонильную группу, изогексилсульфонильную группу и 3-метилпентилсульфонильную группу.

Примеры низшей алкилкарбамоильной группы включают карбамоильную группу, содержащую 1-2 указанных выше низших алкильных группы (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов) в качестве заместителя(ей). Ее конкретные примеры включают N-метилкарбамоильную группу, N,N-диметилкарбамоильную группу, N-

этилкарбамоильную группу, N,N-диэтилкарбамоильную группу, N-пропилкарбамоильную группу, N-н-бутилкарбамоильную группу, N-н-пентилкарбамоильную группу, N-н-гексилкарбамоильную группу, N-изобутилкарбамоильную группу, N-трет-бутилкарбамоильную группу и N,N-ди-н-пропилкарбамоильную группу.

Примеры аминокананоильной группы включают указанную выше низшую алкананоильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкананоильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов), содержащую 1-3 (предпочтительно 1) аминокананоильной группы. Ее конкретные примеры включают аминокананоильную группу, 3-аминопропионильную группу, 4-аминобутирильную группу, 3,4-диаминобутирильную группу, 3,3-диметил-3-аминопропионильную группу, 4-аминобутирильную группу и 5-аминовалериальную группу.

Примеры низшей алкананоил аминокананоильной группы включают указанную выше низшую алкананоильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкананоильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов), низшая алкананоильная часть которой содержит 1-3 (предпочтительно 1) низших алкананоиламинокананоильной группы, указанных выше. Ее конкретные примеры включают N-формиламинокананоильную группу, N-ацетиламинокананоильную группу, N-пропиониламинокананоильную группу, 3-(N-ацетиламинокананоильную группу, 4-(N-ацетиламинокананоильную группу, 3,4-ди(N-ацетиламинокананоильную группу, 3,3-диметил-3-(N-пропиониламинокананоильную группу, 4-(N-формиламинокананоильную группу и 5-(N-ацетиламинокананоильную группу.

Примеры низшей алкоксикарбониламинокананоильной группы включают указанную выше низшую алкананоильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкананоильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов), низшая алкоксикарбониламаноильная часть которой содержит 1-3 (предпочтительно 1) низших алкоксикарбониламинокананоильной группы, указанных выше. Ее конкретные примеры включают N-метоксикарбониламинокананоильную группу, N-этоксикарбониламинокананоильную группу, N-трет-бутоксикарбониламинокананоильную группу, 3-(N-метоксикарбониламинокананоильную группу, 4-(N-ацетиламинокананоильную группу, 3,4-ди(N-ацетиламинокананоильную группу, 3,3-диметил-3-(N-пропиониламинокананоильную группу, 4-(N-формиламинокананоильную группу и 5-(N-ацетиламинокананоильную группу. Примеры аминокананоильной группы, содержащей в качестве заместителя группу, выбранную из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алкананоильной группы, низшей алкоксикарбониламаноильной группы, низшей алкилсульфонильной группы, карбамоильной группы, низшей алкилкарбамоильной группы, аминокананоильной группы, низшей алкананоиламинокананоильной группы и низшей алкоксикарбониламинокананоильной группы, включают аминокананоильную группу, содержащую в качестве заместителя 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из указанной выше низшей алкильной группы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкильной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов); указанной выше низшей алкананоильной группы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкананоильной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов); указанной выше низшей алкоксикарбониламаноильной группы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкоксикарбониламаноильной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов); указанной выше низшей алкилсульфонильной группы

(предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкилсульфонильной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов); карбамоильной группы;

указанной выше низшей алкилкарбамоильной группы (предпочтительно карбамоильной группы, содержащей в качестве заместителя 1-2 указанных выше низших алкильных группы (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов)); указанной выше аминок(низшей)алканоильной группы; указанной выше низшей алканоиламинок(низшей)алканоильной группы и указанной выше низшей алкоксикарбониламинок(низшей)алканоильной группы. Ее конкретные примеры включают аминокгруппу, N-метиламинокгруппу, N,N-диметиламинокгруппу, N-этиламинокгруппу, N-н-пропиламинокгруппу, N-изопропиламинокгруппу, N-формиламинокгруппу, N-ацетиламинокгруппу, N-трет-бутоксикарбониламинокгруппу, N-метоксикарбониламинокгруппу, N-метилсульфониламинокгруппу, N-этилсульфониламинокгруппу, N-метил-N-ацетиламинокгруппу, N-метил-N-метоксикарбониламинокгруппу, N-[N,N-диметилкарбамоил]аминокгруппу, N-карбамоиламинокгруппу, N-[N-метилкарбамоил]аминокгруппу, N-[N,N-диэтилкарбамоил]аминокгруппу, N-[аминоацетил]аминокгруппу, N-[N-формиламино]ацетил]аминокгруппу, N-[N-ацетиламино]ацетил]аминокгруппу, N-[N-метоксикарбониламино]ацетил]аминокгруппу и N-[N-трет-бутоксикарбониламино]ацетил]аминокгруппу.

Примеры арилсульфонильной группы, которая может содержать низшую алкильную группу в арильной группе, включают арилсульфонильную группу, арильная часть которой представляет собой фенил, бифенил, нафтил или тому подобное и в которой могут присутствовать 1-7, предпочтительно 1-5, более предпочтительно 1-2, неразветвленных или разветвленных алкильных групп, содержащих 1-6 углеродных атомов. Конкретные примеры арилсульфонильной группы, которая может содержать низшую алкильную группу в арильной группе, включают фенилсульфонильную группу, (2-, 3- или 4-)бифенилсульфонильную группу, (1- или 2-)нафтилсульфонильную группу, (2-, 3- или 4-)метилфенилсульфонильную группу, (2-, 3- или 4-)этилфенилсульфонильную группу, (2-, 3- или 4-)н-пропилфенилсульфонильную группу, (2-, 3- или 4-)н-бутилфенилсульфонильную группу, (2-, 3- или 4-)н-пентилфенилсульфонильную группу, (2-, 3- или 4-)н-гексилфенилсульфонильную группу, (2-, 3- или 4-)изобутилфенилсульфонильную группу, (2-, 3- или 4-)трет-бутилфенилсульфонильную группу, (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' или 6')-метил-2-бифенилсульфонильную группу, (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' или 6')-метил-3-бифенилсульфонильную группу, (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' или 6')-метил-4-бифенилсульфонильную группу, (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' или 6')-этил-2-бифенилсульфонильную группу, (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' или 6')-этил-3-бифенилсульфонильную группу, (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' или 6')-этил-4-бифенилсульфонильную группу, (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' или 6')-н-пропил-2-бифенилсульфонильную группу, (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' или 6')-н-пропил-3-бифенилсульфонильную группу, (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' или 6')-н-пропил-4-бифенилсульфонильную группу, (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' или 6')-н-бутил-2-бифенилсульфонильную группу, (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' или 6')-н-бутил-3-бифенилсульфонильную группу, (2-, 3-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' или 6')-н-бутил-4-бифенилсульфонильную группу, (3-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' или 6')-н-пентил-2-бифенилсульфонильную группу, (2-, 4-, 5-, 6-, 2', 3', 4', 5' или 6')-н-пентил-3-

бифенилсульфонильную группу, (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)н-пентил-4-
 бифенилсульфонильную группу, (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)н-гексил-2-
 бифенилсульфонильную группу, (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)н-гексил-3-
 бифенилсульфонильную группу, (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)н-гексил-4-
 бифенилсульфонильную группу, (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)изобутил-2-
 бифенилсульфонильную группу, (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)изобутил-3-
 бифенилсульфонильную группу, (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)изобутил-4-
 бифенилсульфонильную группу, (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)трет-бутил-2-
 бифенилсульфонильную группу, (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)трет-бутил-3-
 бифенилсульфонильную группу, (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)трет-бутил-4-
 бифенилсульфонильную группу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)метил-1-
 нафтилсульфонильную группу, (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)метил-2-
 нафтилсульфонильную группу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)этил-1-
 нафтилсульфонильную группу, (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)этил-2-
 нафтилсульфонильную группу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-пропил-1-
 нафтилсульфонильную группу, (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-пропил-2-
 нафтилсульфонильную группу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-бутил-1-
 нафтилсульфонильную группу, (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-бутил-2-
 нафтилсульфонильную группу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-пентил-1-
 нафтилсульфонильную группу, (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-пентил-2-
 нафтилсульфонильную группу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-гексил-1-
 нафтилсульфонильную группу, (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-гексил-2-
 нафтилсульфонильную группу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)изобутил-1-
 нафтилсульфонильную группу, (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)изобутил-2-
 нафтилсульфонильную группу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)трет-бутил-1-
 нафтилсульфонильную группу, (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)трет-бутил-2-
 нафтилсульфонильную группу, 2,3-диметилфенилсульфонильную группу, 3,4-
 диметилфенилсульфонильную группу, 2,4-диметилфенилсульфонильную группу, 2,5-
 диметилфенилсульфонильную группу, 2,6-диметилфенилсульфонильную группу,
 2,4,6-триметилфенилсульфонильную группу, 3,4,5-триметилфенилсульфонильную
 группу, 2,3,4,5-тетраэтилфенилсульфонильную группу,
 пентаметилфенилсульфонильную группу, 2,4-диметил-1-нафтилсульфонильную
 группу, 2,3-диметил-1-нафтилсульфонильную группу, 3,4-диметил-1-
 нафтилсульфонильную группу, 3,5,7-триэтил-1-нафтилсульфонильную группу, 3,4,5,7-
 тетраметил-1-нафтилсульфонильную группу, 2,3,4,5,7-пентаметил-1-
 нафтилсульфонильную группу, 2,3,4,5,6,7-гексаэтил-1-нафтилсульфонильную группу
 и гептаметил-1-нафтилсульфонильную группу.

Примеры карбоксил(нижней)алкильной группы включают указанную выше
 низшую алкильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную
 алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов), содержащую 1-3
 (предпочтительно 1) карбоксильных группы. Ее конкретные примеры включают
 карбоксиметильную группу, 2-карбоксиэтильную группу, 1-карбоксиэтильную
 группу, 1-карбокси-1-метилэтильную группу, 3-карбоксипропильную группу, 2,3-
 дикарбоксипропильную группу, 4-карбоксибутильную группу, 3,4-
 дикарбоксибутильную группу, 1,1-диметил-2-карбоксиэтильную группу, 5-
 карбоксипентильную группу, 6-карбоксигексильную группу, 3,3-диметил-3-
 карбоксипропильную группу, 2-метил-3-карбоксипропильную группу и 2,3,4-
 трикарбоксибутильную группу.

Примеры низшей алкоксикарбонил(низшей)алкильной группы включают указанную выше низшую алкильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов), содержащую 1-3 (предпочтительно 1-2) указанных выше низших алкоксикарбонильных групп (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкоксикарбонильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов). Ее конкретные примеры включают метоксикарбонилметильную группу, этоксикарбонилметильную группу, 1-метоксикарбонилэтильную группу, 2-метоксикарбонилэтильную группу, 2-этоксикарбонилэтильную группу, 1-этоксикарбонилэтильную группу, 3-метоксикарбонилпропильную группу, 3-этоксикарбонилпропильную группу, 4-этоксикарбонилбутильную группу, 5-изопропоксикарбонилпентильную группу, 6-н-пропоксикарбонилгексильную группу, 1,1-диметил-2-н-бутоксикарбонилэтильную группу, 1-метил-1-метоксикарбонилэтильную группу, 2-метил-1-метоксикарбонилпропильную группу, 2-метил-3-трет-бутоксикарбонилпропильную группу, 3-метил-1-метоксикарбонилбутильную группу, диэтоксикарбонилметильную группу, 1,2-диэтоксикарбонилэтильную группу, 2-н-пентилоксикарбонилэтильную группу и н-гексилоксикарбонилметильную группу.

Примеры карбамоил(низшей)алкильной группы, которая может содержать в качестве заместителя группу, выбранную из группы, состоящей из низшей алкильной группы, фенильной группы, которая может содержать низшую алкильную группу, и фенильной группы, которая может содержать низшую алкоксигруппу, включают указанную выше низшую алкильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов), содержащую 1-3 (предпочтительно 1-2) карбамоильных группы. Карбамоильная часть может содержать 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из фенильной группы, которая может содержать 1-3 (предпочтительно 1) указанных выше низших алкильных группы (предпочтительно неразветвленных или разветвленных алкильных группы, содержащих 1-6 углеродных атомов), и фенильной группы, которая может содержать 1-3 (предпочтительно 1) указанных выше низших алкоксигруппы (предпочтительно неразветвленных или разветвленных алкоксигруппы, содержащих 1-6 углеродных атомов). Конкретные примеры карбамоил(низшей)алкильной группы включают карбамоилметильную группу, дикарбамоилметильную группу, 2-карбамоилэтильную группу, 1-карбамоилэтильную группу, 1-карбамоил-2-метилпропильную группу, 3-карбамоилпропильную группу, 4-карбамоилбутильную группу, 5-карбамоилпентильную группу, 6-карбамоилгексильную группу, 1,1-диметил-2-карбамоилэтильную группу, 2-метил-3-карбамоилпропильную группу, N-метилкарбамоилметильную группу, N,N-диметилкарбамоилметильную группу, N-метил-N-этилкарбамоилметильную группу, N-метилкарбамоилметильную группу, 2-(N-метилкарбамоил)этильную группу, 2-(N-этилкарбамоил)этильную группу, N-фенилкарбамоилметильную группу, N-(2-метоксифенил)карбамоилметильную группу и N-(4-метилфенил)карбамоилметильную группу.

Примеры карбоксил(низшей)алкенильной группы включают указанную выше низшую алкенильную группу, содержащую 1-3, предпочтительно 1, карбоксильных группы и включающую как транс-, так и цис-конфигурации (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкенильную группу, содержащую 1-3 двойных связи и 2-6 углеродных атомов). Ее конкретные примеры включают 2-карбоксиэтильную группу, 3-карбокси-2-пропенильную группу, 4-карбокси-2-

бутенильную группу, 4-карбокси-3-бутенильную группу, 4-карбокси-1,3-бутадиенильную группу, 5-карбокси-1,3,5-гексатриенильную группу, 5-карбокси-2,4-гексадиенильную группу, 5-карбокси-3-пентенильную группу и 3-карбокси-1-пропенильную группу.

5 Примеры низшей алкоксикарбонил(низшей)алкенильной группы включают указанную выше низшую алкенильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкенильную группу, содержащую 1-3 двойных связи и 2-6
10 углеродных атомов), содержащую 1-3 указанных выше низших алкоксикарбонильных группы (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкоксикарбонильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов) и включающую как транс-, так и цис-конфигурации. Конкретные примеры низшей алкоксикарбонил(низшей)алкенильной группы включают 2-
15 метоксикарбонилэтенильную группу, 2-этоксикарбонилэтенильную группу, 1-этоксикарбонилэтенильную группу, 3-метоксикарбонил-2-пропенильную группу, 3-этоксикарбонил-2-пропенильную группу, 4-этоксикарбонил-2-бутенильную группу, 4-этоксикарбонил-1,3-бутадиенильную группу, 5-изопропоксикарбонил-3-
20 пентенильную группу, 6-н-пропоксикарбонил-1,3,5-гексатриенильную группу, 1,1-диметил-2-н-бутоксикарбонилэтенильную группу, 2-метил-3-трет-бутоксикарбонил-2-пропенильную группу и 2-н-пентилоксикарбонилэтенильную группу.

Примеры карбамоил(низшей)алкенильной группы включают указанную выше низшую алкенильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную
25 алкенильную группу, содержащую 2-6 углеродных атомов и 1-3 двойных связи), содержащую 1-3, предпочтительно 1, карбамоильных группы. Ее конкретные примеры включают 2-карбамоилэтенильную группу, 3-карбамоил-2-пропенильную группу, 4-карбамоил-2-бутенильную группу, 4-карбамоил-3-бутенильную группу, 4-
30 карбамоил-1,3-бутадиенильную группу, 5-карбамоил-1,3,5-гексатриенильную группу, 5-карбамоил-2,4-гексадиенильную группу, 5-карбамоил-3-пентенильную группу и 3-карбамоил-1-пропенильную группу.

Примеры карбамоил(низшей)алкенильной группы, которая может содержать в качестве заместителя группу, выбранную из группы, состоящей из низшей алкильной
35 группы и галогензамещенной низшей алкильной группы, включают указанную выше низшую алкенильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкенильную группу, содержащую 1-3 двойных связи и 2-6 углеродных атомов), содержащую 1-3, предпочтительно 1, карбамоильные группы, которая может
40 содержать в карбамоильной группе 1-2 заместителя, выбранных из группы, состоящей из указанной выше низшей алкильной группы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкильной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов), и указанной выше галогензамещенной низшей алкильной группы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкильной группы с 1-6
45 углеродными атомами, содержащей 1-7, предпочтительно 1-3, заместителей из атомов галогена). Ее конкретные примеры включают 2-карбамоилэтенильную группу, 2-(N-метилкарбамоил)этенильную группу, 2-(N-этилкарбамоил)этенильную группу, 2-(N,N-диметилкарбамоил)этенильную группу и 2-[N-(2,2,2-
50 трифторэтил)карбамоил]этенильную группу.

Примеры низшей алкокси(низшей)алкильной группы включают указанную выше низшую алкильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов), содержащую 1-3,

предпочтительно 1, указанных выше низших алкоксигрупп (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкоксигруппу, содержащую 1-6 углеродных атомов). Ее конкретные примеры включают метоксиметильную группу, 2-метоксиэтильную группу, 1-этоксиэтильную группу, 2-этоксиэтильную группу, 2-изобутоксипропиловую группу, 2,2-диметоксиэтильную группу, 2-метокси-1-метилэтильную группу, 2-метокси-1-этилэтильную группу, 3-метоксипропиловую группу, 3-этоксипропиловую группу, 2-изопропоксиэтильную группу, 3-изопропоксипропиловую группу, 3-н-бутоксипропиловую группу, 4-н-пропоксибутиловую группу, 1-метил-3-изобутоксипропиловую группу, 1,1-диметил-2-н-пентилоксиэтильную группу, 5-н-гексилоксипентильную группу, 6-метоксигексильную группу, 1-этоксиизопропиловую группу и 2-метил-3-метоксипропиловую группу.

Примеры арилокси(низшей)алкильной группы включают указанную выше низшую алкильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов), содержащую 1-3, предпочтительно 1, арилоксигруппы, арильная часть которой представляет собой фенил, бифенил, нафтил или тому подобное. Примеры заместителя для арильной группы включают указанную выше низшую алкильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов), указанный выше атом галогена и аминокгруппу. В арильном кольце может присутствовать один из семи заместителей по крайней мере одного из указанных типов. Конкретные примеры арилокси(низшего)алкила включают феноксиметильную группу, 2-феноксипропиловую группу, 2-[(1- или 2-)нафтилокси]этильную группу, 2-[(2-, 3- или 4-)метилфенокси]этильную группу, 2-[(2-, 3- или 4-)этилфенокси]этильную группу, 2-[(2-, 3- или 4-)н-пропилфенокси]этильную группу, 2-[(2-, 3- или 4-)н-бутилфенокси]этильную группу, 2-[(2-, 3- или 4-)н-пентилфенокси]этильную группу, 2-[(2-, 3- или 4-)н-гексилфенокси]этильную группу, 2-[(2-, 3- или 4-)изобутилфенокси]этильную группу, 2-[(2-, 3- или 4-)трет-бутилфенокси]этильную группу, 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)метил-1-нафтилокси]этильную группу, 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)метил-2-нафтилокси]этильную группу, 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)этил-1-нафтилокси]этильную группу, 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)этил-2-нафтилокси]этильную группу, 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-пропил-1-нафтилокси]этильную группу, 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-пропил-2-нафтилокси]этильную группу, 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-бутил-1-нафтилокси]этильную группу, 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-бутил-2-нафтилокси]этильную группу, 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-пентил-1-нафтилокси]этильную группу, 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-пентил-2-нафтилокси]этильную группу, 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-гексил-1-нафтилокси]этильную группу, 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-гексил-2-нафтилокси]этильную группу, 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)изобутил-1-нафтилокси]этильную группу, 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)изобутил-2-нафтилокси]этильную группу, 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)трет-бутил-1-нафтилокси]этильную группу, 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)трет-бутил-2-нафтилокси]этильную группу, 2-[(2-, 3- или 4-)хлорфенокси]этильную группу, 2-[(2-, 3- или 4-)бромфенокси]этильную группу, 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)хлор-1-нафтилокси]этильную группу, 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)хлор-2-нафтилокси]этильную группу, 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)фтор-1-нафтилокси]этильную группу, 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)фтор-2-нафтилокси]этильную группу, 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)бром-1-нафтилокси]этильную группу, 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)бром-2-нафтилокси]этильную группу,

2-[(2-, 3- или 4-)аминофенокси]этильную группу, 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)амино-1-нафтилокси]этильную группу, 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)амино-2-нафтилокси]этильную группу, 2-(2,3-диметилфенокси)этильную группу, 2-(3,4-диметилфенокси)этильную группу, 2-(2,4-диметилфенокси)этильную группу, 2-(2,5-диметилфенокси)этильную группу, 2-(2,6-диметилфенокси)этильную группу, 2-(2,4,6-триметилфенокси)этильную группу, 2-(3,4,5-триметилфенокси)этильную группу, 2-(2,3,4,5-тетраэтилфенокси)этильную группу, 2-(пентаметилфенокси)этильную группу, 2-(2,4-диметил-1-нафтилокси)этильную группу, 2-(2,3-диметил-1-нафтилокси)этильную группу, 2-(3,4-диметил-1-нафтилокси)этильную группу, 2-(3,5,7-триэтил-1-нафтилокси)этильную группу, 2-(3,4,5,7-тетраметил-1-нафтилокси)этильную группу, 2-(2,3,4,5,7-пентаметил-1-нафтилокси)этильную группу, 2-(2,3,4,5,6,7-гексаэтил-1-нафтилокси)этильную группу, 2-(гептаметил-1-нафтилокси)этильную группу, 2-(2,3-диаминофенокси)этильную группу, 2-(2,4,6-триаминофенокси)этильную группу, 2-(2-метил-5-хлор-1-нафтил)этильную группу, 3-феноксипропильную группу, 2,3-дифеноксипропильную группу, 4-феноксипропильную группу, 3,4-дифеноксипропильную группу, 1,1-диметил-2-феноксипропильную группу, 5-феноксипропильную группу, 6-феноксипропильную группу, 3,3-диметил-3-феноксипропильную группу, 2-метил-3-феноксипропильную группу и 2,3,4-трифеноксипропильную группу, 3-[(1- или 2-)нафтилокси]пропильную группу, 2,3-ди[(1- или 2-)нафтилокси]пропильную группу, 4-[(1- или 2-)нафтилокси]пропильную группу, 3,4-ди[(1- или 2-)нафтилокси]пропильную группу, 1,1-диметил-2-[(1- или 2-)нафтилокси]этильную группу, 5-[(1- или 2-)нафтилокси]этильную группу, 6-[(1- или 2-)нафтилокси]этильную группу, 3,3-диметил-3-[(1- или 2-)нафтилокси]пропильную группу, 2-метил-3-[(1- или 2-)нафтилокси]пропильную группу и 2,3,4-три[(1- или 2-)нафтилокси]пропильную группу.

Примеры амино(низшей)алкильной группы, которая может содержать группу, выбранную из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алканоильной группы, ароильной группы и карбамоильной группы, включают указанную выше низшую алкильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов), содержащую 1-5 (предпочтительно 1) аминокрупп, которые могут содержать 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из указанной выше низшей алкильной группы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкильной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов), указанной выше низшей алканоильной группы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алканоильной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов), указанной выше ароильной группы (предпочтительно бензоильной группы) и указанной выше карбамоильной группы. Конкретные примеры амино(низшей)алкильной группы включают аминометильную группу, 2-аминоэтильную группу, 1-аминоэтильную группу, 3-аминопропильную группу, 4-аминобутильную группу, 5-аминопентильную группу, 6-аминогексильную группу, 1,1-диметил-2-аминоэтильную группу, 2-метил-3-аминопропильную группу, N,N-диметиламинометильную группу, N-метил-N-этиламинометильную группу, N-метиламинометильную группу, 2-(N-метиламино)этильную группу, 1-метил-2-(N,N-диметиламино)этильную группу, 1-метил-2-(N,N-диэтиламино)этильную группу, 2-(N,N-диметиламино)этильную группу, 2-(N,N-диэтиламино)этильную группу, 2-(N,N-диизопропиламино)этильную группу, 3-(N,N-диметиламино)пропильную группу, 3-(N,N-диэтиламино)пропильную группу, 2-(N-ацетиламино)этильную группу, 2-(N-метил-N-ацетиламино)этильную группу, 2-(N-метил-N-н-бутириламино)этильную

группу, 2-(N-метил-N-бензоиламино)этильную группу и 2-(N-карбамоиламино)этильную группу.

Примеры цикло(C₃-C₈)алкильной группы включают циклопропильную группу, циклобутильную группу, цикlopентильную группу, циклогексильную группу, циклогептильную группу и циклооктильную группу.

Примеры цикло(C₃-C₈)алкильной группы, которая может содержать в качестве заместителя группу, выбранную из группы, состоящей из низшей алкильной группы, гидроксигруппы, низшей алкоксикарбонильной группы и фенил(низшей)алкоксигруппы, включают цикло(C₃-C₈)алкильную группу, которая может содержать в качестве заместителя(ей) 1-3 (предпочтительно 1) группы, выбранных из группы, состоящей из:

указанной выше низшей алкильной группы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкильной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов); гидроксигруппы;

указанной выше низшей алкоксикарбонильной группы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкоксикарбонильной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов); и

низшей алкоксигруппы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкоксигруппы, содержащей 1-6 углеродных атомов), содержащей 1-3 (предпочтительно 1) фенильных группы. Ее конкретные примеры включают циклопропильную группу, циклобутильную группу, цикlopентильную группу, циклогексильную группу, циклогептильную группу, циклооктильную группу, 1-метилциклопропильную группу, 1-метилциклопентильную группу, 1-метилциклогексильную группу, 2-метилциклогексильную группу, 4-гидроксициклогексильную группу, 4-метоксикарбонилциклогексильную группу, 2-бензилоксипентильную группу и 2-бензилоксигексильную группу.

Примеры цикло(C₃-C₈)алкилзамещенной низшей алкильной группы включают указанную выше низшую алкильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов), содержащую 1-3, предпочтительно 1, цикло(C₃-C₈)алкильных группы, указанных выше. Ее конкретные примеры включают циклопропилметильную группу, циклогексилметильную группу, 2-циклопропилэтильную группу, 1-циклобутилэтильную группу, цикlopентилметильную группу, 3-циклопентилпропильную группу, 4-циклогексилбутильную группу, 5-циклогептилпентильную группу, 6-циклооктилгексильную группу, 1,1-диметил-2-циклогексилэтильную группу и 2-метил-3-циклопропилпропильную группу.

Примеры фурил(низшей)алкильной группы (которая может содержать в качестве заместителя низшую алкильную группу в фурильной группе) включают указанную выше низшую алкильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов), содержащую 1-2 (предпочтительно 1) фурильных группы, в которых могут присутствовать в качестве заместителя 1-3 (предпочтительно 1-2) указанных выше низших алкильных группы (предпочтительно неразветвленных или разветвленных алкильных группы, содержащих 1-6 углеродных атомов). Ее конкретные примеры включают [(2- или 3-)фурил]метильную группу, 2-[(2- или 3-)фурил]этильную группу, 1-[(2- или 3-)фурил]этильную группу, 3-[(2- или 3-)фурил]пропильную группу, 4-[(2- или 3-)фурил]бутильную группу, 5-[(2- или 3-)фурил]пентильную группу, 6-[(2- или 3-)фурил]гексильную группу, 1,1-диметил-2-[(2- или 3-)фурил]

этильную группу, 2-метил-3-[(2- или 3-)фурил]пропильную группу, [5-этил-(2-, 3- или 4-)фурил]метильную группу, [5-метил-(2-, 3- или 4-)фурил]метильную группу, [2-н-пропил-(3-, 4- или 5-)фурил]метильную группу, [3-трет-бутил-(2-, 4- или 5-)фурил]метильную группу, [4-н-пентил-(2-, 3-, или 5-)фурил]метильную группу, [2-н-гексил-(3-, 4- или 5-)фурил]метильную группу, [2,5-диметил-(3- или 4-)фурил]метильную группу, [2,5-диэтил-(3- или 4-)фурил]метильную группу и [2,4,5-триэтил-3-фурил]метильную группу.

Примеры тетрагидрофурил(низшей)алкильной группы включают указанную выше низшую алкильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов), содержащую 1-2 (предпочтительно 1) тетрагидрофурильных группы. Ее конкретные примеры включают (2- или 3-) (2,3,4,5-тетрагидрофурил)метильную группу, 2-[(2- или 3-) (2,3,4,5-тетрагидрофурил)]этильную группу, 1-[(2- или 3-) (2,3,4,5-тетрагидрофурил)]этильную группу, 3-[(2- или 3-) (2,3,4,5-тетрагидрофурил)]пропильную группу, 2,3-ди[(2- или 3-) (2,3,4,5-тетрагидрофурил)]пропильную группу, 4-[(2- или 3-) (2,3,4,5-тетрагидрофурил)]бутильную группу, 3,4-ди[(2- или 3-) (2,3,4,5-тетрагидрофурил)]бутильную группу, 1,1-диметил-2-[(2- или 3-) (2,3,4,5-тетрагидрофурил)]этильную группу, 5-[(2- или 3-) (2,3,4,5-тетрагидрофурил)]пентильную группу, 6-[(2- или 3-) (2,3,4,5-тетрагидрофурил)]гексильную группу, 3,3-диметил-3-[(2- или 3-) (2,3,4,5-тетрагидрофурил)]пропильную группу, 2-метил-3-[(2- или 3-) (2,3,4,5-тетрагидрофурил)]пропильную группу и 2,3,4-три[(2- или 3-) (2,3,4,5-тетрагидрофурил)]бутильную группу.

Примеры 1,3-диоксоланил(низшей)алкильной группы включают указанную выше низшую алкильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов), содержащую 1-2 (предпочтительно 1) 1,3-диоксоланильных группы. Ее конкретные примеры включают [(2- или 4-)1,3-диоксоланил]метильную группу, 2-[(2- или 4-)1,3-диоксоланил]этильную группу, 1-[(2- или 4-)1,3-диоксоланил]этильную группу, 3-[(2- или 4-)1,3-диоксоланил]пропильную группу, 4-[(2- или 4-)1,3-диоксоланил]бутильную группу, 1,1-диметил-2-[(2- или 4-)1,3-диоксоланил]этильную группу, 5-[(2- или 4-)1,3-диоксоланил]пентильную группу, 6-[(2- или 4-)1,3-диоксоланил]гексильную группу, 1-[(2- или 4-)1,3-диоксоланил]изопропильную группу и 2-метил-3-[(1-, 2-, или 4-)имидазолил]пропильную группу.

Примеры тетрагидропиранил(низшей)алкильной группы включают указанную выше низшую алкильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов), содержащую 1-2 (предпочтительно 1) тетрагидропиранильных группы. Ее конкретные примеры включают [(2-, 3- или 4-)тетрагидропиранил]метильную группу, 2-[(2-, 3- или 4-)тетрагидропиранил]этильную группу, 1-[(2-, 3- или 4-)тетрагидропиранил]этильную группу, 3-[(2-, 3- или 4-)тетрагидропиранил]пропильную группу, 4-[(2-, 3- или 4-)тетрагидропиранил]бутильную группу, 1,1-диметил-2-[(2-, 3- или 4-)тетрагидропиранил]этильную группу, 5-[(2-, 3- или 4-)тетрагидропиранил]пентильную группу, 6-[(2-, 3- или 4-)тетрагидропиранил]гексильную группу, 1-[(2-, 3- или 4-)тетрагидропиранил]изопропильную группу и 2-метил-3-[(2-, 3- или 4-)тетрагидропиранил]пропильную группу.

Примеры пирролил(низшей)алкильной группы (которая может содержать в качестве заместителя низшую алкильную группу в пирролильной группе) включают указанную выше низшую алкильную группу (предпочтительно неразветвленную или

разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов), содержащую 1-2 (предпочтительно 1) пирролильных группы, в которых могут присутствовать в качестве заместителя(ей) 1-3 (предпочтительно 1-2) указанных выше низших алкильных группы (предпочтительно неразветвленных или

5 разветвленных алкильных группы, содержащих 1-6 углеродных атомов). Ее конкретные примеры включают [(1-, 2- или 3-)пирролил]метильную группу, 2-[(1-, 2- или 3-)пирролил]этильную группу, 1-[(1-, 2- или 3-)пирролил]этильную группу, 3-[(1-, 2- или 3-)пирролил]пропильную группу, 4-[(1-, 2- или 3-)пирролил]бутильную

10 группу, 1,1-диметил-2-[(1-, 2- или 3-)пирролил]этильную группу, 5-[(1-, 2- или 3-)пирролил]пентильную группу, 6-[(1-, 2- или 3-)пирролил]гексильную группу, 1-[(1-, 2- или 3-)пирролил]изопропильную группу, 2-метил-3-[(1-, 2- или 3-)пирролил]пропильную группу, [1-метил-(2- или 3-)пирролил]метильную группу, [1-этил-(2- или 3-)пирролил]метильную группу, [1-н-пропил-(2- или 3-)пирролил]метильную

15 группу, [1-н-бутил-(2- или 3-)пирролил]метильную группу, [1-н-пентил-(2- или 3-)пирролил]метильную группу, [1-н-гексил-(2- или 3-)пирролил]метильную группу, 2-[5-метил-(1-, 2-, 3- или 4-)пирролил]этильную группу, 1-[1-этил-(2- или 3-)пирролил]этильную группу, 3-[1-этил-(2- или 3-)пирролил]пропильную группу, 4-[1-н-пропил-(2- или 3-)пирролил]бутильную группу, 5-[1-н-бутил-(2- или 3-)пирролил]пентильную группу, 6-[1-н-пентил-(2- или 3-)пирролил]гексильную группу, [1,5-диметил-(2-, 3- или 4-)пирролил]метильную группу, [1,3,5-триметил-2-пирролил]метильную группу и [1,2,4-триметил-3-пирролил]метильную группу.

Примеры низшей алкильной группы, замещенной дигидропиразолильной группой, которая может содержать оксогруппу, включают указанную выше низшую алкильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов), содержащую 2,3-дигидропиразолильную группу или 4,5-дигидропиразолильную группу в качестве

25 дигидропиразолильной группы, в которой может присутствовать оксогруппа. Ее конкретные примеры включают 3-(2,3- или 4,5-)дигидропиразолилметильную группу, 2-[4-(2,3- или 4,5-)дигидропиразолил]этильную группу, 1-[5-(2,3- или 4,5-)дигидропиразолил]этильную группу, 3-[3-(2,3- или 4,5-)дигидропиразолил]пропильную группу, 4-[4-(2,3- или 4,5-)дигидропиразолил]бутильную группу, 5-[1-(2,3- или 4,5-)дигидропиразолил]пентильную группу, 6-[5-(2,3- или 4,5-)дигидропиразолил]гексильную группу, 2-метил-3-[1-(2,3- или 4,5-)дигидропиразолил]пропильную группу, 1,1-диметил-2-[3-(2,3- или 4,5-)дигидропиразолил]этильную

30 группу, 5-оксо-4-(4,5-дигидропиразолил)метильную группу, 2-[5-оксо-4-(4,5-дигидропиразолил)]этильную группу и 3-[5-оксо-4-(4,5-дигидропиразолил)]пропильную группу.

Примеры пиразолил(низшей)алкильной группы (которая может содержать в качестве заместителя низшую алкильную группу в пиразолильной группе) включают указанную выше низшую алкильную группу (предпочтительно неразветвленную или

45 разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов), содержащую 1-2 (предпочтительно 1) пиразолильных группы, в которых могут присутствовать в качестве заместителя(ей) 1-3 (предпочтительно 1-2) указанных выше низших алкильных группы (предпочтительно неразветвленных или

50 разветвленных алкильных группы, содержащих 1-6 углеродных атомов). Ее конкретные примеры включают 3-пиразолилметильную группу, 2-(4-пиразолил)этильную группу, 2-(1-пиразолил)этильную группу, 1-(5-пиразолил)этильную группу, 3-(3-пиразолил)пропильную группу, 4-(4-

пиразолил)бутильную группу, 5-(1-пиразолил)пентильную группу, 6-(5-
 пиразолил)гексильную группу, 2-метил-3-(1-пиразолил)пропильную группу, 1,1-
 диметил-2-(3-пиразолил)этильную группу, 1-метил-3-пиразолилметильную группу, 1-
 5 этил-3-пиразолилметильную группу, 1-н-пропил-3-пиразолилметильную группу, 1-н-
 бутил-3-пиразолилметильную группу, 1-н-пентил-3-пиразолилметильную группу, 1-
 метил-4-пиразолилметильную группу, 5-метил-3-пиразолилметильную группу, 1-
 10 этил-4-пиразолилметильную группу, 1-н-пропил-4-пиразолилметильную группу, 1-н-
 бутил-4-пиразолилметильную группу, 1-н-гексил-4-пиразолилметильную группу, 3-
 метил-1-пиразолилметильную группу, 3-этил-1-пиразолилметильную группу, 3-н-
 пропил-1-пиразолилметильную группу, 3-н-бутил-1-пиразолилметильную группу, 1,5-
 диметил-3-пиразолилметильную группу, 3,5-диметил-4-пиразолилметильную группу,
 3,4-диметил-1-пиразолилметильную группу, 1,3-диметил-5-пиразолилметильную
 15 группу, 3,4-диэтил-1-пиразолилметильную группу, 3,4-ди-н-пропил-1-
 пиразолилметильную группу, 3,4-ди-н-бутил-1-пиразолилметильную группу, 1,3,5-
 триметил-4-пиразолилметильную группу, 3,4,5-триметил-1-пиразолилметильную
 группу, 3,4,5-триэтил-1-пиразолилметильную группу, 3,4,5-три-н-пропил-1-
 пиразолилметильную группу, 3,4,5-три-н-бутил-1-пиразолилметильную группу, 1-
 20 метил-5-пиразолилметильную группу, 1-этил-5-пиразолилметильную группу, 1-н-
 пропил-5-пиразолилметильную группу, 1-н-бутил-5-пиразолилметильную группу, 2-
 (3-пиразолил)этильную группу, 3-(3-пиразолил)пропильную группу, 4-(3-
 пиразолил)бутильную группу, 5-(3-пиразолил)пентильную группу, 6-(3-
 пиразолил)гексильную группу, 2-(1-(4-хлорфенил)-3-пиразолил)этильную группу, 3-
 25 (1-метил-3-пиразолил)пропильную группу, 3-(3-метил-4-пиразолил)пропильную
 группу, 3-(5-метил-4-пиразолил)пропильную группу, 3-(1,5-диметил-3-
 пиразолил)пропильную группу, 3-(1-этил-3-пиразолил)пропильную группу, 3-(1-н-
 пропил-3-пиразолил)пропильную группу, 3-(1-н-бутил-3-пиразолил)пропильную
 30 группу, 4-(1-метил-3-пиразолил)бутильную группу, 4-(1-этил-3-пиразолил)бутильную
 группу, 4-(1-н-пропил-3-пиразолил)бутильную группу, 4-(1-н-бутил-3-
 пиразолил)бутильную группу, 5-(1-метил-3-пиразолил)пентильную группу, 5-(1-
 этил-3-пиразолил)пентильную группу, 5-(1-н-пропил-3-пиразолил)пентильную
 35 группу, 5-(1-н-бутил-3-пиразолил)пентильную группу, 6-(1-метил-3-
 пиразолил)гексильную группу, 6-(1-этил-3-пиразолил)гексильную группу, 6-(1-н-
 пропил-3-пиразолил)гексильную группу и 6-[1-(3-бутил)-3-пиразолил]гексильную
 группу.

Примеры имидазолил(низшей)алкильной группы включают указанную выше
 40 низшую алкильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную
 алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов), содержащую 1-2
 (предпочтительно 1) имидазолильных группы. Ее конкретные примеры
 включают [(1-, 2-, 4- или 5-)имидазолил]метильную группу, 2-[(1-, 2-, 4- или 5-
)имидазолил]этильную группу, 1-[(1-, 2-, 4- или 5-)имидазолил]этильную группу, 3-
 45 [(1-, 2-, 4- или 5-)имидазолил]пропильную группу, 4-[(1-, 2-, 4- или 5-)имидазолил]
 бутильную группу, 1,1-диметил-2-[(1-, 2-, 4- или 5-)имидазолил]этильную группу, 5-
 [(1-, 2-, 4- или 5-)имидазолил]пентильную группу, 6-[(1-, 2-, 4- или 5-)имидазолил]
 гексильную группу, 1-[(1-, 2-, 4- или 5-)имидазолил]изопропильную группу и 2-
 50 метил-3-[(1-, 2-, 4- или 5-)имидазолил]пропильную группу.

Примеры пиридил(низшей)алкильной группы включают указанную выше низшую
 алкильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную
 алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов), содержащую 1-2

(предпочтительно 1) пиридилных группы. Ее конкретные примеры включают (2-, 3- или 4-)пиридилметильную группу, 2-[(2-, 3- или 4-)пиридил]метильную группу, 1-[(2-, 3- или 4-)пиридил]этильную группу, 3-[(2-, 3- или 4-)пиридил]пропильную группу, 4-[(2-, 3- или 4-)пиридил]бутильную группу, 1,1-диметил-2-[(2-, 3- или 4-)пиридил]этильную группу, 5-[(2-, 3- или 4-)пиридил]пентильную группу, 6-[(2-, 3- или 4-)пиридил]гексильную группу, 1-[(2-, 3- или 4-)пиридил]изопропильную группу, 2-метил-3-[(2-, 3- или 4-)пиридил]пропильную группу.

Примеры пиразинил(нижней)алкильной группы (нижняя алкильная группа может присутствовать в качестве заместителя в пиразинильной группе) включают указанную выше нижнюю алкильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов), содержащую 1-2 (предпочтительно 1) пиразинильных группы, в которых могут присутствовать в качестве заместителя(ей) 1-3 (предпочтительно 1) указанных выше нижних алкильных группы (предпочтительно неразветвленных или разветвленных алкильных группы, содержащих 1-6 углеродных атомов). Ее конкретные примеры включают 2-пиразинилметильную группу, 2-(2-пиразинил)этильную группу, 1-(2-пиразинил)этильную группу, 3-(2-пиразинил)пропильную группу, 4-(2-пиразинил)бутильную группу, 5-(2-пиразинил)пентильную группу, 6-(2-пиразинил)гексильную группу, 3-метил-3-(2-пиразинил)пропильную группу, 1,1-диметил-2-(2-пиразинил)этильную группу, 3-метил-2-пиразинилметильную группу, 3-этил-2-пиразинилметильную группу, 3-н-пропил-2-пиразинилметильную группу, 3-н-бутил-2-пиразинилметильную группу, 3-н-пентил-2-пиразинилметильную группу, 5-метил-2-пиразинилметильную группу, 5-этил-2-пиразинилметильную группу, 5-н-пропил-2-пиразинилметильную группу, 5-н-бутил-2-пиразинилметильную группу, 6-метил-2-пиразинилметильную группу, 6-этил-2-пиразинилметильную группу, 6-н-пропил-2-пиразинилметильную группу, 6-н-бутил-2-пиразинилметильную группу, 3,5-диметил-2-пиразинилметильную группу, 3,5-диэтил-2-пиразинилметильную группу, 3,5-ди-н-пропил-2-пиразинилметильную группу, 3,5-ди-н-бутил-2-пиразинилметильную группу, 2-(5-метил-2-пиразинил)этильную группу, 2-(5-этил-2-пиразинил)этильную группу, 2-(5-н-пропил-2-пиразинил)этильную группу, 2-(5-н-бутил-2-пиразинил)этильную группу, 3-(5-метил-2-пиразинил)пропильную группу, 3-(5-этил-2-пиразинил)пропильную группу, 3-(5-н-пропил-2-пиразинил)пропильную группу, 3-(5-н-бутил-2-пиразинил)пропильную группу, 4-(5-метил-2-пиразинил)бутильную группу, 4-(5-этил-2-пиразинил)бутильную группу, 4-(5-н-пропил-2-пиразинил)бутильную группу, 4-(5-н-бутил-2-пиразинил)бутильную группу, 5-(5-метил-2-пиразинил)пентильную группу, 5-(5-этил-2-пиразинил)пентильную группу, 5-(5-н-пропил-2-пиразинил)пентильную группу, 5-(5-н-бутил-2-пиразинил)пентильную группу, 6-(5-метил-2-пиразинил)гексильную группу, 6-(5-этил-2-пиразинил)гексильную группу, 6-(5-н-пропил-2-пиразинил)гексильную группу и 6-(5-н-бутил-2-пиразинил)гексильную группу.

Примеры пирролидинил(нижней)алкильной группы (группа, выбранная из группы, состоящей из оксогруппы и нижней алкильной группы, может присутствовать в качестве заместителя в пирролидинильной группе) включают указанную выше нижнюю алкильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов), содержащую 1-2 (предпочтительно 1) пирролидинильных группы, в которых могут присутствовать в качестве заместителя(ей) 1-3 (предпочтительно 1) группы, выбранных из группы, состоящей из оксогруппы и указанной выше нижней

алкильной группы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкильной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов). Ее конкретные примеры включают [(1-, 2- или 3-)пирролидинил]метильную группу, 2-[(1-, 2- или 3-)пирролидинил]этильную группу, 1-[(1-, 2- или 3-)пирролидинил]этильную группу, 3-[(1-, 2- или 3-)пирролидинил]пропильную группу, 4-[(1-, 2- или 3-)пирролидинил]бутильную группу, 5-[(1-, 2- или 3-)пирролидинил]пентильную группу, 6-[(1-, 2- или 3-)пирролидинил]гексильную группу, 1-метил-2-[(1-, 2- или 3-)пирролидинил]этильную группу, 1,1-диметил-2-[(1-, 2- или 3-)пирролидинил]этильную группу, 2-метил-3-[(1-, 2- или 3-)пирролидинил]пропильную группу, 1-метил-(2- или 3-)пирролидинилметильную группу, 1-этил-(2- или 3-)пирролидинилметильную группу, 1-н-пропил-(2- или 3-)пирролидинилметильную группу, 1-н-бутил-(2- или 3-)пирролидинилметильную группу, 1-н-пентил-(2- или 3-)пирролидинилметильную группу, 1-н-гексил-(2- или 3-)пирролидинилметильную группу, 2-метил-1-пирролидинилметильную группу, 2-этил-1-пирролидинилметильную группу, 2-н-пропил-1-пирролидинилметильную группу, 2-н-бутил-1-пирролидинилметильную группу, 2-н-пентил-1-пирролидинилметильную группу, 2-н-гексил-1-пирролидинилметильную группу, 3-метил-2-пирролидинилметильную группу, 3-этил-2-пирролидинилметильную группу, 3-н-пропил-2-пирролидинилметильную группу, 3-н-бутил-2-пирролидинилметильную группу, 1,5-диметил-(2- или 3-)пирролидинилметильную группу, 1,5-диэтил-(2- или 3-)пирролидинилметильную группу, 1,5-ди-н-пропил-(2- или 3-)пирролидинилметильную группу, 1,5-ди-н-бутил-(2- или 3-)пирролидинилметильную группу, 1,4,5-триэтил-(2- или 3-)пирролидинилметильную группу, 1,4,5-три-н-пропил-(2- или 3-)пирролидинилметильную группу, 1,4,5-три-н-бутил-(2- или 3-)пирролидинилметильную группу, 3-[2-оксо-(1-пирролидинил)пропил]группу, 3-[5-оксо-(2-, 3- или 4-)пирролидинил]пропильную группу и 3-[1-метил-5-оксо-(2-, 3- или 4-)пирролидинил]пропильную группу.

Примеры пиперидил(нижней)алкильной группы (которая может содержать в качестве заместителя в пиперидильной группе группу, выбранную из группы, состоящей из бензоильной группы и нижней алканоильной группы) включают указанную выше нижнюю алкильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов), содержащую 1-2 (предпочтительно 1) пиперидильных группы, содержащих в качестве заместителя(ей) 1-3 (предпочтительно 1) группы, выбранных из группы, состоящей из указанных выше бензоильной группы и нижней алканоильной группы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкильной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов) в пиперидильной группе(ах). Ее конкретные примеры включают (1-, 2-, 3- или 4-)пиперидилметильную группу, 2-[(1-, 2-, 3- или 4-)пиперидил]этильную группу, 2-[1-бензоил-(2-, 3- или 4-)пиперидил]этильную группу, 2-[1-ацетил-(2-, 3- или 4-)пиперидил]этильную группу, 2-[1-бутирил-(2-, 3- или 4-)пиперидил]этильную группу, 1-[(1-, 2-, 3- или 4-)пиперидил]этильную группу, 3-[(1-, 2-, 3- или 4-)пиперидил]пропильную группу, 4-[(1-, 2-, 3- или 4-)пиперидил]бутильную группу, 1,1-диметил-2-[(1-, 2-, 3- или 4-)пиперидил]этильную группу, 5-[(1-, 2-, 3- или 4-)пиперидил]пентильную группу, 6-[(1-, 2-, 3- или 4-)пиперидил]гексильную группу, 1-[(1-, 2-, 3- или 4-)пиперидил]изопропильную группу и 2-метил-3-[(1-, 2-, 3- или 4-)пиперидил]пропильную группу.

Примеры пиперазинил(нижней)алкильной группы (которая может содержать нижнюю алкильную группу в качестве заместителя в пиперазинильной группе)

включают указанную выше низшую алкильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов), содержащую 1-2 (предпочтительно 1) пиперазинильных группы, в которых могут присутствовать в качестве заместителя(ей) 1-3 (предпочтительно 1) указанных выше низших алкильных группы (предпочтительно неразветвленных или разветвленных алкильных группы, содержащих 1-6 углеродных атомов). Ее конкретные примеры включают 1-пиперазинилметильную группу, 2-пиперазинилметильную группу, 2-(1-пиперазинил)этильную группу, 2-(2-пиперазинил)этильную группу, 1-(1-пиперазинил)этильную группу, 1-(2-пиперазинил)этильную группу, 3-(1-пиперазинил)пропильную группу, 3-(2-пиперазинил)пропильную группу, 4-(1-пиперазинил)бутильную группу, 4-(2-пиперазинил)бутильную группу, 2-(4-этил-2-пиперазинил)этильную группу, 1-(4-н-пропил-2-пиперазинил)этильную группу, 2-(4-н-бутил-2-пиперазинил)этильную группу, 2-(4-н-пентил-2-пиперазинил)этильную группу, 1-(4-н-гексил-2-пиперазинил)этильную группу, 2-(5-метил-2-пиперазинил)этильную группу, 1-(5-этил-2-пиперазинил)этильную группу, 2-(5-н-пропил-2-пиперазинил)этильную группу, 1-(5-н-бутил-2-пиперазинил)этильную группу, 2-(5-н-пентил-2-пиперазинил)этильную группу, 1-(5-н-гексил-2-пиперазинил)этильную группу, 2-(6-метил-2-пиперазинил)этильную группу, 1-(6-этил-2-пиперазинил)этильную группу, 2-(6-н-пропил-2-пиперазинил)этильную группу, 1-(6-н-бутил-2-пиперазинил)этильную группу, 2-(6-н-пентил-2-пиперазинил)этильную группу, 2-(6-н-гексил-2-пиперазинил)этильную группу, 3-(2-метил-1-пиперазинил)пропильную группу, 3-(2-этил-1-пиперазинил)пропильную группу, 3-(2-н-пропил-1-пиперазинил)пропильную группу, 3-(2-н-бутил-1-пиперазинил)пропильную группу, 3-(2-н-пентил-1-пиперазинил)пропильную группу, 3-(2-н-гексил-1-пиперазинил)пропильную группу, 3-(3-метил-1-пиперазинил)пропильную группу, 3-(3-этил-1-пиперазинил)пропильную группу, 3-(3-н-пропил-1-пиперазинил)пропильную группу, 3-(3-н-бутил-1-пиперазинил)пропильную группу, 3-(3-н-пентил-1-пиперазинил)пропильную группу, 3-(3-н-гексил-1-пиперазинил)пропильную группу, 3-(4-метил-1-пиперазинил)пропильную группу, 3-(4-этил-1-пиперазинил)пропильную группу, 3-(4-н-пропил-1-пиперазинил)пропильную группу, 3-(4-н-бутил-1-пиперазинил)пропильную группу, 3-(4-н-пентил-1-пиперазинил)пропильную группу, 6-(5-н-бутил-2-пиперазинил)гексильную группу, 6-(5-н-пентил-2-пиперазинил)гексильную группу, 6-(5-н-гексил-2-пиперазинил)гексильную группу, 6-(6-метил-2-пиперазинил)гексильную группу, 6-(6-этил-2-пиперазинил)гексильную группу, 6-(6-н-пропил-2-пиперазинил)гексильную группу, 6-(6-н-бутил-2-пиперазинил)гексильную группу, 6-(6-н-пентил-2-пиперазинил)гексильную группу, 6-(6-н-гексил-2-пиперазинил)гексильную группу, 2,3-диметил-1-пиперазинилметильную группу, 3,3-диметил-1-пиперазинилметильную группу и 2-(1,3,4-триметил-2-пиперазинил)этильную группу.

Примеры морфолинил(низшей)алкильной группы включают указанную выше низшую алкильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов), содержащую 1-2 (предпочтительно 1) морфолинильных группы. Ее конкретные примеры включают 2-морфолинилметильную группу, 3-морфолинилметильную группу, 4-морфолинилметильную группу, 2-(2-морфолинил)этильную группу, 2-(3-морфолинил)этильную группу, 2-(4-морфолинил)этильную группу, 1-(2-морфолинил)этильную группу, 1-(3-морфолинил)этильную группу, 1-(4-

морфолинил)этильную группу, 3-(2-морфолинил)пропильную группу, 3-(3-морфолинил)пропильную группу, 3-(4-морфолинил)пропильную группу, 4-(2-морфолинил)бутильную группу, 4-(3-морфолинил)бутильную группу, 4-(4-морфолинил)бутильную группу, 5-(2-морфолинил)пентильную группу, 5-(3-морфолинил)пентильную группу, 5-(4-морфолинил)пентильную группу, 6-(2-морфолинил)гексильную группу, 6-(3-морфолинил)гексильную группу, 6-(4-морфолинил)гексильную группу, 3-метил-3-(2-морфолинил)пропильную группу, 3-метил-3-(3-морфолинил)пропильную группу, 3-метил-3-(4-морфолинил)пропильную группу, 1,1-диметил-2-(2-морфолинил)этильную группу, 1,1-диметил-2-(3-морфолинил)этильную группу и 1,1-диметил-2-(4-морфолинил)этильную группу.

Примеры тиенил(низшей)алкильной группы (которая может содержать низшую алкильную группу в качестве заместителя в тиенильной группе) включают указанную выше низшую алкильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов), содержащую 1-2 (предпочтительно 1) тиенильных группы, в которых могут присутствовать в качестве заместителя(ей) 1-3 (предпочтительно 1) указанных выше низших алкильных группы (предпочтительно неразветвленных или разветвленных алкильных группы, содержащих 1-6 углеродных атомов). Ее конкретные примеры включают (2- или 3-)тиенилметильную группу, 2-[(2- или 3-)тиенил]этильную группу, 1-[(2- или 3-)тиенил]этильную группу, 3-[(2- или 3-)тиенил]пропильную группу, 4-[(2- или 3-)тиенил]бутильную группу, 5-[(2- или 3-)тиенил]пентильную группу, 6-[(2- или 3-)тиенил]гексильную группу, 1,1-диметил-2-[(2- или 3-)тиенил]этильную группу, 2-метил-3-[(2- или 3-)тиенил]пропильную группу, 3-метил-(2-, 4- или 5-)тиенилметильную группу, [5-метил-(2, 3- или 4-)тиенил]метильную группу, [4-этил-(2- или 3-)тиенил]метильную группу, [5-н-пропил-(2, 3- или 4-)тиенил]метильную группу, [3-н-бутил-(2-, 4- или 5-)тиенил]]метильную группу, [4,5-диметил-(2- или 3-)тиенил]метильную группу, (3,4,5-триметил-2-тиенил)метильную группу, 2-[3-метил-(2-, 4- или 5-)тиенил]этильную группу, 1-[4-н-пентил-(2- или 3-)тиенил]этильную группу, 3-[3-гексил-2-тиенил]пропильную группу, 4-[4,5-диметил-(2- или 3-)тиенил]бутильную группу, 5-(2,4,5-триметил-3-тиенил)пентильную группу и 6-[5-этил-(2-, 3- или 4-)тиенил]гексильную группу.

Примеры тиазолильной группы включают (2-, 4- или 5-)тиазолильную группу.

Примеры тиазолил(низшей)алкильной группы включают указанную выше низшую алкильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов), содержащую 1-2 (предпочтительно 1) тиазолильных группы. Ее конкретные примеры включают (2-, 4- или 5-)тиазолилметильную группу, 2-[(2-, 4- или 5-)тиазолил]этильную группу, 1-[(2-, 4- или 5-)тиазолил]этильную группу, 3-[(2-, 4- или 5-)тиазолил]пропильную группу, 4-[(2-, 4- или 5-)тиазолил]бутильную группу, 5-[(2-, 4- или 5-)тиазолил]пентильную группу, 6-[(2-, 4- или 5-)тиазолил]гексильную группу, 1,1-диметил-2-[(2-, 4- или 5-)тиазолил]этильную группу и [2-метил-3-[(2-, 4- или 5-)тиазолил]пропильную группу.

Примеры дигидробензофурильной группы включают 2,3-дигидро-(2-, 3-, 4-, 5-, 6- или 7-)бензофурильную группу.

Примеры дигидробензофурил(низшей)алкильной группы включают указанную выше низшую алкильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов), содержащую 1-2 (предпочтительно 1) дигидробензофурильных группы. Ее

конкретные примеры включают 2,3-дигидро-4-бензофурилметильную группу, 2-(2,3-дигидро-4-бензофурил)этильную группу, 3-(2,3-дигидро-4-бензофурил)пропильную группу, 4-(2,3-дигидро-4-бензофурил)бутильную группу, 5-(2,3-дигидро-4-бензофурил)пентильную группу, 6-(2,3-дигидро-4-бензофурил)гексильную группу, 2,3-дигидро-5-бензофурилметильную группу, 2-(2,3-дигидро-5-бензофурил)этильную группу, 3-(2,3-дигидро-5-бензофурил)пропильную группу, 4-(2,3-дигидро-5-бензофурил)бутильную группу, 2,3-дигидро-6-бензофурилметильную группу, 2-(2,3-дигидро-6-бензофурил)этильную группу, 3-(2,3-дигидро-6-бензофурил)пропильную группу, 4-(2,3-дигидро-6-бензофурил)бутильную группу, 5-(2,3-дигидро-6-бензофурил)пентильную группу, 2,3-дигидро-7-бензофурилметильную группу, 2,3-дигидро-7-бензофурилэтильную группу, 3-(2,3-дигидро-7-бензофурил)пропильную группу, 4-(2,3-дигидро-7-бензофурил)бутильную группу и 6-(2,3-дигидро-7-бензофурил)гексильную группу.

Примеры бензопиранил(низшей)алкильной группы (которая может содержать оксогруппу в качестве заместителя в бензопиранильной группе) включают указанную выше низшую алкильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов), содержащую 1-2 (предпочтительно 1) бензопиранильных группы, в которых может присутствовать оксогруппа в качестве заместителя. Ее конкретные примеры включают (4Н-1-бензопиран-2-ил)метильную группу, 2-(4Н-1-бензопиран-2-ил)этильную группу, 3-(4Н-1-бензопиран-2-ил)пропильную группу, 4-(4Н-1-бензопиран-2-ил)бутильную группу, 5-(4Н-1-бензопиран-2-ил)пентильную группу, 6-(4Н-1-бензопиран-2-ил)гексильную группу, (4Н-1-бензопиран-3-ил)метильную группу, 2-(4Н-1-бензопиран-3-ил)этильную группу, 3-(4Н-1-бензопиран-3-ил)пропильную группу, 4-(4Н-1-бензопиран-3-ил)бутильную группу, 5-(4Н-1-бензопиран-3-ил)пентильную группу, 6-(4Н-1-бензопиран-3-ил)гексильную группу, (4Н-1-бензопиран-4-ил)метильную группу, 2-(4Н-1-бензопиран-4-ил)этильную группу, 3-(4Н-1-бензопиран-4-ил)пропильную группу, 4-(4Н-1-бензопиран-4-ил)бутильную группу, 5-(4Н-1-бензопиран-4-ил)пентильную группу, 6-(4Н-1-бензопиран-4-ил)гексильную группу, (2Н-1-бензопиран-2-ил)метильную группу, 2-(2Н-1-бензопиран-2-ил)этильную группу, 3-(2Н-1-бензопиран-2-ил)пропильную группу, 4-(2Н-1-бензопиран-2-ил)бутильную группу, 5-(2Н-1-бензопиран-2-ил)пентильную группу, 6-(2Н-1-бензопиран-2-ил)гексильную группу, (2Н-1-бензопиран-3-ил)метильную группу, 2-(2Н-1-бензопиран-3-ил)этильную группу, 3-(2Н-1-бензопиран-3-ил)пропильную группу, 4-(2Н-1-бензопиран-3-ил)бутильную группу, 5-(2Н-1-бензопиран-3-ил)пентильную группу, 6-(2Н-1-бензопиран-3-ил)гексильную группу, (2Н-1-бензопиран-4-ил)метильную группу, 2-(2Н-1-бензопиран-4-ил)этильную группу, 3-(2Н-1-бензопиран-4-ил)пропильную группу, 4-(2Н-1-бензопиран-4-ил)бутильную группу, 5-(2Н-1-бензопиран-4-ил)пентильную группу, 6-(2Н-1-бензопиран-4-ил)гексильную группу, (1Н-2-бензопиран-1-ил)метильную группу, 2-(1Н-2-бензопиран-1-ил)этильную группу, 3-(1Н-2-бензопиран-1-ил)пропильную группу, 4-(1Н-2-бензопиран-1-ил)бутильную группу, 5-(1Н-2-бензопиран-1-ил)пентильную группу, 6-(1Н-2-бензопиран-1-ил)гексильную группу, (1Н-2-бензопиран-3-ил)метильную группу, 2-(1Н-2-бензопиран-3-ил)этильную группу, 3-(1Н-2-бензопиран-3-ил)пропильную группу, 4-(1Н-2-бензопиран-3-ил)бутильную группу, 5-(1Н-2-бензопиран-3-ил)пентильную группу, 6-(1Н-2-бензопиран-3-ил)гексильную группу, (1Н-2-бензопиран-3-ил)метильную группу, 2-(1Н-2-бензопиран-4-ил)этильную группу, 3-(1Н-2-бензопиран-4-ил)этильную группу, 3-(1Н-2-бензопиран-4-ил)этильную группу.

ил)пропильную группу, 4-(1Н-2-бензопиран-4-ил)бутильную группу, 5-(1Н-2-бензопиран-4-ил)пентильную группу, 6-(1Н-2-бензопиран-4-ил)гексильную группу, (4-оксо-4Н-1-бензопиран-2-ил)метильную группу, 2-(4-оксо-4Н-1-бензопиран-2-ил)этильную группу, 3-(4-оксо-4Н-1-бензопиран-2-ил)пропильную группу, 4-(4-оксо-4Н-1-бензопиран-2-ил)бутильную группу, 5-(4-оксо-4Н-1-бензопиран-2-ил)пентильную группу, 6-(4-оксо-4Н-1-бензопиран-2-ил)гексильную группу, (4-оксо-4Н-1-бензопиран-3-ил)метильную группу, 2-(4-оксо-4Н-1-бензопиран-3-ил)этильную группу, 3-(4-оксо-4Н-1-бензопиран-3-ил)пропильную группу, 4-(4-оксо-4Н-1-бензопиран-3-ил)бутильную группу, 5-(4-оксо-4Н-1-бензопиран-3-ил)пентильную группу, 6-(4-оксо-4Н-1-бензопиран-3-ил)гексильную группу, (4-оксо-4Н-1-бензопиран-4-ил)метильную группу, (2-оксо-2Н-1-бензопиран-3-ил)метильную группу, 2-(2-оксо-2Н-1-бензопиран-3-ил)этильную группу, 3-(2-оксо-2Н-1-бензопиран-3-ил)пропильную группу, 4-(2-оксо-2Н-1-бензопиран-3-ил)бутильную группу, 5-(2-оксо-2Н-1-бензопиран-3-ил)пентильную группу, 6-(2-оксо-2Н-1-бензопиран-3-ил)гексильную группу, (2-оксо-2Н-1-бензопиран-4-ил)метильную группу, 2-(2-оксо-2Н-1-бензопиран-4-ил)этильную группу, 3-(2-оксо-2Н-1-бензопиран-4-ил)пропильную группу, 4-(2-оксо-2Н-1-бензопиран-4-ил)бутильную группу, 5-(2-оксо-2Н-1-бензопиран-4-ил)пентильную группу, 6-(2-оксо-2Н-1-бензопиран-4-ил)гексильную группу, (1-оксо-1Н-2-бензопиран-3-ил)метильную группу, 2-(1-оксо-1Н-2-бензопиран-3-ил)этильную группу, 3-(1-оксо-1Н-2-бензопиран-3-ил)пропильную группу, 4-(1-оксо-1Н-2-бензопиран-3-ил)бутильную группу, 5-(1-оксо-1Н-2-бензопиран-3-ил)пентильную группу, 6-(1-оксо-1Н-2-бензопиран-3-ил)гексильную группу, (1-оксо-1Н-2-бензопиран-4-ил)метильную группу, 2-(1-оксо-1Н-2-бензопиран-4-ил)этильную группу, 3-(1-оксо-1Н-2-бензопиран-4-ил)пропильную группу, 4-(1-оксо-1Н-2-бензопиран-4-ил)бутильную группу, 5-(1-оксо-1Н-2-бензопиран-4-ил)пентильную группу и 6-(1-оксо-1Н-2-бензопиран-4-ил)гексильную группу.

Примеры бензимидазолил(низшей)алкильной группы включают указанную выше низшую алкильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов), содержащую 1-2 (предпочтительно 1) бензимидазолильных группы. Ее конкретные примеры включают 1-бензимидазолилметильную группу, 2-(1-бензимидазолил)этильную группу, 3-(1-бензимидазолил)пропильную группу, 4-(1-бензимидазолил)бутильную группу, 5-(1-бензимидазолил)пентильную группу, 6-(1-бензимидазолил)гексильную группу, 2-бензимидазолилметильную группу, 2-(2-бензимидазолил)этильную группу, 3-(2-бензимидазолил)пропильную группу, 4-(2-бензимидазолил)бутильную группу, 5-(2-бензимидазолил)пентильную группу и 6-(2-бензимидазолил)гексильную группу.

Примеры индолил(низшей)алкильной группы, которая может содержать низшую алкоксикарбонильную группу в низшей алкильной группе, включают низшую алкильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов), указанную выше, которая может содержать 1-3 (предпочтительно 1) указанных выше низших алкоксикарбонильных группы (предпочтительно неразветвленных или разветвленных алкоксикарбонильных группы, содержащих 1-6 углеродных атомов), которые могут содержать 1-2 (предпочтительно 1) индолильных группы. Ее конкретные примеры включают индол(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- или -7-)илметильную группу, 2-индол(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- или -7-)илэтильную группу, 3-индол(-1-, -2-

, -3-, -4-, -5-, -6- или -7-)илпропильную группу, 4-индол(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- или -7-)илбутильную группу, 5-индол(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- или -7-)илпентильную группу, 6-индол(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- или -7-)илгексильную группу, 3-метил-3-индол(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- или -7-)илпропильную группу, 1,1-диметил-2-индол(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- или -7-)илэтильную группу и 1-метоксикарбонил-2-индол(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- или -7-)илэтильную группу.

Примеры имидазолил(низшей)алкильной группы, содержащей заместитель, выбранный из группы, состоящей из карбамоильной группы и низшей

алкоксикарбонильной группы, в низшей алкильной группе, включают имидазолил(низшую)алкильную группу, содержащую в алкильной группе 1-3, предпочтительно 1, заместителя, выбранных из группы, состоящей из указанных выше карбамоильной группы и низшей алкоксикарбонильной группы, низшая алкильная часть которой является такой же, как указанная выше, предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкильной группой, содержащей 1-6 углеродных атомов. Ее конкретные примеры включают карбамоил-[(1-, 2-, 4- или 5-)имидазолил]метильную группу, метоксикарбонил-[(1-, 2-, 4- или 5-)имидазолил]метильную группу, этоксикарбонил-[(1-, 2-, 4- или 5-)имидазолил]метильную группу, н-бутоксикарбонил-[(1-, 2-, 4- или 5-)имидазолил]метильную группу, изобутоксикарбонил-[(1-, 2-, 4- или 5-)имидазолил]метильную группу, трет-бутоксикарбонил-[(1-, 2-, 4- или 5-)имидазолил]метильную группу, втор-бутоксикарбонил-[(1-, 2-, 4- или 5-)имидазолил]метильную группу, н-пентилоксикарбонил-[(1-, 2-, 4- или 5-)имидазолил]метильную группу, неопентилокси-[(1-, 2-, 4- или 5-)имидазолил]метильную группу, н-гексилоксикарбонил-[(1-, 2-, 4- или 5-)имидазолил]метильную группу, изогексилоксикарбонил-[(1-, 2-, 4- или 5-)имидазолил]метильную группу, 3-метилпентилоксикарбонил-[(1-, 2-, 4- или 5-)имидазолил]метильную группу, 1-карбамоил-2-[(1-, 2-, 4- или 5-)имидазолил]этильную группу, 1-метоксикарбонил-2-[(1-, 2-, 4- или 5-)имидазолил]этильную группу, 1,1-диметоксикарбонил-2-[(1-, 2-, 4- или 5-)имидазолил]этильную группу, 1,1-дикарбамоил-2-[(1-, 2-, 4- или 5-)имидазолил]этильную группу, 2-карбамоил-1-[(1-, 2-, 4- или 5-)имидазолил]этильную группу, 2-метоксикарбонил-3-[(1-, 2-, 4- или 5-)имидазолил]пропильную группу, 2-карбамоил-4-[(1-, 2-, 4- или 5-)имидазолил]бутильную группу, 1-метил-1-карбамоилметил-2-[(1-, 2-, 4- или 5-)имидазолил]этильную группу, 2-метоксикарбонил-5-[(1-, 2-, 4- или 5-)имидазолил]пентильную группу, 3-карбамоил-6-[(1-, 2-, 4- или 5-)имидазолил]гексильную группу, 2-метоксикарбонил-1-[(1-, 2-, 4- или 5-)имидазолил]изопропильную группу и 2-карбамоилметил-3-[(1-, 2-, 4- или 5-)имидазолил]пропильную группу.

Примеры пиридилной группы, которая может содержать в качестве заместителя группу, выбранную из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алкоксигруппы и низшей алкилтио(низшей)алкильной группы, включают пиридилную группу, которая может содержать в качестве заместителя(ей) 1-4 (предпочтительно 1) группы, выбранных из группы, состоящей из указанной выше низшей алкильной группы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкильной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов), указанной выше низшей алкоксигруппы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкоксигруппы, содержащей 1-6 углеродных атомов) и низшей алкилтио(низшей)алкильной группы, в которой каждая из двух низших алкильных частей образована указанной выше низшей алкильной группой (предпочтительно

неразветвленной или разветвленной алкильной группой, содержащей 1-6 углеродных атомов). Ее конкретные примеры включают 2-пиридинильную группу, 3-пиридинильную группу, 4-пиридинильную группу, 4-метил-2-пиридинильную группу, 5-метил-2-пиридинильную группу, 5-этил-3-пиридинильную группу, 2-н-пропил-3-пиридинильную группу, 4-н-бутил-2-пиридинильную группу, 4-трет-бутил-2-пиридинильную группу, 5-н-пентил-3-пиридинильную группу, 4-н-гексил-2-пиридинильную группу, 4-метокси-2-пиридинильную группу, 5-метокси-2-пиридинильную группу, 2-метилтиометил-3-пиридинильную группу, 5-этилтиометил-2-пиридинильную группу, 4-н-пропилтиометил-2-пиридинильную группу, 3-н-бутилтиометил-2-пиридинильную группу, 5-н-пентилтиометил-3-пиридинильную группу, 4-н-гексилтиометил-3-пиридинильную группу, 2-(2-метилтиоэтил)-3-пиридинильную группу, 2-(3-метилтиопропил)-4-пиридинильную группу, 3-(4-метилтиобутил)-4-пиридинильную группу, 3-(5-метилтиопентил)-2-пиридинильную группу, 4-(6-метилтиогексил)-2-пиридинильную группу, 3,4-диметил-2-пиридинильную группу, 2,4,6-триэтил-3-пиридинильную группу, 2,3,5,6-тетраметил-4-пиридинильную группу и 2-метил-3-метилтиометил-4-пиридинильную группу.

Примеры пирролидинильной группы, которая может содержать в качестве заместителя группу, выбранную из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алкоксикарбонильной группы, низшей алканоильной группы и ароильной группы, включают пирролидинильную группу, которая может содержать в качестве заместителя(ей) 1-3, предпочтительно 1, группы, выбранных из группы, состоящей из указанной выше низшей алкильной группы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкильной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов), указанной выше низшей алкоксикарбонильной группы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкоксикарбонильной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов), указанной выше низшей алканоильной группы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алканоильной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов), и ароильной группы (предпочтительно бензоильной группы). Ее конкретные примеры включают пирролидин-1-ильную группу, пирролидин-2-ильную группу, пирролидин-3-ильную группу, 1-метилпирролидин-3-ильную группу, 2-этилпирролидин-3-ильную группу, 3-н-пропилпирролидин-3-ильную группу, 4-н-бутилпирролидин-3-ильную группу, 1-трет-бутилпирролидин-3-ильную группу, 5-н-пентилпирролидин-3-ильную группу, 1-н-гексилпирролидин-2-ильную группу, 2-метоксикарбонил-2-ильную группу, 3-этоксикарбонилпирролидин-2-ильную группу, 1-трет-бутоксикарбонилпирролидин-3-ильную группу, 4-пропоксикарбонилпирролидин-2-ильную группу, 5-бутоксикарбонилпирролидин-2-ильную группу, 1-пентоксикарбонил-2-ильную группу, 2-гексилоксикарбонилпирролидин-2-ильную группу, 1,3-диметоксикарбонилпирролидин-2-ильную группу, 3,4,5-триэтилпирролидин-2-ильную группу, 2,3,4,5-тетраметилпирролидин-1-ильную группу, 2,4-диметоксикарбонилпирролидин-1-ильную группу, 3,4,5-триэтоксикарбонилпирролидин-1-ильную группу, 2-метил-4-метоксикарбонилпирролидин-1-ильную группу, 1-бензоилпирролидин-3-ильную группу, 1-ацетилпирролидин-3-ильную группу и 1-бутирилпирролидин-3-ильную группу.

Примеры пиперидильной группы, которая может содержать в качестве заместителя группу, выбранную из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алкоксикарбонильной группы, низшей алканоильной группы и ароильной группы, которая может содержать группу, выбранную из группы, состоящей из

низшей алкильной группы и атома галогена, включают пиперидильную группу, которая может содержать в качестве заместителя(ей) 1-5 (предпочтительно 1-4) групп, выбранных из группы, состоящей из:

указанной выше низшей алкильной группы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкильной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов);

указанной выше низшей алкоксигруппы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкоксигруппы, содержащей 1-6 углеродных атомов);

указанной выше низшей алканоильной группы (предпочтительно

неразветвленной или разветвленной алканоильной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов); и

ароильной группы, которая может содержать 1-3 (предпочтительно 1) группы, выбранных из группы, состоящей из указанной выше низшей алкильной группы и атома галогена, указанного выше (предпочтительно бензоильной группы). Ее

конкретные примеры включают 1-пиперидильную группу, 2-пиперидильную группу, 3-пиперидильную группу, 4-пиперидильную группу, 1-метил-4-пиперидильную группу, 2-этил-4-пиперидильную группу, 3-н-пропил-4-пиперидильную группу, 4-н-бутил-4-пиперидильную группу, 1-н-пентил-4-пиперидильную группу, 2-н-гексил-4-

пиперидильную группу, 1-метоксикарбонил-4-пиперидильную группу, 1-этоксикарбонил-4-пиперидильную группу, 4-н-пропоксикарбонил-4-пиперидильную группу, 5-н-бутоксикарбонил-4-пиперидильную группу, 1-трет-бутоксикарбонил-4-пиперидильную группу, 1-формил-4-пиперидильную группу, 1-ацетил-4-пиперидильную группу, 1-бутирил-4-пиперидильную группу, 1-бутирил-3-пиперидильную группу, 2-пропионил-4-пиперидильную группу, 3-бутирил-4-пиперидильную группу, 4-изобутирил-4-пиперидильную группу, 1-н-пентаноил-4-пиперидильную группу, 2-трет-бутилкарбонил-4-пиперидильную группу, 3-н-гексаноил-4-пиперидильную группу, 1-бензоил-4-пиперидильную группу, 1-бензоил-3-пиперидильную группу, 1-(2-, 3- или 4- хлорбензоил)-4-пиперидильную группу, 1-(2-, 3- или 4-фторбензоил)-4-пиперидильную группу, 1-(2-, 3- или 4-метилбензоил)-4-пиперидильную группу, 2,6-диметил-4-пиперидильную группу, 2,4,6-триметил-3-пиперидильную группу, 2,2,6,6-тетраметил-4-пиперидильную группу и 2,2,4,4,6-пентаметил-3-пиперидильную группу.

Примеры тетрагидрофурильной группы, которая может содержать оксогруппу, включают 2-тетрагидрофурильную группу, 3-тетрагидрофурильную группу, 3-оксо-2-тетрагидрофурильную группу, 4-оксо-2-тетрагидрофурильную группу, 5-оксо-2-тетрагидрофурильную группу, 2-оксо-3-тетрагидрофурильную группу, 4-оксо-3-тетрагидрофурильную группу и 5-оксо-4-тетрагидрофурильную группу.

Примеры гексагидроазепинильной группы, которая может содержать оксогруппу, включают 2-гексагидроазепинильную группу, 3-гексагидроазепинильную группу, 4-гексагидроазепинильную группу, 2-оксо-3-гексагидроазепинильную группу, 3-оксо-2-гексагидроазепинильную группу, 4-оксо-2-гексагидроазепинильную группу, 5-оксо-2-гексагидроазепинильную группу и 6-оксо-2-гексагидроазепинильную группу.

Примеры пиразолильной группы, которая может содержать в качестве заместителя группу, выбранную из группы, состоящей из низшей алкильной группы, арильной группы и фурильной группы, включают пиразолильную группу, которая может содержать 1-3 (предпочтительно 1-2) группы, выбранных из группы, состоящей из

указанной выше низшей алкильной группы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкильной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов),

указанной выше арильной группы и фурильной группы. Ее конкретные примеры включают 1-пиразолильную группу, 3-пиразолильную группу, 4-пиразолильную группу, 1-метил-5-пиразолильную группу, 1-этил-5-пиразолильную группу, 3-н-пропил-5-пиразолильную группу, 4-н-бутил-5-пиразолильную группу, 1-трет-бутил-4-пиразолильную группу, 1-н-пентил-4-пиразолильную группу, 3-н-гексил-4-пиразолильную группу, 3-фенил-5-пиразолильную группу, 1-(2-нафтил)-3-пиразолильную группу, 4-(2-метилфенил)-3-пиразолильную группу, 5-(3-этилфенил)-3-пиразолильную группу, 1-(4-н-пропилфенил)-4-пиразолильную группу, 3-(2-н-бутилфенил)-4-пиразолильную группу, 5-(3-н-пентилфенил)-4-пиразолильную группу, 1-(4-н-гексилфенил)-5-пиразолильную группу, 3-(2-изобутилфенил)-5-пиразолильную группу, 4-(3-трет-бутилфенил)-5-пиразолильную группу, 3-(2-хлорфенил)-1-пиразолильную группу, 4-(3-фторфенил)-1-пиразолильную группу, 5-(4-бромфенил)-1-пиразолильную группу, 1-(2-аминофенил)-3-пиразолильную группу, 4-(2,3-диметилфенил)-3-пиразолильную группу, 5-(3,4,5-триметилфенил)-3-пиразолильную группу, 1-(2,3-диаминофенил)-4-пиразолильную группу, 3-(2-фурил)-5-пиразолильную группу, 1,3-диметил-5-пиразолильную группу, 1,3,4-триэтил-5-пиразолильную группу, 1,3,5-триметил-4-пиразолильную группу и 1-метил-3-фенил-5-пиразолильную группу.

Примеры тиadiaзолильной группы включают 1,2,3-тиadiaзолильную группу, 1,2,4-тиadiaзолильную группу, 1,2,5-тиadiaзолильную группу или 1,3,4-тиadiaзолильную группу.

Примеры тиadiaзолильной группы, которая может содержать низшую алкильную группу, включают тиadiaзолильную группу, указанную выше, которая может содержать 1-3, предпочтительно 1, указанных выше низших алкильных группы (предпочтительно неразветвленных или разветвленных алкильных группы, содержащих 1-6 углеродных атомов). Ее конкретные примеры включают 4- или 5-(1, 2, 3-тиadiaзолильную) группу, 3- или 5-(1, 2, 4-тиadiaзолильную) группу, 3-(1, 2, 5-тиadiaзолильную) группу, 2-(1, 3, 4-тиadiaзолильную) группу, 5-метил-1,3,4-тиadiaзол-2-ильную группу, 4-этил-1,2,3-тиadiaзол-5-ильную группу, 5-н-пропил-1,2,4-тиadiaзол-3-ильную группу, 5-н-бутил-1,3,4-тиadiaзол-2-ильную группу, 4-трет-бутил-1,2,3-тиadiaзол-5-ильную группу, 5-н-пентил-1,2,4-тиadiaзол-3-ильную группу и 5-н-гексил-1,3,4-тиadiaзол-2-ильную группу.

Примеры изоксазолильной группы, которая может содержать низшую алкильную группу, включают изоксазолильную группу, которая может содержать 1-2 указанных выше низших алкильных группы (предпочтительно неразветвленных или разветвленных алкильных группы, содержащих 1-6 углеродных атомов). Ее конкретные примеры включают 3-изоксазолильную группу, 4-изоксазолильную группу, 5-изоксазолильную группу, 3-метил-5-изоксазолильную группу, 4-этил-5-изоксазолильную группу, 4-н-пропил-3-изоксазолильную группу, 5-метил-3-изоксазолильную группу, 5-н-бутил-3-изоксазолильную группу, 3-трет-бутил-4-изоксазолильную группу, 5-н-пентил-4-изоксазолильную группу, 3-н-гексил-5-изоксазолильную группу и 3,4-диметил-5-изоксазолильную группу.

Примеры индазолильной группы включают (1-, 3-, 4-, 5-, 6- или 7-)индазолильную группу.

Примеры тетрагидробензотиазолильной группы включают (2-, 4-, 5-, 6- или 7-) (4,5,6,7-тетрагидробензотиазолильную) группу.

Примеры тетрагидрохинолильной группы включают (1-, 2-, 4-, 5-, 6- или -8) (1, 2, 3, 4-тетрагидрохинолильную) группу.

Примеры тетрагидрохинолильной группы, которая может содержать в качестве заместителя группу, выбранную из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алкоксигруппы, атома галогена и оксогруппы, включают указанную выше тетрагидрохинолильную группу, которая может содержать в качестве заместителя(ей) 1-3 (предпочтительно 1-2) группы, выбранных из группы, состоящей из

указанной выше низшей алкильной группы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкильной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов),

указанной выше низшей алкоксигруппы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкоксигруппы, содержащей 1-6 углеродных атомов), атома галогена и оксогруппы. Ее конкретные примеры включают 1-(1,2,3,4-тетрагидрохинолильную) группу, 2-(1,2,3,4-тетрагидрохинолильную) группу, 3-(1,2,3,4-тетрагидрохинолильную) группу, 4-(1,2,3,4-тетрагидрохинолильную) группу, 5-(1,2,3,4-тетрагидрохинолильную) группу, 6-(1,2,3,4-тетрагидрохинолильную) группу, 7-(1,2,3,4-тетрагидрохинолильную) группу, 8-(1,2,3,4-тетрагидрохинолильную) группу, 2-метил-3-(1,2,3,4-тетрагидрохинолильную) группу, 3-этил-2-(1,2,3,4-тетрагидрохинолильную) группу, 4-н-пропил-2-(1,2,3,4-тетрагидрохинолильную) группу, 5-н-бутил-3-(1,2,3,4-тетрагидрохинолильную) группу, 6-трет-бутил-3-(1,2,3,4-тетрагидрохинолильную) группу, 7-н-пентил-2-(1,2,3,4-тетрагидрохинолильную) группу, 8-н-гексил-2-(1,2,3,4-тетрагидрохинолильную) группу, 2-метокси-4-(1,2,3,4-тетрагидрохинолильную) группу, 3-этокси-4-(1,2,3,4-тетрагидрохинолильную) группу, 4-пропокси-5-(1,2,3,4-тетрагидрохинолильную) группу, 5-бутокси-6-(1,2,3,4-тетрагидрохинолильную) группу, 6-пентокси-7-(1,2,3,4-тетрагидрохинолильную) группу, 7-гексилокси-8-(1,2,3,4-тетрагидрохинолильную) группу, 4-оксо-3-(1,2,3,4-тетрагидрохинолильную) группу, 2-оксо-(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)-(1,2,3,4-тетрагидрохинолильную) группу, 2-оксо-8-метил-(3-, 4-, 5-, 6- или 7-)-(1,2,3,4-тетрагидрохинолильную) группу, 2-оксо-8-метокси-3-(1,2,3,4-тетрагидрохинолильную) группу, 2-оксо-5-метокси-(1-, 3-, 4-, 6-, 7- или 8-)-(1,2,3,4-тетрагидрохинолильную) группу, 2-оксо-8-фтор-(3-, 4-, 5-, 6- или 7-)-(1,2,3,4-тетрагидрохинолильную) группу и 2-оксо-6,8-диметил-3-(1,2,3,4-тетрагидрохинолильную) группу.

Примеры хинолильной группы включают 2-хинолильную группу, 3-хинолильную группу, 4-хинолильную группу, 5-хинолильную группу, 6-хинолильную группу, 7-хинолильную группу и 8-хинолильную группу. Примеры хинолильной группы, которая может содержать низшую алкильную группу, включают хинолильную группу, которая может содержать 1-2 указанных выше низших алкильных группы (предпочтительно неразветвленных или разветвленных алкильных группы, содержащих 1-6 углеродных атомов). Ее конкретные примеры включают 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-хинолильную группу, 2-метил-6-хинолильную группу, 4-этил-5-хинолильную группу, 4-н-пропил-3-хинолильную группу, 5-метил-3-хинолильную группу, 5-н-бутил-3-хинолильную группу, 3-трет-бутил-4-хинолильную группу, 5-н-пентил-4-хинолильную группу, 3-н-гексил-5-хинолильную группу и 3,4-диметил-5-хинолильную группу.

Примеры бензодиоксолил(низшей)алкильной группы включают указанную выше низшую алкильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов), содержащую 1-2 (предпочтительно 1) бензодиоксолильных группы. Ее конкретные примеры включают 2-, 4- или 5-(1,3-бензодиоксолил)метильную группу, 2-(2-, 4- или 5-) (1,3-

бензодиоксолил)этильную группу и 3-(2-, 4- или 5-) (1,3-бензодиоксолил)пропильную группу.

Примеры арильной группы, которая может содержать группу, выбранную из группы, состоящей из атома галогена; низшей алкильной группы; низшей алкоксигруппы; галогензамещенной низшей алкильной группы; галогензамещенной низшей алкоксигруппы; низшей алкенильной группы; аминогруппы, которая может содержать группу, выбранную из группы, состоящей из низшей алкилсульфонильной группы, низшей алкильной группы и арильной группы; сульфамойльной группы; низшей алкилтиогруппы; низшей алканойльной группы; низшей алкоксикарбонильной группы; пирролильной группы; низшей алкинильной группы; цианогруппы; нитрогруппы; арилоксигруппы; арил(низшей)алкоксигруппы; гидроксигруппы; гидрокси(низшей)алкильной группы; карбамойльной группы, которая может содержать группу, выбранную из группы, состоящей из низшей алкильной группы и арильной группы; пиразолильной группы; пирролидинильной группы, которая может содержать оксогруппу; оксазолильной группы; имидазолильной группы, которая может содержать низшую алкильную группу; дигидрофурильной группы, которая может содержать оксогруппу; тиазолидинил(низшей)алкильной группы, которая может содержать оксогруппу; имидазолил(низшей)алканойльной группы и пиперидинилкарбонильной группы, включают арильную группу, указанную выше, которая может содержать в качестве заместителя(ей) 1-7, предпочтительно 1-5, более предпочтительно 1-2, группы, выбранных из группы, состоящей из:

атома галогена, указанного выше;

указанной выше низшей алкильной группы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкильной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов);

указанной выше низшей алкоксигруппы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкоксигруппы, содержащей 1-6 углеродных атомов);

указанной выше галогензамещенной низшей алкильной группы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкильной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов, замещенной 1-7 атомами галогена);

указанной выше галогензамещенной низшей алкоксигруппы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкоксигруппы, содержащей 1-6 углеродных атомов, замещенной 1-7 атомами галогена);

указанной выше низшей алкенильной группы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкенильной группы, содержащей 1-3 двойных связи и 2-6 углеродных атомов (включая как транс-, так и цис-конфигурации));

аминогруппы, содержащей 1-2 указанных выше низших алканойльных группы, указанных выше низших алкильных группы и указанных выше арильных группы; сульфамойльной группы;

низшей алкилтиогруппы, низшая алкильная часть которой представляет собой указанную выше низшую алкильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов);

указанной выше низшей алканойльной группы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алканойльной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов);

указанной выше низшей алкоксикарбонильной группы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкоксикарбонильной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов); пирролильной группы; указанной выше алкинильной группы;

цианогруппы; нитрогруппы; арилоксигруппы, арильная часть которой, такая, как
 указанная выше; арил(низшей)алкоксигруппы, арильная часть и низшая
 алкоксильная часть которой, такие, как указанные выше; гидроксигруппы;
 5 гидрокси(низшей)алкильной группы, низшая алкильная часть которой, такая, как
 указанная выше; карбамоильной группы, которая может содержать 1-2 группы,
 выбранных из группы, состоящей из указанной выше низшей алкильной группы и
 указанной выше арильной группы; пиразолильной группы; пирролидинильной
 10 группы, которая может содержать 1-2 (предпочтительно 1) оксогруппы;
 оксазолильной группы; имидазолильной группы, которая может содержать 1-3
 (предпочтительно 1-2) указанных выше низших алкильных группы;
 дигидрофурильной группы, которая может содержать 1-2 (предпочтительно 1)
 оксогруппы; тиазолидинильной группы, которая может содержать 1-2
 15 (предпочтительно 1) оксогруппы и содержит низшую алкильную часть, указанную
 выше; имидазолил(низшей)алканоильной группы, алканоильная часть которой,
 такая, как указанная выше, и пиперидинилкарбонильной группы. Ее конкретные
 примеры включают фенильную группу, 1-нафтильную группу, 2- нафтильную
 группу, (2-, 3- или 4-)бифенильную группу, (2-, 3- или 4-)хлорфенильную группу, (2-,
 20 3- или 4-)фторфенильную группу, (2-, 3- или 4-)бромфенильную группу, (2-, 3- или 4-)
 метилфенильную группу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)этил-1-нафтильную группу, (2-, 3-
 или 4-)н-пропилфенильную группу, (2-, 3- или 4-)н-бутилфенильную группу, (2-, 3-
 или 4-)н-пентилфенильную группу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-гексил-1-нафтильную
 25 группу, (2-, 3- или 4-)изобутилфенильную группу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)трет-
 бутил-1-нафтильную группу, (2-, 3- или 4-)метоксифенильную группу, (2-, 3-, 4-, 5-,
 6-, 7- или 8-)этокси-1-нафтильную группу, (2-, 3- или 4-)н-пропоксифенильную
 группу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)изопропокси-1-нафтильную группу, (2-, 3- или 4-)н-
 бутоксифенильную группу, (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)изобутоксид-2-нафтильную
 30 группу, (2-, 3- или 4-)трет-бутоксифенильную группу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)втор-
 бутокси-1-нафтильную группу, (2-, 3- или 4-)н-пентилоксифенильную группу, (2-, 3-
 , 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)изопентилокси-1-нафтильную группу, (2-, 3- или 4-
)неопентилоксифенильную группу, (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-гексилокси-2-
 35 нафтильную группу, (2-, 3- или 4-)изогексилоксифенильную группу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-
 , 7- или 8-) (3-метилпентилокси)-1-нафтильную группу, (2-, 3- или 4-
)хлорметилфенильную группу, (2-, 3- или 4-)трифторметилфенильную группу, (2-, 3-
 , 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)фторэтил-1-нафтильную группу, (2-, 3- или 4-) (3-
 бромпропил)фенильную группу, (2-, 3- или 4-) (4-хлорбутил)фенильную группу, (2-,
 40 3- или 4-) (5-фторпентил)фенильную группу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-) (6-
 бромгексил)-1-нафтильную группу, (2-, 3- или 4-) (1,1-диметил-2-
 хлорэтил)фенильную группу, (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-) (2-метил-3-фторпропил)-2-
 нафтильную группу, (2-, 3- или 4-)хлорметоксифенильную группу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-
 или 8-) (2-фторэтокси)-1-нафтильную группу, (2-, 3- или 4-) (3-
 45 бромпропокси)фенильную группу, (2-, 3- или 4-) (4-хлорбутоксид)фенильную группу,
 (2-, 3- или 4-) (5-фторпентилокси)фенильную группу, (2-, 3- или 4-
)трифторметоксифенильную группу, 4-(6-бромгексилокси)-1-нафтильную группу, (2-
 , 3- или 4-) (1,1-диметил-2-хлорэтокси)фенильную группу, 7-(2-метил-3-
 50 фторпропокси)-2-нафтильную группу, 2-винилфенильную группу, 2-(1-
 метилвинил)фенильную группу, 2-(1-пропенил)-1-нафтильную группу, (2-, 3- или 4-)
 (1-метил-1-пропенил)фенильную группу, 3-(2-метил-1-пропенил)-1-нафтильную
 группу, (2-, 3- или 4-) (1-пропенил)фенильную группу, (2-, 3- или 4-) (2-

пропенил)фенильную группу, 4-(2-бутенил)-1-нафтильную группу, (2-, 3- или 4-) (1-
 бутенил)фенильную группу, 5-(3-бутенил)-1-нафтильную группу, (2-, 3- или 4-) (2-
 пентенил)фенильную группу, 6-(1-пентенил)-1-нафтильную группу, (2-, 3- или 4-) (3-
 пентенил)фенильную группу, 7-(4-пентенил)-1-нафтильную группу, (2-, 3- или 4-) (1,3-
 5 бутадиенил)фенильную группу, 8-(1,3-пентадиенил)-1-нафтильную группу, (2-, 3-
 или 4-) (2-пентен-4-инил)фенильную группу, 1-(2-гексенил)-2-нафтильную группу, 4-
 (1-гексенил)фенильную группу, 3-(5-гексенил)-2-нафтильную группу, (2-, 3- или 4-) (3-
 гексенильную) группу, 4-(4-гексенил)-2-нафтильную группу, (2-, 3- или 4-) (3,3-
 10 диметил-1-пропенил)фенильную группу, 5-(2-этил-1-пропенил)-2-нафтильную
 группу, 4-(1,3,5-гексатриенил)фенильную группу, 6-(1,3-гексадиенил)-2-нафтильную
 группу, (2-, 3- или 4-) (1,4-гексадиенил)фенильную группу, (2-, 3- или 4-) (N-
 формиламино)фенильную группу, (2-, 3- или 4-) (N-ацетиламино)фенильную группу,
 7-(N-ацетиламино)-2-нафтильную группу, (2-, 3- или 4-) (N-
 15 пропиониламино)фенильную группу, 8-(N-бутириламино)-2-нафтильную группу, (2-
 , 3- или 4-) (N-изобутириламино)фенильную группу, 2-(N-пентаноиламино)-1-
 нафтильную группу, (2-, 3- или 4-) (N-трет-бутилкарбониламино)фенильную группу,
 3-(N-гексаноиламино)-1-нафтильную группу, (2-, 3- или 4-) (N,N-
 20 диформиламино)фенильную группу, 4-(N,N-диацетиламино)-1-нафтильную группу,
 (2-, 3- или 4-) (N,N-диметиламино)фенильную группу, (2-, 3- или 4-) (N-
 фениламино)фенильную группу, (2-, 3- или 4-)сульфамоилфенильную группу, 5-
 сульфамоил-1-нафтильную группу, (2-, 3- или 4-)метилтиофенильную группу, 6-
 этилтио-1-нафтильную группу, (2-, 3- или 4-)н-пропилтиофенильную группу, 7-
 25 изопропилтио-1-нафтильную группу, (2-, 3- или 4-)н-бутилтиофенильную группу, 8-
 трет-бутилтио-1-нафтильную группу, (2-, 3- или 4-)н-пентилтиофенильную группу, 1-
 н-гексилтио-2-нафтильную группу, (2-, 3- или 4-) (N-
 метил(сульфониламино)фенильную группу, (2-, 3- или 4-)формилфенильную группу,
 30 (2-, 3- или 4-)ацетилфенильную группу, (2-, 3- или 4-)бутирилфенильную группу, 3-
 ацетил-2-нафтильную группу, (2-, 3- или 4-)пропионилфенильную группу, 4-
 бутирил-2-нафтильную группу, (2-, 3- или 4-)изобутирилфенильную группу, 5-
 пентаноил-2-нафтильную группу, (2-, 3- или 4-)цианофенильную группу, (2-, 3- или 4-
)метоксикарбонилфенильную группу, (2-, 3- или 4-)трет-бутилкарбонилфенильную
 35 группу, 6-гексаноил-2-нафтильную группу, (2-, 3- или 4-)этоксикарбонилфенильную
 группу, 7-этоксикарбонил-2-нафтильную группу, (2-, 3- или 4-)н-
 пропоксикарбонилфенильную группу, 8-изопропоксикарбонил-2-нафтильную
 группу, (2-, 3- или 4-)н-бутоксикарбонилфенильную группу, 2-изобутоксикарбонил-1-
 40 нафтильную группу, (2-, 3- или 4-)трет-бутоксикарбонилфенильную группу, 3-втор-
 бутоксикарбонил-1-нафтильную группу, (2-, 3- или 4-)н-
 пентилоксикарбонилфенильную группу, 4-неопентилокси-1-нафтильную группу, (2-
 , 3- или 4-)н-гексилоксикарбонилфенильную группу, 5-изогексилоксикарбонил-1-
 нафтильную группу, (2-, 3- или 4-) (3-метилпентилоксикарбонил)фенильную группу,
 45 6-(1-пирролил)-1-нафтильную группу, (2-, 3- или 4-) (1-пирролил)фенильную группу,
 (2-, 3- или 4-)этинилфенильную группу, (2-, 3- или 4-) (N-метилкарбамоил)фенильную
 группу, (2-, 3- или 4-) (N-фенилкарбамоил)фенильную группу, (2-, 3- или 4-) (2-
 гидроксипропил)фенильную группу, (2-, 3- или 4-)феноксифенильную группу, (2-, 3-
 50 или 4-)нитрофенильную группу, (2-, 3- или 4-)бензилоксифенильную группу, (2-, 3-
 или 4-)гидроксифенильную группу, (2-, 3- или 4-) (2-оксо-2,5-дигидрофуран-4-
 ил)фенильную группу, (2-, 3- или 4-) (1-имидазолилацетил)фенильную группу, (2-, 3-
 или 4-) (2,4-диоксотиазолидин-5-илметил)фенильную группу, (2-, 3- или 4-)[(1-, 2-, 3-

или 4-)пиперидилкарбонил]фенильную группу, (2-, 3- или 4-)[(1-, 3-, 4- или 5-)
)пиразолил]фенильную группу, (2-, 3- или 4-)[2-оксо-(1- или 3-)пирролидинил]
 фенильную группу, (2-, 3- или 4-)[(2-, 4- или 5-)оксазолил]фенильную группу, (2-, 3-
 5 или 4-) (2-этил-4-метилимидазол-1-ил)фенильную группу, (2-, 3- или 4-)бифенильную
 группу, 2,3-диметоксифенильную группу, 2,4-диметоксифенильную группу, 2,5-
 диметоксифенильную группу, 2,6-диметоксифенильную группу, 3,4-
 диметоксифенильную группу, 3,5-диметоксифенильную группу, 2,3-
 дихлорфенильную группу, 2,4-дихлорфенильную группу, 3,4-дихлорфенильную
 10 группу, 2-метокси-5-хлорфенильную группу, 2-метокси-5-метилфенильную группу, 2-
 метокси-5-ацетиламинофенильную группу, 2-винил-4-метилфенильную группу, 2-
 винил-5-этилфенильную группу, 2,6-дисульфоамилфенильную группу, 2,4,6-
 триметоксифенильную группу, 3,4,5-триэтоксифенильную группу, 2-винил-3,4,5-
 триэтилфенильную группу, пентаметоксифенильную группу, 2-винилнафтильную
 15 группу, 2,3-диметокси-1-нафтильную группу, 3,4-диэтоксифенильную группу, 2-
 метокси-5-метоксикарбонилфенильную группу, 3,5-диметоксикарбонилфенильную
 группу, 3-хлор-4-гидроксифенильную группу, 2-хлор-5-(N-ацетиламино)фенильную
 группу, 2-хлор-5-цианофенильную группу, 2-хлор-5-карбамоилфенильную группу, 2-
 20 метокси-5-(N-ацетиламино)фенильную группу, 2-хлор-5-этоксикарбонилфенильную
 группу, 3,5,7-триэтокси-1-нафтильную группу, 3,4,5,7-тетраметил-1-нафтильную
 группу, 2,3,4,5-тетраметил-7-(N-пентаацетиламино)-1-нафтильную группу, 2,3,4,5,6,7-
 гексаэтокси-1-нафтильную группу и гептаметокси-1-нафтильную группу.

Примеры циано(низшей)алкильной группы включают указанную выше низшую
 25 алкильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную
 алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов), содержащую одну
 цианогруппу. Ее конкретные примеры включают цианометильную группу, 2-
 цианоэтильную группу, 1-цианоэтильную группу, 3-цианопропильную группу, 4-
 30 цианобутильную группу, 1,1-диметил-2-цианоэтильную группу, 5-цианопентильную
 группу, 6-цианогексильную группу, 1-цианоизопропильную группу и 2-метил-3-
 цианопропильную группу.

Примеры низшей алканоиламино(низшей)алкильной группы включают указанную
 выше низшую алкильную группу (предпочтительно неразветвленную или
 35 разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов),
 содержащую 1-3, предпочтительно 1, аминогруппы, содержащих 1-2 указанных
 выше низших алканоильных группы (предпочтительно неразветвленных или
 разветвленных алканоильных группы, содержащих 1-6 углеродных атомов). Ее
 40 конкретные примеры включают 2-(N-формиламино)этильную группу, 2-(N-
 ацетиламино)этильную группу, 2-(N-пропиониламино)этильную группу, 2-(N-
 бутириламино)этильную группу, 2-(N-изобутириламино)этильную группу, 2-(N-
 пентаноиламино)этильную группу, 2-(N-трет-бутилкарбониламино)этильную
 группу, 2-(N-гексаноиламино)этильную группу, N-ацетиламинометильную группу, 1-
 45 (N-ацетиламино)этильную группу, 3-(N-ацетиламино)пропильную группу, 4-(N-
 ацетиламино)бутильную группу, 5-(N-ацетиламино)пентильную группу, 6-(N-
 ацетиламино)гексильную группу, 1,1-диметил-2-(N-ацетиламино)этильную группу, 2-
 метил-3-(N-ацетиламино)пропильную группу и 2-(N,N-диацетиламино)этильную
 50 группу.

Примеры галогензамещенной низшей алкиламиногруппы включают
 аминогруппу, содержащую 1-2 (предпочтительно 1) указанных выше
 галогензамещенных низших алкильных группы (предпочтительно неразветвленных

или разветвленных галогензамещенных алкильных группы, содержащих 1-6 углеродных атомов с 1-7 (предпочтительно 1-3) атомами галогена). Ее конкретные примеры включают N-фторметиламиногруппу, N-дифторметиламиногруппу, N-трифторметиламиногруппу, N-хлорметиламиногруппу, N-дихлорметиламиногруппу, N-трихлорметиламиногруппу, N-бромметиламиногруппу, N-дибромметиламиногруппу, N-дихлорфторметиламиногруппу, N-2,2,2-трифторэтиламиногруппу, N-пентафторэтиламиногруппу, N-2-хлорэтиламиногруппу, N-3,3,3-трифторпропиламиногруппу, N-гептафторпропиламиногруппу, N-гептафторизопропиламиногруппу, N-3-хлорпропиламиногруппу, N-2-хлорпропиламиногруппу, N-3-бромпропиламиногруппу, N-4,4,4-трифторбутиламиногруппу, N-4,4,4,3,3-пентафторбутиламиногруппу, N-4-хлорбутиламиногруппу, N-4-бромбутиламиногруппу, N-2-хлорбутиламиногруппу, N-5,5,5-трифторпентиламиногруппу, N-5-хлорпентиламиногруппу, N-6,6,6-трифторгексиламиногруппу, N-6-хлоргексиламиногруппу, N-(1,1-диметил-2-хлорэтил)аминогруппу, N-(2-метил-3-фторпропил)аминогруппу и N,N-ди(фторметил)аминогруппу.

Примеры низшей алкилтио(низшей)алкильной группы включают указанную выше низшую алкильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов), содержащую 1-3 низших алкилтиогруппы, алкильная часть которых представляет собой указанную выше низшую алкильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов). Ее конкретные примеры включают 2-метилтиоэтильную группу, 2-этилтиоэтильную группу, 2-н-пропилтиоэтильную группу, 2-н-бутилтиоэтильную группу, 2-трет-бутилтиоэтильную группу, 2-н-пентилтиоэтильную группу, 2-н-гексилтиоэтильную группу, метилтиометильную группу, 1-метилтиоэтильную группу, 3-метилтиопропильную группу, 4-метилтиобутильную группу, 5-метилтиопентильную группу, 6-метилтиогексильную группу, 1,1-диметил-2-метилтиоэтильную группу, 2-метил-3-метилтиопропильную группу, 2,2-диэтилтиоэтильную группу и 2,2,2-триэтилтиоэтильную группу.

Примеры амидиногруппы, которая может содержать низшую алкильную группу, включают амидиногруппу, которая может содержать 1-2 указанных выше низших алкильных группы (предпочтительно неразветвленных или разветвленных алкильных группы, содержащих 1-6 углеродных атомов). Ее конкретные примеры включают амидиногруппу, N-метиламидиногруппу, N-этиламидиногруппу, N-н-пропиламидиногруппу, N-н-бутиламидиногруппу, N-н-пентиламидиногруппу, N-н-гексиламидиногруппу, N-изопропиламидиногруппу, N-трет-бутиламидиногруппу, N,N-диметиламидиногруппу, N,N'-диметиламидиногруппу и N-метил-N'-этиламидиногруппу.

Примеры амидино(низшей)алкильной группы включают указанную выше низшую алкильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов), содержащую 1-3 амидиногруппы. Ее конкретные примеры включают амидинометильную группу, 2-амидиноэтильную группу, 3-амидинопропильную группу, 4-амидинобутильную группу, 5-амидинопропильную группу, 6-амидиногексильную группу, 1-амидиноэтильную группу, 1,1-диметил-2-амидиноэтильную группу, 2-метил-3-амидинопропильную группу, 2,2-диамидиноэтильную группу и 2,2,2-

триамидиноэтильную группу.

Примеры низшей алкенилоксигруппы включают низшую алкенилоксигруппу, низшая алкенильная часть которой, такая, как указанная выше (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкенилоксигруппу, содержащую 1-3 двойных связи и 2-6 углеродных атомов). Ее конкретные примеры включают винилоксигруппу, 1-пропенилоксигруппу, 1-метил-1-пропенилоксигруппу, 2-метил-1-пропенилоксигруппу, 2-пропенилоксигруппу, 2-бутенилоксигруппу, 1-бутенилоксигруппу, 3-бутенилоксигруппу, 2-пентенилоксигруппу, 1-пентенилоксигруппу, 3-пентенилоксигруппу, 4-пентенилоксигруппу, 1,3-бутадиенилоксигруппу, 1,3-пентадиенилоксигруппу, 2-пентен-4-инилоксигруппу, 2-гексенилоксигруппу, 1-гексенилоксигруппу, 5-гексенилоксигруппу, 3-гексенилоксигруппу, 4-гексенилоксигруппу, 3,3-диметил-1-пропенилоксигруппу, 2-этил-1-пропенилоксигруппу, 1,3,5-гексатриенилоксигруппу, 1,3-гексадиенилоксигруппу и 1,4-гексадиенилоксигруппу.

Примеры низшей алкенилокси(низшей)алкильной группы включают указанную выше низшую алкильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов), содержащую 1-3 низших алкенилоксигруппы, низшая алкенилоксильная часть которой представляет собой указанную выше низшую алкенилоксигруппу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкенильную группу, содержащую 2-6 углеродных атомов и 1-3 двойных связи). Ее конкретные примеры включают винилоксиметильную группу, 2-винилоксиэтильную группу, 2-(1-пропенилокси)этильную группу, 2-(1-метил-1-пропенилокси)этильную группу, 2-(2-метил-1-пропенилокси)этильную группу, 2-(2-пропенилокси)этильную группу, 2-(2-бутенилокси)этильную группу, 2-(1-бутенилокси)этильную группу, 2-(3-бутенилокси)этильную группу, 2-(2-пентенилокси)этильную группу, 2-(1-пентенилокси)этильную группу, 2-(3-пентенилокси)этильную группу, 2-(4-пентенилокси)этильную группу, 2-(1,3-бутадиенилокси)этильную группу, 2-(1,3-пентадиенилокси)этильную группу, 2-(2-пентен-4-инилокси)этильную группу, 2-(2-гексенилокси)этильную группу, 2-(1-гексенилокси)этильную группу, 2-(5-гексенилокси)этильную группу, 2-(3-гексенилокси)этильную группу, 2-(4-гексенилокси)этильную группу, 2-(3,3-диметил-1-пропенилокси)этильную группу, 2-(2-этил-1-пропенилокси)этильную группу, 2-(1,3,5-гексатриенилокси)этильную группу, 2-(1,3-гексадиенилокси)этильную группу, 2-(1,4-гексадиенилокси)этильную группу, 3-винилоксипропильную группу, 4-винилоксибутильную группу, 5-винилоксипропильную группу, 6-винилоксигексильную группу, 1-винилоксиэтильную группу, 1,1-диметил-2-винилоксиэтильную группу, 2-метил-3-винилоксипропильную группу, 2,2-дивинилоксиэтильную группу и 2,2,2-тривинилоксиэтильную группу.

Примеры ариламиногруппы, которая может содержать заместитель, выбранный из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алкоксигруппы, галогензамещенной низшей алкильной группы и галогензамещенной низшей алкоксигруппы, в арильной группе, включают аминогруппу, содержащую 1-2 указанных выше арильных группы, которая может содержать 1-7, предпочтительно 1-5, более предпочтительно 1-2, заместителей в арильной группе, выбранных из группы, состоящей из:

указанной выше низшей алкильной группы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкильной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов);

указанной выше низшей алкоксигруппы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкоксигруппы, содержащей 1-6 углеродных атомов);

указанной выше галогензамещенной алкильной группы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкильной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов с 1-7, предпочтительно 1-3, атомами галогена) и

указанной выше галогензамещенной низшей алкоксигруппы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкоксигруппы, содержащей 1-6 углеродных атомов с 1-7, предпочтительно 1-3, атомами галогена). Ее конкретные примеры включают N-фениламиногруппу, N-2-нафтиламиногруппу, N-(2-метилфенил)аминогруппу, N-(3-этил-1-нафтил)аминогруппу, N-(4-н-пропилфенил)аминогруппу, N-(2-н-бутил-1-фенил)аминогруппу, N-(3-н-пентилфенил)аминогруппу, N-(4-н-гексил-1-нафтил)аминогруппу, N-(2-изобутилфенил)аминогруппу, N-(3-трет-бутил-1-нафтил)аминогруппу, N-(2-метоксифенил)аминогруппу, N-(3-этокси-1-нафтил)аминогруппу, N-(4-н-пропоксифенил)аминогруппу, N-(3-изопропокси-1-нафтил)аминогруппу, N-(н-бутоксифенил)аминогруппу, N-(1-изобутокси-2-нафтил)аминогруппу, N-(трет-бутоксифенил)аминогруппу, N-(5-втор-бутокси-1-нафтил)аминогруппу, N-(н-пентилоксифенил)аминогруппу, N-(5-изопентилокси-1-нафтил)аминогруппу, N-(1-неопентилоксифенил)аминогруппу, N-(6-н-гексилокси-2-нафтил)аминогруппу, N-(изогексилоксифенил)аминогруппу, N-(3-метилпентилокси-1-нафтил)аминогруппу, N-(2-трифторметилфенил)аминогруппу, N-(4-трифторметилфенил)аминогруппу, N-(2-хлорметилфенил)аминогруппу, N-[3-(2-фторэтил)-1-нафтил]аминогруппу, N-[4-(3-бромпропил)фенил]аминогруппу, N-[2-(4-хлорбутил)-1-фенил]аминогруппу, N-[3-(5-фторпентил)фенил]аминогруппу, N-[4-(6-бромгексил)-1-нафтил]аминогруппу, N-[2-(1,1-диметил-2-хлорэтил)фенил]аминогруппу, N-[7-(2-метил-3-фторпропил)-2-нафтил]аминогруппу, N-(2-хлорметоксифенил)аминогруппу, N-(4-трифторметоксифенил)аминогруппу, N-(3-(2-фторэтокси)-1-нафтил)аминогруппу, N-[4-(3-бромпропокси)фенил]аминогруппу, N-[2-(4-хлорбутокси)-1-фенил]аминогруппу, N-[3-(5-фторпентилокси)фенил]аминогруппу, N-[4-(6-бромгексилокси)-1-нафтил]аминогруппу, N-[2-(1,1-диметил-2-хлорэтокси)фенил]аминогруппу, N-[7-(2-метил-3-фторпропокси)-2-нафтил]аминогруппу, N-(2-хлорметоксифенил)аминогруппу, N-[3-(2-фторэтокси)-1-нафтил]аминогруппу, N-[4-(3-бромпропокси)фенил]аминогруппу, N-[2-(4-хлорбутокси)-1-фенил]аминогруппу, N-[3-(5-фторпентилокси)фенил]аминогруппу, N-[4-(6-бромгексилокси)-1-нафтил]аминогруппу, N-[2-(1,1-диметил-2-хлорэтокси)фенил]аминогруппу, N-[7-(2-метил-3-фторпропокси)-2-нафтил]аминогруппу и N,N-дифениламиногруппу.

Примеры арил(низшей)алкенильной группы включают указанную выше низшую алкенильную группу, содержащую указанную выше арильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкенильную группу, содержащую 1-3 арильных группы и 1-6 углеродных атомов). Ее конкретные примеры включают 2-фенилэтенильную группу, 3-фенил-2-пропенильную группу, 3-[(1- или 2-)нафтил]-2-пропенильную группу, 4-[(2-, 3- или 4-)метилфенил]-2-бутенильную группу, 4-[(2-, 3- или 4-)этилфенил]-3-бутенильную группу, 4-[(2-, 3- или 4-)н-пропилфенил]-1,3-бутадиенильную группу, 5-[(2-, 3- или 4-)н-бутилфенил]-1,3,5-гексатриенильную группу, 5-[(2-, 3- или 4-)н-пентилфенил]-2,4-гексадиенильную группу, 5-[(2-, 3- или 4-)н-гексилфенил]-3-пентенильную группу, 3-[(2-, 3- или 4-)изобутилфенил]-2-пропенильную группу, 2-[(2-, 3- или 4-)трет-бутилфенил]фенильную группу, 3-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)метил-1-нафтил]-2-пропенильную

группу, 4-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)метил-2-нафтил]-2-бутенильную группу, 4-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)этил-1-нафтил]-3-бутенильную группу, 4-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)этил-2-нафтил]-1,3-бутадиенильную группу, 5-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-пропил-1-нафтил]-1,3,5-гексатриенильную группу, 5-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-пропил-2-нафтил]-2,4-гексадиенильную группу, 5-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-бутил-1-нафтил]-3-пентенильную группу, 3-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-бутил-2-нафтил]-2-пропенильную группу, 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-пентил-1-нафтил]этенильную группу, 3-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-пентил-2-нафтил]-2-пропенильную группу, 4-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-гексил-1-нафтил]-2-бутенильную группу, 4-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-гексил-2-нафтил]-3-бутенильную группу, 4-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)изобутил-1-нафтил]-1,3-бутадиенильную группу, 5-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)изобутил-2-нафтил]-1,3,5-гексатриенильную группу, 5-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)трет-бутил-1-нафтил]-2,4-гексадиенильную группу, 5-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)трет-бутил-2-нафтил]-1,3,5-гексатриенильную группу, 5-[(2-, 3- или 4-)хлорфенильную группу, (2-, 3- или 4-)фторфенил]-2,4-гексадиенильную группу, 5-[(2-, 3- или 4-)бромфенил]-3-пентенильную группу, 3-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)хлор-1-нафтил]-2-пропенильную группу, 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)хлор-2-нафтил]этенильную группу, 3-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)фтор-1-нафтил]-2-пропенильную группу, 4-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)фтор-2-нафтил]-2-бутенильную группу, 4-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)бром-1-нафтил]-3-бутенильную группу, 4-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)бром-2-нафтил]-1,3-бутадиенильную группу, 5-[(2-, 3- или 4-)аминофенил]-1,3,5-гексатриенильную группу, 5-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)амино-1-нафтил]-2,4-гексадиенильную группу, 5-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)амино-2-нафтил]-3-пентенильную группу, 3-(2,3-диметилфенил)-2-пропенильную группу, 2-(3,4-диметилфенил)винильную группу, 3-(2,4-диметилфенил)-2-пропенильную группу, 4-(2,5-диметилфенил)-2-бутенильную группу, 4-(2,6-диметилфенил)-3-бутенильную группу, 4-(2,4,6-триметилфенил)-1,3-бутадиенильную группу, 5-(3,4,5-триметилфенил)-1,3,5-гексатриенильную группу, 5-(2,3,4,5-тетраэтилфенил)-2,4-гексадиенильную группу, 5-(пентаметилфенил)-3-пентенильную группу, 3-(2-метилнафтил)-2-пропенильную группу, 2-(2,3-диметилнафтил)этенильную группу, 3-(3,4-диметилфенил)-2-пропенильную группу, 4-(3,5,7-триэтилнафтил)-2-бутенильную группу, 4-(3,4,5,7-тетраметилнафтил)-3-бутенильную группу, 4-(2,3,4,5,7-пентаметилнафтил)-1,3-бутадиенильную группу, 5-(2,3,4,5,6,7-гексаэтилнафтил)-1,3,5-гексатриенильную группу, 5-(гептаметилнафтил)-2,4-гексадиенильную группу, 5-(2,3-диаминофенил)-3-пентенильную группу, 3-(2,4,6-триаминофенил)-2-пропенильную группу и 2-(2-метил-5-хлорнафтил)этенильную группу.

Примеры пиридиламиногруппы, которая может содержать низшую алкильную группу, включают пиридиламиногруппу, которая может содержать 1-3, предпочтительно 1-2, указанных выше низших алкильных группы (предпочтительно неразветвленных или разветвленных алкильных группы, содержащих 1-6 углеродных атомов) в пиридильной группе и/или аминогруппе. Ее конкретные примеры включают N-(2-, 3- или 4-)пиридиламиногруппу, N-3-метил-2-пиридиламиногруппу, N-(4-метил-2-пиридил)аминогруппу, N-(5-метил-2-пиридил)аминогруппу, N-(6-метил-2-пиридил)аминогруппу, N-(2-метил-3-пиридил)аминогруппу, N-(4-метил-3-пиридил)аминогруппу, N-(5-метил-3-пиридил)аминогруппу, N-(6-метил-3-пиридил)аминогруппу, N-(2-метил-4-пиридил)аминогруппу, N-(3-метил-4-пиридил)аминогруппу, N-(3-этил-2-пиридил)аминогруппу, N-(4-н-пропил-2-пиридил)аминогруппу, N-(5-н-пропил-2-

пиридил)аминогруппу, N-(2-н-бутил-3-пиридил)аминогруппу, N-(4-н-пентил-3-пиридил)аминогруппу, N-(5-н-гексил-3-пиридил)аминогруппу, N-(2-изопропил-4-пиридил)аминогруппу, N-(3-трет-бутил-4-пиридил)аминогруппу, N-(3-метил-2-пиридил)-N-метиламиногруппу и N-(2,4-диэтил-3-пиридил)-N-метиламиногруппу.

Примеры арил(низшей)алкильной группы (которая может содержать группу, выбранную из группы, состоящей из атома галогена, низшей алкильной группы, галогензамещенной алкильной группы, галогензамещенной низшей алкоксигруппы, низшей алкоксигруппы, карбамоильной группы и низшей алкоксикарбонильной группы, в качестве заместителя в арильной группе и/или низшей алкильной группе) включают указанную выше низшую алкильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов), содержащую 1-3 (предпочтительно 1) арильных группы, указанных выше. Отметим, что в арильной группе и/или алкильной части могут присутствовать 1-7, предпочтительно 1-5, более предпочтительно 1-2, заместителей, выбранных из группы, состоящей из

атома галогена, указанного выше;

указанной выше низшей алкильной группы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкильной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов);

указанной выше галогензамещенной низшей алкильной группы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкильной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов, замещенной 1-7 атомами галогена);

указанной выше низшей алкоксигруппы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкоксигруппы, содержащей 1-6 углеродных атомов, замещенной 1-7 атомами галогена);

указанной выше низшей алкоксигруппы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкоксигруппы, содержащую 1-6 углеродных атомов);

карбамоильной группы и

указанной выше низшей алкоксикарбонильной группы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкоксикарбонильной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов). Конкретные примеры арил(низшей)алкильной группы (которая может содержать заместитель, выбранный из группы, состоящей из атома галогена, низшей алкильной группы, галогензамещенной низшей алкильной группы, галогензамещенной низшей алкоксигруппы, низшей алкоксигруппы, карбамоильной группы и низшей алкоксикарбонильной группы, в арильной группе и/или низшей алкильной группе) включают бензильную группу, 1-фенилэтильную группу, 2-фенилэтильную группу, 1-метил-1-фенилэтильную группу, 1,1-диметил-2-фенилэтильную группу, 1,1-диметил-3-фенилпропильную группу, (2-, 3- или 4-)фторбензильную группу, 2-[(2-, 3- или 4-)фторфенил]этильную группу, 1-[(2-, 3- или 4-)фторфенил]пропильную группу, 2-[(2,6- или 3,5-)дифторфенил]этильную группу, 1-(3,5-дифторфенил)этильную группу, 1-(3,5-дифторфенил)пропильную группу, (2-, 3- или 4-)хлорбензильную группу, 2-[(2-, 3- или 4-)хлорфенил]этильную группу, 2-(3,4-дихлорфенил)этильную группу, 1-(3-хлорфенил)бутильную группу, 1-(4-хлорфенил)бутильную группу, (2-, 3- или 4-)трифторметилфенилбензильную группу, 1-[(2-, 3- или 4-)трифторметилфенил]этильную группу, 1-[(2-, 3- или 4-)трифторметилфенил]пропильную группу, (2-, 3- или 4-)метилбензильную группу, 2-[(2- 3- или 4-)метилфенил]этильную группу, (2-, 3- или 4-)трифторметоксибензильную группу, 1-[(2-, 3- или 4-)трифторметилфенил]этильную группу, (2-, 3- или 4-)метоксибензильную группу, 2-[(2-, 3- или 4-

5)метилфенил]этильную группу, 1-[(2-, 3- или 4-)метоксифенил]пропильную группу, (2-, 3- или 4-)этоксibenзильную группу, (3,4- или 3,5-)диметоксibenзильную группу, (3,4- или 3,5-)ди(н-бутокси)бензильную группу, 2-[(3,5- или 3,4-)диметоксифенил]этильную группу, 2-(2-этоксифенил)этильную группу, 1-(4-метоксифенил)бутильную группу, 1-фенил-1-метоксикарбонилметильную группу, 1-карбамоил-2-фенилэтильную группу, 1-метоксикарбонил-2-фенилэтильную группу, 2-метоксикарбонил-2-фенилэтильную группу, 2-фенил-2-гидроксиэтильную группу, 2-(4-гидроксифенил)-1-метоксикарбонилэтильную группу, 3-хлор-4-дифторметоксифенилметильную группу и нафтилметильную группу.

10 Примеры низшей алкинильной группы включают неразветвленную или разветвленную алкинильную группу, содержащую 2-6 углеродных атомов. Ее конкретные примеры включают этинильную группу, 2-пропинильную группу, 2-бутинильную группу, 3-бутинильную группу, 1-метил-2-пропинильную группу, 2-пентинильную группу и 2-гексинильную группу.

15 Примеры арилокси(низшей)алкильной группы (в арильной группе может присутствовать группа, выбранная из группы, состоящей из низшей алкоксигруппы; карбамоильной группы, которая может содержать группу, выбранную из группы, состоящей из низшей алкоксигруппы и низшей алкильной группы; и пирролидинильной группы, которая может содержать оксогруппу) включают арил(низшую)алкильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов), арильная часть которой и низшая алкильная группа, такие, как указанные выше. В арильной 25 группе здесь могут присутствовать в качестве заместителя(ей) 1-5 (предпочтительно 1-2) групп, выбранных из группы, состоящей из низшей алкоксигруппы, указанной выше; карбамоильной группы, которая может содержать 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкоксигруппы, указанной выше, и низшей алкильной группы, указанной выше; и оксогруппы. Ее конкретные примеры включают 2-[(2-, 3- или 4-)метоксифенокси]этильную группу, 2-[(2-, 3- или 4-)карбамоилфенокси]этильную группу, 2-[(2-, 3- или 4-) (N-метил-N-этоксикарбамоил)фенокси]этильную группу и 2-[(2-, 3- или 4-) (2-оксо-1-пирролидинил)фенокси]этильную группу.

30 Примеры изоксазолидинильной группы, которая может содержать оксогруппу, включают изоксазолидинильную группу, которая может содержать 1-2 (предпочтительно 1) оксогруппы. Ее конкретные примеры включают 3-оксоизооксазолидин-4- или 5-ильную группу и 3,5-диоксоизоксазолидин-4-ильную группу.

40 Примеры дигидроинденильной группы включают (1-, 2-, 4- или 5-)-1,2-дигидроинденильную группу.

45 Примеры арил(низшей)алкокси(низшей)алкильной группы включают арил(низшую)алкокси(низшую)алкильную группу, арильная часть которой, низшая алкоксильная часть и низшая алкильная группа, такие, как указанные выше. Ее конкретные примеры включают бензилоксиметильную группу, 2-бензилоксиэтильную группу и 2-бензилоксибутильную группу.

50 Примеры азетидинильной группы, которая может содержать группу, выбранную из группы, состоящей из низшей алканоильной группы и ароильной группы, включают азетидинильную группу, которая может содержать 1-3 (предпочтительно 1) группы, выбранных из низшей алканоильной группы, указанной выше, и ароильной группы, указанной выше. Ее конкретные примеры

включают 2- или 3-азетидинильную группу, 1-ацетил-(2- или 3-)азетидинильную группу, 1-бутирил-(2- или 3-)азетидинильную группу и 1-бензоил-(2- или 3-)азетидинильную группу.

5 Примеры азетидинил(низшей)алкильной группы, которая может содержать группу, выбранную из группы, состоящей из низшей алканоильной группы и ароильной группы, включают азетидинил(низшую)алкильную группу, которая может содержать 1-3 (предпочтительно 1) группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алканоильной группы, указанной выше, и ароильной группы, указанной
10 выше, и содержать низшую алкильную часть, указанную выше. Ее конкретные примеры включают 2- или 3-азетидинилметильную группу, 2-(2- или 3-азетидинил)этильную группу, 1-ацетил-(2- или 3-)азетидинилметильную группу, 1-бутирил-(2- или 3-)азетидинилметильную группу, 1-бензоил-(2- или 3-)азетидинилметильную группу, 2-[1-ацетил-(2- или 3-)азетидинил]этильную группу, 2-
15 [1-бутирил-(2- или 3-)азетидинил]этильную группу и 2-[1-бензоил-(2- или 3-)азетидинил]этильную группу.

Примеры тетразолильной группы включают (1- или 5-)тетразолильную группу.

Примеры индолинильной группы, которая может содержать оксогруппу,
20 включают индолинильную группу, которая может содержать 1-2 (предпочтительно 1) оксогруппы. Ее конкретные примеры включают (1-, 3-, 5-, 6-, 7- или 8-)индолинильную группу, 2-оксо-(1-, 3-, 5-, 6-, 7- или 8-)индолинильную группу и 2,3-диоксо-(1-, 5-, 6-, 7- или 8-)индолинильную группу.

Примеры триазолильной группы включают 1,2,4-триазолильную группу и 1,3,5-
25 триазолильную группу.

Примеры триазолильной группы, которая может содержать группу, выбранную из группы, состоящей из низшей алкильной группы и низшей алкилтиогруппы, включают указанную выше триазолильную группу, которая может содержать 1-3
30 (более предпочтительно 1-2) группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, указанной выше, и низшей алкилтиогруппы, указанной выше. Ее конкретные примеры включают (1-, 3- или 5-)-1,2,4-триазолильную группу, (1-, 2- или 5-)-1,3,5-триазолильную группу, 1-метил-5-метилтио-1,2,4-триазол-3-ильную группу и 1-метил-5-метилтио-1,2,3-триазол-2-ильную группу.

Примеры имидазолильной группы, которая может содержать карбамоильную группу, включают имидазолильную группу, которая может содержать 1-2
35 (предпочтительно 1) карбамоильных группы. Ее конкретные примеры включают (1-, 2-, 4- или 5-)имидазолильную группу и 4-карбамоил-(1, 2- или 5-)имидазолильную группу.
40

Примеры оксазолильной группы, которая может содержать низшую алкильную группу, включают оксазолильную группу, которая может содержать 1-2
(предпочтительно 1) указанных выше низших алкильных группы. Ее конкретные примеры включают (2-, 3- или 4-)оксазолильную группу и 4-метил-(2- или 3-
45)оксазолильную группу.

Примеры изотиазолильной группы, которая может содержать низшую алкильную группу, включают изотиазолильную группу, которая может содержать 1-2
(предпочтительно 1) указанных выше низших алкильных группы. Ее конкретные
50 примеры включают (3-, 4- или 5-)изотиазолильную группу и (3- или 4-)метил-2-изотиазолильную группу.

Примеры дигидробензотиазолильной группы включают (1-,2-,4-, 5-, 6- или 7-)2,3-дигидробензотиазолильную группу.

Примеры дигидробензотиазолильной группы, которая может содержать оксогруппу, включают дигидробензотиазолильную группу, которая может содержать одну оксогруппу. Ее конкретные примеры включают (1-, 2-, 5-, 6-, 7- или 8-)-2,3-дигидробензотиазолильную группу и 2-оксо-(1-, 5-, 6-, 7- или 8-)-2,3-дигидробензотиазолильную группу.

Примеры тиенильной группы, которая может содержать низшую алкоксикарбонильную группу, включают тиенильную группу, которая может содержать 1-2 (предпочтительно 1) низших алкоксикарбонильных группы, указанных выше. Ее конкретные примеры включают (2- или 3-)-тиенильную группу и 3-метоксикарбонил-2-тиенильную группу.

Примеры оксазолил(низшей)алкильной группы, которая может содержать низшую алкильную группу, включают указанную выше оксазолил(низшую)алкильную группу, причем указанная выше алкильная группа содержит 1-3 (более предпочтительно 1-2) указанных выше низших алкильных группы в оксазольном цикле. Ее конкретные примеры включают (2-, 4- или 5-)-оксазолилметильную группу, 2-(2-, 4- или 5-)-оксазолилметильную группу, [2-метил-(4- или 5-)-оксазолил]метильную группу и (2,5-диметил-4-оксазолил)метильную группу.

Примеры аминок(низшей)алкильной группы, которая может содержать в аминокгруппе группу, которая выбрана из группы, состоящей из низшей алкильной группы, галогензамещенной низшей алкильной группы, низшей алкоксикарбонильной группы, низшей алканоильной группы, арильной группы, арил(низшей)алкильной группы, ароильной группы и аминокзамещенной алкильной группы (в аминокгруппе аминокзамещенной алкильной группы может присутствовать в качестве заместителя низшая алкильная группа), включают указанную выше низшую алкильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов), содержащую 1-5, предпочтительно 1-3, более предпочтительно 1, аминокгрупп. Следует отметить, что в аминокгруппе могут присутствовать 1-2 заместителя, которые выбраны из группы, состоящей из:

указанной выше низшей алкильной группы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкильной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов);

указанной выше галогензамещенной низшей алкильной группы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкильной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов с 1-13, предпочтительно 1-7, более предпочтительно 1-3, атомами галогена);

указанной выше низшей алкоксикарбонильной группы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкоксикарбонильной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов);

указанной выше низшей алканоильной группы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алканоильной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов);

указанной выше арильной группы;

указанной выше арил(низшей)алкильной группы;

указанной выше ароильной группы и

указанной выше низшей алкильной группы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкильной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов), содержащей 1-5, предпочтительно 1-3, более предпочтительно 1, аминокгрупп (в аминокгруппе могут присутствовать в качестве заместителя(ей) 1-2 указанных выше

низших алкильных группы (предпочтительно неразветвленных или разветвленных алкильных группы, содержащих 1-6 углеродных атомов)). Конкретные примеры аминок(низшей)алкильной группы, которая может содержать в аминокгруппе группу, выбранную из группы, состоящей из низшей алкильной группы, галогензамещенной низшей алкильной группы, низшей алкоксикарбонильной группы, низшей алканоильной группы, арильной группы, арил(низшей)алкильной группы, ароильной группы и аминокзамещенной алкильной группы (в аминокгруппе аминокзамещенной алкильной группы может присутствовать в качестве заместителя низшая алкильная группа), включают N-метиламинометильную группу, N-этиламинометильную группу, N-н-пропиламинометильную группу, N,N-диметиламинометильную группу, N,N-диэтиламинометильную группу, N-метил-N-пропиламинометильную группу, N-метил-N-этиламинометильную группу, N-(2,2,2-трифторэтил)аминометильную группу, N-метил-N-бензиламинометильную группу, N-фениламинометильную группу, N-метил-N-фениламинометильную группу, N-формиламинометильную группу, N-метил-N-ацетиламинометильную группу, N-метил-N-пропиониламинометильную группу, N-(2-(N,N-диэтиламино)этил)аминометильную группу, N-метил-N-бензоиламинометильную группу, N-метиламиноэтильную группу, N-этиламиноэтильную группу, N-(2,2,2-трифторэтил)аминоэтильную группу, N,N-диметиламиноэтильную группу, N,N-диэтиламиноэтильную группу, N-метил-N-ацетиламиноэтильную группу, N-метил-N-бензоиламиноэтильную группу, N-метил-N-пропиониламиноэтильную группу, N-метил-N-бензиламиноэтильную группу и N-метил-N-трет-бутоксикарбониламиноэтильную группу.

Примеры низшей алкильной группы, замещенной карбамоильной группой, которая может содержать группу, выбранную из группы, состоящей из низшей алкильной группы и галогензамещенной низшей алкильной группы, включают указанную выше низшую алкильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов), замещенную 1-3 (предпочтительно 1) карбамоильными группами, которые могут содержать 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из

указанной выше низшей алкильной группы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкильной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов) и

указанной выше галогензамещенной низшей алкильной группы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкильной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов и 1-13, предпочтительно 1-7, более предпочтительно 1-3, атомов галогена).

Ее конкретные примеры включают карбамоилметильную группу, 2-карбамоилэтильную группу, 1-карбамоилэтильную группу, 3-карбамоилпропильную группу, 4-карбамоилбутильную группу, 5-карбамоилпентильную группу, 6-карбамоилгексильную группу, 1,1-диметил-2-карбамоилэтильную группу, 2-метил-3-карбамоилпропильную группу, 1,2-дикарбамоилэтильную группу, 2,2-дикарбамоилэтильную группу, 1,2,3-трикарбамоилпропильную группу, N-метилкарбамоилметильную группу, N-этилкарбамоилметильную группу, 2-(N-н-пропилкарбамоил)этильную группу, 3-(N-н-бутилкарбамоил)пропильную группу, 4-(N-изобутилкарбамоил)бутильную группу, 5-(N-трет-бутилкарбамоил)пентильную группу, 6-(N-пентилкарбамоил)гексильную группу, N,N-диметилкарбамоилметильную группу, N,N-диэтилкарбамоилметильную группу, 2-(N-2-фторэтилкарбамоил)этильную группу, 3-(N-2-хлорэтилкарбамоил)пропильную группу, 4-(N-2-бромэтилкарбамоил)бутильную группу, 2-(N-2,2-

дихлорэтилкарбамоил)этильную группу, N-2,2,2-трифторэтилкарбамоилметильную группу и N-гептафторпропилкарбамоилметильную группу.

Примеры тиокарбамоильной группы, которая может содержать низшую алкильную группу, включают тиокарбамоильную группу, которая может
 5 содержать 1-2 указанных выше низших алкильных группы (предпочтительно неразветвленных или разветвленных алкильных группы, содержащих 1-6 углеродных атомов). Ее конкретные примеры включают тиокарбамоильную группу, N-метилтиокарбамоильную группу, N-этилтиокарбамоильную группу, N-н-
 10 пропилтиокарбамоильную группу, N-н-бутилтиокарбамоильную группу, N-н-пентилтиокарбамоильную группу, N-н-гексилтиокарбамоильную группу, N-изобутилтиокарбамоильную группу, N-трет-бутилтиокарбамоильную группу, N,N-диметилтиокарбамоильную группу и N-метил-N-этилтиокарбамоильную группу.

Примеры оксазолидинильной группы, которая может содержать оксогруппу,
 15 включают оксазолидинильную группу, которая может содержать 1-2 (предпочтительно 1) оксогруппы. Ее конкретные примеры включают оксазолидин-3-ильную группу, оксазолидин-4-ильную группу, оксазолидин-5-ильную группу, 2-оксооксазолидин-4-ильную группу, 2-оксооксазолидин-3-ильную группу и 2-
 20 оксооксазолидин-5-ильную группу.

Примеры имидазолидинильной группы, которая может содержать заместитель, выбранный из группы, состоящей из оксогруппы и низшей алкильной группы, включают имидазолидинильную группу, которая может содержать 1-3,
 25 предпочтительно 1-2 заместителя, выбранных из группы, состоящей из оксогруппы и указанной выше низшей алкильной группы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкильной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов). Ее конкретные примеры включают имидазолидин-1-ильную группу, имидазолидин-2-ильную группу, имидазолидин-4-ильную группу, 2-оксоимидазолидин-1-ильную
 30 группу, 4-оксоимидазолидин-1-ильную группу, 5-оксоимидазолидин-1-ильную группу, 4-оксоимидазолидин-2-ильную группу, 2-оксоимидазолидин-4-ильную группу, 2-метилимидазолидин-1-ильную группу, 4-этилимидазолидин-1-ильную группу, 5-н-пропилимидазолидин-1-ильную группу, 4-н-бутилимидазолидин-2-ильную группу, 2-н-пентилимидазолидин-4-ильную группу, 2-н-
 35 гексилимидазолидин-1-ильную группу, 4-изобутилимидазолидин-2-ильную группу, 2-трет-бутилимидазолидин-4-ильную группу, 2-оксо-3-метилимидазолидин-1-ильную группу и 2-оксо-3,4-диметилимидазолидин-1-ильную группу.

Примеры пирролидинильной группы, которая может содержать оксогруппу,
 40 включают пирролидинильную группу, которая может содержать 1-2 (предпочтительно 1) оксогруппы. Ее конкретные примеры включают (1-, 2- или 3-)пирролидинильную группу, (2- или 3-)оксо-1-пирролидинильную группу, (3-, 4- или 5-)оксо-2-пирролидинильную группу и (2-, 4- или 5-)оксо-3-пирролидинильную группу.

Примеры имидазолильной группы включают (1-, 2-, 4- или 5-)имидазолильную группу.

Примеры изоксазолильной группы включают (3-, 4- или 5-)изоксазолильную группу.

Примеры арилсульфонильной группы включают арилсульфонильную группу, арильная часть которой представляет собой фенил, бифенил, замещенный бифенил, замещенный фенил, нафтил и замещенный нафтил и которая может содержать в арильной части 1-7, предпочтительно 1-5, более предпочтительно 1-2,

неразветвленных или разветвленных алкильных групп, содержащих 1-6 углеродных атомов. Примеры заместителя, такого как фенил, бифенил и нафтил, включают неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов, атом галогена, аминогруппу и тому подобное. 1-7,

5 предпочтительно 1-5, более предпочтительно 1-2, заместителей по крайней мере одного из указанных типов могут присутствовать в фенильном, бифенильном, нафтильном цикле и тому подобном. Конкретные примеры арилсульфонильной группы, которая может содержать низшую алкильную группу в арильной группе,

10 включают фенилсульфонильную группу, (2-, 3- или 4-)бифенилсульфонильную группу, (1- или 2-)нафтилсульфонильную группу, (2-, 3- или 4-)метилфенилсульфонильную группу, (2-, 3- или 4-)этилфенилсульфонильную группу, (2-, 3- или 4-)н-пропилфенилсульфонильную группу, (2-, 3- или 4-)н-бутилфенилсульфонильную группу, (2-, 3- или 4-)н-пентилфенилсульфонильную

15 группу, (2-, 3- или 4-)н-гексилфенилсульфонильную группу, (2-, 3- или 4-)изобутилфенилсульфонильную группу, (2-, 3- или 4-)трет-бутилфенилсульфонильную группу, (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)метил-2-бифенилсульфонильную группу, (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)метил-3-

20 бифенилсульфонильную группу, (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)метил-4-бифенилсульфонильную группу, (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)этил-2-бифенилсульфонильную группу, (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)этил-3-

25 бифенилсульфонильную группу, (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)этил-4-бифенилсульфонильную группу, (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)н-пропил-2-бифенилсульфонильную группу, (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)н-пропил-3-

30 бифенилсульфонильную группу, (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)н-пропил-4-бифенилсульфонильную группу, (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)н-бутил-2-бифенилсульфонильную группу, (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)н-бутил-3-

35 бифенилсульфонильную группу, (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)н-бутил-4-бифенилсульфонильную группу, (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)н-пентил-2-бифенилсульфонильную группу, (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)н-пентил-3-

40 бифенилсульфонильную группу, (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)н-пентил-4-бифенилсульфонильную группу, (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)н-гексил-2-бифенилсульфонильную группу, (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)н-гексил-3-

45 бифенилсульфонильную группу, (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)н-гексил-4-бифенилсульфонильную группу, (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)изобутил-2-бифенилсульфонильную группу, (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)изобутил-3-

50 бифенилсульфонильную группу, (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)изобутил-4-бифенилсульфонильную группу, (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)трет-бутил-2-бифенилсульфонильную группу, (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)трет-бутил-3-

55 бифенилсульфонильную группу, (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'- или 6'-)трет-бутил-4-бифенилсульфонильную группу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)метил-1-нафтилсульфонильную группу, (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)метил-2-

60 нафтилсульфонильную группу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)этил-1-нафтилсульфонильную группу, (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)этил-2-

65 нафтилсульфонильную группу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-пропил-1-нафтилсульфонильную группу, (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-пропил-2-

70 нафтилсульфонильную группу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-бутил-1-нафтилсульфонильную группу, (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-бутил-2-

75 нафтилсульфонильную группу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-пентил-1-

нафтилсульфонильную группу, (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-пентил-2-
 нафтилсульфонильную группу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-гексил-1-
 нафтилсульфонильную группу, (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)н-гексил-2-
 нафтилсульфонильную группу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)изобутил-1-
 нафтилсульфонильную группу, (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)изобутил-2-
 нафтилсульфонильную группу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)трет-бутил-1-
 нафтилсульфонильную группу, (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)трет-бутил-2-
 нафтилсульфонильную группу, (2-, 3- или 4-)хлорфенилсульфонильную группу, (2-,
 3- или 4-)фторфенилсульфонильную группу, (2-, 3- или 4-)бромфенилсульфонильную
 группу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)хлор-1-нафтилсульфонильную группу, (1-, 3-, 4-, 5-
 , 6-, 7- или 8-)хлор-2-нафтилсульфонильную группу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)фтор-1-
 нафтилсульфонильную группу, (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)фтор-2-
 нафтилсульфонильную группу, (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)бром-1-
 нафтилсульфонильную группу, (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)бром-2-
 нафтилсульфонильную группу, (2-, 3- или 4-)аминофенилсульфонильную группу, (2-
 , 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)амино-1-нафтилсульфонильную группу, (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-
 или 8-)амино-2-нафтилсульфонильную группу, 2,3-диметилфенилсульфонильную
 группу, 3,4-диметилфенилсульфонильную группу, 2,4-диметилфенилсульфонильную
 группу, 2,5-диметилфенилсульфонильную группу, 2,6-диметилфенилсульфонильную
 группу, 2,4,6-триметилфенилсульфонильную группу, 3,4,5-
 триметилфенилсульфонильную группу, 2,3,4,5-тетраэтилфенилсульфонильную
 группу, пентаметилфенилсульфонильную группу, 2-метилнафтилсульфонильную
 группу, 2,3-диметилнафтилсульфонильную группу, 3,4-диметилфенилсульфонильную
 группу, 3,5,7-триэтилнафтилсульфонильную группу, 3,4,5,7-
 тетраметилнафтилсульфонильную группу, 2,3,4,5,7-
 пентаметилнафтилсульфонильную группу, 2,3,4,5,6,7-
 гексаэтилнафтилсульфонильную группу, гептаметилнафтилсульфонильную группу,
 2,3-диаминофенилсульфонильную группу, 2,4,6-триаминофенилсульфонильную
 группу и 2-метил-5-хлорнафтилсульфонильную группу.

Примеры пиперидильной группы, которая может содержать заместитель,
 выбранный из группы, состоящей из низшей алкильной группы; низшая
 алканоильной группы; арилсульфонильной группы; оксогруппы; гидроксигруппы и
 аминогруппы, которая может содержать группу, выбранную из группы, состоящей
 из низшей алкильной группы, низшей алканоильной группы, низшей
 алкоксикарбонильной группы и низшей алканоиламино(низшей)алканоильной
 группы, включают пиперидильную группу, которая может содержать 1-5,
 предпочтительно 1-3, более предпочтительно 1, заместителей, выбранных из группы,
 состоящей из:

указанной выше низшей алкильной группы (предпочтительно неразветвленной
 или разветвленной алкильной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов);

указанной выше низшей алканоильной группы (предпочтительно
 неразветвленной или разветвленной алканоильной группы, содержащей 1-6
 углеродных атомов); и

указанной выше арилсульфонильной группы; оксогруппы; гидроксигруппы и
 аминогруппы, которая может содержать 1-2 группы, выбранных из группы,
 состоящей из низшей алкильной группы, указанную выше, низшей алканоильной
 группы, указанную выше, низшей алкоксикарбонильной группы, указанной выше и
 низшей алканоиламино(низшей)алканоильной группы, указанной выше. Ее

конкретные примеры включают (1-, 2-, 3- или 4-)пиперидильную группу, 1-метил-4-
 пиперидильную группу, 2-этил-4-пиперидильную группу, 3-н-пропил-4-
 пиперидильную группу, 4-изопропил-4-пиперидильную группу, 2-н-бутил-1-
 пиперидильную группу, 3-изобутил-1-пиперидильную группу, 4-трет-бутил-1-
 5 пиперидильную группу, 1-втор-бутил-2-пиперидильную группу, 2-н-пентил-2-
 пиперидильную группу, 3-(1-этилпропил)-2-пиперидильную группу, 4-изопентил-2-
 пиперидильную группу, 5-неопентил-2-пиперидильную группу, 6-н-гексил-2-
 пиперидильную группу, 1-(1,2,2-триметилпропил)-3-пиперидильную группу, 2-(3,3-
 10 диметилбутил)-3-пиперидильную группу, 3-(2-этилбутил)-3-пиперидильную группу, 4-
 изогексил-3-пиперидильную группу, 5-(3-метилпентильную группу)-3-
 пиперидильную группу, 6-формил-3-пиперидильную группу, 1-ацетил-4-
 пиперидильную группу, 2-пропионил-4-пиперидильную группу, 3-бутирил-4-
 пиперидильную группу, 4-изобутирил-4-пиперидильную группу, 2-пентаноил-1-
 15 пиперидильную группу, 3-трет-бутилкарбонил-1-пиперидильную группу, 4-
 гексаноил-1-пиперидильную группу, 1-фенилсульфонил-2-пиперидильную группу, 2-
 (2-бифенилсульфонил)-2-пиперидильную группу, 3-(1-нафтилсульфонил)-2-
 пиперидильную группу, 1-тозил-4-пиперидильную группу, 4-(4-
 20 этилфенилсульфонил)-2-пиперидильную группу, 5-(2-н-пропилфенилсульфонил)-2-
 пиперидильную группу, 6-(3-н-бутилфенилсульфонил)-2-пиперидильную группу, 1-(4-
 н-пентилфенилсульфонил)-3-пиперидильную группу, 2-(2-н-гексилфенилсульфонил)-
 3-пиперидильную группу, 3-(3-изобутилфенилсульфонил)-3-пиперидильную группу,
 4-(4-трет-бутилфенилсульфонил)-3-пиперидильную группу, 5-(2-
 25 хлорфенилсульфонил)-3-пиперидильную группу, 6-(4-фторфенилсульфонил)-3-
 пиперидильную группу, 1-(3-бромфенилсульфонил)-4-пиперидильную группу, 2-(2-
 аминофенилсульфонил)-4-пиперидильную группу, 3-(2,3-диметилфенилсульфонил)-4-
 пиперидильную группу, 4-(3,4,5-триметилфенилсульфонил)-4-пиперидильную
 30 группу, 2-(2,3-диаминофенилсульфонил)-1-пиперидильную группу, 4-оксо-1-
 пиперидильную группу, 2-оксо-3-пиперидильную группу, 4-гидрокси-1-
 пиперидильную группу, 2-гидрокси-3-пиперидильную группу, 4-амино-1-
 пиперидильную группу, 2-амино-4-пиперидильную группу, 4-метиламино-1-
 пиперидильную группу, 2-метиламино-4-пиперидильную группу, 4-этиламино-1-
 35 пиперидильную группу, 2-этиламино-4-пиперидильную группу, 2-диметиламино-4-
 пиперидильную группу, 4-диэтиламино-1-пиперидильную группу, 4-формиламино-1-
 пиперидильную группу, 4-ацетиламино-1-пиперидильную группу, 4-(N-метил-N-
 ацетиламино)-1-пиперидильную группу, 4-(N-метил-N-метоксикарбониламино)-1-
 40 пиперидильную группу, 4-(N-метил-N-трет-бутоксикарбониламино)-1-
 пиперидильную группу, 4-[N-метил-N-(N-ацетиламино)ацетиламино]-1-
 пиперидильную группу.

Примеры пиперидилкарбонильной группы, которая может содержать
 заместитель, выбранный из группы, состоящей из низшей алкильной группы,
 45 гидроксигруппы, гидроксизаместителя, низшей алкильной группы, низшей алканоильной
 группы, карбокси(низшей)алкильной группы, низшей
 алкилкарбамоил(низшей)алкильной группы, карбамоильной группы, низшей
 алкоксигруппы, карбоксигруппы, низшей алкоксикарбонильной группы,
 50 аминогруппы (в которой могут присутствовать 1-2 группы, выбранных из группы,
 состоящей из низшей алкильной группы, низшей алканоильной группы, низшей
 алкоксикарбонильной группы и ароильной группы), пиперидильной группы (в
 которой может присутствовать группа, выбранная из группы, состоящей из низшей

алканоильной группы, низшей алкоксикарбонильной группы и ароильной группы),
 пиперазинильной группы (в которой может присутствовать в качестве заместителя
 низшая алкильная группа), 1,4-диокса-8-азаспиро[4.5]децильной группы,
 морфолинильной группы, гексагидро-1,4-дiazепинильной группы (в которой может
 присутствовать в качестве заместителя низшая алкильная группа), пиридилной
 группы, пиридилоксигруппы, пиридил(низшей)алкоксигруппы,
 тетрагидрохинолильной группы (в которой может присутствовать оксогруппа),
 бензодиоксолильной группы, арил(низшей)алкоксигруппы (которая может
 содержать в арильной группе группу, выбранную из группы, состоящей из атома
 галогена, низшей алкильной группы, низшей алкоксигруппы и галогензамещенной
 низшей алкоксигруппы), арильной группы (в которой может присутствовать группа,
 выбранная из группы, состоящей из атома галогена, низшей алкоксигруппы и
 гидроксигруппы), арилоксигруппы (которая может содержать в арильной группе
 группу, выбранную из группы, состоящей из цианогруппы, атома галогена, низшей
 алкильной группы, низшей алкоксигруппы и галогензамещенной низшей алкильной
 группы), арил(низшей)алкильной группы (которая может содержать в арильной
 группе группу, выбранную из группы, состоящей из атома галогена, низшей
 алкильной группы, низшей алкоксигруппы и галогензамещенной низшей алкильной
 группы) и ароильной группы (которая может содержать в арильной группе группу,
 выбранную из группы, состоящей из атома галогена и низшей алкоксигруппы),
 включают пиперидилкарбонильную группу, которая может содержать в
 пиперидильной группе 1-3 (предпочтительно 1) заместителя, выбранных из группы,
 состоящей из

указанной выше низшей алкильной группы (предпочтительно неразветвленной
 или разветвленной алкильной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов);

гидроксигруппы;

указанной выше гидрокси(низшей)алкильной группы (предпочтительно
 неразветвленной или разветвленной алкильной группы, содержащей 1-6 углеродных
 атомов и содержащей 1-3 гидроксигруппы);

низшей алканоильной группы, указанной выше;

указанной выше карбокси(низшей)алкильной группы, содержащей низшую
 алкильную часть, указанную выше;

неразветвленной или разветвленной алкильной группы, содержащей 1-6
 углеродных атомов и замещенной карбамоильной группой, содержащей 1-2
 указанных выше низших алкильных группы (предпочтительно неразветвленных или
 разветвленных алкильных группы, содержащих 1-6 углеродных атомов);

карбамоильной группы;

указанной выше низшей алкоксигруппы (предпочтительно неразветвленной или
 разветвленной алкоксигруппы, содержащей 1-6 углеродных атомов);

карбоксигруппы;

указанной выше низшей алкоксикарбонильной группы (предпочтительно
 неразветвленной или разветвленной алкоксикарбонильной группы, содержащей 1-6
 углеродных атомов),

аминогруппы (в которой могут присутствовать 1-2 группы, выбранных из группы,
 состоящей из низшей алкильной группы, указанной выше, низшей алканоильной
 группы, указанной выше, низшей алкоксикарбонильной группы, указанной выше и
 ароильной группы, указанной выше);

пиперидильной группы (в которой могут присутствовать 1-3 (предпочтительно 1),

группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алканоильной группы, указанной выше, низшей алкоксикарбонильной группы, указанной выше, и ароильной группы, указанной выше);

5 пиперазинильной группы (в которой могут присутствовать в качестве заместителя(ей) 1-3 указанных выше низших алкильных группы (предпочтительно неразветвленных или разветвленных алкильных группы, содержащих 1-6

углеродных атомов));

10 1,4-диокса-8-азаспиро[4.5]децильной группы;

морфолинийной группы;

гексагидро-1,4-дiazепинильной группы (в которой могут присутствовать в качестве заместителя(ей) 1-3 указанных выше низших алкильных группы (предпочтительно неразветвленных или разветвленных алкильных группы, содержащих 1-6 углеродных атомов));

15 пиридийной группы;

пиридилоксигруппы;

пиридил(низшей)алкоксигруппы, содержащей низшую алкоксильную часть, указанную выше;

20 тетрагидрохинолильной группы (в которой могут присутствовать 1-2 (предпочтительно 1) оксогруппы);

бензодиоксилильной группы (предпочтительно бензо[1.3]диоксилильной группы);

арил(низшей)алкоксигруппы, содержащей указанные выше арильную часть и низшую алкоксильную часть (которая может содержать в арильной группе 1-3 (предпочтительно 1-2) группы, выбранных из группы, состоящей из атома галогена, указанного выше, низшей алкильной группы, указанной выше, низшей алкоксигруппы, указанной выше, и галогензамещенной низшей алкоксигруппы, указанной выше);

30 указанной выше арильной группы (которая может содержать в арильной группе 1-3 (предпочтительно 1-2) группы, выбранных из группы, состоящей из атома галогена, указанного выше, низшей алкоксигруппы, указанной выше, и гидроксигруппы);

35 арилоксигруппы, содержащей указанную выше арильную часть (которая может содержать в арильной группе 1-3 (предпочтительно 1-2) группы, выбранных из группы, состоящей из цианогруппы, атома галогена, низшей алкильной группы, указанной выше, низшей алкоксигруппы, указанной выше, и галогензамещенной низшей алкильной группы, указанной выше);

40 арил(низшей)алкильной группы, содержащей указанные выше арильную часть и низшую алкильную часть (которая может содержать в арильной группе 1-3 (предпочтительно 1-2) группы, выбранных из группы, состоящей из атома галогена, низшей алкильной группы, низшей алкоксигруппы и галогензамещенной низшей алкильной группы); и

45 указанной выше ароильной группы (которая может содержать в арильной группе 1-3 (предпочтительно 1-2) группы, выбранных из группы, состоящей из атома галогена, указанного выше, и низшей алкоксигруппы, указанной выше). Ее конкретные примеры включают (1-, 2-, 3- или 4-)пиперидилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3- или 4-)этил-4-пиперидилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)метил-1-пиперидилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-)метил-2-пиперидилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-)метил-3-пиперидилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3- или 4-)метил-4-пиперидилкарбонильную

[illegible]

или 4-)пиперидил]-4-пиперидилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)[1-ацетил-(2-, 3- или 4-)пиперидил]-1-пиперидилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)[1-бутирил-(2-, 3- или 4-)пиперидил]-1-пиперидилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)[1-трет-
 5 бутоксикарбонил-(2-, 3- или 4-)пиперидил]-1-пиперидилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)[1-бензоил-(2-, 3- или 4-)пиперидил]-1-пиперидилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)(1-пиперазинил)-1-пиперидилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)[1-(3,4-
 10 диметилпиперазинил)]-1-пиперидилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-)[1-(3,4-диметилпиперазинил)]-2-пиперидилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-)[1-(3,4-диметилпиперазинил)]-3-пиперидилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3- или 4-)[1-(3,4-диметилпиперазинил)]-4-пиперидилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)[1-(4-метилпиперазинил)]-1-пиперидилкарбонильную группу, (1-, 3- или 4-)[1-(4-метилпиперазинил)]-2-пиперидилкарбонильную группу, (1-, 2-, или 4-)[1-(4-метилпиперазинил)]-3-пиперидилкарбонильную группу, (1-, 2- или 3-)[1-(4-метилпиперазинил)]-4-пиперидилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)[(2-, 3- или 4-)
 15 морфолинил]-1-пиперидилкарбонильную группу, (1-, 3- или 4-)[(2-, 3- или 4-)морфолинил]-2-пиперидилкарбонильную группу, (1-, 2-, 4-, 5- или 6-)[(2-, 3- или 4-)морфолинил]-3-пиперидилкарбонильную группу, (1-, 2- или 3-)[(2-, 3- или 4-)морфолинил]-4-пиперидилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6- или 7-)(4-метилгексагидро-1,4-дiazепинил)-1-пиперидилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-)(4-метилгексагидро-1,4-дiazепинил)-2-пиперидилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-)(4-метилгексагидро-1,4-дiazепинил)-3-пиперидилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3- или 4-)(4-метилгексагидро-1,4-дiazепинил)-4-
 25 пиперидилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)(1,4-диокса-8-азаспиро[4.5]дец-8-ил)-1-пиперидилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-)(1,4-диокса-8-азаспиро[4.5]дец-8-ил)-2-пиперидилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-)(1,4-диокса-8-азаспиро[4.5]дец-8-ил)-3-пиперидилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3- или 4-)(1,4-диокса-8-азаспиро[4.5]дец-8-ил)-4-пиперидилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)[(2-, 3- или 4-)
 30 , 4- или 5-)бензо[1.3]диоксолил]-1-пиперидилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)[2-оксо-(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)-1,2,3,4-тетрагидрохинолил]-1-пиперидилкарбонильную группу, 4-[2-оксо-(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)-1,2,3,4-тетрагидрохинолил]-(2- или 3-метил)-1-пиперидилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)[(2-, 3- или 4-)пиридил]-1-пиперидилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)[(2-, 3- или 4-)пиридилокси]-1-пиперидилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)[(2-, 3- или 4-)пиридилметокси]-1-пиперидилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)[(2-, 3- или 4-)фторбензилокси]-1-пиперидилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)[(2-, 3- или 4-)хлорбензилокси]-1-пиперидилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)[(2-, 3- или 4-)бромбензилокси]-1-пиперидилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)[(2-, 3- или 4-)метилбензилокси]-1-пиперидилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)[(2-, 3- или 4-)трифторметоксибензилокси]-1-пиперидилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)(3,4-дихлорбензилокси)-1-пиперидилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)(3,4-
 45 диметоксибензилокси)-1-пиперидилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)(3-хлор-4-метоксибензилокси)-1-пиперидилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)[(2-, 3- или 4-)фторфенокси]-1-пиперидилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)[(2-, 3- или 4-)хлорфенокси]-1-пиперидилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)[(2-, 3- или 4-)цианофенокси]-1-пиперидилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)[(2-, 3- или 4-)метоксифенокси]-1-пиперидилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)[(2-, 3- или 4-)метилфенокси]-1-пиперидилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)[(2-, 3- или 4-)трифторметоксифенокси]-1-пиперидилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)фенил-1-

пиперидилкарбонильную группу, 4-гидрокси-(2-, 3- или 4-)фенил-1-
 пиперидилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)[(2-, 3- или 4-)хлорфенил]-1-
 пиперидилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)[(2-, 3- или 4-)метоксифенил]-1-
 пиперидилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)[(2-, 3- или 4-)гидроксифенокси]-1-
 пиперидилкарбонильную группу, 4-гидрокси-(2-, 3- или 4-)фенил-1-
 пиперидилкарбонильную группу, 4-этоксикарбонил-(2-, 3- или 4-)фенил-1-
 пиперидилкарбонильную группу, 4-гидрокси-(2-, 3- или 4-)[(2-, 3- или 4-)хлорфенил]-
 1-пиперидилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)бензил-1-пиперидилкарбонильную
 группу, (2-, 3- или 4-)[(2-, 3- или 4-)хлорбензил]-1-пиперидилкарбонильную группу,
 (2-, 3- или 4-)[(2-, 3- или 4-)метилбензил]-1-пиперидилкарбонильную группу, (2-, 3-
 или 4-)[(2-, 3- или 4-)метоксибензил]-1-пиперидилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-
)[(2-, 3- или 4-)трифторметоксибензил]-1-пиперидилкарбонильную группу, 4-
 гидрокси-(2-, 3- или 4-)бензил-1-пиперидилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)[(2-, 3-
 или 4-)хлорбензоил]-1-пиперидилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)[(2-, 3- или 4-
)метоксибензоил]-1-пиперидилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)[(2-, 3- или 4-
)фторбензоил]-1-пиперидилкарбонильную группу и (2-, 3- или 4-)[(2-, 3- или 4-
)трифторметоксибензил]-1-пиперидилкарбонильную группу.

Примеры пирролидинилкарбонильной группы, которая может содержать
 заместитель, выбранный из группы, состоящей из гидроксизаместителя, карбамоильной группы,
 гидроксигруппы, аминогруппы (которая может содержать группу, выбранную из группы,
 состоящей из низшей алкильной группы, низшей алканойльной группы и ароматической группы)
 морфолинил(низшей)алкильной группы, пиперидил(низшей)алкильной группы,
 пиперазинил(низшей)алкильной группы (которая может содержать низшую алкильную группу
 в качестве заместителя), аминозаместителя, аминозаместителя (которая может содержать низшую
 алкильную группу в качестве заместителя) и арилалкоксигруппы (которая может содержать в арильной
 группе галогензамещенную низшую алкоксигруппу), арилалокси(низшей)алкильной группы (в арильной
 группе может присутствовать галогензамещенная низшая алкоксигруппа) и тетрагидрохинолильной
 группы (в которой может присутствовать оксогруппа), включают пирролидинилкарбонильную группу,
 которая может содержать в пирролидинильной группе 1-3 (предпочтительно 1) заместителя, выбранных из

указанной выше низшей алкильной группы, содержащей 1-3 гидроксигруппы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкильной группы,
 содержащей 1-6 углеродных атомов);

карбамоильной группы;

гидроксигруппы;

аминогруппы (которая может содержать 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из указанной выше низшей алкильной группы, указанной выше низшей
 алканойльной группы и указанной выше ароматической группы);

морфолинил(низшей)алкильной группы, низшая алкильная часть которой представляет собой одну из указанных выше, предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов;

пирролидинил(низшей)алкильной группы, низшая алкильная часть которой представляет собой одну из указанных выше, предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов;

пиперидил(низшей)алкильной группы, низшая алкильная часть которой

представляет собой одну из указанных выше, предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов;

пиперазинил(нижней)алкильной группы, низшая алкильная часть которой представляет собой одну из указанных выше, предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов (в пиперазинильной группе могут присутствовать в качестве заместителя(ей) 1-3 (предпочтительно 1) указанных выше низших алкильных группы (предпочтительно неразветвленных или разветвленных алкильных группы, содержащих 1-6 углеродных атомов));

амино(нижней)алкильной группы, низшая алкильная часть которой представляет собой одну из указанных выше, предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов (в аминогруппе могут присутствовать в качестве заместителя(ей) 1-2 низших алкильных группы, указанных выше (предпочтительно неразветвленных или разветвленных алкильных группы, содержащих 1-6 углеродных атомов)), арилоксигруппы, содержащей указанную выше арильную часть (которая может содержать в арильной группе 1-3 (предпочтительно 1) галогензамещенных низших алкоксигруппы), арилокси(нижней)алкильной группы, содержащей арильную часть и низшую алкильную часть, указанные выше (которая может содержать в арильной группе 1-3 (предпочтительно 1) галогензамещенных низших алкоксигруппы), и тетрагидрохинолильной группы (в которой может присутствовать одна оксогруппа). Ее конкретные примеры включают (1-, 2- или 3-)пирролидинилкарбонильную группу, (2- или 3-)гидроксиметил-1-пирролидинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4- или 5-)гидроксиметил-2-пирролидинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4- или 5-)гидроксиметил-3-пирролидинилкарбонильную группу, (2- или 3-)карбамоил-1-пирролидинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4- или 5-)карбамоил-2-пирролидинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4- или 5-)карбамоил-3-пирролидинилкарбонильную группу, (2- или 3-)гидрокси-1-пирролидинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4- или 5-)гидрокси-2-пирролидинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4- или 5-)гидрокси-3-пирролидинилкарбонильную группу, (2- или 3-)амино-1-пирролидинилкарбонильную группу, (2- или 3-)ацетиамидо-1-пирролидинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4- или 5-)ацетиамидо-2-пирролидинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4- или 5-)ацетиамидо-3-пирролидинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4- или 5-)бутириламино-3-пирролидинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4- или 5-) (N-метил-N-ацетиламино)-3-пирролидинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4- или 5-) (N-метил-N-бутириламино)-3-пирролидинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4- или 5-)бензоиламино-3-пирролидинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4- или 5-) (N-метил-N-бензоиламино)-3-пирролидинилкарбонильную группу, (2- или 3-)[(2-, 3- или 4-)морфолинилметил]-1-пирролидинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4- или 5-)[(2-, 3- или 4-)морфолинилметил]-2-пирролидинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4- или 5-)[(2-, 3- или 4-)морфолинилметил]-3-пирролидинилкарбонильную группу, (2- или 3-)[(1-, 2- или 3-)пирролидинилметил]-1-пирролидинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4- или 5-)[(1-, 2- или 3-)пирролидинилметил]-2-пирролидинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4- или 5-)[(1-, 2- или 3-)пирролидинилметил]-3-пирролидинилкарбонильную группу, (2- или 3-)[(1-, 2-, 3- или 4-)пиперидилметил]-1-пирролидинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4- или 5-)[(1-, 2-, 3- или 4-)пиперидилметил]-2-

пирролидинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4- или 5-)[(1-, 2-, 3- или 4-)
)пиперидилметил]-3-пирролидинилкарбонильную группу, (2- или 3-) (4-метил-1-
 пиперазинилметил)-1-пирролидинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4- или 5-) (4-
 метил-1-пиперазинилметил)-2-пирролидинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-
 5 или 5-) (4-метил-1-пиперазинилметил)-3-пирролидинилкарбонильную группу, (2-
 или 3-)N,N-диметиламинометил-1-пирролидинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-
 или 5-)N,N-диметиламинометил-2-пирролидинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-
 или 5-)N,N-диметиламинометил-3-пирролидинилкарбонильную группу, (2- или 3-
 10)N,N-диэтиламинометил-1-пирролидинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4- или 5-
)N,N-диэтиламинометил-2-пирролидинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4- или 5-
)N,N-диэтиламинометил-3-пирролидинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4- или 5-)
 (4-трифторметоксифеноксиметил)-3-пирролидинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-
 , 4- или 5-) (4-трифторметоксифенокси)-3-пирролидинилкарбонильную группу и (1-,
 15 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-) (2-окси-1,2,3,4-тетрагидрохинолил)-3-
 пирролидинилкарбонильную группу.

Примеры пиперазинилкарбонильной группы, которая может содержать
 заместитель, выбранный из группы, состоящей из низшей алкильной группы,
 20 цикло(C₃-C₈)алкильной группы, низшей алканоильной группы,
 гидрокси(низшей)алкильной группы, низшей алкокси(низшей)алкильной группы,
 низшей алкоксикарбонильной группы, amino(низшей)алкильной группы (в
 аминогруппе может присутствовать в качестве заместителя низшая алкильная
 группа), пиперидил(низшей)алкильной группы (в пиперидильной группе может
 25 присутствовать в качестве заместителя низшая алкильная группа),
 морфолинил(низшей)алкильной группы, пирролидинил(низшей)алкильной группы,
 1,3-диоксоланил(низшей)алкильной группы, тетрагидрофурил(низшей)алкильной
 группы, пиридил(низшей)алкильной группы (в низшей алкильной группе может
 30 присутствовать в качестве заместителя фенильная группа),
 имидазолил(низшей)алкильной группы, фурил(низшей)алкильной группы,
 пирролидинилкарбонил(низшей)алкильной группы, пиперидильной группы, которая
 может содержать низшую алкильную группу в качестве заместителя, пиридилной
 группы (в пиридилной группе может присутствовать в качестве заместителя
 35 заместитель, выбранный из группы, состоящей из низшей алкильной группы,
 цианогруппы и галогензамещенной низшей алкильной группы), тиено[2,3-с]
 пиридилной группы, арильной группы (в которой может присутствовать группа,
 выбранная из группы, состоящей из атома галогена и низшей алкильной группы),
 40 ароильной группы, фурил(низшей)алкильной группы,
 арил(низшей)алкоксикарбонильной группы и оксогруппы, включают
 пиперазинилкарбонильную группу, которая может содержать в пиперазинильной
 группе 1-3 (предпочтительно 1) заместителя, выбранных из группы, состоящей из
 указанной выше низшей алкильной группы (предпочтительно неразветвленной
 45 или разветвленной алкильной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов);
 цикло(C₃-C₈)алкильной группы, указанной выше;
 указанной выше низшей алканоильной группы (предпочтительно
 неразветвленной или разветвленной алканоильной группы, содержащей 1-6
 50 углеродных атомов);
 указанной выше гидрокси(низшей)алкильной группы (предпочтительно
 неразветвленной или разветвленной алкильной группы, содержащей 1-6 углеродных
 атомов с 1-3 гидроксигруппами);

указанной выше низшей алкокси(низшей)алкильной группы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкильной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов и 1-3 указанных выше низших алкоксигруппы (предпочтительно неразветвленных или разветвленных алкоксигруппы, содержащих 1-6 углеродных атомов));

указанной выше низшей алкоксикарбонильной группы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкоксикарбонильной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов);

амино(низшей)алкильной группы, низшая алкильная часть которой представляет собой одну из указанных выше, предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов (в аминогруппе могут присутствовать в качестве заместителя(ей) 1-2 указанных выше низших алкильных группы (предпочтительно неразветвленных или разветвленных алкильных группы, содержащих 1-6 углеродных атомов));

пиперидил(низшей)алкильной группы, низшая алкильная часть которой представляет собой одну из указанных выше, предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов (в пиперидильной группе могут присутствовать в качестве заместителя(ей) 1-3 указанных выше низших алкильных группы (предпочтительно неразветвленных или разветвленных алкильных группы, содержащих 1-6 углеродных атомов));

морфолинил(низшей)алкильной группы, алкильная часть которой представляет собой одну из указанных выше, предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов;

пирролидинил(низшей)алкильной группы, алкильная часть которой представляет собой одну из указанных выше, предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов;

1,3-диоксоланил(низшей)алкильной группы, низшая алкильная часть которой представляет собой одну из указанных выше, предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов;

тетрагидрофурил(низшей)алкильной группы, низшая алкильная часть которой представляет собой одну из указанных выше, предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов;

пиридил(низшей)алкильной группы, низшая алкильная часть которой представляет собой одну из указанных выше, предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов (1-3 фенильных группы могут присутствовать в алкильной группе, в качестве заместителя(ей));

имидазолил(низшей)алкильной группы, низшая алкильная часть которой представляет собой одну из указанных выше, предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов;

фурил(низшей)алкильной группы, низшая алкильная часть которой представляет собой одну из указанных выше, предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов;

пирролидинилкарбонил(низшей)алкильной группы, низшая алкильная часть которой представляет собой одну из указанных выше, предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов;

пиперидильной группы, которая может содержать 1-3 указанных выше низших

алкильных группы (предпочтительно неразветвленных или разветвленных алкильных группы, содержащих 1-6 углеродных атомов);

5 пиридинильной группы (в пиридинильной группе могут присутствовать 1-3 (предпочтительно 1) группы, выбранных из группы, состоящей из указанной выше
 10 низшей алкильной группы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкильной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов), цианогруппы и указанной выше галогензамещенной низшей алкильной группы (предпочтительно
 15 неразветвленной или разветвленной алкильной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов, замещенной 1-7 атомами галогена)); тиено[2,3-с]пиридинильной группы; арильной группы, указанной выше (которая может содержать в арильной группе 1-3
 20 (предпочтительно 1) группы, выбранных из группы, состоящей из атома галогена и низшей алкильной группы), ароильной группы, указанной выше, фурил(низшей)алкильной группы, содержащей низшую алкильную часть, указанную
 25 выше, арил(низшей)алкоксикарбонильной группы, содержащей арильную часть и низшую алкоксикарбонильную часть, указанные выше, и оксогруппы. Ее конкретные примеры включают (1- или 2-)пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)метил-1-пиперазинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-)метил-2-
 30 пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)этил-1-пиперазинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-)этил-2-пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)н-пропил-1-пиперазинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-)н-пропил-2-пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)н-бутил-1-
 35 пиперазинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-)н-бутил-2-пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)[(1-этил-н-пропил)]-1-пиперазинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-)[(1-этил-н-пропил)]-2-пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)изопропил-1-
 40 пиперазинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-)изопропил-2-пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)трет-бутил-1-пиперазинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-)трет-бутил-2-пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)н-гексил-1-
 45 пиперазинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-)н-гексил-2-пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)циклопентил-1-пиперазинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-)циклопентил-2-пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)циклогептил-1-
 50 пиперазинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-)циклогептил-2-пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)ацетил-1-пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)бутирил-1-пиперазинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-)ацетил-2-
 пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-) (2-гидроксиэтил)-1-пиперазинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-) (2-гидроксиэтил)-2-пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-) (2-метоксиэтил)-1-
 пиперазинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-) (2-метоксиэтил)-2-пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-) (3-метоксипропил)-1-пиперазинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-) (3-метоксипропил)-2-пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-) (4-метоксибутил)-1-
 пиперазинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-) (4-метоксибутил)-2-пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)этоксикарбонил-1-пиперазинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-)этоксикарбонил-2-пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)трет-бутоксикарбонил-1-

пиперазинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-)трет-бутоксикарбонил-2-
 пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)метоксикарбонил-1-
 пиперазинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-)метоксикарбонил-2-
 пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)[3-(N,N-диметиламино)пропил]-1-
 пиперазинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-)[3-(N,N-
 диметиламино)пропил]-2-пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)[2-(N,N-
 диметиламино)этил]-1-пиперазинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-) (2-
 (N,N-диметиламино)этил)-2-пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-) (2-(1-
 пиперидил)этил)-1-пиперазинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-) (2-(1-
 пиперидил)этил)-2-пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)[(1-метил-3-
 пиперидил)метил]-1-пиперазинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-)[(1-
 метил-3-пиперидил)метил]-2-пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)[(1-
 метил-4-пиперидил)метил]-1-пиперазинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5-
 или 6-)[(1-метил-4-пиперидил)метил]-2-пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3-
 или 4-)[2-(4-морфолинил)этил]-1-пиперазинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5-
 или 6-)[2-(4-морфолинил)этил]-2-пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)[2-
 (1-пирролидинил)этил]-1-пиперазинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-)
 [2-(1-пирролидинил)этил]-2-пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)[2-(1,3-
 диоксоланил)метил]-1-пиперазинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-)[2-
 (1,3-диоксоланил)метил]-2-пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-){2-[2-(1,3-
 диоксоланил)]этил}-1-пиперазинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-){2-[2-
 (1,3-диоксоланил)]этил}-2-пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-) (2-
 тетрагидрофурилметил)-1-пиперазинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-)
 (2-тетрагидрофурилметил)-2-пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-) (2-
 пиридилметил)-1-пиперазинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-) (2-
 пиридилметил)-2-пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-) (3-пиридилметил)-
 1-пиперазинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-) (3-пиридилметил)-2-
 пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-) (4-пиридилметил)-1-
 пиперазинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-) (4-пиридилметил)-2-
 пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)[2-(4-пиридил)этил]-1-
 пиперазинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-)[2-(4-пиридил)этил]-2-
 пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)[2-(2-пиридил)этил]-1-
 пиперазинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-)[2-(2-пиридил)этил]-2-
 пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)[2-фенил-2-(4-пиридил)этил]-1-
 пиперазинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-)[2-фенил-2-(4-
 пиридил)этил]-2-пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)[2-(1-
 имидазолил)этил]-1-пиперазинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-)[2-(1-
 имидазолил)этил]-2-пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-) (3-
 фурилметил)-1-пиперазинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-) (3-
 фурилметил)-2-пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-) (1-
 пирролидинилкарбонилметил)-1-пиперазинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5-
 или 6-) (1-пирролидинилкарбонилметил)-2-пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3-
 или 4-) (1-метил-4-пиперидил)-1-пиперазинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5-
 или 6-) (1-метил-4-пиперидил)-2-пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)[(2-
 , 3- или 4-пиридил)-1-пиперазинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-) (2-,
 3- или 4-пиридил)-2-пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-) (3-циано-2-
 пиридил)-1-пиперазинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-) (3-циано-2-
 пиридил)-2-пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-){4-метил-2-пиридил}-1-

пиперазинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-) (4-метил-2-пиридил)-2-
 пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-) (3-метил-2-пиридил)-1-
 пиперазинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-) (3-метил-2-пиридил)-2-
 пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-) (3-трифторметил-2-пиридил)-1-
 пиперазинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-) (3-трифторметил-2-
 пиридил)-2-пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)[(2-, 3-, 4-, 5- или 6-)
)тиено[2,3-с]пиридил]-1-пиперазинилкарбонильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-)[(2-
 , 3-, 4-, 5- или 6-)тиено[2,3-с]пиридил]-2-пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3-
 или 4-)фенил-1-пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)[(2-, 3- или 4-
)хлорфенил]-1-пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)[(2-, 3- или 4-
)метилфенил]-1-пиперазинилкарбонильную группу, 3-оксо-(2- или 4-)фенил-1-
 пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)бензолил-1-
 пиперазинилкарбонильную группу, (2-, 3- или 4-)[(2- или 3-)фурилкарбонил]-1-
 пиперазинилкарбонильную группу и (2-, 3- или 4-)бензилоксикарбонил-1-
 пиперазинилкарбонильную группу.

Примеры гексагидроазепинилкарбонильной группы включают (1-, 2-, 3- или 4-)
 гексагидроазепинилкарбонильную группу.

Примеры гексагидро-1,4-дiazепинилкарбонильной группы, которая может
 содержать заместитель, выбранный из группы, состоящей из низшей алкильной
 группы и пиридийной группы, включают гексагидро-1,4-дiazепинилкарбонильную
 группу, которая может содержать 1-3, предпочтительно 1, заместителя, выбранных
 из группы, состоящей из указанной выше низшей алкильной группы
 (предпочтительно неразветвленной или разветвленной алкильной группы,
 содержащей 1-6 углеродных атомов) и пиридийной группы. Ее конкретные
 примеры включают (гексагидро-1,4-дiazепин-(1-, 2-, 5- или 6-)ил)карбонильную
 группу, (4-метилгексагидро-1,4-дiazепин-1-ил)карбонильную группу и (4-(4-
 пиридил)метилгексагидро-1,4-дiazепин-1-ил)карбонильную группу.

Примеры дигидропирролилкарбонильной группы включают 2,3-
 дигидропирролилкарбонильную группу и 2,5-дигидропирролилкарбонильную
 группу.

Примеры дигидропирролилкарбонильной группы, которая может содержать
 низшую алкильную группу, включают дигидропирролилкарбонильную группу,
 указанную выше, которая может содержать 1-4, предпочтительно 1-2, указанных
 выше низших алкильных группы (предпочтительно неразветвленных или
 разветвленных алкильных группы, содержащих 1-6 углеродных атомов). Ее
 конкретные примеры включают (1-, 2- или 3-) (2,5-дигидропирролилкарбонильную)
 группу, 2,5-диметил-1-(2,5-дигидропирролилкарбонильную) группу и 2,5-диметил-1-
 (2,3-дигидропирролилкарбонильную) группу.

Примеры тиоморфолинилкарбонильной группы включают (2-, 3- или 4-)
 тиоморфолинилкарбонильную группу.

Примеры морфолинилкарбонильной группы, которая может содержать группу,
 выбранную из группы, состоящей из низшей алкильной группы и
 пиперидил(низшей)алкильной группы, и арильную группу, включают
 морфолинилкарбонильную группу, которая может содержать 1-5, более
 предпочтительно 1-2, групп, выбранных из группы, состоящей из указанной выше
 низшей алкильной группы (предпочтительно неразветвленной или разветвленной
 алкильной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов) (в которой могут
 присутствовать в качестве заместителя(ей) 1-3 (предпочтительно 1) пиперидильных

группы) и арильной группы, описанной выше. Ее конкретные примеры включают (2-, 3- или 4-)морфолинилкарбонильную группу, 2,6-диметил-4-морфолинилкарбонильную группу, 2-(1-пиперидилметил)-4-морфолинилкарбонильную группу и 2-фенил-4-морфолинилкарбонильную группу.

Примеры тиазолидинилкарбонильной группы включают (2-, 3-, 4- или 5-)тиазолидинилкарбонильную группу.

Примеры тиазолидинилкарбонильной группы, которая может содержать арильную группу, которая может содержать группу, выбранную из группы, состоящей из низшей алкоксигруппы и цианогруппы, включают тиазолидинилкарбонильную группу, которая может содержать 1-3 (предпочтительно 1) арильных группы, которые могут содержать 1-3 (предпочтительно 1) группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкоксигруппы и цианогруппы, указанных выше. Ее конкретные примеры включают (2-, 3-, 4- или 5-)тиазолидинилкарбонильную группу, (2-, 4- или 5-)[(2-, 3- или 4-)метоксифенил]-3-тиазолидинилкарбонильную группу и (2-, 4- или 5-)[(2-, 3- или 4-)цианофенил]-3-тиазолидинилкарбонильную группу.

Примеры азабицикло[3.2.2]нонилкарбонильной группы включают 1-азабицикло[3.2.2]нон-(2-, 3-, 5- или 6-)илкарбонильную группу, 2-азабицикло[3.2.2]нон-(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6- или 7-)илкарбонильную группу, 3-азабицикло[3.2.2]нон-(1-, 2-, 3- или 6-)илкарбонильную группу и 6-азабицикло[3.2.2]нон-(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- или 9-)илкарбонильную группу.

Примеры азабицикло[3.2.1]октилкарбонильной группы, которая может содержать галогензамещенную или незамещенную арилоксигруппу, включают азабицикло[3.2.1]октилкарбонильную группу, которая может содержать 1-2 (предпочтительно 1) указанных выше галогензамещенных арильных группы (предпочтительно арильных группы, которым могут быть замещенными 1-3, предпочтительно 1 атомами галогена), или азабицикло[3.2.1]октилкарбонильную группу, которая может содержать 1-2 (предпочтительно 1) незамещенных арильных группы, указанных выше. Ее конкретные примеры включают 1-азабицикло[3.2.1]окт-(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)илкарбонильную группу, 2-азабицикло[3.2.1]окт-(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)илкарбонильную группу, 3-азабицикло[3.2.1]окт-(1-, 2-, 3-, 6- или 8-)илкарбонильную группу, 6-азабицикло[3.2.1]окт-(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)илкарбонильную группу, 8-азабицикло[3.2.1]окт-(1-, 2-, 3-, 6- или 8-)илкарбонильную группу, 3-(фенилокси)-1-азабицикло[3.2.1]окт-2-илкарбонильную группу, 3-(2-бифенилокси)-1-азабицикло[3.2.1]окт-3-илкарбонильную группу, 3-(1-нафтилокси)-1-азабицикло[3.2.1]окт-4-илкарбонильную группу, 3-(3-метилфенилокси)-1-азабицикло[3.2.1]окт-5-илкарбонильную группу, 3-(4-этилфенилокси)-1-азабицикло[3.2.1]окт-6-илкарбонильную группу, 3-(2-н-пропилфенилокси)-1-азабицикло[3.2.1]окт-7-илкарбонильную группу, 3-(3-н-бутилфенилокси)-1-азабицикло[3.2.1]окт-8-илкарбонильную группу, 3-(4-н-пентилфенилокси)-2-азабицикло[3.2.1]окт-1-илкарбонильную группу, 3-(2-н-гексилфенилокси)-2-азабицикло[3.2.1]окт-2-илкарбонильную группу, 3-(3-изобутилфенилокси)-2-азабицикло[3.2.1]окт-3-илкарбонильную группу, 3-(4-трет-бутилфенилокси)-2-азабицикло[3.2.1]окт-4-илкарбонильную группу, 3-(2-хлорфенилокси)-2-азабицикло[3.2.1]окт-5-илкарбонильную группу, 3-(3-фторфенилокси)-8-азабицикло[3.2.1]окт-8-илкарбонильную группу, 3-(3-бромфенилокси)-2-азабицикло[3.2.1]окт-6-илкарбонильную группу, 3-(2-аминофенилокси)-2-азабицикло[3.2.1]окт-7-илкарбонильную группу, 3-(2,3-

диметилфенилокси)-2-азабицикло[3.2.1]окт-8-илкарбонильную группу, 3-(3,4,5-триметилфенилокси)-8-азабицикло[3.2.1]окт-1-илкарбонильную группу и 3-(2,3-диаминофенилокси)-8-азабицикло[3.2.1]окт-2-илкарбонильную группу.

Примеры индолинилкарбонильной группы включают (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6- или 7-)индолинилкарбонильную группу.

Примеры тетрагидропиридо[3.4-b]индолилкарбонильной группы включают (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- или 9-) (2-, 3-, 4-, 9-тетрагидропиридо[3.4-b]индолилкарбонильную) группу.

Примеры пиперазинил(низшей)алкильной группы, которая может содержать низшую алкильную группу в пиперазинильной группе, включают пиперазинил(низшую)алкильную группу, низшая алкильная часть которой представляет собой указанную выше низшую алкильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов), причем в пиперазинильной группе могут присутствовать 1-7, предпочтительно 1-5, более предпочтительно 1, указанных выше низших алкильных групп (предпочтительно неразветвленных или разветвленных алкильных групп, содержащих 1-6 углеродных атомов). Ее конкретные примеры включают (1- или 2-)пиперазинилметильную группу, 2-[(1- или 2-)пиперазинил]этильную группу, 1-[(1- или 2-)пиперазинил]этильную группу, 3-[(1- или 2-)пиперазинил]пропильную группу, 4-[(1- или 2-)пиперазинил]бутильную группу, 5-[(1- или 2-)пиперазинил]пентильную группу, 6-[(1- или 2-)пиперазинил]гексильную группу, 1,1-диметил-2-[(1- или 2-)пиперазинил]этильную группу, 2-метил-3-[(1- или 2-)пиперазинил]пропильную группу, 4-метил-1-пиперазинилметильную группу, 2-(4-метил-2-пиперазинил)этильную группу, 3-(2-этил-1-пиперазинил)пропильную группу, 4-(3-н-пропил-1-пиперазинил)бутильную группу, 5-(4-н-бутил-1-пиперазинил)пентильную группу, 6-(1-н-пентил-2-пиперазинил)гексильную группу, 2-н-гексил-2-пиперазинилметильную группу, 2-(3-изобутил-2-пиперазинил)этильную группу и 3-(4-трет-бутил-2-пиперазинил)пропильную группу.

Примеры морфолинилкарбонил(низшей)алкильной группы включают морфолинилкарбонил(низшую)алкильную группу, низшая алкильная часть которой представляет собой указанную выше низшую алкильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов). Ее конкретные примеры включают 2-морфолинилкарбонилметильную группу, 3-морфолинилкарбонилметильную группу, 4-морфолинилкарбонилметильную группу, 2-(2-морфолинилкарбонил)этильную группу, 2-(3-морфолинилкарбонил)этильную группу, 2-(4-морфолинилкарбонил)этильную группу, 1-(2-морфолинилкарбонил)этильную группу, 1-(3-морфолинилкарбонил)этильную группу, 1-(4-морфолинилкарбонил)этильную группу, 3-(2-морфолинилкарбонил)пропильную группу, 3-(3-морфолинилкарбонил)пропильную группу, 3-(4-морфолинилкарбонил)пропильную группу, 4-(2-морфолинилкарбонил)бутильную группу, 4-(3-морфолинилкарбонил)бутильную группу, 4-(4-морфолинилкарбонил)бутильную группу, 5-(2-морфолинилкарбонил)пентильную группу, 5-(3-морфолинилкарбонил)пентильную группу, 5-(4-морфолинилкарбонил)пентильную группу, 6-(2-морфолинилкарбонил)гексильную группу, 6-(3-морфолинилкарбонил)гексильную группу, 6-(4-морфолинилкарбонил)гексильную группу, 3-метил-3-(2-морфолинилкарбонил)пропильную группу, 3-метил-3-(3-

морфолинилкарбонил)пропильную группу, 3-метил-3-(4-морфолинилкарбонил)пропильную группу, 1,1-диметил-2-(2-морфолинилкарбонил)этильную группу, 1,1-диметил-2-(3-морфолинилкарбонил)этильную группу и 1,1-диметил-2-(4-морфолинилкарбонил)этильную группу.

Примеры пиперазинилкарбонил(низшей)алкильной группы, которая может содержать низшую алкильную группу в пиперазинильной группе, включают пиперазинилкарбонил(низшую)алкильную группу, низшая алкильная часть которой представляет собой указанную выше низшую алкильную группу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкильную группу, содержащую 1-6 углеродных атомов), и которая может содержать 1-7, предпочтительно 1-5, более предпочтительно 1, указанных выше низших алкильных групп (предпочтительно неразветвленных или разветвленных алкильных групп, содержащих 1-6 углеродных атомов) в пиперазинильной группе. Ее конкретные примеры включают (1- или 2-)пиперазинилкарбонилметильную группу, 2-[(1- или 2-)пиперазинилкарбонил]этильную группу, 1-[(1- или 2-)пиперазинилкарбонил]этильную группу, 3-[(1- или 2-)пиперазинилкарбонил]пропильную группу, 4-[(1- или 2-)пиперазинилкарбонил]бутильную группу, 5-[(1- или 2-)пиперазинилкарбонил]пентильную группу, 6-[(1- или 2-)пиперазинилкарбонил]гексильную группу, 1,1-диметил-2-[1- или 2-)пиперазинилкарбонил]этильную группу, 2-метил-3-[(1- или 2-)пиперазинилкарбонил]пропильную группу, 4-метил-1-пиперазинилкарбонилметильную группу, 2-(4-метил-2-пиперазинилкарбонил)этильную группу, 3-(2-этил-1-пиперазинилкарбонил)пропильную группу, 4-(3-н-пропил-1-пиперазинилкарбонил)бутильную группу, 5-(4-н-бутил-1-пиперазинилкарбонил)пентильную группу, 6-(1-н-пентил-2-пиперазинилкарбонил)гексильную группу, 2-н-гексил-2-пиперазинилкарбонилметильную группу, 2-(3-изобутил-2-пиперазинилкарбонил)этильную группу и 3-(4-трет-бутил-2-пиперазинилкарбонил)пропильную группу.

Примеры амино(низшей)алкоксигруппы (в аминогруппе может присутствовать низшая алкильная группа) включают указанную выше низшую алкоксигруппу (предпочтительно неразветвленную или разветвленную алкоксигруппу, содержащую 1-6 углеродных атомов), содержащую 1-5 (предпочтительно 1) аминогрупп, которые могут содержать 1-2 низших алкильных группы, указанных выше. Ее конкретные примеры включают аминотоксигруппу, 2-аминоэтоксигруппу, 1-аминоэтоксигруппу, 3-аминопропоксигруппу, 4-аминобутоксигруппу, 5-аминопентоксигруппу, 6-аминогексилоксигруппу, 1,1-диметил-2-аминоэтоксигруппу, N,N-диметиламинотоксигруппу, N-метил-N-этиламинотоксигруппу, N-метиламинотоксигруппу, 2-(N-метиламино)этоксигруппу, 2-(N,N-диметиламино)этоксигруппу, 2-(N,N-диэтиламино)этоксигруппу, 2-(N,N-диизопропиламино)этоксигруппу и 3-(N,N-диметиламино)пропоксигруппу.

Примеры низшей алкокси(низшей)алкоксигруппы включают низшую алкокси(низшую)алкоксигруппу, содержащую низшую алкоксильную часть, указанную выше. Ее конкретные примеры включают метоксиметоксигруппу, 2-метоксиэтоксигруппу, 1-этоксиэтоксигруппу, 2-этоксиэтоксигруппу, 2-изобутоксигруппу, 2,2-диметоксиэтоксигруппу и 2-метокси-1-метилэтоксигруппу.

Примеры пиперазинильной группы, которая может содержать группу, выбранную из группы, состоящей из оксогруппы, низшей алкильной группы, низшей алканоильной группы и низшей алкоксикарбонильной группы, включают пиперазинильную группу, которая может содержать 1-3 (1-2) группы, выбранных из группы, состоящей из оксогруппы, низшей алкильной группы, указанной выше, низшей алканоильной группы, указанной выше, и низшей алкоксикарбонильной группы, указанной выше. Ее конкретные примеры включают (1- или 2-)пиперазинильную группу, (2-, 3- или 4-)метил-1-пиперазинильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-)метил-2-пиперазинильную группу, (2-, 3- или 4-)этил-1-пиперазинильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-)этил-2-пиперазинильную группу, (2-, 3- или 4-)н-пропил-1-пиперазинильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-)н-пропил-2-пиперазинильную группу, (2-, 3- или 4-)формил-1-пиперазинильную группу, (2-, 3- или 4-)ацетил-1-пиперазинильную группу, (2-, 3- или 4-)пропионил-1-пиперазинильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-)пропионил-2-пиперазинильную группу, (2-, 3- или 4-)бутирил-1-пиперазинильную группу, (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-)бутирил-2-пиперазинильную группу, (2-, 3- или 4-)метоксикарбонил-1-пиперазинильную группу, (2-, 3- или 4-)этоксикарбонил-1-пиперазинильную группу, (2-, 3- или 4-)трет-бутоксикарбонил-1-пиперазинильную группу, (2- или 3-)оксо-1-пиперазинильную группу, 2-оксо-(3-, 4-, 5- или 6-)ацетил-1-пиперазинильную группу, 2-оксо-(3-, 4-, 5- или 6-)бутирил-1-пиперазинильную группу, 2-оксо-(3-, 4-, 5- или 6-)метоксикарбонил-1-пиперазинильную группу и 2-оксо-(3-, 4-, 5- или 6-)метоксикарбонил-1-пиперазинильную группу.

Примеры 1,3,8-триазаспиро[4.5]деканилкарбонильной группы, которая может содержать группу, выбранную из группы, состоящей из оксогруппы и арильной группы, включают 1,3,8-триазаспиро[4.5]деканилкарбонильную группу, которая может содержать 1-3 (1-2) группы, выбранных из группы, состоящей из оксогруппы и арильной группы, указанной выше. Ее конкретные примеры включают 1,3,8-триазаспиро[4.5]деканил-(1, 2, 3, 4 или 8-)илкарбонильную группу, 1-фенил-1,3,8-триазаспиро[4.5]деканил-8-илкарбонильную группу и 1-фенил-4-оксо-1,3,8-триазаспиро[4.5]деканил-8-илкарбонильную группу.

Примеры тетрагидропиридилной группы включают (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-)1,2,3,4-тетрагидропиридилную группу и (1-, 2-, 3-, 4-, 5- или 6-)1,2,3,6-тетрагидропиридилную группу.

Примеры тетрагидропиридилкарбонильной группы, которая может содержать пиридилную группу, включают тетрагидропиридилкарбонильную группу, указанную выше, которая может содержать 1-3 (предпочтительно 1) пиридилных группы. Ее конкретные примеры включают (2-, 3- или 4-)пиридил-1,2,3,6-тетрагидропиридил-1-илкарбонильную группу.

Примеры имидазолидинилкарбонильной группы, которая может содержать тиоксогруппу, включают имидазолидинилкарбонильную группу, которая может содержать 1-2 (предпочтительно 1) тиоксогруппы. Ее конкретные примеры включают 2-тиоксо-1-имидазолидинилкарбонильную группу.

Примеры тетрагидронафтильной группы включают (1- или 2-)1,2,3,4-тетрагидронафтильную группу.

Примеры насыщенной или ненасыщенной гетеромоноциклической группы, содержащей 1-4 гетероатома, выбранных из группы, состоящей из атома азота, атома кислорода и атома серы, включают гетеромоноциклические группы, представленные в пунктах (1)-(9) ниже:

(1) насыщенная 3-8 (предпочтительно 5-6)-членная гетеромоноциклическая группа, содержащая 1-4 (предпочтительно 1-2) атома азота (например, пирролидинильная группа, имидазолидинильная группа, пиперидильная группа, гексагидропиримидинильная группа, пиперазинильная группа, азепанильная группа и азоканильная группа);

(2) ненасыщенная 3-8 (предпочтительно 5-6)-членная гетеромоноциклическая группа, содержащая 1-4 (предпочтительно 1-3) атома азота, например, пирролильная группа, дигидропирролильная группа, такая как 1Н-2,5-дигидропирролильная группа, имидазолильная группа (такая как 1Н-имидазолильная группа), дигидроимидазолильная группа (такая как 1Н-2,3-дигидроимидазолильная группа), триазолильная группа (такая как 4Н-1,2,4-триазолильная группа, 1Н-1,2,3-триазолильная группа и 2Н-1,2,3-триазолильная группа), дигидротриазолильная группа (такая как 1Н-4,5-дигидро-1,2,4-триазолильная группа), пиразолильная группа, пиридилъная группа, дигидропиридилъная группа (такая как 1,2-дигидропиридилъная группа), пиримидинильная группа, дигидропиримидинильная группа (такая как 1,6-дигидропиримидинильная группа), пиразинильная группа, дигидропиразинильная группа (такая как 1,2-дигидропиразинил), пиридазинильная группа и тетразолильная группа (такая как 1Н-тетразолильная группа и 2Н-тетразолильная группа);

(3) ненасыщенная 3-8 (предпочтительно 5-6)-членная гетеромоноциклическая группа, содержащая 1-2 (предпочтительно 1) атома кислорода и 1-3 (предпочтительно 1-2) атома азота, например, оксазолильная группа, изоксазолильная группа, оксадиазолильная группа (такая как 1,2,4-оксадиазолильная группа, 1,3,4-оксадиазолильная группа и 1,2,5-оксадиазолильная группа), и насыщенная 3-8 (предпочтительно 5-6)-членная гетеромоноциклическая группа, содержащая 1-2 (предпочтительно 1) атома кислорода и 1-3 (предпочтительно 1-2) атома азота, например, оксазолидинильная группа, изоксазолидинильная группа и морфолинийная группа;

(4) ненасыщенная 3-8 (предпочтительно 5)-членная гетеромоноциклическая группа, содержащая 1-2 атома серы и 1-3 атома азота, например, тиазолильная группа, дигидротиазолильная группа (такая как 2,3-дигидротиазолильная группа), изотиазолильная группа, тиадиазолильная группа (такая как 1,2,3-тиадиазолильная группа, 1,2,4-тиадиазолильная группа, 1,3,4-тиадиазолильная группа и 1,2,5-тиадиазолильная группа) и дигидротиазинильная группа;

(5) насыщенная 3-8 (предпочтительно 5-6)-членная гетеромоноциклическая группа, содержащая 1-2 атома серы и 1-3 атома азота, например, тиазолидинильная группа;

(6) насыщенная 3-8 (предпочтительно 5-6)-членная гетеромоноциклическая группа, содержащая 1-2 атома кислорода, например, тетрагидрофурильная группа и тетрагидропиранильная группа;

(7) ненасыщенная 3-8 (предпочтительно 5-6)-членная гетеромоноциклическая группа, содержащая 1-2 атома кислорода, например, пиранильная группа (такая как 2Н-пиранильная группа);

(8) насыщенная 3-8 (предпочтительно 5-6)-членная гетеромоноциклическая группа, содержащая 1-2 атома серы, например, тетрагидротииофурильная группа и тетрагидротииопиранильная группа; и

(9) ненасыщенная 3-8 (предпочтительно 5-6)-членная гетеромоноциклическая группа, содержащая 1-2 атома серы, например, тиенильная группа и тииопиранильная группа;

группа (такая как 2Н-тиопиранил).

Из них предпочтительной можно назвать насыщенную или ненасыщенную гетеромоноциклическую группу, содержащую 1-2 гетероатома, выбранных из атома азота, атома кислорода и атома серы, и выбранную из группы, состоящей из
 5 пирролидинильной группы, пиперидильной группы, пиразолильной группы, пиридинильной группы, пиримидинильной группы, пиразинильной группы, изоксазолильной группы, тиазолильной группы, пиранильной группы и тиенильной группы, а более предпочтительной - насыщенную или ненасыщенную
 10 гетеромоноциклическую группу, содержащую 1-2 атома азота и выбранную из пирролидинильной группы, пиперидильной группы, пиразолильной группы, пиридинильной группы, пиримидинильной группы и тиазолильной группы.

Примеры тетрагидрохиноксалинильной группы включают (1-, 2-, 5- или 6-)-1,2,3,4-тетрагидрохиноксалинильную группу и (1-, 2-, 5- или 6-)-5,6,7,8-
 15 тетрагидрохиноксалинильную группу.

Примеры тетрагидрохиназолинильной группы включают (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)-1,2,3,4-тетрагидрохиназолинильную группу и (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)-5,6,7,8-тетрагидрохиназолинильную группу.

Примеры дигидрохиназолинильной группы включают (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)-3,4-дигидрохиназолинильную группу и (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)-1,2-дигидрохиназолинильную группу.

Примеры дигидробензимидазолильной группы включают (1-, 2-, 4- или 5-)-2,3-дигидро-1Н-бензимидазолильную группу.

Примеры тетрагидробензазепинильной группы включают (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- или 9-)-2,3,4,5-тетрагидро-1Н-бензо[б]азепинильную группу и (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- или 9-)-2,3,4,5-тетрагидро-1Н-бензо[с]азепинильную группу.

Примеры тетрагидробензодиазепинильной группы включают (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- или 9-)-2,3,4,5-тетрагидро-1Н-бензо[б][1.4]дiazепинильную группу и (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- или 9-)-2,3,4,5-тетрагидро-1Н-бензо[е][1.4]дiazепинильную группу.

Примеры гексагидробензационильной группы включают (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8-, 9- или 10-)-1,2,3,4,5,6-гексагидробензо[б]ационильную группу и (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8-, 9- или 10-)-1,2,3,4,5,6-гексагидробензо[с]ационильную группу.

Примеры дигидробензоксазинильной группы включают (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)-3,4-дигидро-2Н-бензо[б][1.4]оксазинильную группу и (1-, 2-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)-2,4-дигидро-1Н-бензо[д][1.3]оксазинильную группу.

Примеры дигидробензоксазолильной группы включают (2-, 3-, 4-, 5-, 6- или 7-)-2,3-дигидробензоксазолильную группу.

Примеры бензизоксазолильной группы включают (3-, 4-, 5-, 6- или 7-)-бензо[д]изоксазолильную группу и (3-, 4-, 5-, 6- или 7-)-бензо[с]изоксазолильную группу.

Примеры бензоксадиазолильной группы включают (4- или 5-)-бензо[с][1.2.5]оксадиазолильную группу.

Примеры тетрагидробензоксазепинильной группы включают (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- или 9-)-2,3,4,5-тетрагидробензо[б][1.4]оксазепинильную группу, (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- или 9-)-1,3,4,5-тетрагидробензо[е][1.3]оксазепинильную группу и (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8- или 9-)-2,3,4,5-тетрагидробензо[ф][1.4]оксазепинильную группу.

Примеры дигидробензотиазинильной группы включают (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)-3,4-дигидро-2Н-бензо[б][1.4]тиазинильную группу и (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7- или 8-)-3,4-дигидро-2Н-бензо[е][1.3]тиазинильную группу.

Примеры бензоксатиолильной группы включают (2-, 4-, 5-, 6- или 7-)-бензо[д][1.3]

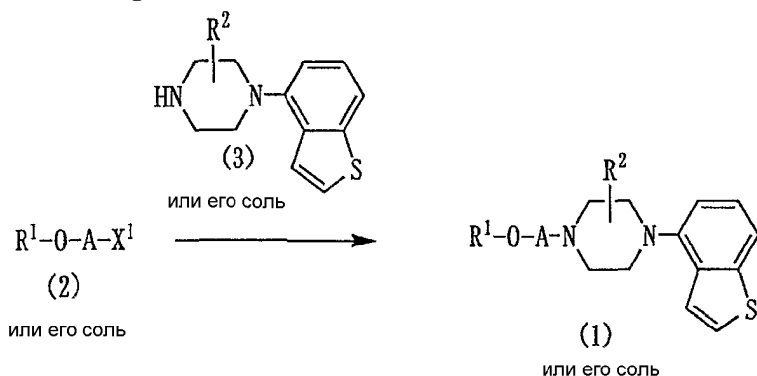
оксатиолильную группу, (3-, 4-, 5-, 6- или 7-)-3Н-бензо[с][1.2]оксатиолильную группу и (3-, 4-, 5-, 6- или 7-)-3Н-бензо[д][1.2]оксатиолильную группу.

Примеры дигидробензофурильной группы включают (2-, 3-, 4-, 5-, 6- или 7-)-2,3-дигидробензофурильную группу.

Гетероциклическое соединение (далее называемое как соединение (1)), представленное общей формулой (1), может быть получено различными способами, например, способом, показанным на следующей далее схеме 1 реакции или схеме 2 реакции.

Формула 4

Схема 1 реакции



где R^1 , R^2 и A , такие, как определено выше, и X^1 представляет собой атом галогена или группу, опосредующую такую же реакцию замещения, как при использовании атома галогена.

Примеры группы, опосредующей такую же реакцию замещения, как при использовании атома галогена, включают низшую алкансульфонилоксигруппу, арилсульфонилоксигруппу и аралкилсульфонилоксигруппу.

Атом галогена, представленный символом X^1 в общей формуле (2), представляет собой атом фтора, атом хлора, атом брома и атом йода.

Конкретные примеры низшей алкансульфонилоксигруппы, представленной символом X^1 , включают неразветвленную или разветвленную алкансульфонилоксигруппу, содержащую 1-6 углеродных атомов, такую как метансульфонилоксигруппа, этансульфонилоксигруппа, изопропансульфонилоксигруппа, н-пропансульфонилоксигруппа, н-бутансульфонилоксигруппа, трет-бутансульфонилоксигруппа, н-пентансульфонилоксигруппа и н-гексансульфонилоксигруппа.

Конкретные примеры арилсульфонилоксигруппы, представленной символом X^1 , включают фенилсульфонилоксигруппу и нафтилсульфонилоксигруппу, которые могут содержать 1-3 заместителя, выбранных из группы, состоящей из неразветвленной или разветвленной алкильной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов, неразветвленной или разветвленной алкоксигруппы, содержащей 1-6 углеродных атомов, нитрогруппы и атома галогена, в фенильном цикле. Конкретные примеры фенилсульфонилоксигруппы, которая может содержать заместитель, включают фенилсульфонилоксигруппу, 4-метилфенилсульфонилоксигруппу, 2-метилфенилсульфонилоксигруппу, 4-нитрофенилсульфонилоксигруппу, 4-метоксифенилсульфонилоксигруппу, 2-нитрофенилсульфонилоксигруппу и 3-хлорфенилсульфонилоксигруппу. Конкретные примеры нафтилсульфонилоксигруппы включают α -нафтилсульфонилоксигруппу и β -нафтилсульфонилоксигруппу.

Примеры аралкилсульфонилоксигруппы, представленной символом X^1 , включают неразветвленную или разветвленную алкилсульфонилоксигруппу, содержащую 1-6 углеродных атомов и замещенную фенильной группой, и

неразветвленную или разветвленную алкилсульфонилоксигруппу, содержащую 1-6 углеродных атомов и замещенную нафтильной группой, причем обе указанные группы могут содержать 1-3 заместителя, выбранных из группы, состоящей из неразветвленной или разветвленной алкильной группы, содержащей 1-6 углеродных атомов, неразветвленной или разветвленной алкоксигруппы, содержащей 1-6 углеродных атомов, нитрогруппы и атома галогена, в фенильном цикле. Конкретные примеры указанной выше алкилсульфонилоксигруппы, замещенной фенильной группой, включают бензилсульфонилоксигруппу, 2-фенилэтилсульфонилоксигруппу, 4-фенилбутилсульфонилоксигруппу, 2-метилбензилсульфонилоксигруппу, 4-метоксибензилсульфонилоксигруппу, 4-нитробензилсульфонилоксигруппу и 3-хлорбензилсульфонилоксигруппу. Конкретные примеры алкилсульфонилоксигруппы, замещенной нафтильной группой, включают α -нафтилметилсульфонилоксигруппу и β -нафтилметилсульфонилоксигруппу.

Соединение (1) может быть получено осуществлением взаимодействия соединения (далее называемого как соединение (2)), представленного общей формулой (2), и соединения (далее называемого как соединение (3)), представленного общей формулой (3).

Данную реакцию обычно проводят в традиционном растворителе, который не может отрицательно влиять на реакцию, таком как вода; растворитель на основе спирта, такой как метанол, этанол, изопропанол, н-бутанол, трифторэтанол и этиленгликоль; растворитель на основе кетона, такой как ацетон и метилэтилкетон; растворитель на основе простого эфира, такой как тетрагидрофуран, диоксан, диэтиловый эфир и диглим; растворитель на основе сложного эфира, такой как метилацетат и этилацетат; апротонный полярный растворитель, такой как ацетонитрил, N,N-диметилформамид и диметилсульфоксид; растворитель на основе галогенированного углеводорода, такой как метиленхлорид и этиленхлорид; или другие органические растворители. Кроме того, реакция может быть проведена в смеси указанных традиционных растворителей. Реакцию обычно проводят в присутствии неорганического основания, такого как щелочной металл (например, натрий и калий), гидрокарбонат щелочного металла (например, гидрокарбонат лития, гидрокарбонат натрия и гидрокарбонат калия), гидроксид щелочного металла (например, гидроксид лития, гидроксид натрия, гидроксид калия и гидроксид цезия), карбонат щелочного металла (например, карбонат лития, карбонат натрия, карбонат калия и карбонат цезия), низший алкоксид щелочного металла (например, метоксид натрия и этоксид натрия) и гидрид щелочного металла (например, гидрид натрия и гидрид калия), или в присутствии органического основания, такого как триалкиламин (например, триметиламин, триэтиламин, N-этилдиизопропиламин), пиридин, хиолин, пиперидин, имидазол, пиколин, диметиламинопиридин, диметиланилин, N-метилморфолин, 1,5-диазабицикло[4.3.0]нон-5-ен (DBN), 1,4-диазабицикло[2.2.2]октан (DABCO) и 1,8-диазабицикло[5.4.0]ундецен-7 (DBU). Когда указанные основания находятся в жидкой форме, они могут быть использованы в качестве растворителей.

Указанные основания могут быть использованы в отдельности или в смеси двух или более типов.

Основание может быть использовано в молярном количестве, равном обычно 0,5-10-кратному, предпочтительно 0,5-6-кратному, количеству соединения (2).

Указанная выше реакция может быть проведена, если это необходимо, с добавлением служащего в качестве ускорителя йодида щелочного металла, такого как йодид калия и йодид натрия.

Молярное отношение соединения (2) к соединению (3), которое используют в реакции по схеме 1, может составлять по крайней мере примерно 0,5, предпочтительно примерно 0,5-5.

Температуру реакции особо не ограничивают, и реакция может быть проведена обычно в условиях охлаждения или нагревания, предпочтительно при температуре от примерно комнатной температуры до примерно 150°C, в течение 1-30 часов.

Соединение (2), служащее в качестве исходного вещества для получения соединения по настоящему изобретению, является новым соединением и может быть получено различными способами, например, способом, представленным на следующей далее схеме 3 реакции.

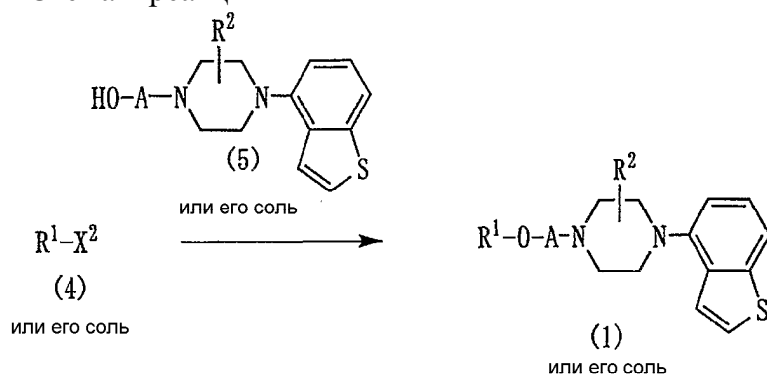
Соединение (3), служащее в качестве исходного вещества для получения соединения по настоящему изобретению, является известным соединением или соединением, которое может быть легко получено из известного соединения.

Могут быть использованы соль соединения (2) вместо соединения (2) и соль соединения (3) вместо соединения (3). Соли соединений (2) и (3) включают кислотно-аддитивные соли. Указанные кислотно-аддитивные соли могут быть получены осуществлением взаимодействия фармацевтически приемлемой кислоты с соединением (2) или (3). Примеры кислоты, используемой в данной реакции, включают неорганические кислоты, такие как серная кислота, азотная кислота, хлористоводородная кислота, фосфорная кислота и бромистоводородная кислота; сульфоновые кислоты, такие как паратолуолсульфоновая кислота, метансульфоновая кислота и этансульфоновая кислота; и органические кислоты, такие как уксусная кислота, щавелевая кислота, малеиновая кислота, фумаровая кислота, яблочная кислота, винная кислота, лимонная кислота, янтарная кислота и бензойная кислота.

Из соединений (2) соединение, содержащее кислотную группу, может легко дать соль при осуществлении взаимодействия с фармацевтически приемлемым основанием. Примеры такого основания включают гидроксиды металлов, такие как гидроксид натрия, гидроксид калия, гидроксид лития и гидроксид кальция; карбонаты или бикарбонаты щелочных металлов, такие как карбонат натрия, гидрокарбонат натрия, гидрокарбонат калия; и алкоголяты щелочных металлов, такие как метилат натрия и этилат калия.

Формула 5

Схема 2 реакции



где R^1 , R^2 и А - такие, как определено выше, и X^2 представляет собой гидроксигруппу, атом галогена или группу, опосредующую такую же реакцию замещения, как в случае атома галогена.

5 Примеры атома галогена, представленного символом X^2 , и группы, опосредующей такую же реакцию замещения, как в случае атома галогена, в связи с общей формулой (4) - такие, как указано выше.

10 Соединение (1) может быть получено осуществлением взаимодействия соединения (далее называемого как соединение (4)), представленного общей формулой (4), и соединения (далее называемого как "соединение (5)"), представленного общей формулой (5).

Реакция может быть проведена в условиях, подобных условиям реакции, показанной на схеме 1.

15 В случае соединения (4), в котором X^2 представляет собой гидроксигруппу, реакция может быть проведена в подходящем растворителе в присутствии подходящего конденсирующего агента.

Данную реакцию обычно проводят в традиционном растворителе, который не может отрицательно влиять на реакцию, таком как вода; растворитель на основе спирта, такой как метанол, этанол, изопропанол, н-бутанол, трифторэтанол и этиленгликоль; растворитель на основе кетона, такой как ацетон и метилэтилкетон; растворитель на основе простого эфира, такой как тетрагидрофуран, диоксан, диэтиловый эфир и диглим; растворитель на основе сложного эфира, такой как метилацетат и этилацетат; апротонный полярный растворитель, такой как ацетонитрил, N,N-диметилформамид и диметилсульфоксид; растворитель на основе галогенированного углеводорода, такой как метиленхлорид и этиленхлорид; или другие органические растворители. Кроме того, в качестве растворителя, используемого в данной реакции, может служить смесь указанных традиционных растворителей.

В качестве конденсирующего агента может служить смесь азокарбоксилата, такого как диэтилазодикарбоксилат, и фосфинового соединения, такого как трифенилфосфин.

35 Количество конденсирующего агента, используемого в данной реакции, обычно по крайней мере эквимольно, предпочтительно вдвойне эквимольно, количеству соединения (4).

Молярное отношение соединения (4) к соединению (5), используемое в реакции, показанной на схеме 2, обычно может быть по крайней мере эквимольным, а предпочтительно равно 2.

Температуру реакции особо не ограничивают, и реакция может быть проведена обычно в условиях охлаждения или нагревания, а предпочтительно при температуре от 0°C до примерно 150°C, в течение 1-10 часов.

45 Соединение (4), служащее в качестве исходного вещества для получения соединения по настоящему изобретению, является известным соединением или соединением, которое может быть легко получено из известного соединения.

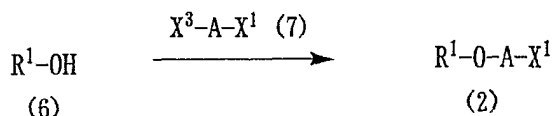
50 Соединение (5), служащее в качестве исходного вещества для получения соединения по настоящему изобретению, включает новое соединение и соединение, которое может быть получено различными способами, например, способами, представленными на следующей далее схеме 3 или 4 реакции.

Могут быть использованы соль соединения (4) вместо соединения (4) и соль соединения (5) вместо соединения (5). В качестве предпочтительной соли

соединения (4) можно назвать такую же соль, как в случае соединения (2). В качестве предпочтительной соли соединения (5) можно назвать такую же соль, как в случае соединения (3).

Формула 6

Схема 3 реакции



или его соль

или его соль

где R^1 , X^1 и A - такие, как определено выше, и X^3 представляет собой атом галогена или группу, опосредующую такую же реакцию замещения, как в случае атома галогена.

Примеры атома галогена, представленного символом X^3 , и группы, опосредующей такую же реакцию замещения, как в случае атома галогена, в связи с общей формулой (7) - такие, как указано выше.

Соединение (2) может быть получено осуществлением взаимодействия соединения (далее называемого как соединение (6)), представленного общей формулой (6), и соединения (далее называемого как соединение (7)), представленного общей формулой (7).

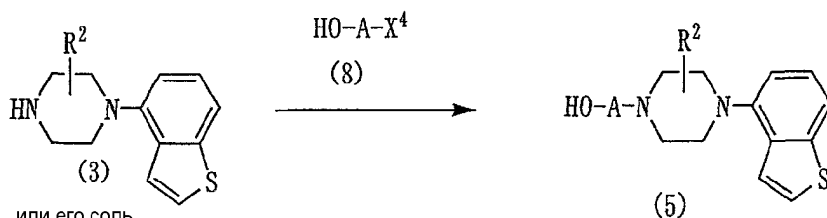
Реакция может быть проведена в условиях, подобных условиям реакции, показанной на схеме 1.

Соединения (6) и (7), служащие в качестве исходных веществ для получения соединения по настоящему изобретению, являются известными соединениями или соединениями, которые могут быть легко получены из известных соединений.

Вместо соединения (6) может быть использована соль соединения (6). В качестве предпочтительной соли соединения (6) можно назвать такую же соль, как в случае соединения (2).

Формула 7

Схема 4 реакции



или его соль

или его соль

где R^2 и A - такие, как определено выше, и X^4 представляет собой атом галогена или группу, опосредующую такую же реакцию замещения, как в случае атома галогена.

Примеры атома галогена, представленного символом X^4 , и группы, опосредующей такую же реакцию замещения, как в случае атома галогена, в связи с общей формулой (8) - такие, как указано выше.

Соединение (5) может быть получено осуществлением взаимодействия соединения (3) и соединения (далее называемого как соединение (8)), представленного общей формулой (8).

Реакция может быть проведена в условиях, подобных условиям реакции, показанной на схеме 1.

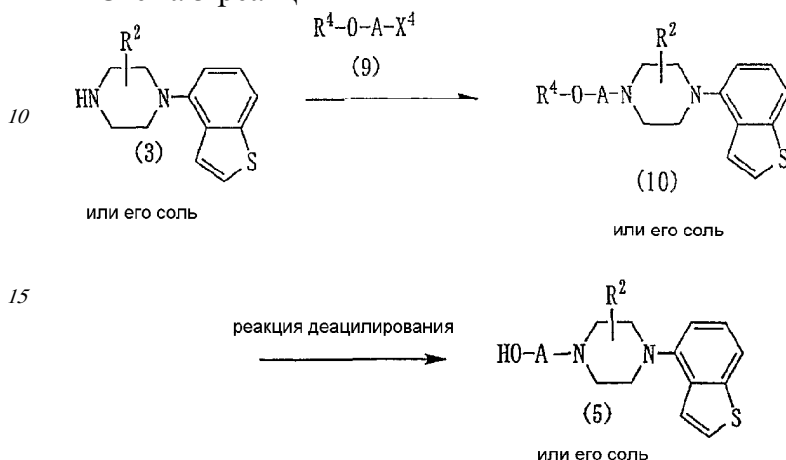
Соединение (8), служащее в качестве исходного вещества для получения

соединения по настоящему изобретению, является известным соединением или соединением, которое может быть легко получено из известного соединения.

Вместо соединения (3) может быть использована соль соединения (3). В качестве предпочтительной соли соединения (3) можно назвать такие соли, как указано выше.

Формула 8

Схема 5 реакций



где R^2 и A - такие, как определено выше, R^4 представляет собой низшую алканоильную группу и X^4 представляет собой атом галогена или группу, опосредующую такую же реакцию замещения, как в случае атома галогена.

Примеры низшей алканоильной группы, представленной символом R^4 в общих формулах (9) и (10), такие, как указано выше.

Кроме того, примеры атома галогена, представленного символом X^4 , и группы, опосредующей такую же реакцию замещения, как в случае атома галогена, в связи с общей формулой (9), такие, как указано выше.

Соединение (далее называемое как соединение (10)), представленное общей формулой (10), может быть получено осуществлением взаимодействия соединения (3) и соединения (9).

Реакция может быть проведена в условиях, подобных условиям реакции, показанной на схеме 1.

Соединение (9), служащее в качестве исходного вещества для получения соединения по настоящему изобретению, является известным соединением или соединением, которое может быть легко получено из известного соединения.

Вместо соединения (3) может быть использована соль соединения (3). В качестве предпочтительной соли соединения (3) можно назвать такие соли, как указано выше.

Затем соединение (10) подвергают реакции удаления ацильной группы с получением соединения (5).

В качестве предпочтительной реакции можно назвать традиционную реакцию, такую как гидролиз. Реакция гидролиза может быть осуществлена предпочтительно в присутствии основания или кислоты, включая кислоту Льюиса. Примеры предпочтительного основания включают неорганические соли, такие как щелочной металл (например, натрий и калий), гидрокарбонат щелочного металла (например, гидрокарбонат лития, гидрокарбонат натрия и гидрокарбонат калия), гидроксид щелочного металла (например, гидроксид лития, гидроксид натрия, гидроксид калия и гидроксид цезия), карбонат щелочного металла (например, карбонат лития, карбонат натрия, карбонат калия и карбонат цезия), низший алкоксид щелочного металла (например, метоксид натрия и этоксид натрия) и гидриды (например, гидрид

натрия и гидрид калия); и органические основания, такие как триалкиламин (например, триметиламин, триэтиламин и N-этилдизопропиламин), пиридин, хинолин, пиперидин, имидазол, пиколлин, диметиламинопиридин, диметиланилин, N-метилморфолин, DBN, DABCO и DBU. В качестве предпочтительной кислоты можно назвать органические кислоты (такие как муравьиная кислота, уксусная кислота, пропионовая кислота, трихлоруксусная кислота, трифторуксусная кислота) и неорганические кислоты (такие как хлористоводородная кислота, бромистоводородная кислота, серная кислота, хлористый водород и бромистый водород). Реакция удаления с использованием кислоты Льюиса, такой как тригалогенуксусная кислота (например, трихлоруксусная кислота и трифторуксусная кислота), может быть осуществлена предпочтительно в присутствии катион-улавливающего агента (например, анизола и фенола).

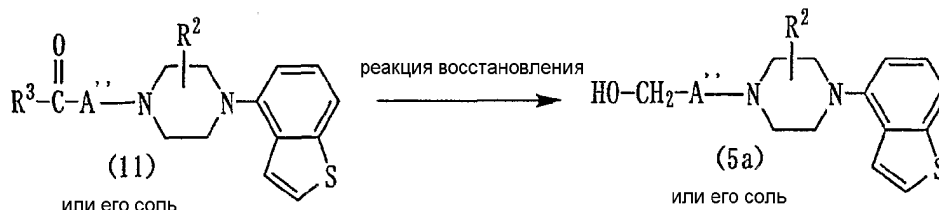
Данную реакцию обычно проводят в традиционном растворителе, который не может отрицательно влиять на реакцию, таком как вода; растворитель на основе спирта, такой как метанол, этанол, изопропанол, н-бутанол, трифторэтанол и этиленгликоль; растворитель на основе кетона, такой как ацетон и метилэтилкетон; растворитель на основе простого эфира, такой как тетрагидрофуран, диоксан, диэтиловый эфир и диглим; растворитель на основе сложного эфира, такой как метилацетат и этилацетат; апротонный полярный растворитель, такой как ацетонитрил, N,N-диметилформамид и диметилсульфоксид; растворитель на основе галогенированного углеводорода, такой как метиленхлорид и этиленхлорид; или другие органические растворители. Кроме того, реакция может быть проведена в смеси указанных традиционных растворителей. Из них предпочтительным является этанол. Температуру реакции особо не ограничивают, и реакция может быть проведена обычно в условиях охлаждения или нагревания, а предпочтительно при температуре в интервале от примерно комнатной температуры до примерно температуры кипения растворителя, в течение 0,5-75 часов.

Вместо соединения (10) может быть использована соль соединения (10). В качестве предпочтительной соли соединения (10) можно назвать такую же соль, как в случае соединения (3).

Кроме того, соединение (далее называемое как соединение (5a)), где A соединения (5) представляет собой $-\text{CH}_2\text{A}''-$, где A'' представляет собой C_1 - C_5 алкиленовую группу, может быть получено способом, представленным на следующей ниже схеме 6 реакции.

Формула 9

Схема 6 реакции



где R^2 - такой, как определено выше, и R^3 представляет собой низшую алкоксигруппу. A'' представляет собой C_1 - C_5 алкиленовую группу. Низшая алкоксигруппа, представленная символом R^3 в общей формуле (11), такая, как определено выше.

Примеры C_1 - C_5 алкиленовой группы, представленной символом A'' в общих формулах (11) и (5a), включают неразветвленную или разветвленную алкиленовую

группу, содержащую 1-5 углеродных атомов, такую как метилен, этилен, метилметилен, триметилен, тетраметилен, 1-метилтриметилен, 2-метилтриметилен, 3-метилтетраметилен, пентаметилен и 2,2-диметилтриметилен.

Соединение (5a) может быть получено подверганием соединения (далее называемого как соединение (11)), представленного общей формулой (11), реакции восстановления.

Реакция может быть осуществлена способом, показанным в ссылочном примере 6, или подобным ему способом. Реакция может быть также осуществлена традиционным способом с использованием восстановителя.

В качестве предпочтительного восстановителя можно назвать гидрид (такой как литийалюминийгидрид, боргидрид натрия, боргидрид лития, диборан и цианборгидрид натрия).

Данную реакцию обычно проводят в традиционном растворителе, который не может отрицательно влиять на реакцию, таком как растворитель на основе спирта, такой как метанол, этанол, изопропанол, н-бутанол, трифторэтанол и этиленгликоль; растворитель на основе кетона, такой как ацетон и метилэтилкетон; растворитель на основе простого эфира, такой как тетрагидрофуран, диоксан, диэтиловый эфир и диглим; растворитель на основе сложного эфира, такой как метилацетат и этилацетат; апротонный полярный растворитель, такой как ацетонитрил, N,N-диметилформамид и диметилсульфоксид; растворитель на основе галогенированного углеводорода, такой как метиленхлорид и этиленхлорид; или другие органические растворители. Кроме того, реакция может быть проведена в смеси указанных традиционных растворителей. Температуру реакции особо не ограничивают, и реакция может быть проведена обычно в условиях охлаждения или нагревания, а предпочтительно при температуре в интервале от примерно комнатной температуры до примерно температуры кипения растворителя в течение 0,5-75 часов.

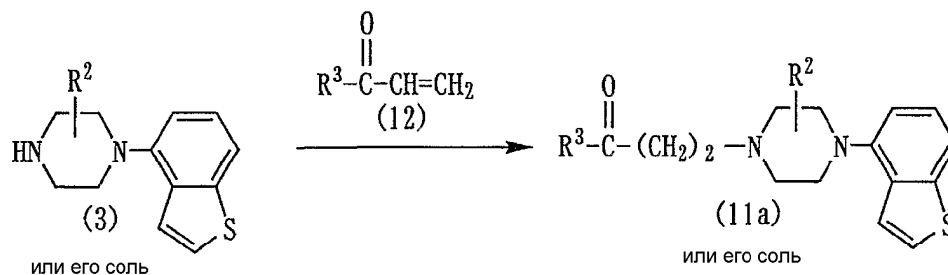
Соединение (11), служащее в качестве исходного вещества для получения соединения по настоящему изобретению, является известным соединением или соединением, которое может быть легко получено из известного соединения.

Вместо соединения (11) может быть использована соль соединения (11). В качестве предпочтительной соли соединения (11) можно назвать такую же соль, как в случае соединения (2).

Кроме того, соединение (далее называемое как соединение (11a)), где A" соединения (11) представляет собой $-(CH_2)_2-$, может быть получено способом, представленным на следующей ниже схеме 7 реакции.

Формула 10

Схема 7 реакции



где R^2 и R^3 - такие, как определено выше.

Соединение (11a) может быть получено осуществлением взаимодействия соединения (3) и соединения (далее называемого как соединение (12)),

представленного общей формулой (12).

Реакция может быть проведена способом, показанным в ссылочном примере 5, или подобным ему способом. Данную реакцию обычно проводят в традиционном растворителе, который не может отрицательно влиять на реакцию, таком как вода, растворитель на основе спирта, такой как метанол, этанол, изопропанол, н-бутанол, трифторэтанол и этиленгликоль; растворитель на основе кетона, такой как ацетон и метилэтилкетон; растворитель на основе простого эфира, такой как тетрагидрофуран, диоксан, диэтиловый эфир и диглим; растворитель на основе сложного эфира, такой как метилацетат и этилацетат; апротонный полярный растворитель, такой как ацетонитрил, N,N-диметилформамид и диметилсульфоксид; растворитель на основе галогенированного углеводорода, такой как метиленхлорид и этиленхлорид; или другие органические растворители. Кроме того, реакция может быть проведена в смеси указанных традиционных растворителей. Температуру реакции особо не ограничивают, и реакция может быть проведена обычно в условиях охлаждения или нагревания, а предпочтительно при температуре в интервале от примерно комнатной температуры до примерно температуры кипения растворителя, в течение 0,5-75 часов.

Соединение (12), служащее в качестве исходного вещества для получения соединения по настоящему изобретению, является известным соединением или соединением, которое может быть легко получено из известного соединения.

Могут быть использованы соль соединения (3) вместо соединения (3) и соль соединения (12) вместо соединения (12). В качестве предпочтительной соли соединения (3) можно назвать такую соль, как указано выше. В качестве предпочтительной соли соединения (12) можно назвать такую же соль, как в случае соединения (2).

Целевое соединение, полученное по каждой из показанных выше схем, может образовывать подходящую соль. Такие подходящие соли включают предпочтительные соли соединения (1), примеры которых представлены ниже.

Предпочтительные соли соединения (1) являются фармакологически приемлемыми солями, и примеры их включают соли металлов, такие как соли щелочных металлов (например, натриевая соль, калиевая соль и т.д.), соли щелочноземельных металлов (например, кальциевая соль, магниевая соль и т.д.), соли неорганических оснований, такие как аммониевая соль, карбонаты щелочных металлов (например, карбонат лития, карбонат калия, карбонат натрия, карбонат цезия и т.д.), гидрокарбонаты щелочных металлов (например, гидрокарбонат лития, гидрокарбонат натрия, бикарбонат калия и т.д.), гидроксиды щелочных металлов (например, гидроксид лития, гидроксид натрия, гидроксид калия, гидроксид цезия и т.д.); например, соли органических оснований, таких как три(низший)алкиламин (например, триметиламин, триэтиламин, N-этилдиизопропиламин), пиридин, хинолин, пиперидин, имидазол, пиколин, диметиламинопиридин, диметиланилин, N-(низший)алкилморфолин (например, N-метилморфолин), 1,5-диазабицикло[4.3.0]нонен-5 (DBN), 1,8-диазабицикло[5.4.0]ундецен-7 (DBU), 1,4-диазабицикло[2.2.2]октан (DABCO); соли неорганических кислот, такие как гидрохлорид, гидробромид, гидроиодид, сульфат, нитрат, фосфат; соли органических кислот, такие как формиат, ацетат, пропионат, оксалат, малонат, сукцинат, фумарат, малеат, лактат, малат, цитрат, тартрат, карбонат, пикрат, метансульфонат, этансульфонат, п-толуолсульфонат, глутамат.

Кроме того, каждая из общих формул включает соединения в форме сольвата

(например, гидрата, этанолята и т.д.) исходных соединений и целевого соединения, показанных на каждой из схем реакций. В качестве предпочтительного сольвата можно назвать гидрат.

5 Каждое из целевых соединений, полученное по каждой из схем реакций, может быть выделено из реакционной смеси и очищено, например, подверганием реакционной смеси после ее охлаждения операции выделения, такой как
фильтрование, концентрирование и экстрагирование, для отделения неочищенного
10 продукта реакции с последующей операцией традиционной очистки, такой как колоночная хроматография и перекристаллизация.

Соединение по настоящему изобретению, представленное общей формулой (1), разумеется, охватывает изомеры, такие как геометрический изомер, стереоизомер и энантиомер.

15 Соединение и его соль, представленные общей формулой (1), могут быть использованы в форме обычной фармацевтической композиции. Композиция может быть получена путем использования разбавителя или эксципиента, такого как наполнитель, сухой разбавитель, связывающее вещество, увлажнитель, разрыхлитель, поверхностно-активное вещество и смазывающее вещество. В
20 качестве фармацевтической композиции могут быть выбраны различные формы в зависимости от терапевтического назначения. Типичные формы включают таблетку, пилюлю, порошок, жидкость, суспензию, эмульсию, гранулу, капсулу, суппозиторий и инъекционную форму (жидкость, суспензию).

25 При формировании таблетки могут быть использованы самые разные типы традиционных носителей, известных в данной области техники. Примеры носителя, который можно использовать, включают эксципиент, такой как лактоза, сахароза, хлорид натрия, глюкоза, мочевины, крахмал, карбонат кальция, каолин, кристаллическая целлюлоза и силикат; связывающее вещество, такое как вода,
30 этанол, пропанол, простой сироп, раствор глюкозы, раствор крахмала, раствор желатина, карбоксиметилцеллюлоза, шеллак, метилцеллюлоза, фосфат калия и поливинилпирролидин; разрыхлитель, такой как высушенный крахмал, альгинат натрия, порошкообразный агар, порошкообразный ламинаран, гидрокарбонат натрия, карбонат кальция, полиоксиэтиленсорбитановый эфир жирной кислоты,
35 лаурилсульфат натрия, моноглицерид стеариновой кислоты, крахмал и лактоза; подавитель распада, такой как сахароза, стеарин, масло какао и гидрогенизированное масло; вещество, способствующее абсорбции, такое как четвертичное аммониевое основание и лаурилсульфат натрия; увлажнитель, такой
40 как глицерин и крахмал; адсорбирующее вещество, такое как крахмал, лактоза, каолин, бентонит и коллоидальный диоксид кремния; и смазывающее вещество, такое как рафинированный тальк, стеарат, порошкообразная борная кислота и полиэтиленгликоль. Кроме того, если это необходимо, таблетка может быть
45 покрыта обычной пленкой. Примеры такой таблетки с покрытием включают таблетку с сахарным покрытием, таблетку с желатиновой оболочкой, таблетку с энтеросолнубильным покрытием, таблетку с пленочным покрытием или таблетку с двухслойным покрытием и таблетку с многослойным покрытием.

50 При формировании пилюли могут быть использованы самые разные типы традиционных носителей, известных в данной области техники. Примеры носителя, который можно использовать, включают эксципиент, такой как глюкоза, лактоза, крахмал, масло какао, отвержденное растительное масло, каолин и тальк; связывающее вещество, такое как порошкообразная аравийская камедь,

порошкообразный трагакант, желатин и этанол; и разрыхлитель, такой как ламинаран и агар.

При формировании суппозитория могут быть использованы самые разные типы традиционных носителей, известных в данной области техники. Примеры носителя, который можно использовать, включают полиэтиленгликоль, масло какао, высший спирт, сложные эфиры высшего спирта, желатин и полусинтетический глицерид.

Капсулу обычно изготавливают смешиванием традиционным способом соединения, служащего активным компонентом, с носителем, указанным выше, и помещением смеси в твердую желатиновую капсулу или мягкую капсулу.

При изготовлении инъекционной формы жидкое вещество, эмульсию и суспензию предпочтительно стерилизуют и делают изотоническими с кровью. При их изготовлении в виде инъекционной формы может быть использован любой разбавитель, обычно используемый в качестве разбавителя в данной области.

Примеры разбавителя, который можно использовать, включают воду, этиловый спирт, макрогол, пропиленгликоль, этоксилированный изостеариловый спирт, полиоксилированный изостеариловый спирт, полиоксиэтиленсорбитановые эфиры жирных кислот.

Следует отметить, что в данном случае фармацевтическая композиция может содержать соль, глюкозу или глицерин в количестве, достаточном для получения изотонического раствора. В соответствии с альтернативным вариантом можно добавлять обычный вспомогательный солибулизатор, буферный раствор, успокаивающее средство. Кроме того, к фармацевтической композиции можно при необходимости добавлять краситель, консервант, отдушку, корригент, подсластитель и другие медицинские вещества.

Количество соединения общей формулы (1) и его соли в фармацевтической композиции по настоящему изобретению особо не ограничивают, и оно может быть выбрано из широких пределов, но обычно составляет примерно 1-70% мас., предпочтительно примерно 1-30% мас. препарата.

Способ введения фармацевтической композиции по настоящему изобретению особо не ограничивают и выбирают его в соответствии с формой препарата, возрастом, полом и другими признаками пациента и тяжестью заболевания.

Например, в случае таблетки, пилюли, жидкого вещества, суспензии, эмульсии, гранулы и капсулы его вводят перорально. Кроме того, в случае инъекционной формы ее вводят внутривенно как таковую или в смеси с обычным наполнителем, таким как глюкоза и аминокислоты, а если это необходимо, его вводят в отдельности внутримышечно, внутрикожно, подкожно или внутривентально. В случае суппозитория его вводят в прямую кишку.

Дозу фармацевтической композиции по настоящему изобретению выбирают в зависимости от схемы приема (инструкция по применению), возраста, пола и других признаков пациента и тяжести заболевания и т.д., однако обычно и предпочтительно доза соединения, служащего в качестве активного компонента, может быть установлена в интервале примерно 0,1-10 мг/масса (кг) в сутки. Является желательным, чтобы содержание активного компонента находилось в интервале примерно 1-200 мг на стандартную лекарственную форму.

Преимущества изобретения

Соединение по настоящему изобретению обладает эффектом частичного агониста D₂ рецепторов, эффектом антагониста 5-HT_{2A} рецепторов и эффектом ингибирования поглощения серотонина.

Эффект частичного агониста D₂ рецепторов относится к действию, которое замедляет допаминергическую (DA) нейротрансмиссию, когда оно усиливается, и ускоряет допаминергическую (DA) нейротрансмиссию, когда слабеет. Таким образом, частичный агонист D₂ рецепторов действует как стабилизатор допаминовой системы, который стабилизирует DA нейротрансмиссию в нормальном состоянии. Благодаря данному эффекту соединение по настоящему изобретению оказывает превосходный эффект клинического улучшения на симптомы, вызванные аномальной DA нейротрансмиссией (ускорением или замедлением), без проявления побочных эффектов. В качестве превосходного эффекта клинического улучшения можно назвать эффекты улучшения положительных и отрицательных симптомов, когнитивного нарушения и депрессивного симптома (см. Michio Toru, Psychiatry, Vol. 46, page 855-864 (2004); Tetsuro Kikuchi and Hirose Takeshi, Brain Science, vol. 25, page 579-583 (2004); и Harrison, T.S. and Perry, C.M.: Drugs 64: 1715-1736, 2004).

Эффект антагониста 5-HT_{2A} рецепторов относится к действию, которое уменьшает экстрапирамидальные побочные эффекты и обнаруживает превосходную клиническую реакцию и, в частности, эффективно работает по улучшению отрицательных симптомов, когнитивного нарушения, депрессивного симптома и бессонницы (см. Jun Ishigooka and Ken Inada: Japanese Journal of Clinical Psychopharmacology, vol. 4, page 1653-1664 (2001); Mitsukuni Murasaki: Japanese Journal of Clinical Psychopharmacology, vol. 1, page 5-22 (1998), и Meltzer, H.Y. et al.: Prog. Neuro-Psychopharmacol. Biol. Psychiatry 27: 1159-1172, 2003).

Эффект ингибирования поглощения серотонина, например, полезен в улучшении депрессивных симптомов (см. Mitsukuni Murasaki: Japanese Journal of Clinical Psychopharmacology, vol. 1, page 5-22 (1998)).

Соединение по настоящему изобретению превосходно по всем трем указанным эффектам и особенно по одному или двум из них.

Кроме того, некоторые соединения по настоящему изобретению, кроме указанных выше эффектов, обладают эффектом антагониста α_1 рецепторов. Эффект антагониста α_1 рецепторов полезен в улучшении положительных симптомов шизофрении (см. Svensson, T.H.: Prog. Neuro-Psychopharmacol. Biol. Psychiatry 27: 1145-1158, 2003).

Таким образом, соединение по настоящему изобретению обладает широким лечебным спектром по отношению к шизофрении и другому расстройству центральной нервной системы и дает превосходную клиническую реакцию.

Следовательно, соединение по настоящему изобретению очень полезно для улучшения состояния при различных видах расстройств центральной нервной системы, таких как шизофрения; резистентная, трудноизлечимая или хроническая шизофрения; эмоциональное расстройство; психотическое расстройство; расстройство настроения; биполярное расстройство (например, биполярное расстройство I типа и биполярное расстройство II типа); депрессия; эндогенная депрессия; классическая депрессия; меланхолическая и резистентная депрессия; дистимическое расстройство; циклотимическое расстройство; тревожное расстройство (например, паническая атака; паническое расстройство; агорафобия; социальная фобия; обсессивно-компульсивное расстройство; посттравматическое стрессовое расстройство; расстройство генерализованной тревоги и острое стрессовое расстройство); соматоформное расстройство (например, истерия; соматизированное расстройство; конверсивное расстройство; болевое расстройство и ипохондрия); искусственное расстройство; диссоциативное расстройство;

сексуальное расстройство (например, сексуальная дисфункция; расстройство полового влечения; расстройство полового возбуждения и эректильная дисфункция); расстройство, связанное с едой (например, нервно-психическая анорексия и нервно-психическая булимия); расстройство сна; регулируемое расстройство; расстройство, связанное с избыточным употреблением веществ (например, злоупотребление алкоголем; алкогольная интоксикация; лекарственная аддикция; интоксикации стимуляторами и наркомания); ангедония (например, ятрогенная ангедония, ангедония психического или ментального происхождения; ангедония, связанная с депрессией, и ангедония, связанная с шизофренией); делирий; когнитивное расстройство; когнитивное расстройство, связанное с болезнью Альцгеймера, болезнью Паркинсона и другими нейродегенеративными заболеваниями; когнитивное расстройство, вызванное болезнью Альцгеймера, болезнью Паркинсона и сопутствующими нейродегенеративными заболеваниями; когнитивное расстройство из-за шизофрении; когнитивное расстройство, вызванное резистентной, трудноизлечимой или хронической шизофренией; рвота; болезнь движения; ожирение; мигрень; боль (в том числе продолжительная, тупая); задержка умственного развития; аутичное расстройство (аутизм); болезнь Туретта; расстройство, выражающееся в тике; расстройство, проявляющееся в дефиците внимания и гиперактивности; кондуктивное расстройство и синдрома Дауна.

Кроме того, соединение по настоящему изобретению проявляет незначительные побочные эффекты и превосходно по толерантности и безопасности.

Исходные соединения, используемые в каждой из описанных выше схем реакций, могут представлять собой подходящую соль, и каждое целевое соединение, полученное в результате каждой реакции, может образовывать подходящую соль. Такие подходящие соли включают предпочтительные соли соединения (1), примеры которых приведены ниже.

Предпочтительные соли соединения (1) являются фармакологически приемлемыми солями, и примеры их включают соли металлов, такие как соли щелочных металлов (например, натриевая соль, калиевая соль и т.д.), соли щелочноземельных металлов (например, кальциевая соль, магниевая соль и т.д.), соли неорганических оснований, такие как аммониевая соль, карбонаты щелочных металлов (например, карбонат лития, карбонат калия, карбонат натрия, карбонат цезия и т.д.), гидрокарбонаты щелочных металлов (например, гидрокарбонат лития, гидрокарбонат натрия, бикарбонат калия и т.д.), гидроксиды щелочных металлов (например, гидроксид лития, гидроксид натрия, гидроксид калия, гидроксид цезия и т.д.); например, соли органических оснований, таких как три(низший)алкиламин (например, триметиламин, триэтиламин, N-этилдиизопропиламин), пиридин, хинолин, пиперидин, имидазол, пиколин, диметиламинопиридин, диметиланилин, N-(низший)алкилморфолин (например, N-метилморфолин), 1,5-диазабицикло[4.3.0]нонен-5 (DBN), 1,8-диазабицикло[5.4.0]ундецен-7 (DBU), 1,4-диазабицикло[2.2.2]октан (DABCO); соли неорганических кислот, такие как гидрохлорид, гидробромид, гидроиодид, сульфат, нитрат, фосфат; соли органических кислот, такие как формиат, ацетат, пропионат, оксалат, малонат, сукцинат, фумарат, малеат, лактат, малат, цитрат, тартрат, карбонат, пикрат, метансульфонат, этансульфонат, п-толуолсульфонат, глутамат.

Кроме того, каждая из общих формул включает соединения в форме сольвата (например, гидрата, этанолата и т.д.) исходных соединений и целевого соединения, показанных на каждой из схем реакций. В качестве предпочтительного сольвата

можно назвать гидрат.

Каждое из целевых соединений, полученное по каждой из схем реакций, может быть выделено из реакционной смеси и очищено, например, подверганием реакционной смеси после ее охлаждения операции выделения, такой как
 5 фильтрование, концентрирование и экстрагирование, для отделения неочищенного продукта реакции с последующей операцией традиционной очистки, такой как колоночная хроматография и перекристаллизация.

Соединение по настоящему изобретению, представленное общей формулой (1),
 10 разумеется, охватывает изомеры, такие как геометрический изомер, стереоизомер и энантиомер.

Соединение общей формулы (1) и его соль могут быть использованы в форме обычной фармацевтической композиции. Фармацевтическую композицию получают, используя обычно применяемый разбавитель или эксципиент, такой как
 15 наполнитель, сухой разбавитель, связывающее вещество, увлажнитель, разрыхлитель, поверхностно-активное вещество и смазывающее вещество. В качестве фармацевтической композиции могут быть выбраны различные формы в зависимости от терапевтического назначения, и типичные их примеры включают
 20 таблетку, пилюлю, порошок, раствор, суспензию, эмульсию, гранулу, капсулу, суппозиторий и инъекционную форму (раствор, суспензию).

Для формования в форме таблетки могут быть широко использованы традиционные материалы, хорошо известные в качестве носителя в данной области техники. В качестве примеров можно назвать, например, эксципиент, такой как
 25 лактоза, сахароза, хлорид натрия, глюкоза, мочеви́на, крахмал, карбонат кальция, каолин, кристаллическая целлюлоза, силикат; связывающее вещество, такое как вода, этанол, пропанол, простой сироп, раствор глюкозы, раствор крахмала, раствор желатина, карбоксиметилцеллюлоза, шеллак, метилцеллюлоза, фосфат
 30 калия, поливинилпирролидон; разрыхлитель, такой как высушенный крахмал, альгинат натрия, порошкообразный агар, порошкообразный ламинаран, гидрокарбонат натрия, карбонат кальция, полиоксиэтиленсорбитановый эфир жирной кислоты, лаурилсульфат натрия, моноглицерид стеариновой кислоты, крахмал, лактоза; вещество, препятствующее распаду, такое как сахароза, стеарин,
 35 масло какао, гидрогенизированное масло; вещество, способствующее абсорбции, такое как четвертичное аммониевое основание, лаурилсульфат натрия; увлажняющее вещество, такое как глицерин, крахмал; абсорбирующее вещество, такое, как крахмал, лактоза, каолин, бентонит, коллоидальный диоксид кремния;
 40 смазывающее вещество, такое как очищенный тальк, стеарат, порошкообразный борат, полиэтиленгликоль. Кроме того, при необходимости таблетка может представлять собой таблетку, снабженную традиционным покрытием, например таблетку с сахарным покрытием, таблетку с желатиновой оболочкой, таблетку с энтеросолнубильным покрытием, таблетку с пленочным покрытием или
 45 двухслойную или многослойную таблетку.

Для формования в форме пилюли могут быть широко использованы традиционные материалы, хорошо известные в качестве носителя в данной области техники. В качестве примеров можно назвать, например, эксципиент, такой как
 50 глюкоза, лактоза, крахмал, масло какао, гидрогенизированное растительное масло, каолин, тальк; связывающее вещество, такое как порошкообразная аравийская камедь, порошкообразный трагакант, желатин, этанол; разрыхлитель, такой как ламинаран, агар.

Для формования в форме суппозитория могут быть широко использованы традиционные материалы, хорошо известные в качестве носителя в данной области техники. Примеры их включают полиэтиленгликоль, масло какао, высший спирт, сложные эфиры высшего спирта, желатин, полусинтетический глицерид.

Капсулу обычно изготавливают традиционным способом смешиванием соединений, служащих в качестве активных компонентов, с различными носителями, примеры которых указаны выше, и помещением смеси в твердую желатиновую капсулу, мягкую капсулу или тому подобное.

При изготовлении в форме инъекционной жидкой препаративной формы является предпочтительным раствор, эмульсию и суспензию стерилизовать и делать их изотоническими по отношению к крови, причем для их изготовления в указанной форме можно использовать любой разбавитель, обычно используемый в качестве разбавителя в данной области, например воду, этиловый спирт, макрогол, пропиленгликоль, этоксилированный изостеариловый спирт, полиоксилированный изостеариловый спирт, полиоксиэтиленсорбитановый эфир жирной кислоты и т.д.

Фармацевтическая композиция в данном случае может содержать обычную соль, глюкозу или глицерин в количестве, достаточном для получения изотонического раствора, причем можно также добавлять обычный солюбилизатор, буферный раствор, успокаивающее средство. Кроме того, можно при необходимости добавлять краситель, консервант, отдушку, корригент, подсластитель и другие фармацевтические вещества.

Количество соединения общей формулы (1) или его соли в фармацевтической композиции по настоящему изобретению особо не ограничивают, но подходящим является его содержание в композиции, составляющее обычно примерно 1-70% по массе, предпочтительно примерно 1-30% по массе.

Нет ограничения, в частности, и в способе введения фармацевтической композиции по настоящему изобретению, который может быть введен способом, соответствующим конкретной форме композиции, возрасту, полу и другим признакам пациента, тяжести заболевания и т.д. Например, в случае таблетки, пилюли, раствора, суспензии, эмульсии, гранулы и капсулы его вводят перорально. В случае инъекционной препаративной формы ее вводят внутривенно в отдельности или в смеси с обычным наполнителем, таким как глюкоза и аминокислоты, а если это необходимо, его можно также вводить в отдельности внутримышечно, внутрикожно, подкожно или внутривентально. В случае суппозитория его вводят в прямую кишку.

Подходящую дозу фармацевтической композиции по настоящему изобретению выбирают в соответствии со схемой приема, возрастом, полом и другими признаками пациента, тяжестью заболевания и т.д., однако обычно является подходящим, чтобы количество соединения, служащего в качестве активного компонента, составляло примерно 0,1-10 мг на 1 кг массы тела в сутки. Кроме того, является желательным, чтобы содержание активного компонента в стандартной лекарственной форме находилось в интервале примерно 1-200 мг.

Соединение по настоящему изобретению обладает эффектом частичного агониста D_2 рецепторов, эффектом антагониста $5-HT_{2A}$ рецепторов и эффектом ингибирования поглощения серотонина (или эффектом ингибирования обратного захвата серотонина).

Эффект частичного агониста D_2 рецепторов подавляет допаминергическую (DA) нейротрансмиссию, когда он усиливается, и ускоряет допаминергическую (DA)

нейротрансмиссию, когда слабеет, и, таким образом, стабилизирует DA нейротрансмиссию в нормальном состоянии (стабилизатор допаминовой системы). В соответствии с указанным действием проявляется превосходный эффект клинического улучшения на состояния, основанные на аномальной DA нейротрансмиссии (усиление и ослабление), например, эффект улучшения на положительные и отрицательные симптомы, эффект улучшения на когнитивное нарушение, эффект улучшения на депрессивный симптом и т.д., без проявления побочных эффектов (см. Michio Toru: Seishin-Igaku (Psychiatry), Vol. 46, pp. 855-864 (2004), Tetsuro Kikuchi и Tsuyoshi Hirose: Nou-no-Kagaku (Brain Science), Vol. 25, pp. 579-583 (2003) и Harrison, T.S. и Perry, C.M.: Drugs 64: 1715-1736, 2004).

Эффект антагониста 5-HT_{2A} рецепторов уменьшает экстрапирамидальные побочные эффекты, проявляет превосходные клинические эффекты и полезен, например, для улучшения отрицательных симптомов, улучшения когнитивного нарушения, улучшения депрессивного состояния, улучшения бессонницы (см. Jun Ishigooka и Ken Inada: Rinsho-Seishin-Yakuri (Japanese Journal of Clinical Psychopharmacology), Vol. 4, pp. 1653-1664 (2001), Mitsukuni Murasaki: Rinsho-Seishin-Yakuri (Japanese Journal of Clinical Psychopharmacology), Vol. 1, pp. 5-22 (1998), Puller, I.A. et al., Eur. J. Pharmacol., 407: 39-46, 2000, и Meltzer, H.Y. et al., Prog. Neuro-Psychopharmacol. Biol. Psychiatry 27: 1159-1172, 2003).

Эффект ингибирования поглощения серотонина (или эффект ингибирования обратного захвата серотонина) полезен, например, в улучшении депрессивных симптомов (см. Mitsukuni Murasaki: Rinsho-Seishin-Yakuri (Japanese Journal of Clinical Psychopharmacology), Vol. 1, pp. 5-22 (1998)).

Соединения по настоящему изобретению превосходны по всем трем указанным эффектам или особенно превосходны по одному или двум из них.

Кроме того, некоторые соединения по настоящему изобретению, кроме указанных выше эффектов, обладают эффектом антагониста α_1 рецепторов. Эффект антагониста α_1 рецепторов полезен в улучшении положительных симптомов шизофрении (см. Svensson, T. H.: Prog. Neuro-Psychopharmacol. Biol. Psychiatry 27: 1145-1158, 2003).

Таким образом, соединения по настоящему изобретению обладают широким лечебным спектром и превосходным клиническим эффектом по отношению к шизофрении и другим расстройствам центральной нервной системы.

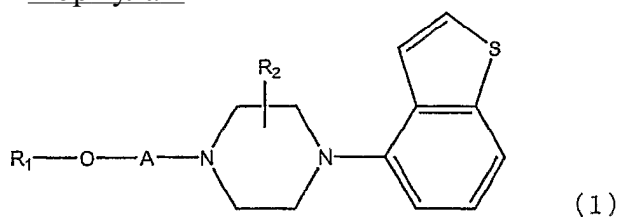
Следовательно, соединения по настоящему изобретению очень полезны для лечения или предотвращения расстройств, включающих группу, состоящую из шизофрении; резистентной, трудноизлечимой или хронической шизофрении; эмоционального расстройства; психотического расстройства; расстройства настроения; биполярного расстройства (например, биполярного расстройства I типа и биполярного расстройства II типа); депрессии; эндогенной депрессии; классической депрессии; меланхолической и резистентной депрессии; дистимического расстройства; циклотимического расстройства; тревожного расстройства (например, панической атаки; панического расстройства; агорафобии; социальной фобии; обсессивно-компульсивного расстройства; посттравматического стрессового расстройства; расстройства генерализованной тревоги, острого стрессового расстройства и т.д.); соматоформного расстройства (например, истерии; соматизированного расстройства; конверсивного расстройства; болевого расстройства, ипохондрии и т.д.); искусственного расстройства; диссоциативного расстройства; сексуального расстройства (например, сексуальной дисфункции;

расстройства полового влечения; расстройства полового возбуждения, эректильной дисфункции и т.д.); расстройства, связанного с едой (например, нервно-психической анорексии, нервно-психической булимии и т.д.); расстройства сна; регулируемого расстройства; расстройства, связанного с избыточным употреблением веществ (например, злоупотребления алкоголем; алкогольной интоксикации; лекарственной аддикции; интоксикации стимуляторами, наркомании и т.д.); ангедонии (например, ятрогенной ангедонии, ангедонии психического или ментального происхождения; ангедонии, связанной с депрессией, ангедонии, связанной с шизофренией, и т.д.); делирия; когнитивного расстройства; когнитивного расстройства, связанного с болезнью Альцгеймера, болезнью Паркинсона и другими нейродегенеративными заболеваниями; когнитивного расстройства, вызванного болезнью Альцгеймера, болезнью Паркинсона и сопутствующими нейродегенеративными заболеваниями; когнитивного расстройства из-за шизофрении; когнитивного расстройства, вызванного резистентной, трудноизлечимой или хронической шизофренией; рвоты; болезни движения; ожирения; мигрени; боли (в том числе продолжительной, тупой); задержки умственного развития; аутичного расстройства (аутизма); болезни Туретта; расстройства, выражающегося в тике; расстройства, проявляющегося в дефиците внимания и гиперактивности; кондуктивного расстройства и синдрома Дауна.

Кроме того, соединения по настоящему изобретению проявляют незначительные побочные эффекты или не проявляют их и превосходны по безопасности и толерантности.

Предпочтительным примером требуемого соединения (1) является следующее соединение:

Формула 1



где R^2 представляет собой атом водорода или низшую алкильную группу; А представляет собой низшую алкиленовую группу или низшую алкениленовую группу (предпочтительно низшую алкиленовую группу); и

R^1 представляет собой цикло(C_3 - C_8)алкильную группу, ароматическую группу или гетероциклическую группу, выбранную из группы, состоящей из групп (I)-(IV), указанных ниже:

(I) цикло(C_3 - C_8)алкильная группа (более предпочтительно циклогексильная группа);

(II) ароматическая группа, выбранная из фенильной группы, нафтильной группы, дигидроинденильной группы и тетрагидронафтильной группы (более предпочтительно фенильная группа);

(III) насыщенная или ненасыщенная гетеромоноциклическая группа, содержащая 1-4 гетероатома, выбранных из группы, состоящей из атома азота, атома кислорода и атома серы, и выбранная из группы, состоящей из пирролидинильной группы, имидазолидинильной группы, пиперидильной группы, гексагидропиримидинильной группы, пиперазинильной группы, азепанильной группы, азоканильной группы, пирролильной группы, дигидропирролильной

группы, имидазолильной группы, дигидроимидазолильной группы, триазолильной группы, дигидротриазолильной группы, пиразолильной группы, пиридилльной группы, дигидропиридилльной группы, пиримидинильной группы, дигидропиримидинильной группы, пиразинильной группы, дигидропиразинильной группы, пиридазинильной группы, тетразолильной группы, оксазолильной группы, изоксазолильной группы, оксадиазолильной группы, оксазолидинильной группы, изоксазолидинильной группы, морфолинийной группы, тиазолильной группы, дигидротиазолильной группы, изотиазолильной группы, тиадиазолильной группы, дигидротиазинильной группы, тиазолидинильной группы, тетрагидрофурильной группы, тетрагидропиранильной группы, пиранильной группы, тетрагидротифурильной группы, тетрагидротипиранильной группы, тиенильной группы и тиопиранильной группы (более предпочтительно насыщенная или ненасыщенная гетеромоноциклическая группа, содержащая 1-2 гетероатома, выбранных из группы, состоящей из атома азота, атома кислорода и атома серы, и выбранная из группы, состоящей из пирролидинильной группы, пиперидильной группы, пиразолильной группы, пиридилльной группы, пиримидинильной группы, пиразинильной группы, изоксазолильной группы, тиазолильной группы, пиранильной группы и тиенильной группы; и более предпочтительно насыщенная или ненасыщенная гетеромоноциклическая группа, содержащая 1-2 атома азота, выбранная из группы, состоящей из пирролидинильной группы, пиперидильной группы, пиразолильной группы, пиридилльной группы, пиримидинильной группы и тиазолильной группы); и

(IV) конденсированная с бензолом гетероциклическая группа, которая содержит 1-4 гетероатома, выбранных из группы, состоящей из атома азота, атома кислорода и атома серы, и которая выбрана из группы, состоящей из (1) тетрагидрохиноксалинильной группы, (2) тетрагидрохиназолинийной группы, (3) дигидрохиназолинийной группы, (4) индолинийной группы, (5) индолинийной группы, (6) изоиндолинийной группы, (7) бензимидазолинийной группы, (8) дигидробензимидазолинийной группы, (9) тетрагидробензазепинильной группы, (10) тетрагидробензодиазепинильной группы, (11) гексагидробензазоцинийной группы, (12) дигидробензоксазинильной группы, (13) дигидробензоксазолинийной группы, (14) бензизоксазолинийной группы, (15) бензоксадиазолинийной группы, (16) тетрагидробензоксазепинильной группы, (17) дигидробензотиазинильной группы, (18) бензотиазолинийной группы, (19) бензоксатиолинийной группы, (20) хроменильной группы, (21) дигидробензофурильной группы, (22) карбазолинийной группы, (23) дибензофурильной группы и (24) хиноксалинийной группы,

причем в качестве заместителя в цикло(C₃-C₈)алкильной группе, ароматической группе и гетероциклической группе, представленными символом R¹, могут присутствовать 1-5 (более предпочтительно 1-3) групп, выбранных из группы, состоящей из групп (1)-(66), определенных ниже:

- (1) низшая алкильная группа,
- (2) низшая алкенильная группа,
- (3) галогензамещенная низшая алкильная группа,
- (4) низшая алкоксигруппа,
- (5) феноксигруппа,
- (6) низшая алкилтиогруппа,
- (7) галогензамещенная низшая алкоксигруппа,
- (8) гидроксигруппа,

- (9) фенил(низшая)алкоксигруппа,
 (10) гидроксид(низшая)алкильная группа,
 (11) низшая алкоксид(низшая)алкильная группа,
 (12) атом галогена,
 (13) цианогруппа,
 (14) фенильная группа,
 (15) нитрогруппа,
 (16) аминогруппа,
 (17) аминогруппа, содержащая в качестве заместителя(ей) 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алканойльной группы, низшей алкоксикарбонильной группы, низшей алкилсульфонильной группы, карбамоильной группы, низшей алкилкарбамоильной группы, аминод(низшей)алканойльной группы, низшей алканойламинод(низшей)алканойльной группы и низшей алкоксикарбониламинод(низшей)алканойльной группы (более предпочтительно N-(низшая)алкиламиногруппа, N,N-ди(низшая)алкиламиногруппа, N-(низшая)алканойламиногруппа, N-(низшая)алкоксикарбониламиногруппа, N-(низшая)алкилсульфониламиногруппа, N-(низшая)алкил-N-(низшая)алканойламиногруппа, N-(низшая)алкил-N-(низшая)алкоксикарбониламиногруппа, N-[карбамоил]аминогруппа, N-[N-(низшая)алкилкарбамоил]аминогруппа, N-[N,N-ди(низшая)алкилкарбамоил]аминогруппа, N-[аминод(низшая)алканойл]аминогруппа, N-[[N-(низшая)алканойламинод(низшая)алканойл]аминогруппа или N-[[N-(низшая)алкоксикарбониламинод(низшая)алканойл]аминогруппа),
 (18) низшая алканойльная группа,
 (19) фенилсульфонильная группа, которая может содержать низшую алкильную группу в фенильной группе (более предпочтительно низшая алкилфенилсульфонильная группа),
 (20) карбоксигруппа,
 (21) низшая алкоксикарбонильная группа,
 (22) карбоксид(низшая)алкильная группа,
 (23) низшая алкоксикарбонил(низшая)алкильная группа,
 (24) низшая алканойламинод(низшая)алканойльная группа,
 (25) карбоксид(низшая)алкенильная группа,
 (26) низшая алкоксикарбонил(низшая)алкенильная группа,
 (27) карбамоил(низшая)алкенильная группа, которая может содержать в качестве заместителя(ей) 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы и низшей алкильной группы, замещенной 1-3 атомами галогена (более предпочтительно карбамоил(низшая)алкенильная группа, N-(низшая)алкилкарбамоил(низшая)алкенильная группа, N,N-ди(низшая)алкилкарбамоил(низшая)алкенильная группа или N-[(низший)алкил, замещенный 1-3 атомами галогена]карбамоил(низший)алкенил),
 (28) карбамоильная группа, которая может содержать в качестве заместителя(ей) 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из групп (i)-(lxxviii), определенных ниже:
 (i) низшая алкильная группа,
 (ii) низшая алкоксигруппа,
 (iii) гидроксид(низшая)алкильная группа,
 (iv) низшая алкоксид(низшая)алкильная группа,

(v) фенилокси(низшая)алкильная группа,

(vi) галогензамещенная низшая алкильная группа,

(vii) аминокс(низшая)алкильная группа, которая может содержать 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алканоильной группы, бензоильной группы и карбамоильной группы (более предпочтительно N,N-ди(низшая)алкиламино(низшая)алкильная группа, N-(низшая)алканоиламино(низшая)алкильная группа, N-(низшая)алкил-N-(низшая)алканоиламино(низшая)алкильная группа, N-(низшая)алкил-N-бензоиламино(низшая)алкильная группа или N-карбамоиламино(низшая)алкильная группа),

(viii) цикло(C₃-C₈)алкильная группа, которая может содержать 1-3 группы (предпочтительно 1-2 группы и более предпочтительно 1 группу), выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, гидроксигруппы, низшей алкоксикарбонильной группы и фенил(низшей)алкоксигруппы, в качестве заместителя,

(ix) цикло(C₃-C₈)алкилзамещенная низшая алкильная группа,

(x) низшая алкенильная группа,

(xi) низшая алкильная группа, содержащая 1-2 карбамоильных группы, которые могут содержать 1-2 группы (предпочтительно 1 группу), выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, фенильной группы, которая может содержать одну низшую алкильную группу, и фенильной группы, которая может содержать одну низшую алкоксигруппу, в качестве заместителя(ей) (более предпочтительно карбамоил(низшая)алкильная группа, дикарбамоил(низшая)алкильная группа, N-низшая алкилкарбамоил(низшая)алкильная группа, N,N-ди(низшая)алкилкарбамоил(низшая)алкильная группа, N-[(низшая)алкилфенил]карбамоил(низшая)алкильная группа или N-[(низшая)алкоксифенил]карбамоил(низшая)алкильная группа),

(xii) низшая алкильная группа, содержащая 1-2 низших алкоксикарбонильных группы,

(xiii) фурил(низшая)алкильная группа (которая может содержать 1-2 низших алкильных группы в качестве заместителя(ей) в фурильной группе),

(xiv) тетрагидрофурил(низшая)алкильная группа,

(xv) 1,3-диоксоланил(низшая)алкильная группа,

(xvi) тетрагидропиранил(низшая)алкильная группа,

(xvii) пирролил(низшая)алкильная группа (которая может содержать 1-2 низших алкильных группы в качестве заместителя(ей) в пирролильной группе),

(xviii) дигидропиразолил(низшая)алкильная группа, которая может содержать одну оксогруппу,

(xix) пиразолил(низшая)алкильная группа (которая может содержать 1-3 низших алкильных группы в качестве заместителя(ей) в пиразолильной группе),

(xx) имидазолил(низшая)алкильная группа,

(xxi) пиридил(низшая)алкильная группа,

(xxii) пиазинил(низшая)алкильная группа (которая может содержать 1-3 (предпочтительно 1) низших алкильных группы в качестве заместителя в пиазинильной группе),

(xxiii) пирролидинил(низшая)алкильная группа (которая может содержать 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из оксогруппы и низшей алкильной

группы, в качестве заместителя(ей) в пирролидинильной группе),

(xxiv) пиперидил(низшая)алкильная группа (которая может содержать 1-3 группы (предпочтительно 1 группу), выбранных из группы, состоящей из бензоильной группы и низшей алканоильной группы, в качестве заместителя(ей) в пиперидильной

группе),
(xxv) пиперазинил(низшая)алкильная группа (которая может содержать 1-3 (предпочтительно 1) низших алкильных группы в качестве заместителя(ей) в пиперазинильной группе),

(xxvi) морфолинил(низшая)алкильная группа,

(xxvii) тиенил(низшая)алкильная группа (которая может содержать 1-3 (предпочтительно 1) низших алкильных группы в качестве заместителя(ей) в тиенильной группе),

(xxviii) тиазолил(низшая)алкильная группа,

(xxix) дигидробензофурил(низшая)алкильная группа,

(xxx) бензопиранил(низшая)алкильная группа (которая может содержать одну оксогруппу в качестве заместителя в бензопиранильной группе),

(xxxi) бензимидазолил(низшая)алкильная группа,

(xxxii) индолил(низшая)алкильная группа, которая может содержать 1-3 (предпочтительно 1) низших алкоксикарбонильных группы в низшей алкильной группе),

(xxxiii) имидазолил(низшая)алкильная группа, которая содержит 1-3 заместителя (предпочтительно 1 заместитель), выбранных из группы, состоящей из карбамоильной группы и низшей алкоксикарбонильной группы, в низшей алкильной группе,

(xxxiv) пиридилная группа, которая может содержать 1-3 группы (предпочтительно 1 группу), выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алкоксигруппы и низшей алкилтио(низшей)алкильной группы, в качестве заместителя(ей),

(xxxv) пирролидинильная группа, которая может содержать 1-3 группы (предпочтительно 1 группу), выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алкоксикарбонильной группы, низшей алканоильной группы и бензоильной группы, в качестве заместителя,

(xxxvi) пиперидильная группа, которая может содержать 1-3 группы (предпочтительно 1 группу), выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алкоксикарбонильной группы, низшей алканоильной группы и бензоильной группы, которая может содержать 1-3 группы (предпочтительно 1 группу), выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы и атома галогена, в фенильной группе,

(xxxvii) тетрагидрофурильная группа, которая может содержать одну оксогруппу,

(xxxviii) гексагидроазепинильная группа, которая может содержать одну оксогруппу,

(xxxix) пиразолильная группа, которая может содержать 1-3 группы (предпочтительно 1 группу), выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, фенильной группы и фурильной группы, в качестве заместителя,

(xl) тиазолильная группа,

(xli) тиадиазолильная группа, которая может содержать 1-3 (предпочтительно 1) низших алкильных группы,

(xlii) изоксазолильная группа, которая может содержать 1-3 (предпочтительно 1-

- 2) низших алкильных группы,
 (xliii) индазолильная группа,
 (xliv) индолильная группа,
 (xlv) тетрагидробензотиазолильная группа,
 5 (xlvii) тетрагидрохинолильная группа, которая может содержать 1-3 (предпочтительно 1-2) группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алкоксигруппы, атома галогена и оксогруппы, в качестве заместителя,
 10 (xlviii) хинолильная группа, которая может содержать 1-3 (предпочтительно 1) низших алкильных группы,
 (xlviii) бензодиоксолил(низшая)алкильная группа,
 (xlix) фенильная группа или нафтильная группа, которая может содержать в качестве заместителя(ей) 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из
 15 атома галогена; низшей алкильной группы; низшей алкоксигруппы; галогензамещенной низшей алкильной группы; галогензамещенной низшей алкоксигруппы; низшей алкенильной группы; аминогруппы, которая может содержать 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алканоильной группы, низшей алкилсульфонильной группы, низшей алкильной группы и арильной группы; сульфамонильной группы; низшей алкилтиогруппы; низшей алканоильной группы; низшей алкоксикарбонильной группы; пирролильной группы; низшей алкинильной группы; цианогруппы; нитрогруппы; фенилоксигруппы;
 20 фенил(низшей)алкоксигруппы; гидроксигруппы; гидроксид(низшей)алкильной группы; карбамоильной группы, которая может содержать группу, выбранную из группы, состоящей из низшей алкильной группы и фенильной группы; пиразолильной группы; пирролидинильной группы, которая может содержать одну оксогруппу; оксазолильной группы; имидазолильной группы, которая может
 25 содержать 1-3 (предпочтительно 1-2) низших алкильных группы; дигидрофурильной группы, которая может содержать одну оксогруппу; тиазолидинил(низшей)алкильной группы, которая может содержать две оксогруппы; имидазолил(низшей)алканоильной группы и пиперидинилкарбонильной группы,
 30 (I) циано(низшая)алкильная группа,
 35 (li) дигидрохинолильная группа, которая может содержать 1-3 (более предпочтительно 1-2) группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы и оксогруппы,
 (lii) галогензамещенная низшая алкиламиногруппа,
 40 (liii) низшая алкилтио(низшая)алкильная группа,
 (liv) амидиногруппа, которая может содержать 1-2 низших алкильных группы,
 (lv) амидино(низшая)алкильная группа,
 (lvi) низшая алкенилокси(низшая)алкильная группа,
 (lvii) фениламиногруппа, которая может содержать 1-3 заместителя (более
 45 предпочтительно 1 заместитель), выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алкоксигруппы, галогензамещенной низшей алкильной группы и галогензамещенной низшей алкоксигруппы, в фенильной группе,
 (lviii) фенил(низшая)алкенильная группа,
 50 (lix) пиридиламиногруппа, которая может содержать 1-3 (более предпочтительно 1-2) низших алкильных группы (более предпочтительно N-(низшая)алкил-N-[(низшая)алкилпиридил]аминогруппа),
 (Ix) фенил(низшая)алкильная группа (которая может содержать 1-3 группы (более

предпочтительно 1-2 группы), выбранных из группы, состоящей из атома галогена, низшей алкильной группы, галогензамещенной низшей алкильной группы, галогензамещенной низшей алкоксигруппы, низшей алкоксигруппы, карбамоильной группы и низшей алкоксикарбонильной группы, в качестве заместителя в фенильной

группе и/или низшей алкильной группе),

(Ixi) низшая алкильная группа,

(Ixii) фенилокси(низшая)алкильная группа (которая может содержать в качестве заместителя(ей) в фенильной группе 1-3 группы (предпочтительно 1 группу),

выбранных из группы, состоящей из низшей алкоксигруппы, N-(низшей)алкокси-N-(низшей)алкилкарбамоильной группы и оксопирролидинильной группы),

(Ixiii) изоксазолидинильная группа, которая может содержать одну оксогруппу,

(Ixiv) дигидроинденильная группа,

(Ixv) фенил(низшая)алкокси(низшая)алкильная группа,

(Ixvi) тетрагидропиранильная группа,

(Ixvii) азетидинильная группа, которая может содержать 1-3 группы (более предпочтительно 1 группу), выбранных из группы, состоящей из низшей алканоильной группы и бензоильной группы,

(Ixviii) азетидинил(низшая)алкильная группа, которая может содержать 1-3 группы (более предпочтительно 1 группу), выбранных из группы, состоящей из низшей алканоильной группы и бензоильной группы,

(Ilix) тетразолильная группа,

(Ixx) индолинильная группа, которая может содержать одну оксогруппу,

(Ixxi) триазолильная группа, которая может содержать 1-3 группы (более предпочтительно 1-2 группы), выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы и низшей алкилтиогруппы,

(Ixxii) имидазолильная группа, которая может содержать 1-3 (более предпочтительно 1) карбамоильных группы,

(Ixxiii) оксазолильная группа, которая может содержать 1-3 (более предпочтительно 1) низших алкильных группы,

(Ixxiv) изотиазолильная группа, которая может содержать 1-3 (более предпочтительно 1) низших алкильных группы,

(Ixxv) бензимидазолильная группа,

(Ixxvi) дигидробензотиазолильная группа, которая может содержать одну оксогруппу,

(Ixxvii) тиенильная группа, которая может содержать 1-3 (более предпочтительно 1) низших алкоксикарбонильных группы, и

(Ixxviii) оксазолил(низшая)алкильная группа, которая может содержать 1-3 (более предпочтительно 1-2) низших алкильных группы,

(29) амино(низшая)алкильная группа, которая может содержать 1-2 группы,

выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, галогензамещенной

низшей алкильной группы, низшей алкоксикарбонильной группы, низшей алканоильной группы, фенильной группы, фенил(низшей)алкильной группы, бензоильной группы и аминзамещенной алкильной группы (которая может

содержать 1-2 (более предпочтительно 2) низших алкильных группы в качестве заместителя(ей) в аминогруппе) в аминогруппе,

(30) низшая алкильная группа, замещенная одной карбамоильной группой,

которая может содержать 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы и галогензамещенной низшей алкильной группы,

(31) тиокарбамоильная группа, которая может содержать 1-2 (более предпочтительно 1) низших алкильных группы,

(32) сульфамойльная группа,

(33) оксазолидинильная группа, которая может содержать одну оксогруппу (более предпочтительно оксазолидинильная группа, замещенная одной оксогруппой),

(34) имидазолидинильная группа, которая может содержать 1-2 заместителя, выбранных из группы, состоящей из оксогруппы и низшей алкильной группы,

(35) пирролидинильная группа, которая может содержать одну оксогруппу,

(36) имидазолильная группа,

(37) триазолильная группа,

(38) изоксазолильная группа,

(39) пиперидильная группа, которая может содержать 1-3 (более предпочтительно 1-2 и еще более предпочтительно 1) заместителя, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алканоильной группы, низшей алкилфенилсульфонильной группы, оксогруппы, гидроксигруппы и аминоксигруппы, которая может содержать 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алканоильной группы, низшей алкоксикарбонильной группы и низшей алканоиламино(низшей)алканоильной группы (более предпочтительно пиперидильная группа, которая может содержать 1-3 (более предпочтительно 1-2 и еще более предпочтительно 1) заместителя, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алканоильной группы, низшей алкилфенилсульфонильной группы, оксогруппы, гидроксигруппы, аминоксигруппы, N-(низшей)алкиламиногруппы, N,N-ди(низшей)алкиламиногруппы, N-(низшей)алканоиламиногруппы, N-(низшей)алкил-N-(низшей)алкоксикарбониламиногруппы, N-(низшей)алкил-N-(низшей)алканоиламиногруппы и N-(низшей)алканоиламино(низшей)алканоиламиногруппы),

(40) пиперидилкарбонильная группа, которая может содержать 1-3 (более предпочтительно 1-2) заместителя, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, гидроксигруппы, гидрокси(низшей)алкильной группы, низшей алканоильной группы, карбокси(низшей)алкильной группы, низшей алкилкарбамоил(низшей)алкильной группы, карбамоильной группы, низшей алкоксигруппы, карбоксигруппы, низшей алкоксикарбонильной группы, аминоксигруппы (в которой могут присутствовать 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алканоильной группы, низшей алкоксикарбонильной группы и бензоильной группы), пиперидильной группы (в которой могут присутствовать 1-3 группы (более предпочтительно 1 группа), выбранных из группы, состоящей из низшей алканоильной группы, низшей алкоксикарбонильной группы и бензоильной группы), пиперазинильной группы (в которой могут присутствовать 1-3 (более предпочтительно 1-2) низших алкильных группы в качестве заместителя), 1,4-диокса-8-азаспиро[4.5]децильной группы, морфолинийной группы, гексагидро-1,4-дiazепинильной группы (в которой может присутствовать в качестве заместителя одна низшая алкильная группа), пиридинильной группы, пиридилоксигруппы, пиридил(низшей)алкоксигруппы, тетрагидрохинолильной группы (в которой может присутствовать одна оксогруппа), бензодиоксолильной группы, фенил(низшей)алкоксигруппы (которая может содержать 1-3 группы (более предпочтительно 1-2 группы), выбранных из группы,

состоящей из атома галогена, низшей алкильной группы, низшей алкоксигруппы и галогензамещенной низшей алкоксигруппы, в фенильной группе), фенильной группы (в которой могут присутствовать 1-3 группы (предпочтительно 1-2 группы), выбранных из группы, состоящей из атома галогена, низшей алкоксигруппы и гидроксигруппы), фенилоксигруппы (которая может содержать в фенильной группе 1-3 группы (предпочтительно 1-2 группы), выбранных из группы, состоящей из цианогруппы, атома галогена, низшей алкильной группы, низшей алкоксигруппы и галогензамещенной низшей алкильной группы), фенил(низшей)алкильной группы (которая может содержать в фенильной группе 1-3 группы (более предпочтительно 1-2 группы), выбранных из группы, состоящей из атома галогена, низшей алкильной группы, низшей алкоксигруппы и галогензамещенной низшей алкильной группы), и бензоильной группы (которая может содержать в фенильной группе 1-3 группы (более предпочтительно 1-2 группы), выбранных из группы, состоящей из атома галогена и низшей алкоксигруппы),

(41) пирролидинилкарбонильная группа, которая может содержать в качестве заместителя 1-3 (более предпочтительно 1) группы, выбранных из группы, состоящей из гидроксиз(низшей)алкильной группы, карбамоильной группы, гидроксигруппы, аминогруппы (которая может содержать в аминогруппе 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алканоильной группы и бензоильной группы), морфолинил(низшей)алкильной группы, пирролидинил(низшей)алкильной группы, пиперидил(низшей)алкильной группы, пиперазинил(низшей)алкильной группы (которая может содержать одну низшую алкильную группу в качестве заместителя в пиперазинильной группе), аминоз(низшей)алкильной группы (которая может содержать 1-2 низших алкильных группы в качестве заместителя в аминогруппе), фенилоксигруппы (которая может содержать 1-3 (более предпочтительно 1) галогензамещенных низших алкоксигруппы в фенильной группе), фенилокси(низшей)алкильной группы (которая может содержать 1-3 (более предпочтительно 1) галогензамещенных низших алкоксигруппы в фенильной группе) и тетрагидрохинолильной группы (в которой может присутствовать оксогруппа),

(42) пиперазинилкарбонильная группа, которая может содержать в качестве заместителя 1-3 группы (более предпочтительно 1-2 группы), выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, цикло(C₃-C₈)алкильной группы, низшей алканоильной группы, гидроксиз(низшей)алкильной группы, низшей алкоксиз(низшей)алкильной группы, низшей алкоксикарбонильной группы, аминоз(низшей)алкильной группы (которая может содержать 1-2 низших алкильных группы в качестве заместителя в аминогруппе), пиперидил(низшей)алкильной группы (которая может содержать 1-2 (более предпочтительно 1) низших алкильных группы в качестве заместителя(ей) в пиперидильной группе), морфолинил(низшей)алкильной группы, пирролидинил(низшей)алкильной группы, 1,3-диоксоланил(низшей)алкильной группы, тетрагидрофурил(низшей)алкильной группы, пиридил(низшей)алкильной группы (которая может содержать 1-2 (более предпочтительно 1) фенильных группы в качестве заместителя(ей) в низшей алкильной группе), имидазолил(низшей)алкильной группы, фурил(низшей)алкильной группы, пирролидинилкарбонил(низшей)алкильной группы, пиперидильной группы, которая может содержать 1-2 (более предпочтительно 1) низших алкильных группы в качестве заместителя(ей), пиридильной группы (которая может содержать в пиридильной группе 1-3 группы (более предпочтительно 1 группу), выбранных из

группы, состоящей из низшей алкильной группы, цианогруппы и галогензамещенной низшей алкильной группы, в качестве заместителя), тиено[2,3-b]пиридинной группы, фенильной группы (в которой могут присутствовать 1-3 группы (более предпочтительно 1 группу), выбранных из группы, состоящей из атома галогена и низшей алкильной группы), бензоильной группы, фурилкарбонильной группы, фенил(низшей)алкоксикарбонильной группы и оксогруппы,

(43) гексагидроазепинилкарбонильная группа,

(44) гексагидро-1,4-дiazепинилкарбонильная группа, которая может содержать 1-3 заместителя (более предпочтительно 1 заместитель), выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы и пиридинной группы,

(45) дигидропирролилкарбонильная группа, которая может содержать 1-3 (более предпочтительно 1-2) низших алкильных группы,

(46) тиоморфолинилкарбонильная группа,

(47) морфолинилкарбонильная группа, которая может содержать 1-3 группы (более предпочтительно 1 группу), выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, пиперидил(низшей)алкильной группы и фенильной группы,

(48) тиазолидинилкарбонильная группа, которая может содержать 1-3 (более предпочтительно 1) фенильных группы, которые могут содержать 1-3 группы (более предпочтительно 1 группу), выбранных из группы, состоящей из низшей алкоксигруппы и цианогруппы,

(49) азабицикло[3.2.2]нонилкарбонильная группа,

(50) 8-азабицикло[3.2.1]октилкарбонильная группа, которая может содержать 1-3 (более предпочтительно 1) галогензамещенных или незамещенных фенилоксигруппы,

(51) индолинилкарбонильная группа,

(52) тетрагидрохинолилкарбонильная группа,

(53) тетрагидропиридо[3.4-b]индолилкарбонильная группа,

(54) морфолинил(низшая)алкильная группа,

(55) пиперазинил(низшая)алкильная группа, которая может содержать 1-3 (более предпочтительно 1) низших алкильных группы в пиперазинильной группе,

(56) морфолинилкарбонил(низшая)алкильная группа,

(57) пиперазинилкарбонил(низшая)алкильная группа, которая может содержать 1-3 (более предпочтительно 1) низших алкильных группы в пиперазинильной группе,

(58) оксогруппа,

(59) амино(низшая)алкоксигруппа (которая может содержать 1-2 (более предпочтительно 2) низших алкильных группы в аминогруппе),

(60) низшая алкокси(низшая)алкоксигруппа,

(61) пиперазинильная группа, которая может содержать 1-3 группы (более предпочтительно 1-2 группы), выбранных из группы, состоящей из оксогруппы, низшей алкильной группы, низшей алканоильной группы и низшей

алкоксикарбонильной группы (более предпочтительно пиперазинильная группа, замещенная одной оксогруппой, пиперазинильная группа, замещенная одной низшей алкильной группой, пиперазинильная группа, замещенная одной низшей алканоильной группой, пиперазинильная группа, замещенная одной оксогруппой и одной низшей алканоильной группой и пиперазинильная группа, замещенная одной оксогруппой и одной низшей алкоксикарбонильной группой),

(62) морфолинильная группа,

(63) 1,3,8-триазаспиро[4.5]деканилкарбонильная группа, которая может

содержать 1-3 группы (более предпочтительно 1-2 группы), выбранных из группы, состоящей из оксогруппы и фенильной группы,

(64) тетрагидропиридилкарбонильная группа, которая может содержать 1-3 (более предпочтительно 1) пиридилных группы,

(65) имидазолидинилкарбонильная группа, которая может содержать одну тиоксогруппу, и

(66) 1,4-диокса-8-азаспиро[4.5]деканильная группа.

В общей формуле (1) R^1 предпочтительно представляет собой циклогексильную группу, фенильную группу, пирролидинильную группу, пиперидильную группу, пиразолильную группу, пиридилную группу, пиримидинильную группу или тиазолильную группу. Цикл каждой группы предпочтительно является замещенным 1-3 группами, выбранными из группы, состоящей из

(1) низшей алкильной группы,

(4) низшей алкоксигруппы,

(10) гидроксизамещенной алкильной группы,

(17) аминогруппы, содержащей в качестве заместителя(ей) 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алканойльной группы, низшей алкоксикарбонильной группы, низшей алкилсульфонильной группы, карбамоильной группы, низшей алкилкарбамоильной группы, аминозамещенной алканойльной группы, низшей алканойламино(низшей)алканойльной группы и низшей алкоксикарбонилзамещенной алканойльной группы,

(21) низшей алкоксикарбонильной группы,

(28) карбамоильной группы, которая может содержать 1-2 заместителя, выбранных из группы, состоящей из групп (i), (ii), (iv), (xii) и (xxi), указанных ниже:

(i) низшая алкильная группа,

(ii) низшая алкоксигруппа,

(iv) низшая алкоксизамещенная алкильная группа,

(xii) низшая алкильная группа, содержащая 1-2 низших алкилкарбонильных группы,

(xxi) пиридилзамещенная алкильная группа,

(29) аминозамещенная алкильная группа, которая может содержать в аминогруппе 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, галогензамещенной низшей алкильной группы, низшей алкоксикарбонильной группы, низшей алканойльной группы, фенильной группы, фенилзамещенной алкильной группы, бензоильной группы и аминозамещенной алкильной группы (которая может содержать 1-2 низших алкильных группы в качестве заместителя(ей) в аминогруппе),

(30) низшей алкильной группы, замещенной одной карбамоильной группой, которая может содержать 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы и галогензамещенной низшей алкильной группы,

(33) оксазолидинильной группы, которая может содержать одну оксогруппу,

(34) имидазолидинильной группы, которая может содержать 1-2 заместителя, выбранных из группы, состоящей из оксогруппы и низшей алкильной группы,

(35) пирролидинильной группы, которая может содержать одну оксогруппу,

(36) имидазолильной группы,

(39) пиперидильной группы, которая может содержать один заместитель, выбранный из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алканойльной группы, низшей алкилфенилсульфонильной группы, оксогруппы, гидроксигруппы, аминогруппы, N-(низшей)алкиламиногруппы, N,N-

ди(низшей)алкиламиногруппы, N-(низшей)алканоиламиногруппы, N-(низшей)алкил-N-(низшей)алкоксикарбониламиногруппы, N-(низшей)алкил-N-(низшей)алканоиламиногруппы и N-(низшей)алканоиламино(низшей)алканоиламиногруппы),

(61) пиперазинильной группы, которая может содержать 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из оксогруппы, низшей алкильной группы, низшей алканоильной группы и низшей алкоксикарбонильной группы, и

(62) морфолинильной группы.

ПРИМЕРЫ

Далее настоящее изобретение дополнительно поясняется на ссылочных примерах примерах и фармакологических экспериментальных примерах и примерах получения.

Ссылочный пример 1

Синтез гидрохлорида 1-бензо[b]тиофен-4-илпиперазина

Смесь, состоящая из 14,4 г 4-бромбензо[b]тиофена, 29,8 г пиперазинового ангидрида, 9,3 г трет-бутоксид натрия, 0,65 г (R)-(+)-2,2'-бис(дифенилфосфино)-1,1'-бинафтила (BINAP), 0,63 г трис(дибензилиденацетон)дипалладия(0) и 250 мл толуола нагревали с обратным холодильником в течение одного часа в атмосфере азота.

Воду вливали в реакционный раствор, который затем экстрагировали этилацетатом, промывали водой и сушили над сульфатом магния. Растворитель выпаривали при пониженном давлении. Полученный остаток очищали хроматографией на колонке с силикагелем (дихлорметан:метанол:25% аммиачная вода = 100:10:1) с получением 9,5 г 1-бензо[b]тиофен-4-илпиперазина в виде желтого масла.

Затем к метанольному раствору 9,5 г 1-бензо[b]тиофен-4-илпиперазина добавляли 3,7 мл концентрированной хлористоводородной кислоты и выпаривали при пониженном давлении растворитель. К полученному остатку добавляли этилацетат и выпавшие в осадок кристаллы отфильтровывали. Производили перекристаллизацию из метанола с получением гидрохлорида 1-бензо[b]тиофен-4-илпиперазина в виде бесцветных иглообразных кристаллов.

Температура плавления 276-280°C

¹H-ЯМР (ДМСО-d₆) δ м.д.: 3,25-3,35 (8H, м), 6,94 (1H, д, J=7,6 Гц), 7,30 (1H, дд, J=7,8 Гц, J=7,8 Гц), 7,51 (1H, д, J=5,5 Гц), 7,68 (1H, д, J=8,1 Гц), 7,73 (1H, д, J=5,5 Гц), 9,35 (2H, ушир.с).

Ссылочный пример 2

Синтез трет-бутил 4-бензо[b]тиофен-4-ил-3-метилпиперазин-1-карбоксилата

Указанное в заголовке соединение получали с использованием трет-бутил 3-метилпиперазин-1-карбоксилата и 4-бромбензо[b]тиофена так же, как в ссылочном примере 1.

¹H-ЯМР (CDCl₃) δ м.д.: 1,85-1,95 (3H, м), 1,50 (9H, с), 2,8-2,9 (1H, м), 3,15-3,35 (2H, м), 3,4-3,5 (1H, м), 3,5-3,65 (1H, м), 3,65-3,7 (1H, м), 3,7-3,9 (1H, м), 6,98 (1H, д, J=7,5 Гц), 7,29 (1H, дд, J=8 Гц, J=8 Гц), 7,38 (1H, д, J=5,5 Гц), 7,61 (1H, д, J=8 Гц).

Ссылочный пример 3

Синтез дигидрохлорида 1-бензо[b]тиофен-4-ил-2-метилпиперазина

Трифторуксусную кислоту (6 мл) добавляли к раствору 1,22 г (3,7 ммоль) трет-бутил 4-бензо[b]тиофен-4-ил-3-метилпиперазин-1-карбоксилата в дихлорметановом растворе (12 мл) и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение одного часа. Реакционную смесь концентрировали при пониженном давлении, к остатку добавляли 5% водный раствор карбоната калия и полученную смесь экстрагировали дихлорметаном. Экстракционный раствор с дихлорметаном сушили

над сульфатом магния и затем концентрировали при пониженном давлении. К полученному остатку добавляли концентрированную хлористоводородную кислоту (0,6 мл) и метанол (10 мл) и полученную смесь концентрировали при пониженном давлении. Полученный остаток подвергали перекристаллизации из ацетонитрила с получением дигидрохлорида 1-бензо[b]тиофен-4-ил-2-метилпиперазина (0,98 г) в виде светло-коричневого порошка.

^1H -ЯМР (DMCO-d_6) δ м.д.: 0,92 (3H, д, $J=6,5$ Гц), 2,8-3,6 (6H, м), 3,6-4,0 (1H, м), 5,3-6,8 (1H, м), 7,20 (1H, ушир.), 7,38 (1H, дд, $J=8$ Гц, $J=8$ Гц), 7,5-8,0 (3H, м), 9,4-10,1 (2H, м).

Ссылочный пример 4

Синтез дигидрохлорида 1-бензо[b]тиофен-4-ил-3-метилпиперазина

Указанное в заголовке соединение получали с использованием 2-метилпиперазина и 4-бромбензо[b]тиофена так же, как в ссылочном примере 1.

^1H -ЯМР (DMCO-d_6) δ м.д.: 1,34 (3H, д, $J=6,5$ Гц), 2,85-2,95 (1H, м), 3,05-3,15 (1H, м), 3,2-3,6 (6H, м), 6,97 (1H, д, $J=7,5$ Гц), 7,31 (1H, дд, $J=8$ Гц, $J=8$ Гц), 7,54 (1H, д, $J=5,5$ Гц), 7,69 (1H, д, $J=8$ Гц), 7,75 (1H, д, $J=5,5$ Гц), 9,2-9,3 (1H, м), 9,64 (1H, ушир.).

Ссылочный пример 5

Синтез этил 3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропионата

5,05 г (19,8 ммоль) 1-бензо[b]тиофен-4-илпиперазингидрохлорида добавляли к водному раствору гидроксида натрия и смесь экстрагировали дихлорметаном. Экстракционный раствор сушили над сульфатом магния и концентрировали при пониженном давлении. Полученный остаток растворяли в 50 мл этанола и к раствору добавляли этилакрилат (2,44 мл, 21,8 ммоль), после чего реакцию смесь нагревали с обратным холодильником в течение 4 часов. Реакционный раствор охлаждали до комнатной температуры и концентрировали при пониженном давлении. К остатку добавляли диизопропиловый эфир и выпавшее в осадок нерастворимое вещество отфильтровывали, промывали диизопропиловым эфиром и сушили с получением этил 3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропионата (5,26 г) в виде белого порошка.

^1H -ЯМР (CDCl_3) δ м.д.: 1,28 (3H, т, $J=7,0$ Гц), 2,50-2,63 (2H, м), 2,67-2,87 (6H, м), 3,11-3,24 (4H, м), 4,17 (2H, кв, $J=7,0$ Гц), 6,89 (1H, д, $J=7,8$ Гц), 7,27 (1H, т, $J=7,8$ Гц), 7,37-7,42 (2H, м), 7,55 (1H, д, $J=7,8$ Гц).

Ссылочный пример 6

Синтез 3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропан-1-ола

Литийалюминийгидрид (1,18 г, 24,8 ммоль) добавляли к раствору 5,26 г (16,5 ммоль) этил 3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропионата в тетрагидрофурановом (ТГФ) растворе (55 мл) при охлаждении льдом и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 4 часов. К реакционному раствору добавляли воду (1,2 мл), 15% водный раствор гидроксида натрия (1,2 мл) и воду (3,6 мл) в указанном порядке и смесь перемешивали при комнатной температуре. Нерастворимое вещество удаляли фильтрованием и фильтрат концентрировали при пониженном давлении. Полученный остаток очищали хроматографией на колонке с силикагелем (н-гексан:этилацетат = 3:2→этилацетат) и концентрировали досуха при пониженном давлении с получением 3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропан-1-ола (0,23 г) в виде белого порошка.

^1H -ЯМР (CDCl_3) δ м.д.: 1,75-1,85 (2H, м), 2,74 (2H, т, $J=5,8$ Гц), 2,75-2,85 (4H, м), 3,15-3,25 (4H, м), 3,85 (2H, т, $J=5,3$ Гц), 5,19 (1H, ушир.с), 6,88 (1H, д, $J=7,6$ Гц), 7,27

(1H, дд, J=7,9 Гц, J=7,8 Гц), 7,39 (2H, с), 7,56 (1H, д, J=8,0 Гц).

Ссылочный пример 7

Синтез 4-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)бутилацетата

1,0 г (3,9 ммоль) гидрохлорида 1-бензо[b]тиофен-4-илпиперазина суспендировали в 20 мл диметилформамида (ДМФА) и добавляли карбонат калия (1,3 г, 9,4 ммоль) и 4-бромбутилацетат (0,7 мл, 4,8 ммоль). Реакционную смесь перемешивали при 80°C в течение 6 часов, охлаждали до комнатной температуры, добавляли к ней воду и экстрагировали этилацетатом. Органическую фазу промывали водой, сушили над сульфатом натрия и концентрировали при пониженном давлении. Полученный остаток очищали хроматографией на колонке с силикагелем (дихлорметан: метанол = 30:1) и концентрировали досуха при пониженном давлении с получением 4-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)бутилацетата (0,72 г) в виде светло-желтого масла.

¹H-ЯМР (CDCl₃) δ м.д.: 1,60-1,73 (4H, м), 2,07 (3H, с), 2,47 (2H, т, J=7,2 Гц), 2,60-2,72 (4H, м), 3,17-3,22 (4H, м), 4,11 (2H, т, J=6,3 Гц), 6,90 (1H, д, J=7,6 Гц), 7,27 (1H, дд, J=7,6 Гц, J=8,0 Гц), 7,37-7,42 (2H, м), 7,55 (1H, д, J=8,0 Гц).

Ссылочный пример 8

Синтез 4-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)бутан-1-ола

Карбонат калия (3,87 г, 28 ммоль) добавляли к раствору 7,76 г (23,3 ммоль) 4-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)бутилацетата в 90% метанольном растворе (150 мл). Полученную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 2 часов. К реакционному раствору добавляли воду, после чего смесь экстрагировали дихлорметаном. Экстракционный раствор сушили над сульфатом натрия и концентрировали при пониженном давлении. Остаток очищали хроматографией на колонке с основным силикагелем (н-гексан:этилацетат = 2:1→1:1) и концентрировали при пониженном давлении с получением 4-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)бутан-1-ола (6,65 г) в виде бесцветного масла.

¹H-ЯМР (CDCl₃) δ м.д.: 1,60-1,74 (4H, м), 2,50-2,55 (2H, м), 2,70-2,80 (4H, м), 3,20-3,30 (4H, м), 3,60-3,63 (2H, м), 6,2 (1H, ушир.с), 6,90 (1H, д, J=7,6 Гц), 7,27 (1H, дд, J=7,6 Гц, J=8,0 Гц), 7,39 (1H, с), 7,56 (1H, д, J=8,0 Гц).

Ссылочный пример 9

Синтез 1-бензо[b]тиофен-4-ил-4-(3-хлорпропил)пиперазина

3,56 г (12,9 ммоль) 3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропан-1-ола суспендировали в 30 мл дихлорметана и к суспензии добавляли тетрахлорид углерода (30 мл) и трифенилфосфин (4,06 г, 15,5 ммоль). Смесь нагревали с обратным холодильником в течение 3 часов. Реакционный раствор охлаждали до комнатной температуры, после чего добавляли к нему метанол и дихлорметан, чтобы гомогенизировать смесь. Добавляли к раствору силикагель (30 г) и выпаривали при пониженном давлении растворитель. Полученный остаток загружали на колонку с силикагелем (300 г) и экстрагировали растворительной смесью н-гексан:этилацетат = 2:1. Экстракционный раствор концентрировали при пониженном давлении с получением 1-бензо[b]тиофен-4-ил-4-(3-хлорпропил)пиперазина (2,36 г) в виде бесцветного масла.

¹H-ЯМР (CDCl₃) δ м.д.: 1,95-2,10 (2H, м), 2,60 (2H, т, J=7,2 Гц), 2,65-2,75 (4H, м), 3,15-3,25 (4H, м), 3,65 (2H, т, J=6,6 Гц), 6,89 (1H, дд, J=7,6 Гц, J=0,7 Гц), 7,27 (1H, дд, J=7,9 Гц, J=7,8 Гц), 7,38 (1H, д, J=5,6 Гц), 7,41 (1H, д, J=5,7 Гц), 7,55 (1H, д, J=8,0 Гц).

Ссылочный пример 10

Синтез метил 4-гидрокситиофен-2-карбоксилата

Тионилхлорид (1,6 мл) добавляли по каплям к метанольному раствору (20 мл) 4-гидрокситиофен-2-карбоновой кислоты (1,1 г, 7,6 ммоль) при охлаждении льдом. Полученную смесь нагревали с обратным холодильником в течение 5 часов.

Реакционный раствор охлаждали до комнатной температуры, вливали в ледяную воду и экстрагировали этилацетатом. Экстракционный раствор с этилацетатом сушили над сульфатом магния и концентрировали при пониженном давлении. Остаток очищали хроматографией на колонке с силикагелем (н-гексан:этилацетат = 4:1) и концентрировали/сушили при пониженном давлении с получением метил 4-гидрокситиофен-2-карбоксилата (0,7 г) в виде белого порошка.

^1H -ЯМР (CDCl_3) δ м.д.: 3,90 (3H, с), 5,50-6,60 (1H, ушир.), 6,64 (1H, д, $J=1,9$ Гц), 7,43 (1H, д, $J=1,8$ Гц).

Ссылочный пример 11

Синтез этил 6-гидроксипиримидин-4-карбоксилата

Указанное в заголовке соединение получали с использованием 6-гидроксипиримидин-4-карбоновой кислоты так же, как в ссылочном примере 10.

^1H -ЯМР (CDCl_3) δ м.д.: 1,29 (3H, т, $J=7,0$ Гц), 4,29 (2H, кв, $J=7,0$ Гц), 6,87 (1H, д, $J=1,0$ Гц), 8,27 (1H, д, $J=1,0$ Гц), 10,54 (1H, ушир.).

Ссылочный пример 12

Синтез метил 5-гидрокси-1-метил-1H-пиразол-3-карбоксилата

Раствор в диэтиловом эфире (35 мл) диметилацетилендикарбоксилата (5,0 г, 35 ммоль) охлаждали охлаждающей средой (лед с солью). К данному раствору добавляли по каплям раствор в диэтиловом эфире (15 мл) метилгидразина (0,63 мл, 35 ммоль), поддерживая при этом температуру на уровне 0°C или ниже. По окончании капельного добавления раствор перемешивали при 0°C в течение одного часа. Выпавшее в осадок нерастворимое вещество отфильтровывали и промывали диэтиловым эфиром. Отфильтрованный осадок нагревали до 130°C в течение 30 минут и охлаждали до комнатной температуры. К осадку добавляли метанол и смесь концентрировали при пониженном давлении. К полученному остатку добавляли этилацетат и смесь концентрировали при пониженном давлении. К остатку добавляли этилацетат и выпавшее в осадок нерастворимое вещество отфильтровывали, промывали этилацетатом и сушили с получением метил 5-гидрокси-1-метил-1H-пиразол-3-карбоксилата (3,26 г) в виде светло-желтого порошка.

^1H -ЯМР ($\text{DMSO}-d_6$) δ м.д.: 3,58 (3H, с), 3,73 (3H, с), 5,77 (1H, с), 11,41 (1H, ушир.).

Ссылочный пример 13

Синтез 6-хлор-N-(2,2,2-трифторэтил)никотинамида

Триэтиламин (1,03 мл, 7,4 ммоль) и изобутилхлорформат (0,76 мл, 5,5 ммоль) добавляли к ацетонитриловому раствору (12 мл) 6-хлорникотиновой кислоты (0,58 г, 3,6 ммоль) при охлаждении льдом и смесь перемешивали при 0°C в течение 30 минут. К полученной смеси добавляли 2,2,2-трифторэтиламин (0,88 мл, 11,2 ммоль) и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 10 минут. К реакционному раствору добавляли воду, после чего смесь экстрагировали этилацетатом. Экстракционный раствор с этилацетатом сушили над сульфатом магния и концентрировали при пониженном давлении. Остаток очищали хроматографией на колонке с основным силикагелем (н-гексан:этилацетат = 5:1 $\rightarrow$ 1:1). Очищенный продукт концентрировали при пониженном давлении и добавляли диизопропиловый эфир и н-гексан. Выпавшее в осадок нерастворимое вещество отфильтровывали и сушили с получением 6-хлор-N-(2,2,2-

трифторэтил)никотинамида (0,58 г) в виде светло-желтого порошка.

¹H-ЯМР (CDCl₃) δ м.д.: 4,15 (2H, дкв, J=6,5 Гц, 9,0 Гц), 6,35 (1H, ушир.), 7,46 (1H, дд, J=0,7 Гц, J=8,5 Гц), 8,11 (1H, дд, J=2,5 Гц, J=8,5 Гц), 8,77 (1H, дд, J=0,7 Гц, J=2,5 Гц).

Ссылочный пример 14

Синтез N-(2,2,2-трифторэтил)-4-хлорпиридин-2-карбоксамида
1-Гидроксibenзотриазол (0,53 г, 3,5 ммоль), гидрохлорид 1-(3-

диметиламинопропил)-3-этилкарбодиимида (WSC) (0,67 г, 3,5 ммоль) и 2,2,2-трифторэтиламин (0,51 мл, 6,35 ммоль) добавляли к дихлорметановому раствору (5 мл) 4-хлорпиридин-2-карбоновой кислоты (0,5 г, 3,17 ммоль) и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение одного часа. К реакционному раствору добавляли воду, после чего смесь экстрагировали этилацетатом. Экстракционный раствор с этилацетатом сушили над сульфатом магния и концентрировали при пониженном давлении. Остаток очищали хроматографией на колонке с силикагелем (н-гексан:этилацетат = 11:1→5:1). Очищенный продукт концентрировали досуха при пониженном давлении с получением N-(2,2,2-трифторэтил)-4-хлорпиридин-2-карбоксамида (435 мг) в виде белого порошка.

¹H-ЯМР (CDCl₃) δ м.д.: 4,13 (2H, дкв, J=6,8 Гц, 9,0 Гц), 7,49 (1H, дд, J=2,1 Гц, J=5,3 Гц), 8,22 (1H, дд, J=0,4 Гц, J=2,1 Гц), 8,30 (1H, ушир.), 8,49 (1H, дд, J=0,4 Гц, J=5,3 Гц).

Ссылочный пример 15

Синтез 2-хлортиазол-4-карбоксамида

1-Гидроксibenзотриазол (0,56 г, 3,7 ммоль), гидрохлорид 1-(3-диметиламинопропил)-3-этилкарбодиимид (WSC) (0,7 г, 3,7 ммоль) и аммиачную воду (28%, 0,5 мл) добавляли к дихлорметановому раствору (10 мл) 2-хлортиазол-4-карбоновой кислоты (0,5 г, 3,06 ммоль) и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 46 часов. К реакционному раствору добавляли воду, после чего смесь экстрагировали этилацетатом. Экстракционный раствор с этилацетатом сушили над сульфатом магния и концентрировали при пониженном давлении. Остаток очищали хроматографией на колонке с силикагелем (н-гексан:этилацетат = 3:5→этилацетат). Очищенный продукт концентрировали досуха при пониженном давлении с получением 2-хлортиазол-4-карбоксамида (475 мг) в виде белого порошка.

¹H-ЯМР (CDCl₃) δ м.д.: 5,70 (1H, ушир.), 7,01 (1H, ушир.), 8,06 (1H, с).

Ссылочный пример 16

Синтез N-метил-2-хлортиазол-5-карбоксамида

Указанное в заголовке соединение получали с использованием 2-хлортиазол-5-карбоновой кислоты так же, как в ссылочном примере 13.

¹H-ЯМР (CDCl₃) δ м.д.: 3,00 (3H, д, J=4,9 Гц), 5,92 (1H, ушир.), 7,84 (1H, ушир.).

Ссылочный пример 17

Синтез 6-метокси-2,2-диметил-4H-бензо[1,4]оксазин-3-она

5% палладий-на-углероде (1,5 г) добавляли к этанольному раствору (250 мл) этил 2-(4-метокси-2-нитрофенокси)-2-метилпропионата (14,6 г, 51,6 ммоль) для осуществления каталитического восстановления при комнатной температуре. Катализатор удаляли фильтрованием и фильтрат концентрировали при пониженном давлении. К полученному остатку добавляли воду, после чего смесь экстрагировали этилацетатом. Экстракционный раствор сушили над сульфатом магния и концентрировали при пониженном давлении. Полученный остаток очищали хроматографией на колонке с силикагелем (н-гексан:этилацетат = 9:1). Очищенный

продукт концентрировали досуха при пониженном давлении с получением 6-метокси-2,2-диметил-4Н-бензо[1,4]оксазин-3-она (7,0 г) в виде белого порошка.

¹Н-ЯМР (CDCl₃) δ м.д.: 1,53 (6Н, с), 3,78 (3Н, с), 6,40 (1Н, д, J=2,8 Гц), 6,52 (1Н, дд, J=2,8 Гц, J=8,8 Гц), 6,88 (1Н, д, J=8,7 Гц), 8,66 (1Н, ушир.с).

Ссылочный пример 18

Синтез 6-гидрокси-2,2-диметил-4Н-бензо[1,4]оксазин-3-она

Дихлорметановый раствор (36 мл) 2М трибромида бора добавляли по каплям к дихлорметановому раствору 6-метокси-2,2-диметил-4Н-бензо[1,4]оксазин-3-она (5,0 г, 26 ммоль) при охлаждении льдом и смесь перемешивали в течение ночи. К реакционному раствору добавляли воду, чтобы разложить избыточные реактивы. Реакционный раствор промывали водой, сушили над сульфатом магния и концентрировали при пониженном давлении. Полученный остаток очищали хроматографией на колонке с силикагелем (н-гексан:этилацетат = 2:1). Очищенный продукт концентрировали досуха при пониженном давлении с получением 6-гидрокси-2,2-диметил-4Н-бензо[1,4]оксазин-3-она (4,02 г) в виде белого порошка.

¹Н-ЯМР (DMSO-d₆) δ м.д.: 1,34 (6Н, с), 6,25-6,40 (2Н, м), 6,70 (1Н, д, J=8,5 Гц), 9,09 (1Н, с), 10,41 (1Н, ушир.с).

Ссылочный пример 19

Синтез 6-гидрокси-2-метил-4Н-бензо[1,4]оксазин-3-она

Указанное в заголовке соединение получали с использованием 6-метокси-2-метил-4Н-бензо[1,4]оксазин-3-она так же, как в ссылочном примере 18.

Белый порошок

¹Н-ЯМР (DMSO-d₆) δ м.д.: 1,34 (3Н, д, J=6,8 Гц), 4,46 (1Н, кв, J=6,8 Гц), 6,23-6,27 (1Н, м), 6,33 (1Н, д, J=2,7 Гц), 6,70 (1Н, д, J=8,6 Гц), 9,11 (1Н, с), 10,44 (1Н, ушир.с).

Ссылочный пример 20

Синтез 4-(4-метоксифенил)-1-(толуол-4-сульфонил)пиперидина

п-Толуолсульфонилхлорид (4,39 г, 23 ммоль) добавляли к пиридиновому раствору (30 мл) 4-(4-метоксифенил)пиперидина (4,0 г, 21 ммоль) и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение ночи. К полученной смеси добавляли воду, после чего смесь экстрагировали этилацетатом. Органическую фазу промывали хлористоводородной кислотой и водой, сушили над сульфатом магния и концентрировали при пониженном давлении. Полученный остаток очищали хроматографией на колонке с силикагелем (н-гексан:этилацетат = 1:1). Очищенный продукт концентрировали досуха при пониженном давлении с получением 4-(4-метоксифенил)-1-(толуол-4-сульфонил)пиперидина (4,8 г) в виде белого порошка.

¹Н-ЯМР (CDCl₃) δ м.д.: 1,60-1,90 (4Н, м), 2,30-2,40 (3Н, м), 2,46 (3Н, с), 3,78 (3Н, с), 3,90-3,95 (2Н, м), 6,84 (2Н, дд, J=1,9, J=6,8 Гц), 7,07 (2Н, дд, J=1,9, J=6,8 Гц), 7,35 (2Н, д, J=8,2 Гц), 7,68 (2Н, д, J=8,2 Гц).

Ссылочный пример 21

Синтез 4-(4-гидроксифенил)-1-(толуол-4-сульфонил)пиперидина

Указанное в заголовке соединение получали с использованием 4-(4-метоксифенил)-1-(толуол-4-сульфонил)пиперидина так же, как в ссылочном примере 18.

Коричневый порошок

¹Н-ЯМР (CDCl₃) δ м.д.: 1,60-1,90 (4Н, м), 2,30-2,50 (3Н, м), 2,45 (3Н, с), 3,90-3,95 (2Н, м), 6,67 (1Н, ушир.с), 6,80 (2Н, дд, J=1,9, J=6,8 Гц), 7,02 (2Н, дд, J=1,8, J=6,9 Гц), 7,35 (2Н, д, J=8,1 Гц), 7,68 (2Н, д, J=8,1 Гц).

Ссылочный пример 22Синтез 4-бром-2-гидроксиметил-6-метоксифенола

Боргидрид натрия (0,28 г, 6,9 ммоль) добавляли к ТГФ раствору (30 мл) 5-бром-2-гидрокси-3-метоксибензальдегида (3,2 г, 13,8 ммоль) при охлаждении льдом и смесь перемешивали при 0°C в течение 2 часов. К реакционному раствору добавляли уксусную кислоту, чтобы довести pH до 3. Добавляли к реакционной смеси 10% хлористоводородную кислоту, после чего смесь экстрагировали этилацетатом. Экстрагированное вещество сушили над сульфатом магния и концентрировали при пониженном давлении. Полученный остаток очищали хроматографией на колонке с силикагелем (н-гексан:этилацетат = 5:1 → 1:1) и концентрировали досуха при пониженном давлении с получением 4-бром-2-гидроксиметил-6-метоксифенола (3,23 г) в виде светло-желтого масла.

¹H-ЯМР (CDCl₃) δ м.д.: 3,88 (3H, с), 4,71 (2H, с), 6,94 (1H, д, J=2,0 Гц), 7,03 (1H, д, J=2,0 Гц).

Ссылочный пример 23Синтез 5-бром-3-метокси-2-метоксиметоксибензальдегида

Этилдиизопропиламин (3,01 мл, 17,1 ммоль) и метоксиметилхлорид (1,5 мл, 15,7 ммоль) добавляли к дихлорметановому раствору (30 мл) 5-бром-2-гидрокси-3-метоксибензальдегида (3,3 г, 14,3 ммоль) при охлаждении льдом и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 2 часов. Реакционный раствор промывали водой, сушили над сульфатом магния и концентрировали при пониженном давлении. Полученный остаток очищали хроматографией на колонке с силикагелем (н-гексан:этилацетат = 3:1 → 1:1). Очищенный продукт концентрировали досуха при пониженном давлении с получением 5-бром-3-метокси-2-метоксиметоксибензальдегида (4,2 г) в виде светло-желтого твердого вещества.

¹H-ЯМР (CDCl₃) δ м.д.: 3,56 (3H, с), 3,89 (3H, с), 5,21 (2H, с), 7,23 (1H, д, J=2,5 Гц), 7,56 (1H, д, J=2,5 Гц), 10,39 (1H, с).

Ссылочный пример 24Синтез 3-метокси-2-метоксиметокси-5-(2-оксооксазолидин-3-ил)бензальдегида

2-Оксазолидинон (0,38 г, 4,36 ммоль), трис(дибензилиденацетон)дипалладий (0,17 г, 0,18 ммоль), 9,9-диметил-4,5-бис(дифенилфосфино)ксантен (XANTPHOS) (0,32 г, 0,55 ммоль) и карбонат цезия (1,66 г, 5,1 ммоль) добавляли к диоксановому раствору (20 мл) 5-бром-3-метокси-2-метоксиметоксибензальдегида (1,0 г, 3,6 ммоль) и смесь перемешивали при 100°C в течение 24 часов в атмосфере аргона.

Реакционный раствор охлаждали до комнатной температуры и добавляли к нему этилацетат. Смесь фильтровали через церит. Фильтрат промывали водой, сушили над сульфатом магния и концентрировали при пониженном давлении. Полученный остаток очищали хроматографией на колонке с силикагелем (н-гексан:этилацетат = 4:1 → 1:1). Очищенный продукт концентрировали при пониженном давлении. К остатку добавляли этилацетат и диизопропиловый эфир. Нерастворимое вещество, очищенное описанным образом, отфильтровывали и сушили с получением 3-метокси-2-метоксиметокси-5-(2-оксооксазолидин-3-ил)бензальдегида (0,5 г) в виде белого порошка.

¹H-ЯМР (CDCl₃) δ м.д.: 3,57 (3H, с), 3,93 (3H, с), 4,06-4,12 (2H, м), 4,48-4,54 (2H, м), 5,21 (2H, с), 6,96 (1H, д, J=2,5 Гц), 8,18 (1H, д, J=2,5 Гц), 10,45 (1H, с).

Ссылочный пример 25Синтез 3-(3-метокси-4-метоксиметокси-5-метилфенил)оксазолидин-2-она

3-Метокси-2-метоксиметокси-5-(2-оксооксазолидин-3-ил)бензальдегид (0,5 г, 1,79 ммоль) растворяли в растворительной смеси уксусной кислоты (5 мл) и этанола (5 мл) и к раствору добавляли 10% палладий-на-углероде (0,05 г) для осуществления каталитического восстановления при 1 атм и 50°C в течение 4 часов. Реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры и фильтровали через церит. Фильтрат концентрировали при пониженном давлении. Остаток растворяли в уксусной кислоте (10 мл) и к раствору добавляли 10% палладий-на-углероде (0,05 г) для осуществления каталитического восстановления при 1 атм и 50°C в течение 6 часов. Удаляли при пониженном давлении растворитель с получением 3-(3-метокси-4-метоксиметокси-5-метилфенил)оксазолидин-2-она в виде неочищенного продукта, который подвергали следующей реакции в том виде, как он был.

¹H-ЯМР (CDCl₃) δ м.д.: 2,32 (3H, с), 3,56 (3H, с), 3,85 (3H, с), 3,98-4,06 (2H, м), 4,43-4,50 (2H, м), 5,05 (2H, с), 6,61 (1H, д, J=2,3 Гц), 7,36 (1H, д, J=2,3 Гц).

Ссылочный пример 26

Синтез 3-(4-гидрокси-3-метокси-5-метилфенил)оксазолидин-2-она

10% Хлористоводородную кислоту (5 мл) добавляли к метанольному раствору (5 мл) 3-(3-метокси-4-метоксиметокси-5-метилфенил)оксазолидин-2-она (0,48 г, 1,79 ммоль) и смесь перемешивали при 50°C в течение 10 минут. К реакционному раствору добавляли воду и смесь экстрагировали этилацетатом. Экстрагированное вещество сушили над сульфатом магния и затем концентрировали досуха при пониженном давлении с получением 3-(4-гидрокси-3-метокси-5-метилфенил)оксазолидин-2-она (434 мг) в виде светло-желтого порошка.

¹H-ЯМР (CDCl₃) δ м.д.: 2,26 (3H, с), 3,90 (3H, с), 4,02 (2H, дд, J=7,0 Гц, J=8,5 Гц), 4,46 (2H, дд, J=7,0 Гц, J=8,5 Гц), 5,55 (1H, ушир.), 6,56 (1H, д, J=2,5 Гц), 7,31 (1H, д, J=2,5 Гц).

Ссылочный пример 27

Синтез 1-(8-метокси-2,2-диметил-4Н-бензо[1,3]диоксин-6-ил)пирролидин-2-она

Указанное в заголовке соединение получали с использованием 6-бром-8-метокси-2,2-диметил-4Н-бензо[1,3]диоксина и 2-пирролидона так же, как в ссылочном примере 25.

¹H-ЯМР (CDCl₃) δ м.д.: 1,59 (6H, с), 2,09-2,21 (2H, м), 2,60 (2H, т, J=8,3 Гц), 3,82 (2H, т, J=7,0 Гц), 3,88 (3H, с), 4,83 (2H, с), 6,67 (1H, д, J=2,5 Гц), 7,24 (1H, д, J=2,5 Гц).

Ссылочный пример 28

Синтез 1-(4-гидрокси-3-гидроксиметил-5-метоксифенил)пирролидин-2-она

10% Хлористоводородную кислоту (4 мл) добавляли к ТГФ раствору (7 мл) 1-(8-метокси-2,2-диметил-4Н-бензо[1,3]диоксин-6-ил)пирролидин-2-она (0,36 г, 1,3 ммоль) и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 17 часов. К реакционному раствору добавляли воду, после чего смесь экстрагировали дихлорметаном. Экстрагированное вещество сушили над сульфатом магния, концентрировали при пониженном давлении и очищали хроматографией на колонке с силикагелем (дихлорметан:метанол = 300:1→30:1). Очищенный продукт концентрировали досуха при пониженном давлении с получением 1-(4-гидрокси-3-гидроксиметил-5-метоксифенил)пирролидин-2-она (0,31 г) в виде светло-коричневого порошка.

¹H-ЯМР (CDCl₃) δ м.д.: 2,05-2,28 (3H, м), 2,26 (2H, т, J=7,5 Гц), 3,84 (2H, т, J=7,0 Гц), 3,91 (3H, с), 4,74 (2H, с), 5,90 (1H, ушир.), 6,78 (1H, д, J=2,5 Гц), 7,52 (1H, д, J=2,5 Гц).

Ссылочный пример 29Синтез 3-метокси-2-метоксиметокси-5-(2-оксопирролидин-1-ил)бензальдегида

Указанное в заголовке соединение получали с использованием 5-бром-3-метокси-2-метоксиметоксибензальдегида и 2-пирролидона так же, как ссылочный

¹H-ЯМР (CDCl₃) δ м.д.: 2,11-2,24 (2H, м), 2,63 (2H, т, J=8,3 Гц), 3,56 (3H, с), 3,89 (2H, т, J=7,0 Гц), 3,92 (3H, с), 5,21 (2H, с), 7,08 (1H, д, J=2,5 Гц), 8,28 (1H, д, J=2,5 Гц), 10,46 (1H, с).

Ссылочный пример 30Синтез 1-(4-гидрокси-3-метокси-5-метилфенил)пирролидин-2-она

3-Метокси-2-метоксиметокси-5-(2-оксопирролидин-1-ил)бензальдегид (0,72 г, 2,56 ммоль) растворяли в растворе смеси уксусной кислоты (5 мл) и этанола (7 мл) и к раствору добавляли 10% палладий-на-углероде (70 мг) для осуществления

каталитического восстановления при 50°C в течение 10 часов. Реакционный раствор

охлаждали до комнатной температуры и фильтровали через церит.

Отфильтрованный осадок концентрировали при пониженном давлении. Полученный при этом остаток растворяли в дихлорметане (15 мл) и к раствору добавляли

трифторуксусную кислоту (2,0 мл, 25,6 ммоль) и триэтилсилан (2,0 мл, 12,8 ммоль) при охлаждении льдом. Смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 16 часов. Смесь концентрировали при пониженном давлении и остаток

очищали хроматографией на колонке с силикагелем (н-гексан:этилацетат = 5:

1→этилацетат). Очищенный продукт концентрировали при пониженном давлении с получением 1-(4-гидрокси-3-метокси-5-метилфенил)пирролидин-2-она (0,41 г) в виде

светло-желтого масла.

¹H-ЯМР (CDCl₃) δ м.д.: 2,17-2,25 (5H, м), 2,72 (2H, т, J=8,3 Гц), 3,88 (2H, т, J=7,0 Гц), 3,89 (3H, с), 6,66 (1H, д, J=2,5 Гц), 7,15 (1H, д, J=2,5 Гц).

Ссылочный пример 31Синтез 3,4-диацетокси-5-метилбензальдегида

Уксусный ангидрид (1,2 мл, 12 ммоль) добавляли к пиридиновому раствору (4 мл) 3,4-дигидрокси-5-метилбензальдегида (0,72 г, 4,7 ммоль) и смесь перемешивали при

0°C в течение одного часа. Добавляли к реакционному раствору 10% хлористоводородную кислоту и смесь экстрагировали этилацетатом. Органическую

фазу промывали водным раствором гидрокарбоната натрия, сушили над сульфатом

магния и концентрировали при пониженном давлении. Полученный остаток очищали хроматографией на колонке с силикагелем (н-гексан:этилацетат = 5:1→3:1).

Очищенный продукт концентрировали при пониженном давлении с получением 3,4-диацетокси-5-метилбензальдегида (0,98 г) в виде светло-желтого масла.

¹H-ЯМР (CDCl₃) δ м.д.: 2,29 (3H, с), 2,32 (3H, с), 2,35 (3H, с), 7,58 (1H, д, J=1,6 Гц), 7,67 (1H, д, J=1,6 Гц), 9,93 (1H, с).

Ссылочный пример 32Синтез 7-гидрокси-1,4-дигидробензо[d][1,3]оксазин-2-она

Указанное в заголовке соединение получали с использованием 7-метоксиметокси-1,4-дигидробензо[d][1,3]оксазин-2-она так же, как в ссылочном

примере 26.

Белый порошок

¹H-ЯМР (DMCO-d₆) δ м.д.: 5,14 (2H, с), 6,35 (1H, д, J=2,2 Гц), 6,39 (1H, дд, J= 8,1, J= 2,2 Гц), 6,97 (1H, д, J=8,1 Гц), 9,98 (1H, ушир.-с).

Ссылочный пример 33Синтез 7-метокси-3,4-дигидро-1Н-хиназолин-2-она

2-Аминометил-5-метоксианилин (1,2 г, 7,9 ммоль) и карбонилдиимидазол (1,53 г, 9,5 ммоль) добавляли к ТГФ (100 мл) и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение ночи. Выпавшее в осадок нерастворимое вещество отфильтровывали, промывали дихлорметаном и водой, сушили с получением 7-метокси-3,4-дигидро-1Н-хиназолин-2-она (1,11 г) в виде белого порошка.

¹Н-ЯМР (ДМСО-d₆) δ м.д.: 3,68 (3Н, с), 4,23 (2Н, с), 6,35 (1Н, д, J=2,5 Гц), 6,42 (1Н, дд, J=8,3 Гц, J=2,5 Гц), 6,96 (1Н, д, J=8,3 Гц), 8,90 (1Н, ушир.с).

Ссылочный пример 34Синтез 7-гидрокси-3,4-дигидро-1Н-хиназолин-2-она

Указанное в заголовке соединение получали с использованием 7-метокси-3,4-дигидро-1Н-хиназолин-2-она так же, как в ссылочном примере 18.

Светло-коричневый порошок

¹Н-ЯМР (ДМСО-d₆) δ м.д.: 4,18 (2Н, ушир.с), 6,75-6,85 (1Н, м), 7,01 (1Н, дд, J=2,0 Гц, J=9,0 Гц), 8,07 (1Н, д, J=9,0 Гц), 8,87 (1Н, ушир.с), 9,48 (1Н, ушир.с), 13,21 (1Н, ушир.с).

Ссылочный пример 35Синтез метил 5-(3-хлорпропокси)-1-метил-1Н-пиразол-3-карбоксилата

Карбонат цезия (2,08 г, 6,4 ммоль) и 1-бром-3-хлорпропан (1,6 мл) добавляли к ДМФА раствору (5 мл) метил 5-гидрокси-1-метил-1Н-пиразол-3-карбоксилата (0,83 г, 5,3 ммоль) и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 21 часа. К реакционному раствору добавляли воду, после чего смесь экстрагировали этилацетатом. Органическую фазу промывали водой и сушили над сульфатом магния. Реакционный раствор концентрировали при пониженном давлении. Остаток очищали хроматографией на колонке с силикагелем (н-гексан:этилацетат = 100:1→4:1). Очищенный продукт концентрировали досуха при пониженном давлении с получением метил 5-(3-хлорпропокси)-1-метил-1Н-пиразол-3-карбоксилата (1,17 г) в виде белого твердого вещества.

¹Н-ЯМР (CDCl₃) δ м.д.: 2,21-2,32 (2Н, м), 3,72 (2Н, т, J=6,3 Гц), 3,72 (2Н, с), 3,91 (3Н, с), 4,24 (2Н, т, J=5,8 Гц), 6,10 (1Н, с).

Ссылочный пример 36Синтез 7-(3-хлорпропокси)-2Н-1,4-бензоксазин-3(4Н)-она

Указанное в заголовке соединение получали с использованием 7-гидрокси-2Н-1,4-бензоксазин-3(4Н)-она и 1-бром-3-хлорпропана так же, как в ссылочном примере 35.

Светло-коричневый иглообразный кристал (этанол-н-гексан)

Температура плавления: 119-120°C

Соединения, перечисленные в таблицах 1-12, (см. в конце текста описания) получали, используя подходящие исходные вещества, такими же способами, как в ссылочных примерах 1-36.

Пример 1Синтез метил 5-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-1-метил-1Н-пиразол-3-карбоксилата

Метил 5-(3-хлорпропокси)-1-метил-1Н-пиразол-3-карбоксилат (1,17 г, 5,0 ммоль), гидрохлорид 1-бензо[b]тиофен-4-илпиперазина (1,35 г, 5,3 ммоль), карбонат калия (1,74, 12,6 ммоль) и йодид натрия (0,75 г, 5,0 ммоль) добавляли к ДМФА (12 мл) и смесь перемешивали при 80°C в течение 3 часов. Реакционный раствор охлаждали до комнатной температуры и добавляли к нему воду, после чего смесь

экстрагировали этилацетатом. Органическую фазу промывали водой и сушили над сульфатом магния. Реакционный раствор концентрировали при пониженном давлении и остаток очищали хроматографией на колонке с силикагелем (н-гексан: этилацетат = 7:3 → дихлорметан:метанол = 100:3). Очищенный продукт концентрировали при пониженном давлении с получением светло-желтого маслянистого вещества (1,97 г). Маслянистому веществу давали еще постоять при комнатной температуре, получив в результате твердое вещество, которое промывали диизопропиловым эфиром и сушили с получением метил 5-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-1-метил-1Н-пиразол-3-карбоксилата (1,49 г).
Температура плавления: 109,0-110,5°C

МС 414 (M⁺)

Пример 2

Синтез 5-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-1-метил-1Н-пиразол-3-карбоновой кислоты

6 н. водный раствор гидроксида натрия (2 мл) добавляли к этильному раствору (10 мл) метил 5-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-1-метил-1Н-пиразол-3-карбоксилата (1,62 г, 3,9 ммоль) и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 4 дней. Затем к реакционному раствору добавляли при охлаждении льдом 6 н. хлористоводородную кислоту (2 мл) и полученную смесь перемешивали. Добавляли к реакционному раствору дихлорметан и осадок отфильтровывали. Фильтрат разделяли и органическую фазу концентрировали при пониженном давлении. Отфильтрованный осадок и остаток объединяли, промывали водой и сушили с получением 5-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-1-метил-1Н-пиразол-3-карбоновой кислоты (1,53 г) в виде белого порошка.

Температура плавления: 114,5-118,0°C

Пример 3

Синтез гидрохлорида N-метил-5-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)]пропокси]-1-метил-1Н-пиразол-3-карбоксамида

ДМФА раствор 5-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-1-метил-1Н-пиразол-3-карбоновой кислоты (0,3 г, 0,75 ммоль) охлаждали на льду и добавляли к нему триэтиламин (0,73 мл, 5,2 ммоль), гидрохлорид метиламина (0,3 г, 4,5 ммоль) и диэтилфосфороцианидат (DEPC) (0,25 мл, 1,4 ммоль), после чего смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 24 часов. К реакционному раствору добавляли триэтиламин (0,73 мл, 5,2 ммоль), гидрохлорид метиламина (0,3 г, 4,5 ммоль) и DEPC (0,25 мл, 1,4 ммоль) и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 4 дней. К реакционному раствору добавляли воду, после чего смесь экстрагировали этилацетатом. Экстрагированное вещество промывали водой и сушили над сульфатом магния. Раствор концентрировали при пониженном давлении и остаток очищали хроматографией на колонке с основным силикагелем (н-гексан:этилацетат=5:1 → этилацетат). Очищенный продукт концентрировали при пониженном давлении и остаток растворяли в этилацетате и к полученному раствору добавляли раствор 4N-хлористоводородной кислоты в этилацетате. Выпавшее в осадок нерастворимое вещество отфильтровывали и сушили с получением гидрохлорида N-метил-5-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-1-метил-1Н-пиразол-3-карбоксамида (0,24 г) в виде белого порошка.

Температура плавления: 228,0-232,5°C (разл.)

Пример 4

Синтез 5-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-1-метил-1Н-

пиразол-3-карбоксамида

Указанное в заголовке соединение получали с использованием 5-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-1-метил-1Н-пиразол-3-карбоновой кислоты и хлорида аммония так же, как в примере 3.

Белый порошок (этилацетат-диизопропиловый эфир)

Температура плавления: 186,5-188,5°C

Пример 5

Синтез 4-[3-4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-3-метокси-5,N-диметилбензамида

Указанное в заголовке соединение получали с использованием 4-(3-хлорпропокси)-3-метокси-5,N-диметилбензамида и гидрохлорида 1-бензо[b]тиофен-4-илпиперазина так же, как в примере 1.

Белый порошок (этилацетат-метанол)

Температура плавления: 141,5-142,5°C

Пример 6

Синтез гидрохлорида N-метил-2-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]тиазол-4-карбоксамида

Гидрид натрия (55%, масляный, 90 мг, 2,2 ммоль) добавляли к ДМФА раствору (2 мл) 3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропанола (0,2 г, 0,7 ммоль) и N-метил-2-хлортиазол-4-карбоксамида (0,26 г, 1,45 ммоль) при охлаждении льдом и раствор перемешивали при 80°C в течение 1,5 часов. После того как реакционный раствор охлаждали до комнатной температуры и добавляли к нему воду, экстрагировали его этилацетатом. Экстракционный раствор с этилацетатом промывали водой, сушили над сульфатом магния и концентрировали при пониженном давлении. Полученный остаток очищали хроматографией на колонке с силикагелем (дихлорметан:этилацетат = 5:1→этилацетат). После того как очищенный продукт концентрировали при пониженном давлении, остаток растворяли в этилацетате. К полученному раствору добавляли раствор 4 н. хлористоводородной кислоты в этилацетате и выпавшее в осадок нерастворимое вещество отфильтровывали и сушили с получением гидрохлорида N-метил-2-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]тиазол-4-карбоксамида (0,24 г) в виде светло-желтого порошка.

Температура плавления: 199,5-202,5°C

Пример 7

Синтез 2-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]тиазол-4-карбоксамида

Указанное в заголовке соединение получали с использованием 3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропанола (0,2 г, 0,7 ммоль) и 2-хлортиазол-4-карбоксамида так же, как в примере 6.

Белый порошок (этилацетат-диизопропиловый эфир)

Температура плавления: 139,5-140,5°C

Пример 8

Синтез трет-бутилового эфира {4-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-3-метокси-5-метилфенил}карбаминовой кислоты

Указанное в заголовке соединение получали с использованием трет-бутилового эфира [4-(3-хлорпропокси)-3-метокси-5-метилфенил]карбаминовой кислоты и гидрохлорида 1-бензо[b]тиофен-4-илпиперазина так же, как в примере 1.

Светло-коричневое маслянистое вещество

¹H-ЯМР (CDCl₃) δ м.д.: 1,51 (9H, с), 1,95-2,10 (2H, м), 2,24 (3H, с), 2,66-2,81 (6H, м), 3,14-3,31 (2H, м), 3,84 (3H, с), 3,95 (2H, т, J=6,3 Гц), 6,36 (1H, ушир.), 6,60 (1H, д, J=2,5 Гц), 6,87-6,92 (1H, м), 7,01 (1H, д, J=2,0 Гц), 7,24-7,31 (1H, м), 7,37-7,44 (2H, м), 7,55 (1H, д, J=8,0 Гц).

МС 511 (M⁺).

Пример 9

Синтез 4-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-3-метокси-5-метиланилина

6 н. хлористоводородную кислоту (3 мл) добавляли к метанольному раствору (10 мл) трет-бутилового эфира {4-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-3-метокси-5-метилфенил} карбаминовой кислоты (2,18 г, 4,3 ммоль) и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение ночи. После перемешивания при 60°C в течение 15 минут смесь охлаждали до комнатной температуры и добавляли к ней 6 н. водный раствор гидроксида натрия, чтобы нейтрализовать ее. Добавляли к реакционной смеси дихлорметан и вещество, экстрагированное дихлорметаном, сушили над сульфатом магния и концентрировали при пониженном давлении. Полученный остаток очищали хроматографией на колонке с силикагелем (н-гексан:этилацетат = 3:2→этилацетат). Очищенный продукт концентрировали досуха при пониженном давлении с получением 4-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-3-метокси-5-метиланилина (1,26 г) в виде светло-желтого твердого вещества.

Температура плавления: 155,0-158,0°C

МС 411 (M⁺)

Пример 10

Синтез гидрохлорида N-{4-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-3-метокси-5-метилфенил}формамида

4-[3-(4-Бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-3-метокси-5-метиланилин (0,9 г, 2,2 ммоль) добавляли к этилформиату (10 мл) и нагревали с обратным холодильником в течение 33 часов. После того как реакционный раствор охлаждали до комнатной температуры, его концентрировали при пониженном давлении. Полученный остаток очищали хроматографией на колонке с основным силикагелем (н-гексан:этилацетат = 5:1→этилацетат). Очищенный продукт концентрировали при пониженном давлении и к этилацетатному раствору остатка добавляли раствор 4 н. хлористоводородной кислоты в этилацетате. Выпавшее в осадок нерастворимое вещество отфильтровывали с получением гидрохлорида N-{4-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-3-метокси-5-метилфенил} формамида (0,3 г) в виде белого порошка.

Температура плавления: 247,5-253,0°C (разл.)

Пример 11

Синтез гидрохлорида N-метил-4-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-3-метокси-5-метиланилина

6н водный раствор гидрохлорида натрия добавляли к гидрохлориду N-{4-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-3-метокси-5-метилфенил}формамида (0,23 г, 0,48 ммоль) и полученную смесь экстрагировали дихлорметаном. Экстракционный раствор с дихлорметаном сушили над сульфатом магния и концентрировали при пониженном давлении. Полученный остаток растворяли в тетрагидрофурановом (ТГФ) растворе (5 мл) и к полученному раствору добавляли при охлаждении льдом литийалюминийгидрид (30 мг, 0,71

ммоль) и смесь нагревали с обратным холодильником в течение 15 минут. Реакционный раствор охлаждали на льду и добавляли к нему воду (0,03 мл), 15% водный раствор гидроксида натрия (0,03 мл) и воду (0,09 мл) в указанном порядке и перемешивали. Нерастворимое вещество удаляли фильтрованием и фильтрат концентрировали при пониженном давлении. Полученный остаток очищали хроматографией на колонке с основным силикагелем (н-гексан:этилацетат = 5:1→3:1) и концентрировали при пониженном давлении. К этилацетатному раствору остатка добавляли раствор 4 н. хлористоводородной кислоты в этилацетате и выпавшее в осадок нерастворимое вещество отфильтровывали с получением гидрохлорида N-метил-4-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-3-метокси-5-метиланилина (63 мг) в виде белого порошка.

Температура плавления: 239,5-244,0°C (разл.)

Пример 12

Синтез гидрохлорида 3-{4-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-3-метокси-5-метилфенил}оксазолидин-2-она

Указанное в заголовке соединение получали с использованием 3-[4-(3-хлорпропокси)-3-метокси-5-метилфенил]оксазолидин-2-она и гидрохлорида 1-бензо[b]тиофен-4-илпиперазина так же, как в примере 1.

Белый порошок (этанол)

Температура плавления: 247,5-251,0°C (разл.)

Пример 13

Синтез N-{4-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-3-метокси-5-метилфенил}ацетамида

Указанное в заголовке соединение получали с использованием N-[4-(3-хлорпропокси)-3-метокси-5-метилфенил]ацетамида и гидрохлорида 1-бензо[b]тиофен-4-илпиперазина так же, как в примере 1.

Белый порошок (этилацетат-диизопропиловый эфир)

Температура плавления: 121,5-122,0°C

Пример 14

Синтез гидрохлорида N-{4-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-3-метокси-5-метилфенил}-N-метилацетамида

Гидрид натрия (55%, масляный, 0,06 г, 1,3 ммоль) добавляли к ДМФА раствору (5 мл) N-{4-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-3-метокси-5-метилфенил}ацетамида (0,45 г, 0,99 ммоль) при охлаждении льдом и смесь перемешивали при 0°C в течение 15 минут. Добавляли к реакционному раствору метилйодид (0,07 мл, 1,1 ммоль) и раствор перемешивали при 0°C в течение одного часа. Затем к реакционному раствору добавляли гидрид натрия (55% маслянистый, 0,06 г, 1,3 ммоль) и метилйодид (0,07 мл, 1,1 ммоль) и полученную смесь перемешивали при 0°C в течение 2 часов. К реакционному раствору добавляли воду и производили экстракцию этилацетатом. Экстрагированное вещество промывали водой и сушили над сульфатом магния. Реакционный раствор концентрировали при пониженном давлении и остаток очищали хроматографией на колонке с основным силикагелем (н-гексан:этилацетат = 5:1→этилацетат). После того как очищенный продукт концентрировали при пониженном давлении, к этилацетатному раствору остатка добавляли раствор 4 н. хлористоводородной кислоты в этилацетате. Выпавшее в осадок нерастворимое вещество отфильтровывали с получением гидрохлорида N-{4-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-3-метокси-5-метилфенил}-N-метилацетамида (325 мг).

Температура плавления: 230,0-234,0°C (разл.)

Пример 15

Синтез гидрохлорида 4-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-N,N-диметил-3-метокси-5-метиланилина

Формалин (37%, 0,29 мл, 3,9 ммоль) и цианоборгидрид натрия (0,21 г, 3,1 ммоль) добавляли к метанольному раствору (6 мл) 4-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-3-метокси-5-метиланилина (0,32 г, 0,78 ммоль) при охлаждении льдом и смесь перемешивали при 0°C в течение 15 минут. К реакционному раствору добавляли уксусную кислоту (0,18 мл, 3,1 ммоль) и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение одного часа. Добавляли к реакционному раствору при охлаждении льдом водный раствор карбоната калия и производили экстракцию этилацетатом. Экстрагированное вещество сушили над сульфатом магния. Реакционный раствор концентрировали при пониженном давлении и остаток очищали хроматографией на колонке с основным силикагелем (н-гексан: этилацетат = 11:1→3:1). Очищенный продукт концентрировали при пониженном давлении. К этилацетатному раствору остатка добавляли раствор 4 н. хлористоводородной кислоты и этилацетата и выпавшее в осадок нерастворимое вещество отфильтровывали с получением гидрохлорида 4-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-N,N-диметил-3-метокси-5-метиланилина (137 мг) в виде белого порошка.

Температура плавления: 234,5-240,5°C (разл.)

Пример 16

Синтез гидрохлорида метил {4-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-3-метокси-5-метилфенил}карбамата

Указанное в заголовке соединение получали с использованием метил 4-(3-хлорпропокси)-3-метокси-5-метилфенилкарбамата и гидрохлорида 1-бензо[b]тиофен-4-илпиперазина так же, как в примере 1.

Белый порошок (этилацетат)

Температура плавления: 230,0-235,5°C

Пример 17

Синтез гидрохлорида метил N-метил-{4-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-3-метокси-5-метилфенил}карбамата

Указанное в заголовке соединение получали с использованием гидрохлорида метил {4-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-3-метокси-5-метилфенил}карбамата и метилиодида так же, как в примере 14.

Белый порошок (этилацетат)

Температура плавления: 228,0-233,5°C

Пример 18

Синтез гидрохлорида 6-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-3,4-дигидро-2Н-бензо[1,4]оксазина

Литийалюминийгидрид (86 мг, 2,3 ммоль) суспендировали в ТГФ (20 мл). К полученной суспензии добавляли по каплям в атмосфере аргона ТГФ раствор (10 мл) 6-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-3,4-дигидро-2Н-бензо[1,4]оксазин-3-она (0,8 г, 1,9 ммоль). По окончании капельного добавления полученную смесь нагревали с обратным холодильником в течение одного часа. Добавляли к реакционной смеси при охлаждении льдом воду (0,1 мл), 15% водный раствор гидроксида натрия (0,1 мл) и воду (0,3 мл) и смесь перемешивали. Нерастворимое вещество удаляли фильтрованием через церит и фильтрат концентрировали при

пониженном давлении. Полученный остаток очищали хроматографией на колонке с силикагелем (дихлорметан:метанол = 1:0→20:1) и концентрировали при пониженном давлении. Остаток растворяли в этилацетате (10 мл) и к полученному раствору добавляли раствор (0,34 мл) 1 н. хлористоводородная кислота/этанол и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 15 минут. Выпавшее в осадок нерастворимое вещество отфильтровывали, промывали этилацетатом и сушили с получением гидрохлорида 6-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-3,4-дигидро-2Н-бензо[1,4]оксазина (0,11 г) в виде белого твердого вещества.

Температура плавления 207,9-208,8°C

Пример 19

Синтез гидрохлорида 7-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-3,4-дигидро-2Н-бензо[1,4]оксазина

Указанное в заголовке соединение получали с использованием 7-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-3,4-дигидро-2Н-бензо[1,4]оксазин-3-она так же, как в примере 18.

Светло-коричневое твердое вещество (этилацетат)

Температура плавления: 214,0-215,9°C

Пример 20

Синтез гидрохлорида 7-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-4-метил-3,4-дигидро-2Н-бензо[1,4]оксазина

Формалин (37%, 0,22 мл, 2,7 ммоль) и МР-цианоборгидрид (2,41 ммоль/г, 1,12 г, 2,7 ммоль) добавляли к метанольному раствору (15 мл) 7-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-3,4-дигидро-2Н-бензо[1,4]оксазина (0,30 г, 0,67 ммоль) и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение ночи. Нерастворимое вещество удаляли фильтрованием и фильтрат концентрировали при пониженном давлении. Полученный остаток очищали хроматографией на колонке с силикагелем (дихлорметан:метанол = 1:0→50:1). Очищенный продукт концентрировали при пониженном давлении и остаток растворяли в этилацетате (15 мл) и к полученному раствору добавляли раствор (0,64 мл) 1 н. хлористоводородная кислота/этанол. Смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 15 минут. Выпавшее в осадок нерастворимое вещество отфильтровывали, промывали этилацетатом и сушили с получением гидрохлорида 7-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-4-метил-3,4-дигидро-2Н-бензо[1,4]оксазина (0,23 г) в виде светло-коричневого твердого вещества.

Температура плавления: 248,1-249,6°C

Пример 21

Синтез гидрохлорида 6-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-3-метил-1,2,3,4-тетрагидрохиназолин-4-ола и гидрохлорида 6-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-3-метил-1,2,3,4-тетрагидрохиназолина

ТГФ раствор (20 мл) 6-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-3-метилхиназолина (0,25 г, 0,58 ммоль) охлаждали на льду. К данному раствору добавляли по каплям в атмосфере аргона ТГФ раствор (5 мл) литийалюминийгидрида (26 мг, 0,69 ммоль). По окончании капельного добавления раствор перемешивали при комнатной температуре в течение 20 минут и нагревали с обратным холодильником в течение одного часа. Добавляли к реакционному раствору при охлаждении льдом воду (0,03 мл), 15% водный раствор гидроксида натрия (0,03 мл) и воду (0,1 мл) и перемешивали. Нерастворимое вещество удаляли фильтрованием через церит и фильтрат концентрировали при пониженном давлении.

Полученный остаток очищали хроматографией на колонке с силикагелем (дихлорметан:метанол = 1:0→25:1). Очищенный продукт концентрировали при пониженном давлении и остаток растворяли в этилацетате (5 мл). К полученному раствору добавляли раствор (0,189 мл) 1 н. хлористоводородная кислота/этанол и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 15 минут. Выпавшее в осадок нерастворимое вещество отфильтровывали, промывали этилацетатом и сушили с получением гидрохлорида 6-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-3-метил-1,2,3,4-тетрагидрохиназолин-4-ола (87 мг) в виде белого твердого вещества.

МС: 438 (M⁺).

Элюирующий раствор дихлорметан/метанол (10:1) пропускали через хроматографическую колонку с силикагелем. Полученный элюат концентрировали при пониженном давлении и затем остаток растворяли в этилацетате (5 мл). К полученному раствору добавляли раствор (0,226 мл) 1 н. хлористоводородная кислота/этанол и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 15 минут. Выпавшее в осадок нерастворимое вещество отфильтровывали, промывали этилацетатом и сушили с получением гидрохлорида 6-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-3-метил-1,2,3,4-тетрагидрохиназолина (49 мг) в виде белого твердого вещества.

Температура плавления: 203,1-204,4°C

Пример 22

Синтез гидрохлорида 5-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-2,3-дигидро-1H-индола

Триэтилсилан (1,14 мл, 7,14 ммоль) добавляли к раствору в трифторуксусной кислоте (5 мл) 5-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-1H-индола (228 мг, 0,71 ммоль) и смесь перемешивали при 50°C в течение 2 часов. Смесь концентрировали при пониженном давлении. Остаток растворяли в дихлорметане, нейтрализовали насыщенным водным раствором гидрокарбоната натрия и разделяли. Органическую фазу промывали насыщенным водным раствором гидрокарбоната натрия, водой и насыщенным раствором соли в указанном порядке и концентрировали при пониженном давлении. Полученный остаток очищали хроматографией на колонке с основным силикагелем (н-гексан:этилацетат = 5:1→1:1). Очищенный продукт концентрировали при пониженном давлении и остаток добавляли к этилацетату (5 мл) и к полученной смеси добавляли раствор 1 н. хлористоводородная кислота/этанол (0,10 мл) и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 15 минут. Выпавшее в осадок нерастворимое вещество отфильтровывали, промывали этилацетатом и сушили с получением гидрохлорида 5-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-2,3-дигидро-1H-индола (32 мг) в виде белого твердого вещества.

Температура плавления: 222,4-223,9°C

Соединения, перечисленные в таблицах 13 (см. в конце текста описания), получали, используя подходящие исходные вещества, такими же способами, как в ссылочных примерах 1-36 или примерах 1-22 и 3094-3110.

В таблицах представлены действительно полученные соединения с их физическими свойствами, такими как кристаллическая форма, т.пл. (температура плавления), соль, ¹H-ЯМР и МС (масс-спектр).

Пример 3094

Синтез 3-амино-4-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-N-

этилбензамида

5% палладий-на-углероде (0,8 г) добавляли к этанольному раствору (30 мл) 4-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-N-этил-3-нитробензамида (1,0 г, 2,1 ммоль) и смесь подвергали каталитическому восстановлению при комнатной температуре при нормальном давлении. Катализатор удаляли фильтрованием и фильтрат концентрировали при пониженном давлении. К остатку добавляли воду и раствор экстрагировали этилацетатом. Органический слой сушили над безводным сульфатом натрия и затем концентрировали при пониженном давлении. Остаток очищали хроматографией на колонке с силикагелем (дихлорметан:метанол = 30:1→20:1). Очищенный продукт концентрировали при пониженном давлении с получением 3-амино-4-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-N-этилбензамида (0,78 г, 83% выход) в виде желтого аморфного твердого вещества.

¹H-ЯМР (CDCl₃) δ м.д.: 1,23 (3H, т, J=7,4 Гц), 2,00-2,15 (2H, м), 2,67 (2H, т, J=7,3 Гц), 2,75 (4H, ушир.с), 3,21 (4H, ушир.с), 3,40-3,50 (2H, м), 3,50-4,30 (2H, ушир.), 4,13 (2H, т, J=6,5 Гц), 5,99 (1H, ушир.с), 6,80 (1H, д, J=8,4 Гц), 6,90 (1H, д, J=7,6 Гц), 7,08 (1H, дд, J=2,1, 8,3 Гц), 7,19 (1H, д, J=2,1 Гц), 7,25-7,30 (1H, м), 7,35-7,45 (2H, м), 7,55 (1H, д, J=8,0 Гц).

Пример 3095

Синтез гидрохлорида 1-бензо[b]тиофен-4-ил-4-[3-(1-ацетилпиперидин-4-илокси)пропил]пиперазина

Триэтиламин (0,28 мл, 2,0 ммоль) добавляли к дихлорметановому раствору (15 мл) 1-бензо[b]тиофен-4-ил-4-[3-(пиперидин-4-илокси)пропил]пиперазина (0,45 г, 1,25 ммоль) и смесь охлаждали на ледяной бане. К полученной смеси добавляли ацетилхлорид (0,1 мл, 1,4 ммоль) и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение ночи. К реакционному раствору добавляли воду, после чего смесь экстрагировали дихлорметаном. Органический слой сушили над безводным сульфатом натрия и затем концентрировали при пониженном давлении. Остаток очищали хроматографией на колонке с силикагелем (дихлорметан:метанол = 30:1). Очищенный продукт концентрировали при пониженном давлении. К остатку добавляли 0,5 н. раствор гидрохлорид-метанол (3 мл). Полученные кристаллы отфильтровывали и сушили с получением гидрохлорида 1-бензо[b]тиофен-4-ил-4-[3-(1-ацетилпиперидин-4-илокси)пропил]пиперазина в виде белого порошка (0,36 г, 66% выход).

Температура плавления: 208-210°C

Пример 3096

Синтез гидрохлорида 1-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]пирролидин-2,5-диона

PS-трифенилфосфин (3 ммоль/г, 1,80 г), дитрет-бутилазодикарбоксилат (1,27 г, 5,4 ммоль) и N-гидроксисукцинимид (510 мг, 4,3 ммоль) добавляли к ТГФ раствору (50 мл) 3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропанола (1,00 г, 3,6 ммоль) и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 4 часов. Смола удаляли фильтрованием и фильтрат концентрировали при пониженном давлении. Остаток очищали хроматографией на колонке с основным силикагелем (н-гексан: этилацетат = 1:2). Очищенный продукт концентрировали при пониженном давлении с получением белого аморфного твердого вещества (762 мг, 47% выход). Растворяли в этаноле 157 мг белого аморфного твердого вещества. К раствору добавляли 1 н. раствор хлористоводородная кислота-этанол (0,42 мл), после чего добавляли еще простой эфир. Раствор отстаивали в холодильнике. Полученные кристаллы

фильтровали и сушили с получением гидрохлорида 1-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]пирролидин-2,5-диона (158 мг) в виде белого порошка.

Температура плавления: 255,0-257,0°C

Пример 3097

Синтез амида 6-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]нафталин-1-карбоновой кислоты

Триэтиламин (0,24 мл, 1,7 ммоль) и изобутилхлорформиат (0,19 мл, 1,4 ммоль) добавляли к ацетонитриловому раствору (10 мл) 6-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]нафталин-1-карбоновой кислоты (0,52 г, 1,2 ммоль) при охлаждении льдом и смесь перемешивали в течение 20 минут. К реакционному раствору добавляли 28% аммиачную воду (0,5 мл) и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 20 минут. К реакционному раствору добавляли этилацетат и раствор промывали водой. Органический слой сушили над безводным сульфатом магния и затем концентрировали при пониженном давлении. Остаток очищали хроматографией на колонке с основным силикагелем (н-гексан: этилацетат = 2:1→0:1). Очищенный продукт концентрировали при пониженном давлении и остаток перекристаллизовывали из смеси растворителей этилацетат-диизопропиловый эфир с получением амида 6-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-1-нафталин-1-карбоновой кислоты (0,27 г, 53% выход) в виде белого порошка.

Температура плавления 167,0-169,0°C

Пример 3098

Синтез метиламида 1-аллил-5-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-1Н-пиразол-3-карбоновой кислоты

40% метанольный раствор (5 мл) метиламина добавляли к метанольному раствору (5 мл) этилового эфира 1-аллил-5-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-1Н-пиразол-3-карбоновой кислоты (0,5 г, 1,1 ммоль) и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 3 дней. Раствор концентрировали при пониженном давлении и остаток очищали хроматографией на колонке с основным силикагелем (н-гексан:этилацетат = 5:1→0:1). Очищенный продукт концентрировали при пониженном давлении и остаток перекристаллизовывали из смеси растворителей этилацетат-диизопропиловый эфир с получением метиламида 1-аллил-5-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-1Н-пиразол-3-карбоновой кислоты (0,32 г, 67% выход) в виде белого порошка.

Температура плавления 138,5-140,5°C

Пример 3099

Синтез амида 4-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]циклогексанкарбоновой кислоты

Аммиачную воду (28%, 0,5 мл), 1-(3-диметиламинопропил)-3-этилкарбодиимидгидрохлорид (WSC) (0,36 г, 1,9 ммоль) и 4-диметиламинопиридин (DMAP) (0,05 г, 0,4 ммоль) добавляли к дихлорметановому раствору (10 мл) 4-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]циклогексанкарбоновой кислоты (0,5 г, 1,2 ммоль) и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 19 часов. К реакционному раствору добавляли дихлорметан и смесь промывали водой. Органический слой сушили над безводным сульфатом магния и затем концентрировали при пониженном давлении. Остаток очищали хроматографией на колонке с основным силикагелем (н-гексан:

этилацетат = 3:1→0:1). Очищенный продукт концентрировали при пониженном давлении и остаток перекристаллизовывали из смеси растворителей этилацетат-диизопропиловый эфир с получением амида 4-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]циклогексанкарбоновой кислоты (0,1 г, 22% выход) в виде белого порошка.

Температура плавления 107,5-108,5°C.

Пример 3100

Синтез гидрохлорида {4-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-3-метокси-5-метилфенил}амида этансульфоновой кислоты

Дихлорметановый раствор (4 мл) 4-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-3-метокси-5-метилфениламина (0,2 г, 0,49 ммоль) охлаждали на льду. Добавляли к нему N-этилдиизопропиламин (0,15 мл, 0,87 ммоль) и этансульфонилхлорид (0,07 мл, 0,73 ммоль) и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение одного часа. Еще добавляли N-этилдиизопропиламин (0,15 мл, 0,87 ммоль) и этансульфонилхлорид (0,07 мл, 0,73 ммоль) и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 19 часов. Добавляли 6 н. водный раствор гидроксида натрия (0,5 мл) и этанол (2 мл) и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение ночи. Добавляли к реакционному раствору дихлорметан, после чего реакционный раствор промывали водой. Органический слой сушили над безводным сульфатом магния и затем концентрировали при пониженном давлении. Остаток очищали хроматографией на колонке с основным силикагелем (н-гексан: этилацетат = 2:1→0:1). Очищенный продукт концентрировали при пониженном давлении. К остатку добавляли 4 н. раствор гидрохлорид/этилацетат. Образовавшиеся кристаллы отфильтровывали и сушили с получением гидрохлорида {4-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-3-метокси-5-метилфенил}амида этансульфоновой кислоты (222 мг, 85% выход) в виде белого порошка.

Температура плавления: 235,5-237,5°C

Пример 3101

Синтез метилового эфира 5-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-1-метил-1Н-пиразол-3-ил}карбаминовой кислоты

Дихлорметановый раствор (2 мл) 5-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-1-метил-1Н-пиразол-3-иламина (0,17 г, 0,47 ммоль) охлаждали на льду. Добавляли к нему пиридин (0,08 мл, 0,94 ммоль) и метилхлорформиат (0,04 мл, 0,52 ммоль) и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 17 часов. К реакционному раствору добавляли этилацетат и реакционную смесь промывали водой. Водный слой экстрагировали этилацетатом. Органические слои объединяли, сушили над безводным сульфатом магния и затем концентрировали при пониженном давлении. Остаток очищали хроматографией на колонке с основным силикагелем (н-гексан:этилацетат = 2:1→1:1). Очищенный продукт концентрировали при пониженном давлении и остаток перекристаллизовывали из смеси растворителей этилацетат-диизопропиловый эфир с получением метилового эфира 5-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-1-метил-1Н-пиразол-3-ил}карбаминовой кислоты (0,10 г, 51% выход) в виде белого порошка.

Температура плавления: 162,5-165,0°C

Пример 3102

Синтез гидрохлорида 3-{5-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-1-метил-1Н-пиразол-3-ил}-1,1-диметилмочевины

Дихлорметановый раствор (5 мл) 5-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-1-метил-1Н-пиразол-3-иламина (0,27 г, 0,73 ммоль) охлаждали на льду. Добавляли к нему триэтиламин (0,36 мл, 2,5 ммоль), диметилкарбамоилхлорид (0,20 мл, 2,1 ммоль) и пиридин (0,06 мл, 0,73 ммоль) и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение ночи. К реакционному раствору добавляли воду и реакционный раствор экстрагировали этилацетатом. Органический слой сушили над безводным сульфатом магния и затем концентрировали при пониженном давлении. Остаток очищали хроматографией на колонке с основным силикагелем (н-гексан: этилацетат = 3:1→0:1). Очищенный продукт концентрировали при пониженном давлении и остаток растворяли в этилацетате, после чего к раствору добавляли 4 н. раствор гидрохлорид/этилацетат. Полученные кристаллы отфильтровывали и сушили с получением гидрохлорида 3-{5-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-1-метил-1Н-пиразол-3-ил}-1,1-диметилмочевины (0,10 г, 30% выход) в виде светло-желтого порошка.

Температура плавления: 174,0-176,5°C

Пример 3103

Синтез гидрохлорида 3-{5-[4-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)бутокс]-1-метил-1Н-пиразол-3-ил}-1,1-диметилмочевины

Водный раствор диметиламина (50%, 0,16 мл, 1,6 ммоль) добавляли к ДМФА раствору фенилового эфира (3 мл) 5-[4-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)бутокс]-1-метил-1Н-пиразол-3-илкарбаминовой кислоты (0,26 г, 0,52 ммоль) и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 16 часов. К реакционному раствору добавляли воду, после чего смесь экстрагировали этилацетатом. Органический слой сушили над безводным сульфатом магния и затем концентрировали при пониженном давлении. Остаток очищали хроматографией на колонке с основным силикагелем (н-гексан:этилацетат = 7:3→0:1). Очищенный продукт концентрировали при пониженном давлении и остаток растворяли в этилацетате. Добавляли 1 н. этанольный раствор хлористоводородной кислоты и полученные кристаллы отфильтровывали и сушили с получением гидрохлорида 3-{5-[4-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)бутокс]-1-метил-1Н-пиразол-3-ил}-1,1-диметилмочевины (95 мг, 37% выход) в виде белого порошка.

Температура плавления: 186,0-187,5°C

Пример 3104

Синтез N-{5-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-1-метил-1Н-пиразол-3-ил}ацетамида

Уксусный ангидрид (1 мл) и триэтиламин (0,09 мл, 0,65 ммоль) добавляли к дихлорметановому раствору (4 мл) 5-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-1-метил-1Н-пиразол-3-иламина (0,20 г, 0,54 ммоль) и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 6 часов. Добавляли к реакционному раствору водный раствор карбоната калия, после чего смесь экстрагировали этилацетатом. Органический слой сушили над безводным сульфатом магния и затем концентрировали при пониженном давлении. Остаток очищали хроматографией на колонке с основным силикагелем (н-гексан:этилацетат = 2:1→0:1). Очищенный продукт концентрировали при пониженном давлении и остаток перекристаллизовывали из смеси растворителей этилацетат-диизопропиловый эфир с получением N-{5-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-1-метил-1Н-пиразол-3-ил}ацетамида (0,19 г, 89% выход) в виде белого порошка.

Температура плавления: 137,0-139,0°C

Пример 3105

Синтез гидрохлорида 3-{4-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-3-гидроксиметил-5-метоксифенил}оксазолидин-2-она

Сначала добавляли гидрохлорид 2-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-3-метокси-5-(2-оксооксазолидин-3-ил)бензальдегида (1,28 г, 2,4 ммоль)) к водному раствору гидрохлорида калия. Смесь экстрагировали дихлорметаном. Экстрагированный раствор концентрировали при пониженном давлении и остаток растворяли в ТГФ (15 мл). К раствору добавляли при охлаждении льдом боргидрид натрия (0,05 г, 1,2 ммоль) и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 3 часов. Затем к смеси добавляли при охлаждении льдом 10% хлористоводородную кислоту для разложения избыточного реактива. После того как к раствору добавляли 6 н. водный раствор гидроксида натрия, чтобы сделать раствор щелочным, смесь экстрагировали этилацетатом. Органический слой сушили над безводным сульфатом магния и затем концентрировали при пониженном давлении. Остаток очищали хроматографией на колонке с силикагелем (дихлорметан:этилацетат = 3:7 → дихлорметан:метанол = 100:3). Очищенный продукт концентрировали при пониженном давлении и остаток растворяли в этаноле. К раствору добавляли 1 н. этанольный раствор хлористоводородной кислоты. Образовавшиеся кристаллы перекристаллизовывали из этанола с получением гидрохлорида 3-{4-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-3-гидроксиметил-5-метоксифенил}оксазолидин-2-она (0,52 г, 41% выход) в виде белого порошка.

Температура плавления: 224,0-226,5°C (разложение)

Пример 3106

Синтез гидрохлорида 1-ацетил-4-{4-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-3-метокси-5-метилфенил}пиперазина

Гидрохлорид 1-бензо[b]тиофен-4-ил-4-[3-(4-бром-2-метокси-6-метилфеноксипропил)пиперазина (0,5 г, 0,98 ммоль), 1-ацетилпиперазин (0,15 г, 1,2 ммоль), ацетат палладия (11 мг, 0,048 ммоль), 2,2'-бис(дифенилфосфино)-1,1'-бинафтил (BINAP) (63 мг, 0,098 ммоль) и трет-бутоксид натрия (0,23 г, 2,3 ммоль) добавляли к толуолу (10 мл) и смесь перемешивали в атмосфере аргона при 90°C в течение 22 часов. Реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры и фильтровали через церит. Отфильтрованный осадок промывали этилацетатом. Фильтрат и промывную жидкость объединяли и затем концентрировали при пониженном давлении. Остаток очищали хроматографией на колонке с основным силикагелем (н-гексан:этилацетат = 11:1 → 1:1). Очищенный продукт концентрировали при пониженном давлении и остаток растворяли в этилацетате. К раствору добавляли 1 н. этанольный раствор хлористоводородной кислоты и полученные кристаллы отфильтровывали и сушили с получением гидрохлорида 1-ацетил-4-{4-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-3-метокси-5-метилфенил}пиперазина (75 мг, 14% выход) в виде белого порошка.

Температура плавления: 257,0-261,0°C (разложение)

Пример 3107

Синтез дигидрохлорида 1-бензо[b]тиофен-4-ил-4-[3-(4-имидазол-1-ил-2-метокси-6-метилфеноксипропил)пиперазина

1-Бензо[b]тиофен-4-ил-4-[3-(4-йод-2-метокси-6-метилфеноксипропил)пиперазин (0,6 г, 0,69 ммоль), имидазол (0,07 г, 1,03 ммоль), иодид меди(I) (13 мг, 0,069 ммоль), транс-N,N'-диметил-1,2-циклогександиамин (0,02 мл, 0,14 ммоль) и

карбонат цезия (0,47 г, 1,38 ммоль) добавляли к 1,4-диоксану (6 мл) и смесь нагревали с обратным холодильником в атмосфере аргона в течение 50 часов. После того как полученную реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры, к реакционному раствору добавляли воду и смесь экстрагировали этилацетатом.

Органический слой сушили над безводным сульфатом магния и затем концентрировали при пониженном давлении. Остаток очищали хроматографией на колонке с основным силикагелем (н-гексан:этилацетат = 5:1→1:1). Очищенный продукт концентрировали при пониженном давлении и остаток растворяли в этилацетате. К раствору добавляли 1 н. этанольный раствор хлористоводородной кислоты и полученные кристаллы отфильтровывали и сушили с получением дигидрохлорида 1-бензо[b]тиофен-4-ил-4-[3-(4-имидазол-1-ил-2-метокси-6-метилфенокси)пропил]пиперазина (60 мг, 17% выход) в виде светло-желтого порошка.

Температура плавления: 234,0-240,0°C (разложение)

Пример 3108

Синтез гидрохлорида 4-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-3,N-диметил-5-(2,2,2-трифторэтоксид)бензамида

Карбонат цезия (0,34 г, 0,99 ммоль) и 1,1,1-трифтор-2-йодэтан (0,05 мл, 0,47 ммоль) добавляли к ДМФА раствору (2 мл) 4-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-3-гидрокси-5,N-диметилбензамида (188 мг, 0,39 ммоль) и смесь перемешивали при 40°C в течение 2 часов. Затем еще добавляли 1,1,1-трифтор-2-йодэтан (0,1 мл, 0,94 ммоль) и смесь перемешивали при 40°C в течение 5 часов. После того как реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры, к реакционному раствору добавляли воду и затем экстрагировали этилацетатом. Органический слой сушили над безводным сульфатом магния и затем концентрировали при пониженном давлении. Остаток очищали хроматографией на колонке с основным силикагелем (н-гексан:этилацетат = 3:1→0:1). Очищенный продукт концентрировали при пониженном давлении и остаток растворяли в изопропиловом спирте. К раствору добавляли 1 н. этанольный раствор хлористоводородной кислоты и смесь затем концентрировали при пониженном давлении. Остаток перекристаллизовывали из смеси растворителей изопропиловый спирт/этилацетат с получением гидрохлорида 4-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-3,N-диметил-5-(2,2,2-трифторэтоксид)бензамида (88 мг, 40% выход) в виде светло-желтого порошка.

Температура плавления: 156,0-157,5°C

Пример 3109

Синтез гидрохлорида 1-{5-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-1-метил-1H-пиразол-3-ил}этанона

Гидрохлорид метоксиметиламида 5-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-1-метил-1H-пиразол-3-карбоновой кислоты (0,61 г, 1,3 ммоль) добавляли к водному раствору гидроксида натрия и полученную смесь экстрагировали дихлорметаном. Экстрагированный раствор концентрировали при пониженном давлении и остаток растворяли в ТГФ (12 мл). Раствор охлаждали до -78°C и добавляли к нему 1 н. эфирный раствор метиллития (1,2 мл), после чего смесь перемешивали при той же температуре в течение 2 часов. Добавляли к реакционному раствору водный раствор хлорида аммония и раствор нагревали до комнатной температуры. К раствору добавляли хлорид калия и затем экстрагировали этилацетатом. Органический слой сушили над безводным сульфатом магния и затем концентрировали при пониженном давлении. Остаток очищали хроматографией на

колонке с силикагелем (дихлорметан:этилацетат = 3:1→0:1). Очищенный продукт концентрировали при пониженном давлении и остаток растворяли в этаноле. К раствору добавляли 1 н. этанольный раствор хлористоводородной кислоты и полученные кристаллы перекристаллизовывали из этанола, содержащего воду, с получением гидрохлорида 1-{5-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-1-метил-1Н-пиразол-3-ил}этанона (0,22 г, 40% выход) в виде белого порошка.

Температура плавления: 245,0°C (разложение)

Пример 3110

Синтез 5-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-3-гидроксиметил-1-метил-1Н-пиразола

ТГФ раствор (8 мл) 5-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-3-(трет-бутилдиметилсиланилоксиметил)-1-метил-1Н-пиразола (0,75 г, 1,5 ммоль) охлаждали на льду и добавляли к нему 1М ТГФ раствор тетрабутиламмонийфторида (1,7 мл). Смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 16 часов. Добавляли к реакционному раствору этилацетат и смесь промывали водой. Органический слой сушили над безводным сульфатом магния и затем концентрировали при пониженном давлении. Остаток очищали хроматографией на колонке с силикагелем (дихлорметан:метанол = 1:0→30:1→15:1). Очищенный продукт концентрировали при пониженном давлении и остаток перекристаллизовывали из смеси этилацетата и диизопропилового эфира с получением 5-[3-(4-бензо[b]тиофен-4-илпиперазин-1-ил)пропокси]-3-гидроксиметил-1-метил-1Н-пиразола (0,46 г, 79% выход) в виде белого порошка.

Температура плавления: 123,5-126,0°C

Фармакологическое испытание 1

1) Анализ на связывание с допаминовым D₂ рецептором

Анализ выполняли по методу Kohler et al. (Kohler C., Hall H., Ogren S.O. и Gawell L., Specific in vitro and in vivo binding of 3H-raclopride. A potent substituted benzamide drug with high affinity for dopamine D-2 receptors in the rat brain. Biochem. Pharmacol., 1985; 34: 2251-2259).

Обезглавливали крыс-самцов Wistar, сразу же извлекали головной мозг и выделяли полосатое тело. Гомогенизировали его в 50 мМ буферном растворе трис(гидроксиметил)аминометана (Tris)-хлористоводородная кислота (pH 7,4) объемом, 50-кратным массе ткани, используя гомогенизатор с лопастью, вращающейся с высокой скоростью, и центрифугировали при 4°C, 48000×g в течение 10 минут. Полученный осадок суспендировали снова в указанном выше буфере объемом, 50-кратным массе ткани, и после инкубирования при 37°C в течение 10 минут, центрифугировали в описанных выше условиях. Полученный осадок суспендировали в 50 мМ буфере (Tris)-хлористоводородная кислота (содержащем 120 мМ NaCl, 5 мМ KCl, 2 мМ CaCl₂, 1 мМ MgCl₂, pH 7,4) объемом, 25-кратным массе ткани, и сохраняли замораживанием при -85°C до момента использования для анализа на связывание в качестве мембранного препарата.

Анализ на связывание выполняли, используя 40 мкл мембранного препарата, 20 мкл [³H]-раклоприда (конечная концентрация 1-2 нМ), 20 мкл испытуемого лекарственного вещества и 50 мМ буфера Tris-хлористоводородная кислота (содержащего 120 мМ NaCl, 5 мМ KCl, 2 мМ CaCl₂, 1 мМ MgCl₂, pH 7,4), так что общее количество составляло 200 мкл (конечная концентрация диметилсульфоксида 1%). Реакцию проводили при комнатной температуре в течение 1 часа и заканчивали проведением вакуум-фильтрования с помощью

сборщика клеток на стекловолоконной фильтровальной пластине. Фильтровальную пластину, изготовленную из стекловолокна, промывали 50 мМ буфером Tris-хлористоводородная кислота (pH 7,4) и затем сушили, после чего добавляли жидкую сцинтилляционную смесь для микропланшетов и измеряли радиоактивность с помощью микропланшетного сцинтилляционного счетчика. Радиоактивность в присутствии 10 мкМ гидрохлорида (+)-бутакламола принимали за неспецифическое связывание.

По данным зависящего от концентрации взаимодействия вычисляли значение IC_{50} , используя программу нелинейного анализа. Из значения IC_{50} по формуле Ченга-ПруссOFFа вычисляли значение K_i . Результаты показаны в таблице 312 (см. в конце текста описания).

2) Анализ на связывание с серотониновым 5-HT_{2A} рецептором

Анализ выполняли по методу Leysen J.E. et al. (Leysen J.E., Niemegeers C.J.E., Van Nueten J.M., Laduron P.M. [3H] Ketanserin (R 41 468), a selective 3H-ligand for serotonin 2 receptor binding sites. Mol. Pharmacol., 1982, 21: 301-314).

Обезглавливали крыс-самцов Wistar, сразу же извлекали головной мозг и выделяли лобную кору. Гомогенизировали ее в 0,25М сахарозе объемом, 10-кратным массе ткани, используя гомогенизатор из стекла и тефлона, и центрифугировали при 4°C, 1000×g в течение 10 минут. Полученный супернатант переносили в другую центрифужную пробирку и суспендировали в 0,25М сахарозе объемом, 5-кратным массе ткани, и осадок центрифугировали в описанных выше условиях. Полученный супернатант объединяли с ранее полученным супернатантом и доводили до объема, 40-кратного массе ткани, используя 50 мМ буфер (Tris)-хлористоводородная кислота (pH 7,4), и центрифугировали при 4°C, 35000×g в течение 10 минут. Полученный осадок суспендировали опять в описанном выше буфере объемом, 40-кратным массе ткани, и центрифугировали в указанных выше условиях. Полученный осадок суспендировали в описанном выше буфере объемом, 20-кратным массе ткани, и сохраняли замораживанием при -85°C до момента использования для анализа на связывание в качестве мембранного препарата.

Анализ на связывание выполняли, используя 40 мкл мембранного препарата, 20 мкл [³H]-Кетансерина (конечная концентрация 1-3 нМ), 20 мкл испытуемого лекарственного вещества и 50 мМ буфера Tris-хлористоводородная кислота (pH 7,4), так что общее количество составляло 200 мкл (конечная концентрация диметилсульфоксида 1%). Реакцию проводили при 37°C в течение 20 минут и заканчивали проведением вакуум-фильтрации с помощью сборщика клеток на стекловолоконной фильтровальной пластине.

Фильтровальную пластину, изготовленную из стекловолокна, промывали 50 мМ буфером Tris-хлористоводородная кислота (pH 7,4) и затем сушили, после чего добавляли жидкую сцинтилляционную смесь для микропланшетов и измеряли радиоактивность с помощью микропланшетного сцинтилляционного счетчика. Радиоактивность в присутствии 10 мкМ спиперона принимали за неспецифическое связывание.

По данным зависящего от концентрации взаимодействия вычисляли значение IC_{50} , используя программу нелинейного анализа. Из значения IC_{50} по формуле Ченга-ПруссOFFа вычисляли значение K_i . Результаты показаны в таблице 313 (см. в конце текста описания).

3) Анализ на связывание с адреналиновым α_1 рецептором

Анализ выполняли по методу Groß G. et al. (Groß G., Hanft G. и Kolassa N. Urapidil

and some analogues with hypotensive properties show high affinities for 5-hydroxytryptamine (5-HT) binding sites of the 5-HT_{1A} subtype and for α 1-adrenoceptor binding sites. Naunyn-Schmiedeberg's Arch Pharmacol., 1987, 336: 597-601).

Обезглавливали крыс-самцов Wistar, сразу же извлекали головной мозг и выделяли кору большого мозга. Гомогенизировали ее в 50 мМ буферном растворе Tris-хлористоводородная кислота (100 мМ NaCl, содержащем 2 мМ этилендиаминтетраацетат дигидродинатрия, pH 7,4) объемом, 20-кратным массе ткани, используя гомогенизатор с лопастью, вращающейся с высокой скоростью, и центрифугировали при 4°C, 80000×g в течение 20 минут. Полученный осадок суспендировали в указанном выше буфере объемом, 20-кратным массе ткани, и после инкубирования при 37°C в течение 10 минут, центрифугировали в описанных выше условиях. Полученный осадок суспендировали опять в указанном выше буфере объемом, 20-кратным массе ткани, и центрифугировали в описанных выше условиях. Полученный осадок суспендировали в 50 мМ буфере (Tris)-хлористоводородная кислота (содержащем 1 мМ этилендиаминтетраацетат дигидродинатрия, pH 7,4) объемом, 20-кратным массе ткани, и сохраняли замораживанием при -85°C до момента использования для анализа на связывание в качестве мембранного препарата.

Анализ на связывание выполняли, используя 40 мкл мембранного препарата, 20 мкл [³H]-празозина (конечная концентрация 0,2-0,5 нМ), 20 мкл испытуемого лекарственного вещества и 50 мМ буфера Tris-хлористоводородная кислота (содержащего 1 мМ EDTA, pH 7,4), так что общее количество составляло 200 мкл (конечная концентрация диметилсульфоксида 1%). Реакцию проводили при 30°C в течение 45 минут и заканчивали проведением вакуум-фильтрования с помощью сборщика клеток на стекловолоконной фильтровальной пластине.

Фильтровальную пластину, изготовленную из стекловолокна, промывали 50 мМ буфером Tris-хлористоводородная кислота (pH 7,4) и затем сушили, после чего добавляли жидкую сцинтилляционную смесь для микропланшетов и измеряли радиоактивность с помощью микропланшетного сцинтилляционного счетчика. Радиоактивность в присутствии 10 мкМ гидрохлорида фентоламина принимали за неспецифическое связывание.

По данным зависящего от концентрации взаимодействия вычисляли значение IC₅₀, используя программу нелинейного анализа. Из значения IC₅₀ по формуле Ченга-Пруссоффа вычисляли значение K_i.

Фармакологическое испытание 2

Частичная агонистическая активность по отношению к допаминному D₂ рецептору с использованием клеток, экспрессирующих D₂ рецептор

Частичную агонистическую активность по отношению к допаминному D₂ рецептору оценивали количественным определением ингибирующего эффекта испытуемого соединения на продукцию циклического АМФ (AMP) в экспрессирующих допаминный D₂ рецептор клетках, в которых продукция аденозин 3',5'-циклического монофосфата (циклического АМФ) индуцируется стимуляцией форсколина.

Клетки яичника китайского хомяка/DHFR(-), экспрессирующие рекомбинантный допаминный D₂ рецептор, культивировали в питательной среде (среда Дульбекко, модифицированная по способу Исков (питательная среда IMDM), 10% фетальная сыворотка, 50 МЕ/мл пенициллин, 50 мкг/мл стрептомицин, 200 мкг/мл генетицин, 0,1 мМ гипоксантин натрия, 16 мкМ тимидин) при 37°C в атмосфере 5% диоксида

углерода. Клетки высевали по 10^4 клеток/лунку на 96-луночном микропланшете, покрытом поли-L-лизинном, и выращивали в тех же самых условиях в течение 2 дней. Каждую лунку промывали 100 мкл питательной среды (питательная среда IMDM, 0,1 мМ гипоксантин натрия, 16 мкМ тимидин). Питательную среду заменяли 50 мкл питательной среды (питательная среда IMDM, 0,1% аскорбат натрия, 0,1 мМ гипоксантин натрия, 16 мкМ тимидин), содержащей растворенные в ней 3 мкМ испытуемого соединения. После инкубирования при 37°C в атмосфере 5% диоксида углерода в течение 20 минут, питательную среду заменяли 100 мкл форсколиновой стимулирующей питательной среды (питательная среда IMDM, 0,1% аскорбат натрия, 0,1 мМ гипоксантин натрия, 16 мкМ тимидин, 10 мкМ форсколин, 500 мкМ 3-изобутил-1-метилксантин), содержащей растворенные в ней 3 мМ испытуемого соединения, и проводили инкубирование при 37°C в атмосфере 5% диоксида углерода в течение 10 минут. После удаления питательной среды распределяли 200 мкл водного раствора Lysis 1B (Amersham Bioscience, реактив, прилагаемый к системе Biotrack для иммуноферментного анализа циклического АМФ) и встряхивали в течение 10 минут. Водный раствор из каждой лунки использовали в качестве образца для измерения. Образцы для измерения, четырехкратно разведенные, подвергали операции определения количества циклического АМФ, используя указанную выше систему для иммуноферментного анализа. Коэффициент ингибирования соответственного испытуемого соединения вычисляли, полагая количество циклического АМФ в лунке, в которую испытуемое соединение не добавляли, за 100%. В данной тест-системе допамин, который использовали в качестве контрольного лекарственного вещества, снижал количество циклического АМФ до примерно 10%, что считалось проявлением максимальной активности.

В описанном выше испытании было подтверждено, что испытуемые соединения обладали частичной агонистической активностью в отношении допаминового D₂ рецептора.

Поскольку испытуемые соединения обладают частичной агонистической активностью в отношении допаминового D₂ рецептора, они могут стабилизировать допаминую нейротрансмиссию у больного шизофренией в нормальном состоянии и, следовательно, проявлять, например, эффект улучшения положительного и отрицательного состояний, эффект улучшения когнитивных расстройств и эффекты улучшения других симптомов, не вызывая побочных эффектов.

Фармакологическое испытание 3

Ингибирующий эффект на стереотипное поведение, индуцированное апоморфином у крыс

В качестве животных для испытания использовали крыс Wistar (самцы, возраст шесть-семь недель, Japan SLC, Inc.). Испытуемое соединение суспендировали в смеси 5% аравийская камедь/(физиологический раствор или вода), используя агатовую ступку, и при необходимости разбавляли таким же растворителем.

Сутками ранее животных не кормили в течение ночи. Через 1 час после перорального введения каждого испытуемого соединения (5 мл/кг) вводили подкожно (1 мл/кг) апоморфин (0,7 мг/кг). После инъекции апоморфина соответственно через 20, 30 и 40 минут наблюдали за стереотипным поведением.

Стереотипное поведение каждого животного оценивали количественно по описанному ниже состоянию, и баллы, набранные в указанные три момента времени, суммировали и оценивали противоапоморфинный эффект. В каждой группе было шесть подопытных животных.

0: внешний вид животных - такой же, как у крыс, обработанных физиологическим раствором;

1: периодическое фырканье, постоянная исследовательская активность;

2: постоянное фырканье, периодическая исследовательская активность;

3: постоянное фырканье, периодическое кусание, грызение или облизывание.

Очень короткие периоды двигательной активности;

4: постоянное кусание, грызение или облизывание; отсутствие исследовательской активности.

Для статистической обработки всех данных использовали систему неклинического статистического анализа. Когда величина значимой вероятности была менее 0,05, считали, что существовало значительное различие. Различие в баллах между группой животных, которым вводили физиологический раствор, и группой животных, которым вводили каждое испытываемое соединение, анализировали с использованием теста ранговых сумм Уилкоксона или теста Стила. Кроме того, использовали линейный регрессионный анализ для вычисления 50% эффективной дозы (95% доверительный интервал).

Наличие ингибирующего эффекта испытываемых соединений на индуцируемое апоморфином стереотипное поведение подтверждало, что испытываемые соединения обладают антагонистическим эффектом по отношению к D₂ рецепторам.

Фармакологическое испытание 4

Ингибирующий эффект на судорожное подергивание головы, индуцированное (±)D-2,5-диметокси-4-йодамфетамин (DOI) у крыс

В качестве животных для испытания использовали крыс Wistar (самцы, возраст шесть-семь недель, Japan SLC, Inc.). Испытуемое соединение суспендировали в смеси 5% аравийская камедь/(физиологический раствор или вода), используя агатовую ступку, и при необходимости разбавляли таким же растворителем.

Сутками ранее животных не кормили в течение ночи. Через 1 час после перорального введения каждого испытываемого соединения (5 мл/кг) вводили подкожно (1 мл/кг) DOI (5,0 мг/кг). Сразу же после инъекции DOI считали в течение 10 минут число подергиваний головы. В каждой группе было шесть подопытных животных.

Для статистической обработки всех данных использовали неклинический статистический анализ. Когда величина значимой вероятности была менее 0,05, считали, что существовало значительное различие. Различие в числе подергиваний головы между группой животных, которым вводили физиологический раствор, и группой животных, которым вводили каждое испытываемое соединение, анализировали с использованием t-теста или теста Даннета. Кроме того, использовали линейный регрессионный анализ для вычисления 50% эффективной дозы (95% доверительный интервал).

Поскольку испытываемые соединения демонстрировали ингибирующий эффект на индуцируемое DOI подергивание головы, это подтверждало, что испытываемые соединения обладают антагонистическим эффектом по отношению к 5HT_{2A} рецепторам.

Фармакологическое испытание 5

Эффект индуцирования каталепсии у крыс

В качестве животных для испытания использовали крыс Wistar (самцы, возраст шесть-семь недель, Japan SLC, Inc.). Испытуемое соединение суспендировали в смеси 5% аравийская камедь/(физиологический раствор или вода), используя

агатовую ступку, и при необходимости разбавляли таким же растворителем.

За сутки до наблюдения каталепсии животных не кормили в течение ночи и через 1, 2, 4, 6 и 8 часов после перорального введения (5 мл/кг) каждого испытуемого соединения производили птоз. В каждой группе было шесть подопытных животных.

Одну переднюю лапку крысы помещали на край небольшой стальной коробки (ширина: 6,5 см, глубина: 4,0 см, высота: 7,2 см) (неестественная поза), и когда крыса сохраняла позу более 30 секунд, считали данный случай каталептически положительным. Данное наблюдение выполняли каждый раз троекратно и если имелся по крайней мере один положительный случай, считали, что каталепсия у данной особи имела место.

Таким образом, эффект индукции испытуемым соединением каталепсии разобщен с ингибирующим эффектом на стереотипное поведение, индуцированное апоморфином, и поэтому можно предположить, что опасение экстрапирамидального побочного эффекта в клинических условиях было бы низким.

Фармакологическое испытание 6

Измерение ингибирующей активности испытуемого соединения в отношении поглощения серотонина (5-НТ) синапсосомами головного мозга крысы

Крыс-самцов Wistar обезглавливали, извлекали головной мозг и отсекали лобную кору большого головного мозга, после чего ее гомогенизировали в 0,32М растворе сахарозы массой, 20-кратной массе ткани, используя гомогенизатор Поттера. Гомогенат центрифугировали при 4°C, 1000×g в течение 10 минут, полученный супернатант дополнительно центрифугировали при 4°C, 20000×g в течение 20 минут и осадок суспендировали в инкубационном буфере (20 мМ HEPES буфер (pH 7,4), содержащий 10 мМ глюкозу, 145 мМ хлорид натрия, 4,5 мМ хлорид калия, 1,2 мМ хлорид магния, 1,5 мМ хлорид кальция) и использовали в качестве неочищенной синапсосомной фракции.

Реакцию поглощения 5-НТ осуществляли в объеме 200 мкл, используя 96-луночный круглодонный планшет, и после реакции в используемый инкубационный буфер вводили паргалин (конечная концентрация 10 мкМ) и аскорбат натрия (конечная концентрация 0,2 мг/мл).

В каждую лунку добавляли инкубационный буфер (общий счет), немеченый 5-НТ (конечная концентрация 10 мкМ, неспецифический счет) и разведенное испытуемое соединение (конечная концентрация 30 нМ). Добавляли одну десятую конечного объема синапсосомной фракции и после предварительной инкубации при 37°C в течение 10 минут добавляли раствор меченного тритием 5-НТ (конечная концентрация 8 нМ) и начинали реакцию поглощения при 37°C. Время поглощения составляло 10 минут, и реакцию заканчивали вакуумным фильтрованием через бумажную пластину 96-луночного стекловолоконного фильтра, после чего бумагу фильтра промывали холодным нормальным физиологическим раствором, в достаточной мере сушили, вносили в фильтр Microscint 0 (Perkin-Elmer) и измеряли оставшуюся в фильтре радиоактивность.

Из радиоактивности общего счета (100%), неспецифического счета (0%) и счета, полученного с использованием испытуемого соединения, вычисляли активность ингибирования (%) поглощения серотонина.

$$\% \text{ ингибирования 5-НТ (\%)} = 100 - [(\text{счет, полученный с использованием испытуемого соединения} - \text{неспецифический счет (0\% поглощение)}) / \text{общий счет (100\% поглощение)} - \text{неспецифический счет (0\% поглощение)}] \times 100$$

Результаты показаны в таблице 314 (см. в конце текста описания).

Примеры композиции

5 Смешивали 100 г соединения по настоящему изобретению, 40 г Avicel (торговое название, продукт Asahi Chemical Industry Co., Ltd.), 30 г кукурузного крахмала и 2 г стеарата магния, отделявали и таблетировали с использованием пестика R10 мм для гликокаликса.

10 Полученную таблетку покрывали пленкой, используя средство для пленочного покрытия, состоящее из 10 г ТС-5 (торговое название, продукт Shin-Etsu Chemical Co., Ltd., гидроксипропилметилцеллюлоза), 3 г полиэтиленгликоля 6000, 40 г касторового масла и подходящего количества этанола, с получением таблетки с пленочным покрытием из указанной выше композиции.

15

20

25

30

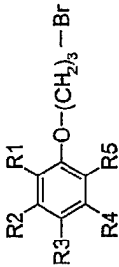
35

40

45

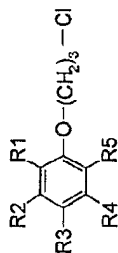
50

Таблица 1



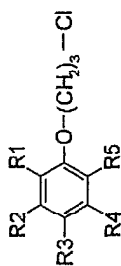
Ссылочный пример	R1	R2	R3	R4	R5	ЯМР
37	-H	-H	-CONHC ₂ H ₅	-H	-H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,25 (3H, т, J=7,5 Гц), 2,29-2,39 (2H, м), 3,43-3,54 (2H, м), 3,61 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,15 (2H, т, J=5,8 Гц), 5,99 (1H, ушпр.), 6,89-6,95 (2H, м), 7,70-7,75 (2H, м).
38	-H	-H	-CONHC ₃ H ₇	-H	-H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 0,99 (3H, т, J=7,5 Гц), 1,57-1,68 (2H, м), 2,23-2,36 (2H, м), 3,37-3,45 (2H, м), 3,61 (2H, т, J=6,3 Гц), 3,75 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,12-4,18 (2H, м), 6,02 (1H, ушпр.), 6,71-6,95 (2H, м), 7,71-7,75 (2H, м).

Таблица 2



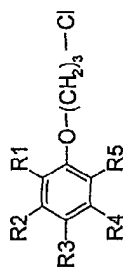
Ссылочный пример	R1	R2	R3	R4	R5	ЯМР
39	-H	-H	-NO ₂	-H	-F	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,20-2,45 (2H, м), 3,70-3,80 (2H, м), 4,30-4,35 (2H, м), 7,07 (1H, дд, J=8,2, 8,9 Гц), 8,00 (1H, дд, J=2,7, 10,7 Гц), 8,07 (1H, дд, J=0,9, 9,0 Гц).
40	-H	-H	-NH ₂	-H	-H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,14-2,24 (2H, м), 3,26 (2H, ушпр.), 3,73 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,04 (2H, т, J=5,8 Гц), 6,61-5,67 (2H, м), 6,72-6,78 (2H, м).
41	-H	-H	-NHCO ₂ CH ₃	-H	-H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,15-2,25 (2H, м), 3,74 (2H, т, J=6,3 Гц), 3,76 (3H, о), 4,09 (2H, т, J=5,8 Гц), 6,42 (1H, ушпр.), 6,85 (2H, дд, J=2,5, 6,8 Гц), 7,21-7,33 (2H, м).
42	-H	-H	-CH ₂ CON(C ₂ H ₅) ₂	-H	-H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,07-1,14 (6H, м), 2,17-2,30 (2H, м), 3,26-3,42 (4H, м), 3,63 (2H, о), 3,74 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,09 (2H, т, J=5,8 Гц), 6,83-6,88 (2H, м), 7,14-7,19 (2H, м).
43	-H	-H	-H	-NHCO ₂ CH ₃	-H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,28-2,37 (2H, м), 3,74 (2H, т, J=6,5 Гц), 3,77 (3H, о), 4,11 (2H, т, J=6,0 Гц), 6,50-6,67 (2H, м), 6,83 (1H, дд, J=1,5 Гц, 7,8 Гц), 7,16-7,22 (2H, м).
44	-H	-H	-NHSO ₂ C ₂ H ₅	-H	-H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,37 (3H, т, J=7,4 Гц), 2,15-2,30 (2H, м), 3,07 (2H, кв, J=7,4 Гц), 3,75 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,10 (2H, т, J=5,8 Гц), 6,41 (1H, ушпр.с), 6,88 (2H, дт, J=8,9, 3,4 Гц), 7,19 (2H, дт, J=8,9, 3,4 Гц).
45	-H	-H	-NH ₂	-H	-OCH ₃	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,15-2,30 (2H, м), 3,20-3,70 (2H, ушпр.), 3,75-3,95 (2H, м), 3,83 (3H, о), 4,07 (2H, т, J=3 Гц), 6,24 (1H, дд, J=2,6, 8,4 Гц), 6,33 (1H, д, J=2,7 Гц), 6,77 (1H, д, J=8,4 Гц).
46	-H	-H	-NHCO ₂ CH ₃	-H	-OCH ₃	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,20-2,30 (2H, м), 3,77 (3H, о), 3,86 (3H, о), 4,13 (2H, т, J=6,0 Гц), 6,55 (1H, ушпр.с), 6,73 (1H, дд, J=2,4, 8,6 Гц), 6,84 (1H, д, J=8,6 Гц), 7,20 (1H, ушпр.с).
47	-H	-H	-CONHC ₂ H ₅	-H	-H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,23 (3H, т, J=7,3 Гц), 2,20-2,30 (2H, м), 3,40-3,50 (2H, м), 3,74 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,14 (2H, т, J=5,8 Гц), 6,13 (1H, ушпр.с), 6,85-6,95 (2H, м), 7,70-7,75 (2H, м).
48	-H	-H	-NHCON(CH ₃) ₂	-H	-H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,15-2,25 (2H, м), 3,02 (6H, о), 3,74 (2H, т, J=6,4 Гц), 4,08 (2H, т, J=5,9 Гц), 6,20 (1H, ушпр.с), 6,84 (2H, дд, J=2,0, 6,8 Гц), 7,26 (2H, дд, J=2,1, 6,8 Гц).
49	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-Cl	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,39 (3H, т, J=7,0 Гц), 2,27-2,37 (2H, м), 3,81 (2H, т, J=6,8 Гц), 4,25 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,36 (2H, кв, J=7,0 Гц), 6,96 (1H, д, J=8,5 Гц), 7,93 (1H, дд, J=2,0 Гц, 8,5 Гц), 8,06 (1H, д, J=2,0 Гц).

Таблица 3



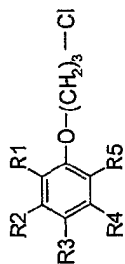
Ссылочный пример	R1	R2	R3	R4	R5	ЯМР
50	-H	-H	-CH ₂ CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-Cl	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,26 (3H, т, J=7,0 Гц), 2,23-2,33 (2H, м), 3,52 (2H, с), 3,80 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,15 (2H, кв, J=7,0 Гц), 6,90 (1H, д, J=8,3 Гц), 7,13 (1H, д, J=2,0 Гц), 8,3 Гц), 7,30 (1H, д, J=2,0 Гц).
51	-H	-H	-CH ₂ CONHCH ₃	-H	-H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,19-2,29 (2H, м), 2,76 (3H, д, J=4,8 Гц), 3,52 (2H, с), 3,76 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,12 (2H, т, J=5,8 Гц), 5,35 (1H, ушир.), 6,86-6,92 (2H, м), 7,13-7,18 (2H, м).
52	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ NHCH ₃	-H	-H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,18-2,27 (2H, м), 2,43 (2H, с), 2,72-2,83 (4H, м), 3,71 (3H, с), 3,75 (4H, т, J=6,3 Гц), 4,09 (2H, т, J=5,8 Гц), 6,83-6,86 (2H, м), 7,10-7,14 (2H, м).
53	-H	-H	-(CH ₂) ₂ N(CH ₃)CO ₂ C(CH ₃) ₃	-H	-H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,42 (9H, с), 2,17-2,27 (2H, м), 2,67-2,86 (5H, м), 3,35-3,41 (2H, м), 3,74 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,09 (2H, т, J=5,8 Гц), 6,83 (2H, д, J=8,5 Гц), 7,00-7,16 (2H, м).
54	-H	-H	-NH ₂	-H	-F	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,15-2,25 (2H, м), 3,54 (2H, ушир.с), 3,76 (2H, т, J=6,4 Гц), 4,05-4,15 (2H, м), 6,35-6,40 (1H, м), 6,46 (1H, д, J=0,9), 12,6 Гц), 6,82 (1H, д, J=8,5 Гц).
55	-H	-H	-NHCO ₂ CH ₃	-H	-F	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,20-2,30 (2H, м), 3,77 (2H, т, J=6,5 Гц), 3,77 (3H, с), 4,10-4,20 (2H, м), 6,57 (1H, ушир.с), 6,85-7,00 (2H, м), 7,25-7,30 (1H, м).
56	-H	-H	-CH ₂ CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-F	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,26 (3H, т, J=7,0 Гц), 2,21-2,30 (2H, м), 3,5382H, с), 3,77 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,11-4,20 (4H, м), 6,89-7,06 (3H, м).
57	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-Br	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,39 (3H, т, J=7,0 Гц), 2,27-2,37 (2H, м), 3,82 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,24 (2H, т, J=5,8 Гц), 4,35 (2H, кв, J=7,0 Гц), 6,92 (1H, д, J=8,5 Гц), 7,98 (1H, д, J=2,0 Гц), 8,5 Гц), 8,23 (1H, д, J=2,0 Гц).
58	-H	-H	-CHO	-OCH ₃	-H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,23-2,34 (2H, м), 3,76 (2H, т, J=6,3 Гц), 3,91 (3H, с), 4,20 (2H, т, J=5,8 Гц), 6,46 (1H, д, J=2,0 Гц), 6,56 (1H, д, J=2,0 Гц), 8,3 Гц), 7,81 (1H, д, J=8,3 Гц), 10,29 (1H, с).
59	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-NO ₂	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,41 (3H, т, J=7,0 Гц), 2,26-2,40 (2H, м), 3,81 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,32-4,44 (4H, м), 7,15 (1H, д, J=8,8 Гц), 8,22 (1H, д, J=2,0 Гц), 8,8 Гц), 8,52 (1H, д, J=2,0 Гц).

Таблица 4



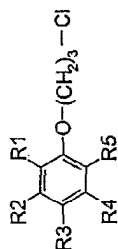
Ссылочный пример	R1	R2	R3	R4	R5	ЯМР
60	-H	-H	-CONHC ₂ H ₅	-H	-NO ₂	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,26 (3H, т, J=7,3 Гц), 2,25-2,35 (2H, м), 3,45-3,55 (2H, м), 3,80 (2H, т, J=6,1 Гц), 4,30-4,35 (2H, м), 6,34 (1H, ушир.с), 7,15 (1H, д, J=8,8 Гц), 8,04 (1H, дд, J=2,3, 8,8 Гц), 8,25 (1H, д, J=2,3 Гц).
61	-H	-H	-CONH ₂	-OCH ₃	-H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,21-2,35 (2H, м), 3,75 (2H, т, J=6,3 Гц), 3,95 (3H, с), 4,18 (2H, т, J=5,8 Гц), 5,67 (1H, ушир.), 6,51 (1H, д, J=2,5 Гц), 6,61 (1H, дд, J=2,5 Гц, 8,8 Гц), 7,59 (1H, ушир.), 8,18 (1H, д, J=8,8 Гц).
62	-H	-H	-CONHCH ₃	-OCH ₃	-H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,20-2,30 (2H, м), 2,99 (3H, д, J=5,0 Гц), 3,75 (2H, т, J=6,3 Гц), 3,94 (3H, с), 4,17 (2H, т, J=6,0 Гц), 6,49 (1H, д, J=2,5 Гц), 6,60 (1H, дд, J=2,5 Гц, 8,8 Гц), 7,70 (1H, ушир.), 8,19 (1H, д, J=8,8 Гц).
63	-H	-H	-CONHC ₃ H ₅	-OCH ₃	-H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,23 (3H, т, J=7,3 Гц), 2,20-2,30 (2H, м), 3,43-3,54 (2H, м), 3,75 (2H, т, J=6,3 Гц), 3,94 (3H, с), 4,17 (2H, т, J=6,3 Гц), 6,49 (1H, д, J=2,5 Гц), 6,60 (1H, дд, J=2,5 Гц, 8,8 Гц), 7,70 (1H, ушир.), 8,18 (1H, д, J=8,8 Гц).
64	-H	-H	-CONHCH ₂ CF ₃	-OCH ₃	-H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,21-2,31 (2H, м), 3,75 (2H, т, J=6,3 Гц), 3,98 (3H, с), 4,07-4,21 (4H, м), 6,51 (1H, д, J=2,5 Гц), 6,62 (1H, дд, J=2,5 Гц, 8,8 Гц), 8,09 (1H, ушир.), 8,18 (1H, д, J=8,8 Гц).
65	-H	-H	-CH=CHCO ₂ C ₂ H ₅	-H	-H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,33 (3H, т, J=7,0 Гц), 2,20-2,30 (2H, м), 3,75 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,15 (2H, т, J=5,8 Гц), 4,25 (2H, кв, J=7,0 Гц), 6,31 (1H, д, J=16,0 Гц), 6,88-6,93 (2H, м), 7,44-7,50 (2H, м), 7,64 (1H, д, J=16,0 Гц).
66	-F	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,40 (3H, т, J=7,0 Гц), 2,25-2,34 (2H, м), 3,78 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,25 (2H, т, J=5,8 Гц), 4,37 (2H, кв, J=7,0 Гц), 7,08-7,15 (1H, м), 7,62-7,70 (2H, м).
67	-H	-H	-CO ₂ H	-CH ₃	-H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,21-2,31 (2H, м), 2,64 (3H, с), 3,75 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,18 (2H, т, J=5,8 Гц), 6,77-6,81 (2H, м), 8,06 (1H, д, J=9,5 Гц), 11,00 (1H, ушир.).
68	-Cl	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,40 (3H, т, J=7,0 Гц), 2,25-2,37 (2H, м), 3,82 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,25 (2H, т, J=5,8 Гц), 4,38 (2H, кв, J=7,0 Гц), 7,42 (1H, д, J=8,5 Гц), 7,58-7,62 (2H, м).
69	-CH ₃	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,39 (3H, т, J=7,0 Гц), 2,24-2,34 (2H, м), 2,26 (3H, с), 3,78 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,19 (2H, т, J=5,8 Гц), 4,37 (2H, кв, J=7,0 Гц), 7,19 (1H, д, J=7,8 Гц), 7,49 (1H, д, J=1,5 Гц), 7,57 (1H, дд, J=1,5 Гц, 7,8 Гц).

Таблица 5



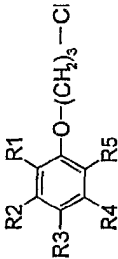
Ссылочный пример	R1	R2	R3	R4	R5	ЯМР
70	-H	-H	-CONH ₂	-CH ₃	-H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,19-2,29 (2H, м), 2,51 (3H, с), 3,75 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,14 (2H, т, J=6,3 Гц), 6,53 (2H, ушир.), 6,71 (2H, м), 7,45 (1H, д, J=8,3 Гц).
71	-H	-H	-CONHCH ₃	-CH ₃	-H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,18-2,28 (2H, м), 2,45 (3H, с), 2,98 (3H, д, J=4,9 Гц), 3,74 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,12 (2H, т, J=5,8 Гц), 5,72 (1H, ушир.), 6,68-6,75 (2H, м), 7,32 (1H, д, J=8,3 Гц).
72	-H	-H	-CONHC ₂ H ₅	-CH ₃	-H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,24 (3H, т, J=7,3 Гц), 2,19-2,28 (2H, м), 2,45 (3H, с), 3,41-3,52 (2H, м), 3,74 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,12 (2H, т, J=6,0 Гц), 5,68 (1H, ушир.), 6,68-6,75 (2H, м), 7,32 (1H, д, J=8,3 Гц).
73	-CH ₃	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-CH ₃	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,38 (3H, т, J=7,0 Гц), 2,21-2,28 (2H, м), 2,31 (6H, с), 3,84 (2H, т, J=6,3 Гц), 3,93 (2H, т, J=5,8 Гц), 4,35 (2H, т, J=7,0 Гц), 7,72 (2H, с).
74	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-H	-OCH ₃	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,39 (3H, т, J=7,1 Гц), 2,26-2,36 (2H, м), 3,78 (2H, т, J=6,3 Гц), 3,91 (3H, с), 4,22 (2H, т, J=5,8 Гц), 4,36 (2H, кв, J=7,1 Гц), 6,89 (1H, д, J=8,3 Гц), 7,58 (1H, д, J=2,0 Гц), 7,70 (1H, д, J=8,3 Гц).
75	-OCH ₃	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-OCH ₃	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,40 (3H, т, J=7,0 Гц), 2,13-2,23 (2H, м), 3,85 (2H, т, J=6,3 Гц), 3,90 (6H, с), 4,17 (2H, т, J=5,8 Гц), 4,38 (2H, кв, J=7,0 Гц), 7,30 (2H, с).
76	-CH ₃	-H	-CHO	-H	-OCH ₃	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,17-2,29 (2H, м), 2,34 (3H, с), 3,83 (2H, т, J=6,3 Гц), 3,91 (3H, с), 4,18 (2H, т, J=5,8 Гц), 7,31 (1H, с), 9,86 (1H, с).
77	-CH ₃	-H	-CO ₂ H	-H	-OCH ₃	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,18-2,28 (2H, м), 2,32 (6H, с), 3,83 (2H, т, J=6,3 Гц), 3,90 (3H, с), 4,16 (2H, т, J=5,8 Гц), 7,50 (1H, д, J=2,0 Гц), 7,60 (1H, д, J=2,0 Гц).
78	-CH ₃	-H	-CONH ₂	-H	-OCH ₃	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,17-2,27 (2H, м), 2,30 (3H, с), 3,83 (2H, т, J=6,3 Гц), 3,89 (3H, с), 4,12 (2H, т, J=5,8 Гц), 5,24-6,26 (2H, ушир.), 7,15 (1H, д, J=2,0 Гц), 7,32 (1H, д, J=2,0 Гц).
79	-CH ₃	-H	-CONHCH ₃	-H	-OCH ₃	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,17-2,26 (2H, м), 2,29 (3H, с), 3,00 (3H, д, J=5,0 Гц), 3,83 (2H, т, J=6,3 Гц), 3,88 (3H, с), 4,10 (2H, т, J=5,8 Гц), 6,06 (1H, ушир.), 7,08 (1H, д, J=1,9 Гц), 7,28 (1H, д, J=1,9 Гц).

Таблица 6



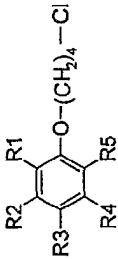
Ссылочный пример	R1	R2	R3	R4	R5	ЯМР
80	-CH ₃	-H	-CONHC ₂ H ₅	-H	-OCH ₃	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,25 (3H, т, J=7,3 Гц), 2,17-2,26 (2H, м), 2,30 (3H, с), 3,43-3,54 (2H, м), 3,83 (2H, т, J=6,3 Гц), 3,89 (3H, с), 4,10 (2H, т, J=5,8 Гц), 6,02 (1H, ушпир.), 7,07 (1H, д, J=2,0 Гц), 7,28 (1H, д, J=2,0 Гц).
81	-CH ₃	-H	-NHCO ₂ C(CH ₃) ₃	-H	-OCH ₃	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,51 (9H, с), 2,14-2,26 (2H, м), 2,23 (3H, с), 3,82 (2H, т, J=6,3 Гц), 3,83 (3H, с), 3,99 (2H, т, J=5,8 Гц), 6,34 (1H, ушпир.), 6,59 (1H, д, J=2,5 Гц), 7,01 (1H, д, J=2,5 Гц).
82	-CH ₃	-H	-NHCO ₂ CH ₃	-H	-OCH ₃	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,17-2,29 (2H, м), 2,30 (3H, с), 3,83 (2H, т, J=6,3 Гц), 3,89 (6H, с), 4,13 (2H, т, J=5,8 Гц), 7,44 (1H, д, J=2,0 Гц), 7,51 (1H, д, J=2,0 Гц).
83	-CH ₃	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	-OCH ₃	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,15-2,30 (2H, м), 2,29 (3H, с), 3,75-3,90 (2H, м), 3,88 (3H, с), 3,89 (3H, с), 4,13 (2H, т, J=5,9 Гц), 7,43 (1H, д, J=1,8 Гц), 7,50 (1H, д, J=1,4 Гц).
84	-CH ₃	-H	-NH ₂	-H	-OCH ₃	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,14-2,22 (2H, м), 2,19 (3H, с), 3,47 (2H, ушпир.), 3,82 (2H, т, J=5,3 Гц), 3,95 (2H, т, J=4,8 Гц), 6,09-6,13 (2H, м).
85	-CH ₃	-H	-NHCOCH ₃	-H	-OCH ₃	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,11-2,28 (2H, м), 2,15 (3H, с), 2,24 (3H, с), 3,82 (2H, т, J=6,3 Гц), 3,83 (3H, с), 4,01 (2H, т, J=5,8 Гц), 6,66 (1H, д, J=2,1 Гц), 7,02 (1H, ушпир.), 7,23 (1H, д, J=2,1 Гц).
86	-CH ₃	-H	-CHO	-H	-OCOCH ₃	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,17-2,27 (2H, м), 2,37 (6H, с), 3,79 (2H, т, J=5,6 Гц), 4,11 (2H, т, J=5,8 Гц), 7,46 (1H, д, J=2,0 Гц), 7,62 (1H, д, J=2,0 Гц), 9,88 (1H, с).
87	-CH ₃	-H	-CO ₂ H	-H	-OCOCH ₃	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,16-2,26 (2H, м), 2,35 (3H, с), 2,36 (3H, с), 3,79 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,09 (2H, т, J=5,8 Гц), 7,67 (1H, д, J=2,0 Гц), 7,84 (1H, д, J=2,0 Гц).
88	-OH	-H	-CONHCH ₃	-H	-CH ₃	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,21-2,35 (2H, м), 2,32 (3H, с), 2,99 (3H, д, J=4,9 Гц), 3,85 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,05 (2H, т, J=5,8 Гц), 5,90 (1H, ушпир.), 6,02 (1H, ушпир.), 7,15 (1H, д, J=1,8 Гц), 7,20 (1H, д, J=2,0 Гц).
89	-CH ₃	-H	-CONHCH ₃	-H	-OC ₂ H ₅	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,46 (3H, т, J=7,0 Гц), 2,17-2,27 (2H, м), 2,28 (3H, с), 2,99 (3H, д, J=5,0 Гц), 3,83 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,06-4,15 (4H, м), 6,04 (1H, ушпир.), 7,07 (1H, д, J=1,8 Гц), 7,25 (1H, д, J=1,8 Гц).
90	-H	-H	-CO ₂ H	-OCH ₃	-H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,22-2,32 (2H, м), 3,75 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,05 (3H, с), 4,21 (2H, т, J=5,8 Гц), 6,55 (1H, д, J=2,5 Гц), 6,66 (1H, д, J=8,8 Гц), 8,14 (1H, д, J=8,8 Гц), 10,43 (1H, ушпир.).

Таблица 7



Ссылочный пример	R1	R2	R3	R4	R5	ЯМР
91	-H	-H		-H	-H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,2-2,3 (2H, м), 3,77 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,16 (2H, т, J=5,8 Гц), 7,00 (2H, дд, J=2,2, 6,7 Гц), 7,15-7,25 (2H, м), 7,25-7,35 (2H, м), 7,76 (1H, с).
92	-H	-H		-H	-H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,26 (2H, т, J=6,1 Гц), 3,75 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,15 (2H, т, J=5,7 Гц), 7,00 (1H, дд, J=2,1, 6,9 Гц), 7,56 (1H, дд, J=2,2, 7,1 Гц), 8,07 (1H, с), 8,45 (1H, с).
93	-H	-H		-H	-H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,70-1,90 (4H, м), 2,10-2,40 (3H, м), 2,45 (3H, с), 3,55-3,75 (2H, м), 3,90-3,95 (2H, м), 4,05-4,15 (2H, м), 6,84 (2H, дд, J=1,9, 6,8 Гц), 7,06 (2H, дд, J=1,8, 6,9 Гц), 7,34 (2H, д, J=8,0 Гц), 7,68 (2H, д, J=8,2 Гц).
94	-CH ₃	-H		-H	-OCH ₃	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,16-2,25 (2H, м), 2,28 (3H, с), 3,83 (2H, т, J=6,3 Гц), 3,86 (3H, с), 3,99-4,06 (4H, м), 4,46 (2H, дд, J=6,3 Гц, 8,8 Гц), 6,61 (1H, д, J=2,5 Гц), 7,33 (1H, д, J=2,5 Гц).
95	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₂ OH	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,09-2,28 (2H, м), 2,61 (2H, т, J=7,8 Гц), 3,79-3,87 (4H, м), 3,88 (3H, с), 4,13 (2H, т, J=5,5 Гц), 4,71 (2H, д, J=5,8 Гц), 6,85 (1H, д, J=2,5 Гц), 7,59 (1H, д, J=2,5 Гц).
96	-CH ₃	-H		-H	-OCH ₃	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,05-2,25 (4H, м), 2,27 (3H, с), 2,60 (2H, т, J=8,3 Гц), 3,79-3,89 (4H, м), 3,86 (3H, с), 6,71 (1H, д, J=2,5 Гц), 7,37 (1H, д, J=2,5 Гц).

Таблица 8



Ссылочный пример	R1	R2	R3	R4	R5	ЯМР
97	-H	-H	-H	-NO ₂	-H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,93-2,11 (4H, м), 3,59-3,70 (2H, м), 4,00-4,13 (2H, м), 7,20-7,24 (1H, м), 7,43 (1H, т, J=8,0 Гц), 7,72 (1H, т, J=2,3 Гц), 7,80-7,84 (1H, м).
98	-H	-H	-H	-CN	-H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,96-2,00 (4H, м), 3,60-3,65 (2H, м), 3,99-4,14 (2H, м), 7,10-7,14 (2H, м), 7,22-7,26 (1H, м), 7,34-7,40 (1H, м).

Таблица 9

R1-O-(CH₂)₃-Cl

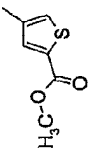
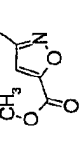
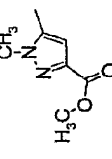
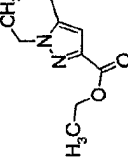
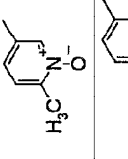
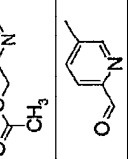
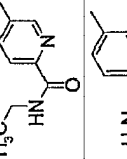
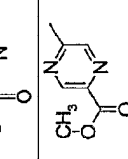
Ссылочный пример	R1	ЯМР
99		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,15-2,30 (2H, м), 3,72 (2H, т, J=6,3 Гц), 3,87 (3H, с), 4,05-4,15 (2H, м), 6,55 (1H, д, J=1,8 Гц), 7,42 (1H, д, J=1,8 Гц).
100		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,21-2,31 (2H, м), 3,70 (2H, т, J=6,3 Гц), 3,95 (3H, с), 4,46 (2H, т, J=6,0 Гц), 6,54 (1H, с).
101		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,21-2,32 (2H, м), 3,72 (2H, т, J=6,3 Гц), 3,72 (2H, с), 3,91 (3H, с), 4,24 (2H, т, J=5,8 Гц), 6,10 (1H, с).
102		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,39 (3H, т, J=7,0 Гц), 1,39 (3H, т, J=7,3 Гц), 2,22-2,32 (2H, м), 3,71 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,10 (2H, кв, J=7,3 Гц), 4,24 (2H, т, J=5,8 Гц), 4,39 (2H, кв, J=7,0 Гц), 6,08 (1H, с).
103		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,20-2,29 (2H, м), 2,46 (3H, с), 3,72 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,12 (2H, т, J=5,8 Гц), 6,84 (1H, д, J=2,5 Гц), 8,8 Гц), 7,13 (1H, д, J=8,8 Гц), 8,07 (1H, д, J=2,5 Гц).
104		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,13 (3H, с), 2,21-2,31 (2H, м), 3,76 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,18 (2H, т, J=5,8 Гц), 5,17 (2H, с), 7,19-7,32 (2H, м), 8,30 (1H, д, J=2,5 Гц).
105		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,27-2,36 (2H, м), 3,77 (2H, т, J=6,0 Гц), 4,28 (2H, т, J=5,8 Гц), 7,33 (1H, д, J=2,5 Гц), 8,5 Гц), 7,97 (1H, д, J=2,5 Гц), 8,5 Гц), 8,44 (1H, д, J=2,5 Гц), 10,00 (1H, с).
106		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,26 (3H, т, J=7,3 Гц), 2,24-2,34 (2H, м), 3,55 (2H, кв, J=6,0 Гц), 7,3 Гц), 3,77 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,22 (2H, т, J=5,8 Гц), 7,29 (1H, д, J=2,3 Гц), 8,8 Гц), 7,83 (1H, ушпир.), 8,18 (1H, д, J=8,8 Гц), 8,20 (1H, д, J=2,3 Гц).
107		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,25-2,34 (2H, м), 3,77 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,23 (2H, т, J=5,8 Гц), 5,48 (1H, ушпир.), 7,31 (1H, д, J=2,3 Гц), 8,8 Гц), 7,68 (1H, ушпир.), 8,16 (1H, д, J=8,8 Гц), 8,23 (1H, д, J=2,3 Гц).
108		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,24-2,34 (2H, м), 3,73 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,00 (3H, с), 4,58 (2H, т, J=6,0 Гц), 8,28 (1H, д, J=1,3 Гц), 8,87 (1H, д, J=1,3 Гц).

Таблица 10

E1-O-(CH₂)₃-Cl

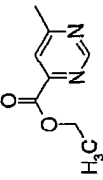
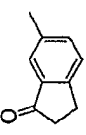
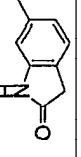
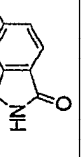
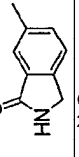
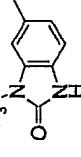
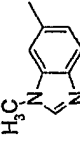
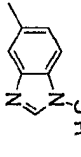
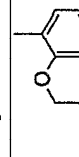
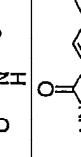
Ссылочный пример	R1	ЯМР
109		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,44 (3H, т, J=7,0 Гц), 2,22-2,31 (2H, м), 3,72 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,48 (2H, кв, J=7,0 Гц), 4,59 (2H, т, J=6,0 Гц), 7,44 (1H, д, J=1,0 Гц), 8,90 (1H, д, J=1,0 Гц).
110		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,20-2,30 (2H, м), 2,70-2,75 (2H, м), 3,07 (2H, т, J=5,8 Гц), 3,74 (2H, т, J=6,4 Гц), 7,15-7,20 (2H, м), 7,37 (1H, д, J=8,2 Гц).
111		¹ H-ЯМР (DMSO-d ₆) δ м.д.: 2,1-2,2 (2H, м), 3,37 (2H, с), 3,78 (2H, т, J=6,5 Гц), 4,04 (2H, т, J=6 Гц), 6,40 (1H, д, J=2,5 Гц), 6,49 (1H, д, J=2,5, 8 Гц), 7,08 (1H, д, J=8 Гц), 10,33 (1H, ушир.с).
112		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,27 (2H, т, J=6,1 Гц), 3,76 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,19 (2H, т, J=5,7 Гц), 4,41 (2H, с), 6,96 (1H, с), 7,01 (1H, д, J=2,2, 8,5 Гц), 7,17 (1H, ушир.с), 7,77 (1H, д, J=8,4 Гц).
113		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,27 (2H, т, J=6,1 Гц), 3,76 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,19 (2H, т, J=5,7 Гц), 4,40 (2H, с), 6,50-6,60 (1H, ушир.), 7,15 (1H, д, J=2,3, 8,5 Гц), 7,35-7,40 (2H, м).
114		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,20-2,35 (2H, м), 3,39 (3H, с), 3,75-3,80 (2H, м), 4,05-4,15 (2H, м), 6,55-6,65 (2H, м), 6,98 (1H, д, J=7,5 Гц), 9,92 (1H, ушир.с).
115		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,28 (2H, т, J=6,0 Гц), 3,75-3,80 (5H, м), 4,18 (2H, т, J=5,7 Гц), 6,85 (1H, д, J=2,1 Гц), 6,90-6,95 (1H, м), 7,66 (1H, д, J=8,8 Гц), 7,76 (1H, с).
116		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,20-2,30 (2H, м), 3,78 (2H, т, J=6,9 Гц), 3,82 (3H, с), 4,18 (2H, т, J=5,8 Гц), 6,97 (1H, д, J=2,3, 8,8 Гц), 7,25-7,30 (2H, м), 7,81 (1H, с).
117		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,20-2,35 (2H, м), 3,77 (2H, т, J=6,2 Гц), 4,19 (2H, т, J=6,0 Гц), 4,66 (2H, с), 6,47 (1H, д, J=7,9, 1,2 Гц), 6,67 (1H, д, J=8,3, 1,1 Гц), 6,90 (1H, д, J=8,2, 8,1 Гц), 8,29 (1H, ушир.с).
118		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,24 (2H, т, J=6,2, 6,2 Гц), 3,70 (2H, т, J=6,4 Гц), 3,77 (3H, с), 4,45 (2H, т, J=6,1 Гц), 6,70 (1H, д, J=8,9 Гц), 6,98 (1H, д, J=8,9, 3,0 Гц), 7,35 (1H, д, J=3,0 Гц).

Таблица 11

R1-O-(CH2)3-Cl

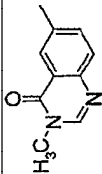
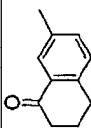
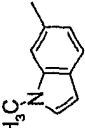
Ссылочный пример	R1	ЯМР
119		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,30 (2H, тт, J=6,1, 6,1 Гц), 3,60 (3H, с), 3,77 (2H, т, J=5,8 Гц), 4,25 (2H, т, J=6,3 Гц), 7,34 (1H, дд, J=8,9, 2,9 Гц), 7,65 (1H, д, J=8,9 Гц), 7,68 (1H, д, J=2,9 Гц), 7,96 (1H, с).
120		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,12 (2H, тт, J=6,3, 6,3 Гц), 2,24 (2H, тт, J=6,1, 6,1 Гц), 2,62 (2H, т, J=6,5 Гц), 2,902 (2H, т, J=6,1 Гц), 3,74 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,15 (2H, т, J=5,8 Гц), 7,05 (1H, дд, J=8,4, 2,8 Гц), 7,17 (1H, д, J=8,4 Гц), 7,52 (1H, д, J=2,8 Гц).
121		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,25 (2H, тт, J=6,1, 6,1 Гц), 3,76 (3H, с), 3,78 (2H, т, J=6,4 Гц), 4,15 (2H, т, J=5,8 Гц), 6,39 (1H, т, J=3,0 Гц), 6,88 (1H, дд, J=8,8, 2,4 Гц), 7,02 (1H, д, J=3,0 Гц), 7,10 (1H, д, J=2,3 Гц), 7,21 (1H, д, J=8,8 Гц).

Таблица 12

R1-O-(CH₂)₄-Cl

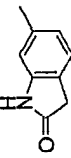
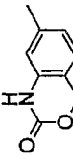
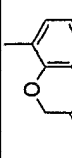
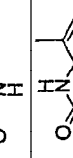
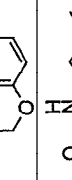
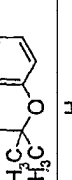
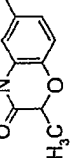
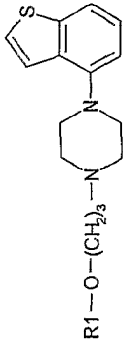
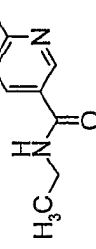
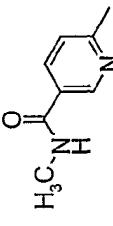
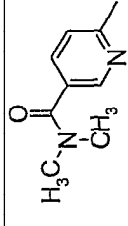
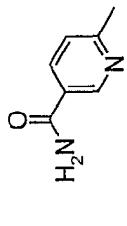
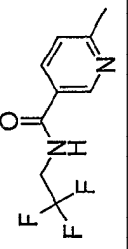
Ссылочный пример	R1	ЯМР
122		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,85-2,05 (4H, м), 3,62 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,33 (2H, т, J=6,3 Гц), 6,72 (1H, д, J=8,3 Гц), 6,85 (1H, дт, J=0,8, 5,1 Гц), 7,56 (1H, дт, J=2,0, 8,4 Гц), 8,14 (1H, дт, J=5,1, 1,4 Гц).
123		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,95-2,05 (4H, м), 3,62 (2H, т, J=6,2 Гц), 4,05 (2H, т, J=5,8 Гц), 6,80 (2H, дт, J=4,8, 1,6 Гц), 8,43 (2H, дт, J=4,9, 1,5 Гц).
124		¹ H-ЯМР (DMSO-d ₆) δ м.д.: 1,75-1,9 {4H, м), 3,36 (2H, с), 3,70 (2H, т, J=6,5 Гц), 3,96 (2H, т, J=6 Гц), 6,38 (1H, д, J=2 Гц), 6,48 (1H, дт, J=2,5, 8 Гц), 7,07 (1H, д, J=8 Гц), 10,32 (1H, ушир.с).
125		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,91-2,00 (4H, м), 3,62 (2H, т, J=6,2 Гц), 3,98 (2H, т, J=5,6 Гц), 5,26 (2H, с), 6,36 (1H, д, J=2,3 Гц), 6,57 (1H, дт, J=8,4, 2,3 Гц), 7,00 (1H, д, J=8,4 Гц), 8,08 (1H, ушир.с).
126		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,95-2,04 (4H, м), 3,61-3,65 (2H, м), 4,06-4,09 (2H, м), 4,66 (2H, с), 6,46 (1H, д, J=8,0 Гц), 6,63 (1H, д, J=8,3 Гц), 6,89 (1H, дт, J=8,0, 8,3 Гц), 8,41 (1H, ушир.с).
127		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,80-2,00 (4H, м), 3,77 (2H, т, J=6,4 Гц), 4,24 (2H, т, J=5,8 Гц), 4,63 (2H, с), 6,55-6,70 (2H, м), 6,90 (1H, дт, J=8,4, 8,4 Гц), 8,00 (1H, ушир.с).
128		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,52 (6H, с), 1,90-2,10 (4H, м), 3,63 (2H, т, J=6,3 Гц), 3,95 (2H, т, J=5,8 Гц), 6,38 (1H, д, J=2,8 Гц), 6,50 (1H, дт, J=2,8, 8,7 Гц), 6,86 (1H, д, J=8,8 Гц), 8,57 (1H, ушир.с).
129		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,56 (3H, д, J=6,8 Гц), 1,85-2,10 (4H, м), 3,61 (2H, т, J=6,2 Гц), 3,94 (2H, т, J=5,8 Гц), 4,59 (1H, кв, J=6,8 Гц), 6,38 (1H, д, J=2,8 Гц), 6,49 (1H, дт, J=2,8, 8,7 Гц), 6,88 (1H, д, J=8,7 Гц), 8,60 (1H, ушир.с).
130		¹ H-ЯМР (DMSO-d ₆) δ м.д.: 1,81-2,10 (4H, м), 3,54-3,70 (2H, м), 3,89-4,03 (2H, м), 4,47 (2H, ушир.с), 5,02 (1H, ушир.с), 6,22 (1H, д, J=2,4 Гц), 6,49 (1H, дт, J=8,3, 2,4 Гц), 6,86-7,00 (2H, м).

Таблица 13



Пример	R1	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
23		Белое твердое вещество (этанол)	225-228	Тригидрохлорид
24		Белые игольчатые кристаллы (этанол/этилацетат)	165,0-167,0	Гидрохлорид
25		Белое твердое вещество (этанол)	204-206	Гидрохлорид
26		Белый порошок (этилацетат)	201,5-207,5	Гидрохлорид
27		Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	132,5-133,5	—
28		Белый порошок (этилацетат)	205,5-208,0	Гидрохлорид
29		Белый порошок (2-пропанол)	206,5-208,0	—
30		Светло-желтый порошок (этилацетат)	201,5-204,0	Гидрохлорид

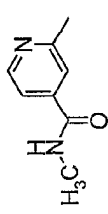
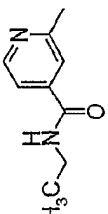
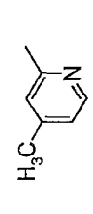
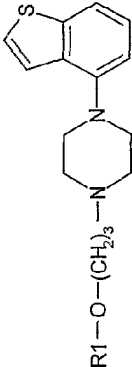
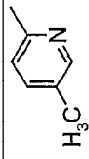
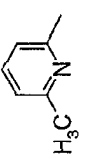
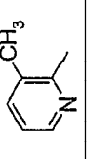
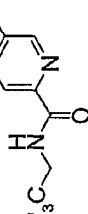
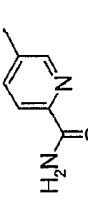
31		Белый порошок (этилацетат)	155,5-162,0	Гидрохлорид
32		Белый порошок (этилацетат)	140,0-141,5	Гидрохлорид
33		Светло-желтый порошок (этилацетат)	192-194	Дигидрохлорид

Таблица 14



Пример	R1	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
34		Светло-желтый порошок (этанол)	201-203	Дигидрохлорид
35		Белый порошок (этанол)	201-203	Гидрохлорид
36		Белый порошок (этанол)	214,0-215,0	Гидрохлорид
37		Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	131,5-132,0	-
38		Белый порошок (этилацетат)	193,0-194,0	-

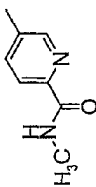
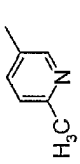
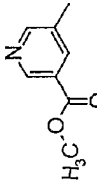
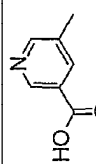
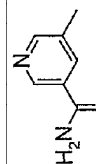
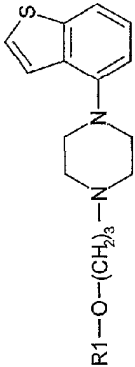
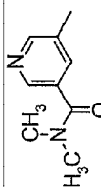
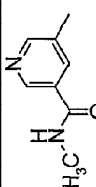
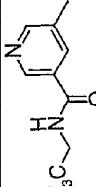
39		Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	128,0-129,5	-
40		Белый порошок (этанол)	234,0-236,0	Гидрохлорид
41		Светло-желтый порошок (этилацетат)	224,0-226,0	Дигидрохлорид
42		Белый порошок (вода)	230,0 (разл.)	Гидрохлорид
43		Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	171,0-174,5	-

Таблица 15



Пример	R1	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
44		Светло-желтый порошок (этилацетат)	166,0 (разл.)	Дигидрохлорид
45		Светло-желтый порошок (этилацетат)	198,5-204,0	Дигидрохлорид
46		Белый порошок (этилацетат)	211,5-214,5	Дигидрохлорид

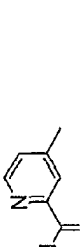
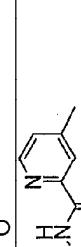
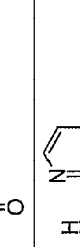
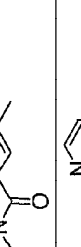
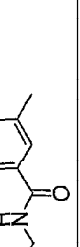
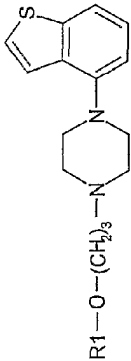
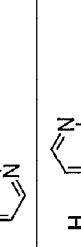
47		Белый порошок (этанол)	241,0-243,0	Гидрохлорид
48		Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	150,0-150,5	-
49		Белый порошок (этилацетат)	199,0-200,5	Дигидрохлорид
50		Белый порошок (этилацетат)	206,0-208,5	Гидрохлорид
51		Белый порошок (этилацетат)	208,0-213,0	Гидрохлорид
52		Белый порошок (этанол)	157-159	Гидрохлорид
53		Белый порошок (этанол)	197,0-199,0	Дигидрохлорид

Таблица 16



Пример	R1	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
54		Белый порошок (этанол)	205-207	Гидрохлорид
55		Белый порошок (этилацетат)	178,0-182,5	Гидрохлорид

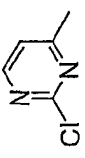
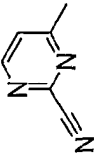
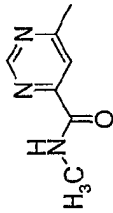
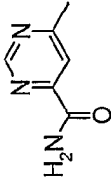
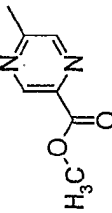
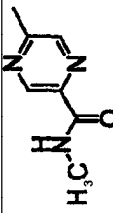
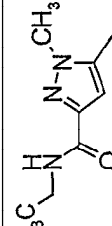
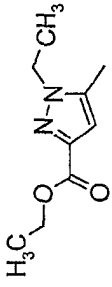
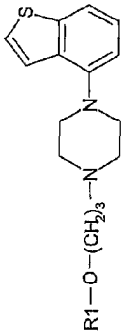
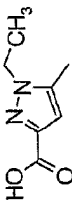
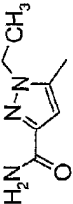
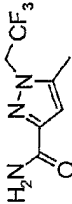
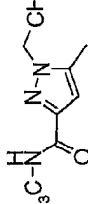
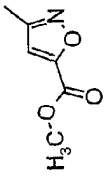
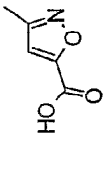
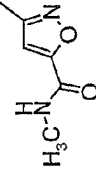
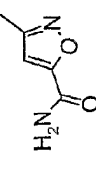
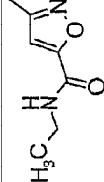
56		Светло-желтый порошок (этилацетат)	191,5-195,5	Гидрохлорид
57		Светло-желтый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	112,0-115,5	-
58		Белый порошок (метанол)	205,0-209,5	Гидрохлорид
59		Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	149,5-151,0	-
60		Светло-желтый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	114,5-115,5	-
61		Белый порошок (метанол)	116,5-118,0	-
62		Белый порошок (этилацетат)	210,5-214,5	Гидрохлорид
63		Светло-желтый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	109,0-110,0	-

Таблица 17



Пример	R1	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
64		Белый порошок (этанол/вода)	129,0-131,0	-
65		Белый порошок (этилацетат)	247,5 (разл.)	Гидрохлорид
66		Белый порошок (этилацетат)	231,0-234,0	Гидрохлорид
67		Белый порошок (этилацетат)	245,5 (разл.)	Гидрохлорид
68		Белый порошок (этилацетат)	199,5-201,5	Гидрохлорид
69		Белый порошок (этанол/вода)	252,5-255,0 (разл.)	-
70		Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	131,5-132,5	-
71		Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	167,5-169,0	-
72		Белый порошок (этилацетат)	219,5-222,5 (разл.)	Гидрохлорид

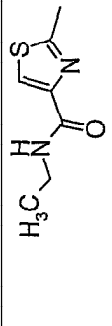
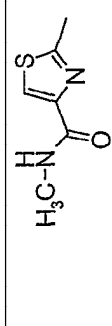
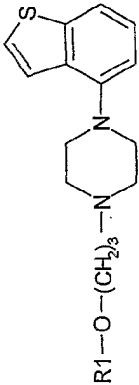
73		Светло-желтый порошок (этилацетат)	151,0-153,5	Гидрохлорид
74		Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	138,5-140,0	-

Таблица 18



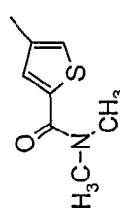
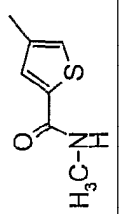
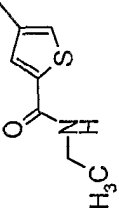
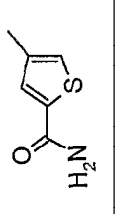
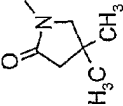
Пример	R1	ЯМР	Соль
75		^1H -ЯМР (DMSO- d_6) δ м.д.: 2,10-2,30 (2H, м), 2,80-3,90 (16H, м), 4,09 (2H, т, J=5,9 Гц), 6,88 (1H, д, J=1,5 Гц), 6,96 (1H, д, J=7,6 Гц), 7,17 (1H, д, J=1,4 Гц), 7,31 (1H, д, J=7,8, 7,8 Гц), 7,48 (1H, д, J=5,6 Гц), 7,70 (1H, д, J=8,1 Гц), 7,76 (1H, д, J=5,6 Гц), 10,68 (1H, ушпр.с).	Гидрохлорид
76		^1H -ЯМР (CDCl $_3$) δ м.д.: 1,95-2,10 (2H, м), 2,62 (2H, т, J=7,0 Гц), 2,65-2,80 (4H, м), 2,98 (3H, д, J=4,9 Гц), 3,15-3,25 (4H, м), 4,05 (2H, т, J=6,3 Гц), 5,94 (1H, ушпр.с), 6,43 (1H, д, J=1,8 Гц), 6,90 (1H, д, J=1,4, 7,6 Гц), 7,15 (1H, д, J=1,7 Гц), 7,20-7,35 (1H, м), 7,35-7,45 (2H, м), 7,55 (1H, д, J=8,1 Гц).	-
77		^1H -ЯМР (CDCl $_3$) δ м.д.: 1,23 (3H, т, J=7,3 Гц), 1,95-2,05 (2H, м), 2,61 (2H, т, J=7,3 Гц), 2,65-2,80 (4H, м), 3,10-3,30 (4H, м), 3,40-3,55 (2H, м), 4,04 (2H, т, J=6,3 Гц), 6,01 (1H, ушпр.с), 6,43 (1H, д, J=1,6 Гц), 6,90 (1H, д, J=7,6 Гц), 7,16 (1H, д, J=1,7 Гц), 7,27 (1H, д, J=7,8, 7,8 Гц), 7,35-7,45 (2H, м), 7,55 (1H, д, J=8,1 Гц).	-
78		^1H -ЯМР (CDCl $_3$) δ м.д.: 1,95-2,10 (2H, м), 2,63 (2H, т, J=7,3 Гц), 2,70-2,80 (4H, м), 3,15-3,25 (4H, м), 4,06 (2H, т, J=6,3 Гц), 5,74 (2H, ушпр.с), 6,51 (1H, д, J=1,7 Гц), 6,90 (1H, д, J=0,5, 7,6 Гц), 7,19 (1H, д, J=1,7 Гц), 7,28 (1H, д, J=7,8, 7,8 Гц), 7,35-7,45 (2H, м), 7,56 (1H, д, J=8,0 Гц).	-

Таблица 19

Пример	R1	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
79		Белый порошок (этилацетат/простой эфир)	183-186	Гидрохлорид

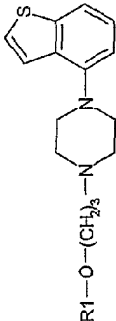
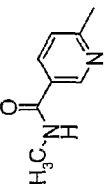
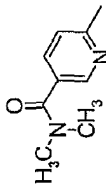


Таблица 20

Пример	R1	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
80		Белый порошок (этанол/этилацетат)	183,0-185,0	Дигидрохлорид
81		Белый порошок (этанол/этилацетат)	205,0-207,0	Гидрохлорид
82		Белый порошок (этанол/этилацетат)	197,0-199,0	Гидрохлорид
83		Белый порошок (этилацетат)	166,5-168,0	Гидрохлорид
84		Белый порошок (этилацетат)	196,0-201,0	Гидрохлорид

5
10
15
20
25
30
35
40
45
50

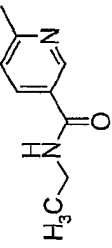
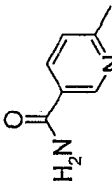
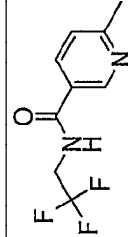
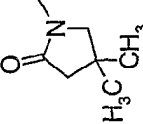
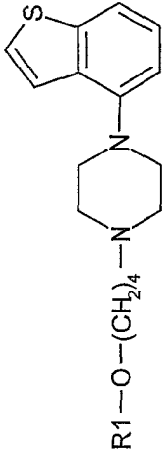
85		Белый порошок (этилацетат)	175,0-176,0	Гидрохлорид
86		Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	150,0-154,5	-
87		Белый порошок (этилацетат)	172,0-175,0	Гидрохлорид
88		Белый порошок (этилацетат/простой эфир)	201-205	Гидрохлорид

Таблица 21



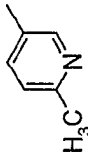
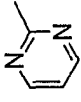
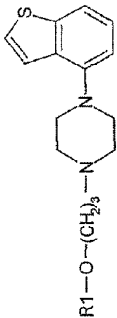
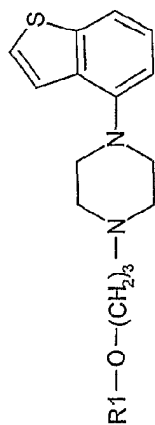
Пример	R1	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
89		Белый порошок (этанол)	195-197	Гидрохлорид
90		Белый порошок (этанол)	190-192	Гидрохлорид

Таблица 22



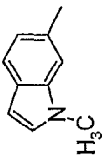
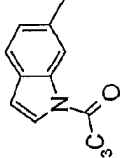
Пример	R1	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
91		Белый порошок (этилацетат)	149-150	-
92		Светло-розовый порошок (этанол)	161-163	-
93		Белое твердое вещество (этилацетат)	226,8-229,0	Гидрохлорид
94		Белое твердое вещество (этилацетат)	213,1-218,5	-
95		Белое твердое вещество (этилацетат)	252,9-254,3	Гидрохлорид
96		Белое твердое вещество (этилацетат)	238,7-239,9	Гидрохлорид
97		Белое твердое вещество (этилацетат)	238,9-240,7	Гидрохлорид
98		Светло-коричневое твердое вещество (этилацетат)	218,4-220,4	Гидрохлорид

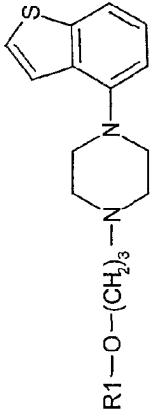
Таблица 23



Пример	R1	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
99		Белое твердое вещество (этилацетат)	267,0-271,0	Гидрохлорид
100		Белое твердое вещество (этилацетат/гексан)	143,8-145,2	-
101		Белое твердое вещество (этилацетат)	250,6-252,1	Гидрохлорид
102		Белое твердое вещество (этилацетат)	233,3-235,2	Гидрохлорид
103		Белое твердое вещество (этанол/этилацетат)	251,1-253,6	Гидрохлорид
104		Белое твердое вещество (этилацетат)	249,8-252,3	Гидрохлорид
105		Белое твердое вещество (этилацетат)	255,1-256,6	Гидрохлорид

Таблица 24

106		Белое твердое вещество (этилацетат)	207,9-208,7	Гидрохлорид
107		Белое твердое вещество (этилацетат)	214,5-216,8	Гидрохлорид



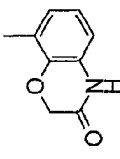
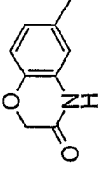
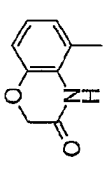
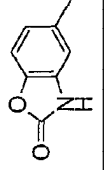
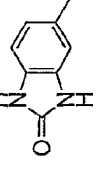
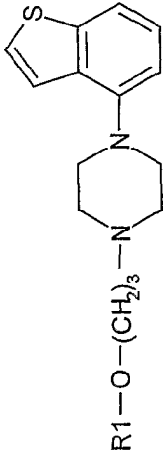
Пример	R1	ЯМР	Соль
108		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,04-2,13 (2H, м), 2,65 (2H, т, J=7,2 Гц), 2,73 (4H, ушпр.), 3,19 (4H, ушпр.), 4,15 (2H, т, J=6,6 Гц), 4,67 (2H, с), 6,42 (1H, дд, J=1,3, 8,0 Гц), 6,69 (1H, дд, J=1,3, 8,3 Гц), 6,87-6,92 (2H, м), 7,25-7,30 (1H, м), 7,35-7,42 (2H, м), 7,55 (1H, д, J=8,0 Гц), 7,84 (1H, ушпр.).	-
109		¹ H-ЯМР (DMSO-d ₆) δ м.д.: 1,80-2,00 (2H, м), 2,45-2,55 (2H, м), 2,55-2,65 (4H, ушпр.), 3,00-3,10 (4H, ушпр.), 3,93 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,47 (2H, с), 6,45-6,55 (2H, м), 6,80-6,90 (2H, м), 7,26 (1H, т, J=7,8 Гц), 7,38 (1H, д, J=5,5 Гц), 7,60 (1H, д, J=8,0 Гц), 7,67 (1H, д, J=5,5 Гц), 10,59 (1H, с).	-
110		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,06 (2H, квинт., J=6,5 Гц), 2,66 (2H, т, J=6,9 Гц), 2,70-2,80 (4H, м), 3,20-3,25 (4H, м), 4,12 (2H, т, J=6,1 Гц), 4,60 (2H, с), 6,55-6,70 (2H, м), 6,88 (1H, д, J=8,3 Гц), 6,91 (1H, д, J=8,3 Гц), 7,20-7,30 (1H, м), 7,35-7,45 (2H, м), 7,55 (1H, д, J=8,1 Гц), 8,43 (1H, ушпр.с).	-
111		¹ H-ЯМР (DMSO-d ₆) δ м.д.: 1,80-1,90 (2H, м), 2,41 (2H, т, J=6,6 Гц), 2,50-2,55 (4H, м), 2,95-3,00 (4H, м), 3,83 (2H, т, J=6,7 Гц), 6,47 (1H, дд, J=2,4, 8,6 Гц), 6,70 (1H, д, J=2,4 Гц), 6,85 (1H, д, J=7,5 Гц), 7,09 (1H, д, J=8,6 Гц), 7,27 (1H, дд, J=7,9, 7,9 Гц), 7,36 (1H, д, J=5,6 Гц), 7,60 (1H, д, J=8,0 Гц), 7,67 (1H, д, J=5,6 Гц), 9,46 (1H, ушпр.с).	-
112		¹ H-ЯМР (DMSO-d ₆) δ м.д.: 1,88 (2H, т, J=6,8 Гц), 2,50-2,55 (2H, м), 2,60 (4H, ушпр.с), 3,06 (4H, ушпр.с), 3,95 (2H, т, J=6,4 Гц), 6,45-6,55 (2H, м), 6,78 (1H, д, J=9,1 Гц), 6,88 (1H, д, J=7,7 Гц), 7,26 (1H, дд, J=7,8, 7,8 Гц), 7,39 (1H, д, J=5,6 Гц), 7,55-7,70 (2H, м), 10,35 (1H, ушпр.с), 10,49 (1H, ушпр.с).	-

Таблица 2.5



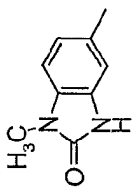
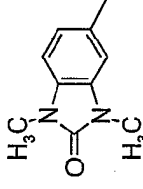
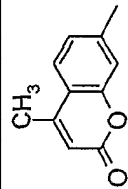
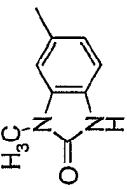
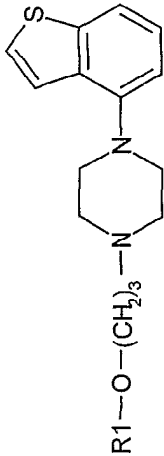
Пример	R1	¹ H-ЯМР	Соль
113		¹ H-ЯМР (DMSO-d ₆) δ м.д.: 2,20-2,30 (2H, м), 2,45-2,55 (2H, м), 3,00-3,80 (1H, м), 4,06 (2H, т, J=5,9 Гц), 6,60-6,70 (2H, м), 6,90-7,00 (2H, м), 7,33 (1H, д, J=7,9, 7,9 Гц), 7,50 (1H, д, J=5,5 Гц), 7,71 (1H, д, J=8,0 Гц), 7,78 (1H, д, J=5,5 Гц), 10,67 (1H, ушпр.с), 10,81 (1H, ушпр.с).	Дигидрохлорид
114		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,00-2,10 (4H, м), 2,70-2,85 (6H, м), 3,20-3,25 (4H, м), 3,40 (6H, с), 4,097 (2H, т, J=6,3 Гц), 6,61 (1H, д, J=2,2 Гц), 6,68 (1H, д, J=2,3, 8,4 Гц), 6,85 (1H, д, J=8,5 Гц), 6,92 (1H, д, J=7,6 Гц), 7,25-7,35 (1H, м), 7,35-7,45 (2H, м), 7,57 (1H, д, J=8,0 Гц).	-
115		¹ H-ЯМР (DMSO-d ₆) δ м.д.: 2,25-2,35 (2H, м), 2,40 (3H, с), 3,20-3,70 (10H, м), 4,22 (2H, т, J=5,9 Гц), 6,22 (1H, с), 6,95-7,05 (3H, м), 7,31 (1H, д, J=7,9, 7,9 Гц), 7,49 (1H, д, J=5,5 Гц), 7,65-7,80 (3H, м), 10,93 (1H, ушпр.с).	Гидрохлорид
116		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,00-2,10 (2H, м), 2,60-2,70 (2H, м), 2,75 (4H, ушпр.с), 3,21 (4H, ушпр.с), 3,39 (3H, с), 4,05-4,15 (2H, м), 6,55-6,70 (2H, м), 6,90 (1H, д, J=7,6 Гц), 6,96 (1H, д, J=8,5 Гц), 7,25-7,30 (1H, м), 7,35-7,45 (2H, м), 7,55 (1H, д, J=8,1 Гц), 9,12 (1H, ушпр.с).	-

Таблица 25-1



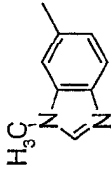
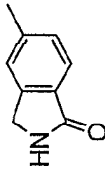
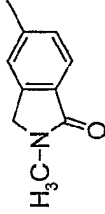
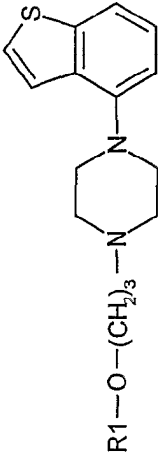
Пример	R1	ЯМР	Соль
117		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,10 (2H, т, J=7,3 Гц), 2,70 (2H, т, J=7,4 Гц), 2,77 (4H, ушир.с), 3,22 (4H, ушир.с), 3,80 (3H, с), 4,14 (2H, т, J=6,3 Гц), 6,85-7,00 (3H, м), 7,25-7,35 (1H, м), 7,35-7,45 (2H, м), 7,56 (1H, д, J=8,1 Гц), 7,68 (1H, д, J=8,8 Гц), 7,77 (1H, с).	-
118		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) См.д.: 2,07 (2H, т, J=7,0 Гц), 2,65 (2H, т, J=7,2 Гц), 2,74 (4H, ушир.с), 3,20 (4H, ушир.с), 4,13 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,40 (2H, с), 6,38 (1H, ушир.с), 6,90 (1H, д, J=7,6 Гц), 6,97 (1H, с), 7,02 (1H, дд, J=2,1, 8,4 Гц), 7,25-7,30 (1H, м), 7,35-7,45 (2H, м), 7,55 (1H, д, J=8,1 Гц), 7,78 (1H, д, J=8,4 Гц).	-
119		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,07 (2H, т, J=7,0 Гц), 2,66 (2H, т, J=5,7 Гц), 2,74 (4H, ушир.с), 3,17 (3H, с), 3,20 (4H, ушир.с), 4,12 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,31 (2H, с), 6,90 (1H, д, J=7,6 Гц), 6,90-7,00 (2H, м), 7,25-7,30 (1H, м), 7,39 (1H, д, J=5,5 Гц), 7,41 (1H, д, J=5,5 Гц), 7,55 (1H, д, J=8,1 Гц), 7,74 (1H, д, J=8,4 Гц).	-

Таблица 25-2



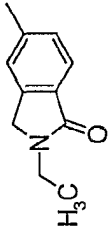
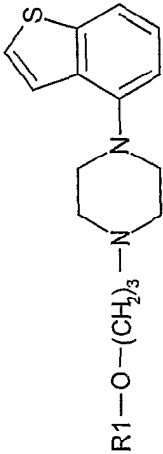
Пример	R1	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
120		Белый порошок (мэтанол)	242-246	Гидрохлорид

Таблица 25-3



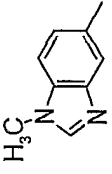
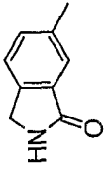
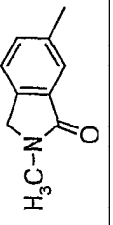
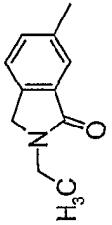
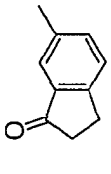
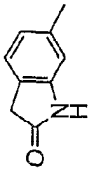
Пример	R1	ЯМР	Соль
121		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,08 (2H, т, J=7,3 Гц), 2,69 (2H, т, J=7,4 Гц), 2,76 (4H, ушир.с), 3,21 (4H, ушир.с), 3,82 (3H, с), 4,13 (2H, т, J=6,3 Гц), 6,91 (1H, д, J=6,3 Гц), 6,99 (1H, д, J=2,3, 8,7 Гц), 7,25-7,35 (3H, м), 7,39 (1H, д, J=5,6 Гц), 7,43 (1H, д, J=5,5 Гц), 7,55 (1H, д, J=8,0 Гц), 7,81 (1H, с).	-
122		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,00-2,10 (2H, м), 2,65 (2H, т, J=7,3 Гц), 2,74 (4H, ушир.с), 3,21 (4H, ушир.с), 4,13 (2H, т, J=6,4 Гц), 4,40 (2H, с), 6,84 (1H, ушир.с), 6,91 (1H, д, J=7,5 Гц), 7,16 (1H, д, J=2,3, 8,3 Гц), 7,25-7,30 (1H, м), 7,35-7,45 (4H, м), 7,55 (1H, д, J=8,0 Гц).	-
123		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,06 (2H, т, J=7,2 Гц), 2,65 (2H, т, J=7,3 Гц), 2,74 (4H, ушир.с), 3,20 (7H, ушир.с), 4,12 (2H, т, J=6,4 Гц), 4,31 (2H, с), 6,91 (1H, д, J=7,7 Гц), 7,10 (1H, д, J=2,4, 8,3 Гц), 7,25-7,35 (2H, м), 7,35 (1H, д, J=2,3 Гц), 7,39 (1H, д, J=5,5 Гц), 7,42 (1H, д, J=5,5 Гц), 7,55 (1H, д, J=8,0 Гц).	-
124		¹ H-ЯМР (DMSO-d ₆) δ м.д.: 1,15 (3H, т, J=7,3 Гц), 2,20-2,30 (2H, м), 3,15-3,30 (2H, м), 3,30-3,40 (4H, м), 3,45-3,70 (6H, м), 4,16 (2H, т, J=5,8 Гц), 4,39 (2H, с), 6,97 (1H, д, J=7,6 Гц), 7,10-7,25 (2H, м), 7,31 (1H, д, J=7,9, 7,9 Гц), 7,45-7,55 (2H, м), 7,69 (1H, д, J=8,1 Гц), 7,76 (1H, д, J=5,6 Гц), 10,74 (1H, ушир.с).	Гидрохлорид
125		¹ H-ЯМР (DMSO-d ₆) δ м.д.: 2,20-2,30 (2H, м), 2,64 (2H, т, J=5,8 Гц), 3,01 (2H, т, J=5,5 Гц), 3,20-3,40 (6H, м), 3,53 (2H, д, J=12,3 Гц), 3,64 (2H, д, J=11,2 Гц), 4,15 (2H, т, J=6,0 Гц), 6,95 (1H, д, J=7,7 Гц), 7,13 (1H, д, J=2,4 Гц), 7,25-7,35 (2H, м), 7,45-7,55 (2H, м), 7,69 (1H, д, J=8,0 Гц), 7,75 (1H, д, J=5,6 Гц), 11,12 (1H, ушир.с).	Гидрохлорид

Таблица 26

Пример	R1	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
126		Красно-коричневый порошок (ацетонитрил)	191-193	-

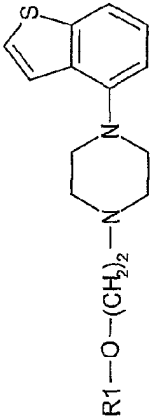
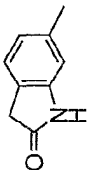
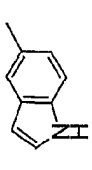
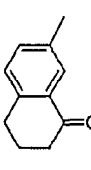
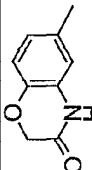


Таблица 27

Пример	R1	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
127		Красно-коричневый порошок (этанол)	215-217	Гидрохлорид
128		Белое твердое вещество (этилацетат)	209,2-210,9	Гидрохлорид
129		Белое твердое вещество (этанол/этилацетат)	242,0-244,9	Гидрохлорид
130		Белый порошок (этанол)	211-213	Гидрохлорид

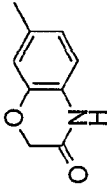
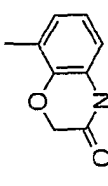
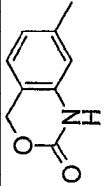
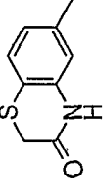
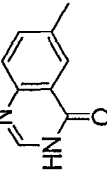
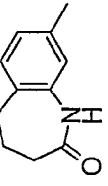
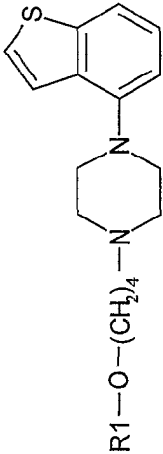
131			Светло-пурпурный порошок (этилацетат)	180-182	-
132			Светло-розовый порошок (этанол)	170,2-171,9	-
133			Белый порошок (этанол/этилацетат)	253-258 (разл.)	Гидрохлорид
134			Белый порошок (2-пропанол)	213,7-220,6	Гидрохлорид
135			Белое твердое вещество (этилацетат)	152,6-155,3	Гидрохлорид
136			Белый порошок (этанол/этилацетат)	226-228	Гидрохлорид

Таблица 28



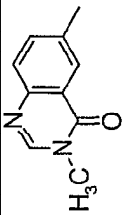
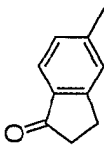
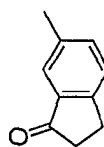
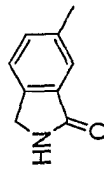
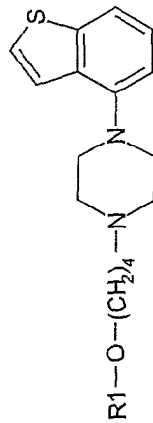
Пример	R1	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
137		Белое твердое вещество (этилацетат)	238, 8-241, 8	Гидрохлорид
138		Белый порошок (этилацетат/простой эфир)	198-201	Гидрохлорид
139		Белый порошок (этилацетат/простой эфир)	206-209	Гидрохлорид
140		Белый порошок (этилацетат/простой эфир)	157-161	-

Таблица 29



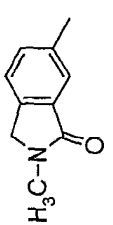
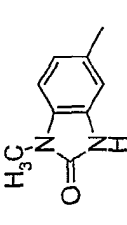
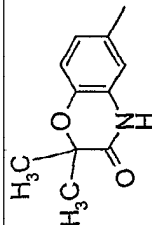
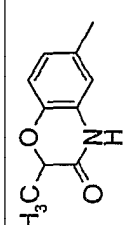
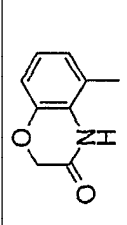
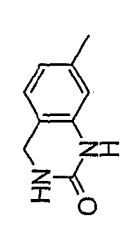
Пример	R1	ЯМР	Соль
141		¹ H-ЯМР (ДМСО-d ₆) δ м.д.: 1,75-1,85 (2H, м), 1,90-1,95 (2H, м), 3,05 (3H, с), 3,15-3,35 (6H, м), 3,55-3,65 (4H, м), 4,08 (2H, т, J=6,1 Гц), 4,36 (2H, с), 6,95 (1H, д, J=7,7 Гц), 7,10-7,20 (2H, м), 7,30 (1H, дд, J=7,9, 7,9 Гц), 7,45-7,50 (2H, м), 7,69 (1H, д, J=8,1 Гц), 7,75 (1H, д, J=5,5 Гц), 10,75 (1H, ушир.с).	Дигидрохлорид
142		¹ H-ЯМР (ДМСО-d ₆) δ м.д.: 1,70-1,80 (2H, м), 1,85-2,00 (2H, м), 3,22 (3H, с), 3,15-3,35 (6H, м), 3,45-3,60 (4H, м), 3,95 (2H, т, J=6,1 Гц), 6,60-6,65 (2H, м), 6,90-7,00 (2H, м), 7,30 (1H, дд, J=7,9, 7,9 Гц), 7,45-7,50 (1H, м), 7,68 (1H, д, J=8,0 Гц), 7,75 (1H, д, J=5,5 Гц), 10,82 (1H, с), 11,31 (1H, ушир.с).	Гидрохлорид
143		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,52 (6H, с), 1,60-1,90 (4H, м), 2,53 (2H, т, J=7,3 Гц), 2,70-2,80 (4H, м), 3,10-3,30 (4H, м), 3,97 (2H, т, J=6,0 Гц), 6,37 (1H, д, J=2,7 Гц), 6,53 (1H, дд, J=2,7, 8,8 Гц), 6,85-6,95 (2H, м), 7,25-7,35 (2H, м), 7,35-7,45 (2H, м), 7,56 (1H, д, J=8,0 Гц), 8,06 (1H, с).	-
144		¹ H-ЯМР (ДМСО-d ₆) δ м.д.: 1,37 (3H, д, J=6,7 Гц), 1,50-1,80 (4H, м), 2,41 (2H, т, J=6,9 Гц), 2,55-2,65 (4H, ушир.), 3,90 (2H, т, J=6,2 Гц), 4,51 (1H, кв, J=6,7 Гц), 6,45-6,50 (2H, м), 6,80-6,90 (2H, м), 7,25 (1H, т, J=7,8 Гц), 7,38 (1H, д, J=8,0 Гц), 7,59 (1H, д, J=8,0 Гц), 7,67 (1H, д, J=5,5 Гц), 10,53 (1H, с).	-
145		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,65-1,95 (4H, м), 2,53 (2H, т, J=7,3 Гц), 2,70-2,75 (4H, м), 3,15-3,25 (4H, м), 4,08 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,61 (2H, с), 6,57 (1H, д, J=8,3 Гц), 6,61 (1H, д, J=8,3 Гц), 6,85-6,95 (2H, м), 7,20-7,35 (1H, м), 7,35-7,45 (2H, м), 7,55 (1H, д, J=8,0 Гц), 7,80 (1H, ушир.с).	-
146		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,60-1,88 (4H, м), 2,51 (2H, т, J=7,5 Гц), 2,63-2,77 (4H, м), 3,13-3,25 (4H, м), 3,95 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,46 (2H, с), 5,28 (1H, ушир.с), 6,25 (1H, д, J=2,4 Гц), 6,50 (1H, дд, J=8,4, 2,4 Гц), 6,90 (1H, д, J=7,7 Гц), 6,92 (1H, д, J=8,4 Гц), 7,27 (1H, дд, J=7,8, 8,0 Гц), 7,38 (1H, д, J=5,5 Гц), 7,41 (1H, д, J=5,5 Гц), 7,51 (1H, ушир.с), 7,54 (1H, д, J=8,0 Гц).	-

Таблица 31

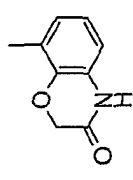
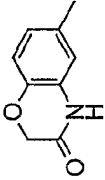
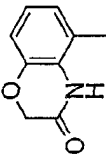
Пример	R1	ЯМР	Соль
150		¹ H-ЯМР (ДМСО-d ₆) δ м.д.: 1,40-1,67 (2H, м), 1,73-1,90 (4H, м), 3,13-3,30 (6H, м), 3,52-3,62 (4H, м), 3,96-4,01 (2H, м), 4,54 (2H, с), 6,50 (1H, д, J=7,7 Гц), 6,67 (1H, д, J=7,3 Гц), 6,83-6,88 (1H, м), 6,96 (1H, д, J=7,7 Гц), 7,28-7,34 (1H, м), 7,48 (1H, д, J=5,6 Гц), 7,70 (1H, д, J=8,1 Гц), 7,76 (1H, д, J=5,6 Гц), 10,42 (1H, ушпр.), 10,67 (1H, ушпр.).	Гидрохлорид
151		¹ H-ЯМР (ДМСО-d ₆) δ м.д.: 1,40-1,60 (4H, м), 1,60-1,80 (2H, м), 2,35-2,45 (2H, м), 2,55-2,65 (4H, ушпр.), 3,90 (2H, т, J=6,4 Гц), 4,49 (2H, с), 6,45-6,55 (2H, м), 6,80-6,95 (2H, м), 7,28 (1H, т, J=7,8 Гц), 7,40 (1H, д, J=5,6 Гц), 7,62 (1H, д, J=8,0 Гц), 7,69 (1H, д, J=5,5 Гц), 10,61 (1H, с).	-
152		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,45-1,70 (4H, м), 1,80-1,90 (2H, м), 2,45-2,55 (2H, м), 2,65-2,75 (4H, м), 3,15-3,25 (4H, м), 4,05 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,61 (2H, с), 6,50-6,65 (2H, м), 6,85-6,95 (2H, м), 7,20-7,35 (1H, м), 7,35-7,45 (2H, м), 7,55 (1H, д, J=8,0 Гц), 7,80 (1H, ушпр.с).	-

Таблица 32

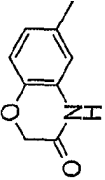
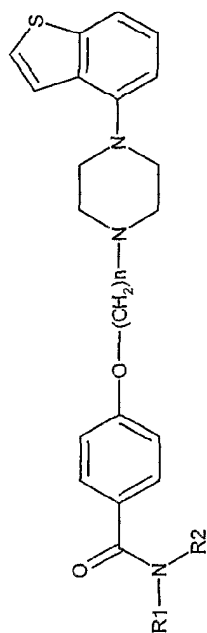
Пример	R1	ЯМР	Соль
153		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,73 (4H, м), 3,19-3,20 (6H, м), 4,56 (2H, с), 4,54-4,62 (2H, м), 5,76-5,92 (2H, м), 6,38 (1H, д, J=2,7 Гц), 6,54 (1H, дх, J=8,8, 2,7 Гц), 6,89-6,92 (2H, м), 7,25 (1H, м), 7,39-7,41 (2H, м), 7,53-7,56 (2H, м)	-

Таблица 33



Пример	R1	R2	n	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
154	-H	-C ₂ H ₅	3	Белый порошок (этилацетат)	218,5-222,0 (разл.)	Гидрохлорид
155	-H	-C ₃ H ₇	3	Светло-желтый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	127,0-128,5	-
156	-H	-CH ₃	3	Светло-желтый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	151,0-154,5	-
157	-CH ₃	-CH ₃	3	Белый порошок (этилацетат)	206,5-211,5	Гидрохлорид
158	-C ₃ H ₅	-C ₂ H ₅	3	Белый порошок (этилацетат)	205,5-209,0	Гидрохлорид
159	-H	-CH ₂ CF ₃	3	Белый порошок (этилацетат)	217,0 (разл.)	Гидрохлорид
160	-H	-CH ₂ CH ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	3	Белый порошок (этилацетат)	229,5-232,5	Дигидрохлорид
161	-H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	3	Белый порошок (этилацетат)	218,5-221,0	Гидрохлорид
162	-H	-цикло-C ₃ H ₅	3	Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	165,5-167,0	-
163	-H	-CH(CH ₃) ₂	3	Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	131,5-132,5	-
164	-H	-H	3	Белый порошок (дихлорметан)	186,0-191,0	-
165	-H	-(CH ₂) ₅ OH	3	Белое твердое вещество (этанол)	202-203	Гидрохлорид
166	-H		3	Светло-коричневое твердое вещество (этанол)	215-216	Гидрохлорид
167	-H	-C ₂ H ₅	4	Белый порошок (этилацетат)	198,0-199,5	Гидрохлорид
168	-H	-CH ₂ CF ₃	4	Белый порошок (этилацетат)	194,5-196,0	Гидрохлорид
169	-H	-H	4	Белый порошок (2-пропанол)	150,0-151,5	-
170	-H	-CH ₃	4	Белый порошок (этилацетат)	154,0-156,0	-
171	-CH ₃	-CH ₃	4	Белый порошок (этилацетат)	226,0 (разл.)	Гидрохлорид

Таблица 34

Пример	R1	R2	ЯМР	Соль
172	-H	-CH ₂ CH ₂ OH	¹ H-ЯМР (ДМСО-d ₆) δ м.д.: 2,1-2,2 (2H, м), 3,1-3,8 (14H, м), 4,17 (2H, т, J=5,7 Гц), 4,6-4,8 (1H, ушпр.), 6,9-7,1 (3H, м), 7,33 (1H, дт, J=7,9, 8,1 Гц), 7,51 (1H, д, J=5,5 Гц), 7,72 (1H, д, J=8,1 Гц), 7,78 (1H, д, J=5,5 Гц), 7,86 (2H, д, J=8,8 Гц), 8,2-8,3 (1H, ушпр.), 10,2-10,4 (1H, ушпр.).	Гидрохлорид

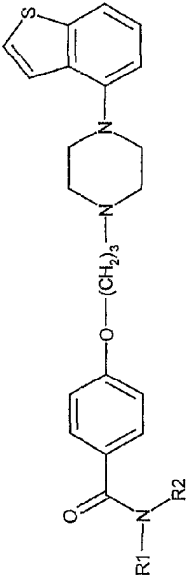


Таблица 35

Пример	R1	R2	R3	R4	R5	R6	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
173	-H	-H	-H	-OCH ₃	-CH ₃	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат)	199,0-204,0	Гидрохлорид
174	-OCH ₃	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	-H	Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	162,0-163,0	-
175	-Cl	-H	-H	-H	-H	-H	Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	154,0-155,5	-
176	-Cl	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	145,0-148,0	-
177	-H	-H	-H	-Cl	-CH ₃	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат)	213,0 (разл.)	Гидрохлорид
178	-H	-H	-H	-Cl	-C ₂ H ₅	-H	Белый порошок (этилацетат)	211,0 (разл.)	Гидрохлорид
179	-Cl	-H	-H	-H	-CH ₂ CF ₃	-H	Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	128,5-131,0	-
180	-F	-H	-H	-H	-H	-H	Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	153,5-156,0	-

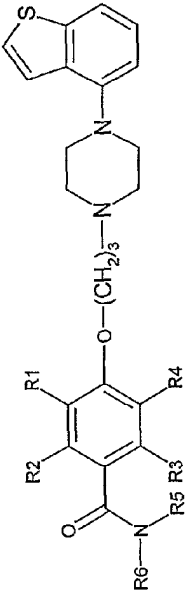
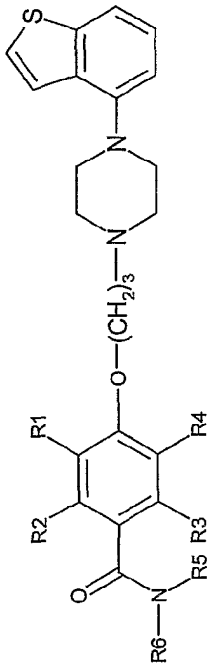
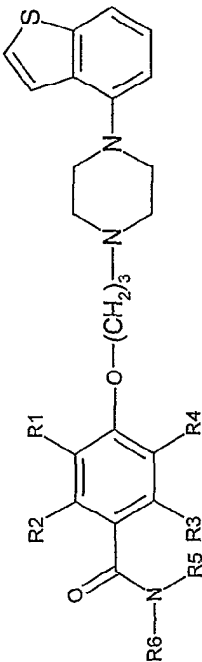


Таблица 36



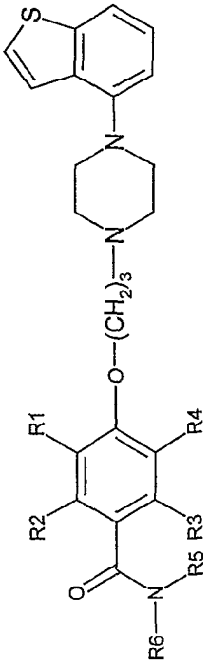
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	R6	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
181	-H	-H	-H	-F	-CH ₃	-H	Белый порошок (этилацетат)	232,0 (разл.)	Гидрохлорид
182	-H	-H	-H	-F	-CH ₃	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат)	198,0-202,0	Гидрохлорид
183	-H	-H	-H	-F	-C ₂ H ₅	-H	Белый порошок (этилацетат)	210,5-213,0	Гидрохлорид
184	-F	-H	-H	-H	-CH ₂ CF ₃	-H	Светло-желтый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	176,5-179,5	-
185	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	Белый порошок (2-пропанол)	178,5-180,0	-
186	-CH ₃	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	Белый порошок (2-пропанол)	156,5-158,0	-
187	-H	-H	-H	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат)	220,0-222,0 (разл.)	Гидрохлорид
188	-CH ₃	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	-H	Белый порошок (2-пропанол)	140,5-143,0	-
189	-CH ₃	-H	-H	-H	-CH ₂ CF ₃	-H	Белый порошок (2-пропанол)	154,5-157,0	-
190	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	Белый порошок (2-пропанол)	162,0-163,5	-

Таблица 37



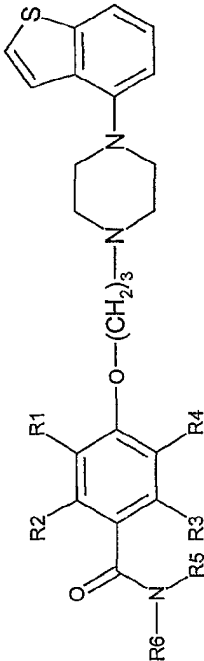
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	R6	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
191	-OCH ₃	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	Белый порошок (2-пропанол)	160,5-162,0	-
192	-OCH ₃	-H	-H	-H	-CH ₂ CF ₃	-H	Светло-желтый порошок (2-пропанол)	144,5-146,0	-
193	-Cl	-H	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	-H	Белый порошок	120-122	-
194	-H	-H	-H	-F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	-H	Белый порошок (этанол/этилацетат)	215,0-217,0	Гидрохлорид
195	-CH ₃	-H	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	-H	Белый порошок (этанол/гексан)	120,0-121,0	-
196	-H	-H	-H	-OCH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	-H	Белый порошок (этанол/этилацетат)	194-196	Гидрохлорид
197	-Br	-H	-H	-H	-H	-H	Белый порошок (этилацетат/изо-пропиловый эфир)	152,5-154,0	-
198	-Br	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	Белый порошок (этилацетат/изо-пропиловый эфир)	148,0-150,0	-
199	-H	-H	-H	-Br	-CH ₃	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат)	225,0 (разл.)	Гидрохлорид
200	-H	-H	-H	-Br	-C ₂ H ₅	-H	Светло-желтый порошок (этилацетат)	214,5-220,5 (разл.)	Гидрохлорид

Таблица 38



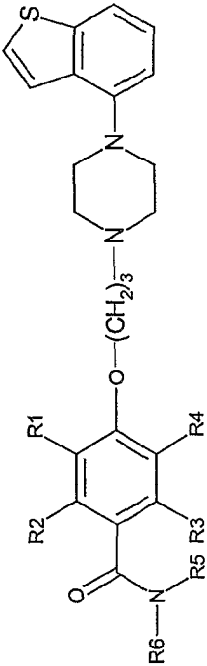
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	R6	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
201	-H	-H	-H	-Br	-CH ₂ CF ₃	-H	Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	230,0-234,5	Гидрохлорид
202	-CN	-H	-H	-H	-H	-H	Белый порошок (этилацетат)	182,0-185,0	-
203	-CN	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	Белый порошок (2-пропанол)	177,5-181,5	-
204	-H	-H	-H	-CN	-CH ₃	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат)	213,5-214,0	Гидрохлорид
205	-CN	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	-H	Белый порошок (2-пропанол)	162,5-166,0	-
206	-H	-H	-H	-CN	-CH ₂ CF ₃	-H	Белый порошок (этилацетат)	217,0-222,0	Гидрохлорид
207	-H	-Cl	-H	-H	-H	-H	Белый порошок (95% 2-пропанол)	133,5-135,5	-
208	-H	-Cl	-H	-H	-CH ₃	-H	Белый порошок (95% 2-пропанол)	137,0-139,0	-
209	-H	-H	-Cl	-H	-CH ₃	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат)	236,0 (разл.)	Гидрохлорид
210	-H	-H	-Cl	-H	-C ₂ H ₅	-H	Белый порошок (этилацетат)	223,0-224,0	Гидрохлорид

Таблица 39



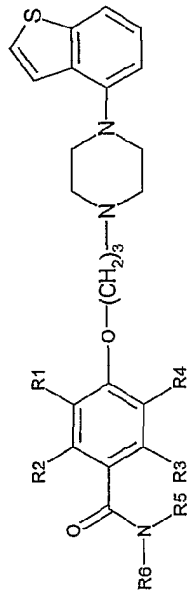
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	R6	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
211	-H	-H	-Cl	-H	-CH ₂ CF ₃	-H	Белый порошок (этилацетат)	210,5-216,0	Гидрохлорид
212	-H	-H	-CF ₃	-H	-C ₂ H ₅	-H	Белый порошок (этилацетат)	212,0-219,5	Гидрохлорид
213	-H	-CF ₃	-H	-H	-H	-H	Белый порошок (дихлорметан/изопропиловый эфир)	139,5-141,0	Гидрохлорид
214	-H	-H	-CF ₃	-H	-CH ₃	-H	Белый порошок (этилацетат)	214,0-218,5	Гидрохлорид
215	-H	-H	-CF ₃	-H	-CH ₃	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат)	252,5 (разл.)	Гидрохлорид
216	-H	-H	-CF ₃	-H	-CH ₂ CF ₃	-H	Белый порошок (этилацетат)	216,0-218,5	Гидрохлорид
217	-H	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	Белый порошок (2-пропанол)	173,5-178,5	-

Таблица 39-1



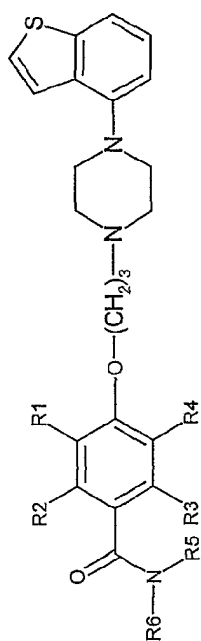
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	R6	ЯМР	Соль
218	-N(CH ₃) ₂	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	-H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,20-1,30 (3H, м), 2,10-2,20 (2H, м), 2,69 (2H, т, J=7,3 Гц), 2,70-2,75 (4H, м), 2,85 (6H, с), 3,20-3,25 (4H, м), 3,45-3,55 (2H, м), 4,10-4,20 (2H, м), 6,00 (1H, ушир.с), 6,85-6,95 (2H, м), 7,25-7,30 (3H, м), 7,35-7,45 (2H, м), 7,56 (1H, д, J=8,1 Гц).	-
219	-NHCOCH ₃	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	-H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,20-1,30 (3H, м), 2,05-2,15 (2H, м), 2,25 (3H, с), 2,65 (2H, т, J=7,1 Гц), 2,70-2,80 (4H, м), 3,20-3,25 (4H, м), 3,40-3,55 (2H, м), 4,21 (2H, т, J=6,4 Гц), 6,22 (1H, ушир.с), 6,91 (1H, д, J=7,7 Гц), 6,98 (1H, д, J=8,6 Гц), 7,25-7,30 (1H, м), 7,35-7,45 (2H, м), 7,56 (1H, д, J=8,0 Гц), 7,71 (1H, д, J=8,5 Гц), 7,82 (1H, ушир.с), 8,70 (1H, с).	-

Таблица 40



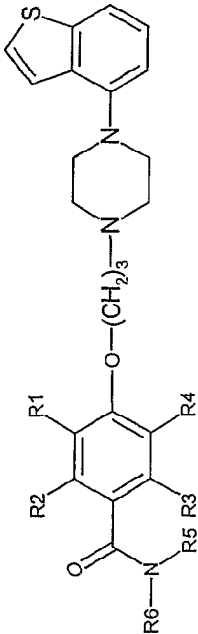
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	R6	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
220	-H	-H	-OCH ₃	-H	-CH ₃	-H	Белый порошок (2-пропанол)	221,5-223,0	Гидрохлорид
221	-H	-H	-OCH ₃	-H	-CH ₃	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат)	207,5-215,0	Гидрохлорид
222	-H	-H	-OCH ₃	-H	-C ₂ H ₅	-H	Белый порошок (этилацетат)	197,0-202,0	Гидрохлорид
223	-H	-H	-OCH ₃	-H	-CH ₂ CF ₃	-H	Белый порошок (этилацетат)	219,0-227,0	Гидрохлорид
224	-NO ₂	-H	-H	-H	-H	-H	Светло-желтый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	157,5-161,0	-
225	-NO ₂	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	Светло-желтый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	157,5-161,5	-
226	-H	-H	-H	-NO ₂	-CH ₂ CF ₃	-H	Светло-желтый порошок (этилацетат)	217,5-219,5 (разл.)	Гидрохлорид
227	-CF ₃	-H	-H	-H	-H	-H	Белый порошок (95% пропанол)	163,5-165,5	-
228	-NH ₂	-H	-H	-H	-H	-H	Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	172,5-173,0	-
229	-CF ₃	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	Белый порошок (95% 2-пропанол)	158,5-162,0	-
230	-CF ₃	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	-H	Белый порошок (95% 2-пропанол)	146,5-148,5	-

Таблица 41



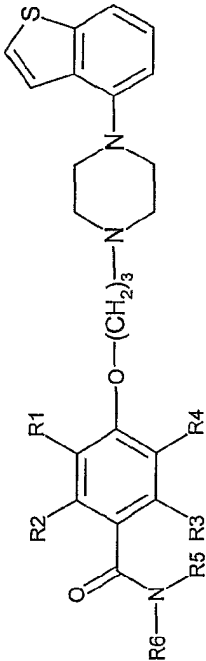
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	R6	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
231	-CF ₃	-H	-H	-H	-CH ₂ CF ₃	-H	Белый порошок (95% 2-пропанол)	144,5-150,0	-
232	-NH ₂	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	124,0-125,5	-
233	-N(CH ₃) ₂	-H	-H	-H	-H	-H	Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	143,0-145,0	-
234	-H	-H	-H	N(CH ₃) ₂	-CH ₃	-H	Белый порошок (этилацетат)	219,0-223,0	Гидрохлорид
235	-NH ₂	-H	-H	-H	-CH ₂ CF ₃	-H	Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	125,0-126,0	-
236	-N(CH ₃) ₂	-H	-H	-H	-CH ₂ CF ₃	-H	Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	147,5-148,5	-
237	-H	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	Белый порошок (95% 2-пропанол)	150,5-152,5	-
238	-H	-CH ₃	-H	-H	-CH ₃	-H	Белый порошок (95% 2-пропанол)	138,0-139,0	-
239	-H	-CH ₃	-H	-H	-C ₂ H ₅	-H	Белый порошок (95% 2-пропанол)	137,5-139,0	-
240	-CH ₃	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	Белый порошок (95% 2-пропанол)	167,0-168,0	-

Таблица 42



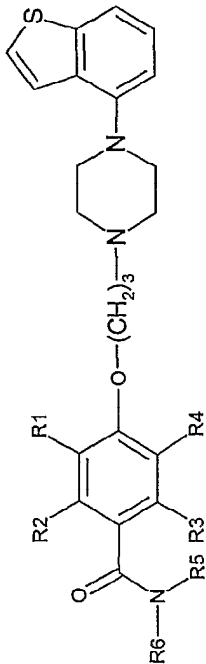
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	R6	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
241	-CH ₃	-H	-H	-CH ₃	-CH ₃	-H	Белый порошок (95% 2-пропанол)	152,5-154,5	-
242	-CH ₃	-H	-H	-CH ₃	-C ₂ H ₅	-H	Белый порошок (95% 2-пропанол)	184,0-185,5	-
243	-OCH ₃	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	147,5-148,0	-
244	-OCH ₃	-H	-H	-OCH ₃	-CH ₃	-H	Белый порошок (этилацетат)	233,0-237,5 (разл.)	Гидрохлорид
245	-OCH ₃	-H	-H	-OCH ₃	-C ₂ H ₅	-H	Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	145,5-147,5	-
246	-OC ₂ H ₅	-H	-H	-CH ₃	-CH ₃	-H	Белый порошок (этанол/этилацетат)	186,5-188,0	Гидрохлорид
247	-CH ₂ CH=CH ₂	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	(Этилацетат/изопропиловый эфир)	126,0-130,0	-
248	-C ₃ H ₇	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	(Этилацетат/изопропиловый эфир)	137,5-140,0	-
249	-OCH ₃	-H	-H	-CH ₂ CH=CH ₂	-CH ₃	-H	Белый порошок (этилацетат)	180,5-186,0	Гидрохлорид
250	-OCH ₃	-H	-H	-C ₃ H ₇	-CH ₃	-H	Белый порошок (этилацетат)	186,5-192,0	Гидрохлорид

Таблица 43



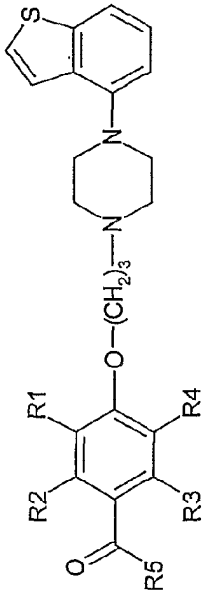
Пример	R 1	R 2	R 3	R 4	R 5	R 6	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
251	-CH ₃	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	156,0-157,0	-
252	-CH ₃	-H	-H	-OCH ₃	-CH ₃	-H	Белый порошок (этилацетат/метанол)	141,5-142,5	-
253	-OCH ₃	-H	-H	-CH ₃	-C ₂ H ₅	-H	Белый порошок (этилацетат)	220,5-224,5	Гидрохлорид
254	-OCH ₃	-H	-H	-CH ₃	-CH ₃	-OCH ₃	Белый порошок (этилацетат)	223,0-227,5	Гидрохлорид

Таблица 44



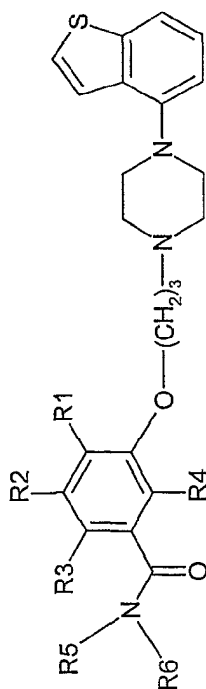
Пример	R 1	R 2	R 3	R 4	R 5	R 6	ЯМР	Соль
255	-H	-H	-H	-NO ₂	-C ₂ H ₅	-H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,28 (3H, т, J=7,3 Гц), 2,05-2,15 (2H, м), 2,68 (2H, т, J=7,0 Гц), 2,73 (4H, ушпр.с), 3,19 (4H, ушпр.с), 3,45-3,55 (2H, м), 4,29 (2H, т, J=6,2 Гц), 6,14 (1H, ушпр.с), 6,90 (1H, д, J=7,6 Гц), 7,18 (1H, д, J=8,8 Гц), 7,25-7,30 (1H, м), 7,35-7,45 (2H, м), 7,55 (1H, д, J=8,1 Гц), 8,04 (1H, д, J=2,3, 8,8 Гц), 8,23 (1H, д, J=2,2 Гц).	-

Таблица 45



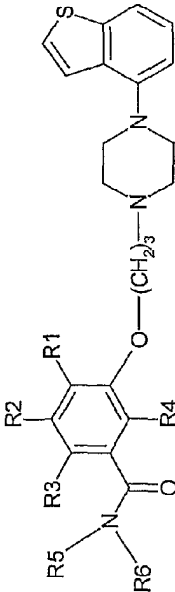
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
256	-H	-H	-H	-H		Белый порошок (этилацетат)	234,5-238,0	Гидрохлорид
257	-H	-H	-H	-H		Белый порошок (этилацетат)	244,0 (разл.)	Дигидрохлорид
258	-H	-H	-H	-Cl		Белый порошок (этилацетат)	218,5-222,0	Гидрохлорид
259	-H	-H	-H	-Cl		Белый порошок (этилацетат)	255,0 (разл.)	Дигидрохлорид
260	-H	-H	-H	-F		Белый порошок (этилацетат)	224,5-227,5 (разл.)	Гидрохлорид
261	-H	-H	-H	-F		Белый порошок (этилацетат)	255,0 (разл.)	Дигидрохлорид
262	-H	-H	-H	-CH3		Белый порошок (этилацетат)	236,0 (разл.)	Гидрохлорид
263	-H	-H	-H	-CH3		Белый порошок (этилацетат)	255,5 (разл.)	Дигидрохлорид
264	-H	-H	-H	-OCH3		Белый порошок (этилацетат)	226,0-228,0 (разл.)	Гидрохлорид
265	-H	-H	-H	-OCH3		Белый порошок (этилацетат)	232,0 (разл.)	Дигидрохлорид

Таблица 46



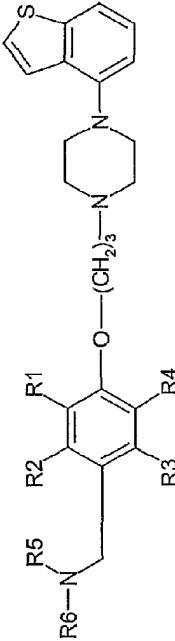
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	R6	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
266	-H	-H	-H	-H	-H	-H	Светло-желтый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	158,0-160,0	-
267	-H	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	Светло-желтый порошок (этилацетат)	183,0-186,0	Гидрохлорид
268	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	-CH ₃	Светло-желтый порошок (этилацетат)	158,0-161,5	Гидрохлорид
269	-H	-H	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	Светло-желтый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	168,5-173,0	Гидрохлорид
270	-H	-H	-H	-H	-H	-CH ₂ CF ₃	Светло-желтый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	187,5-189,0	Гидрохлорид
271	-F	-H	-H	-H	-H	-H	Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	156,5-159,0	-
272	-F	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	214,5-218,0	Гидрохлорид
273	-F	-H	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	Белый порошок (этилацетат)	211,0-218,0	Гидрохлорид
274	-Cl	-H	-H	-H	-H	-H	Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	139,0-140,5	-
275	-Cl	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат)	218,5-222,5	Гидрохлорид
276	-Cl	-H	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	Белый порошок (этилацетат)	247,0 (разл.)	Гидрохлорид
277	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	129,5-130,0	-
278	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	148,5-151,0	-
279	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	133,0-134,5	-
280	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	Белый порошок (этилацетат)	155,5-160,0	-
281	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат)	163,5-165,0	Гидрохлорид

Таблица 47



Пример	R1	R2	R3	R4	R5	R6	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
282	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	Белый порошок (этилацетат)	187,0-188,5	Гидрохлорид
283	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	132,0-134,0	-
284	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	-H	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат)	201,0-206,0	Гидрохлорид
285	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	156,0-158,5	-

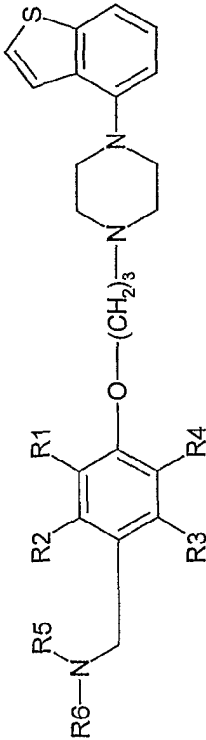
Таблица 48



Пример	R1	R2	R3	R4	R5	R6	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
286	-H	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	-H	Светло-желтый порошок (этилацетат)	228,0-241,0 (разл.)	Дигидрохлорид
287	-H	-H	-H	-H	-C ₃ H ₇	-H	Белый порошок (этилацетат)	232,0-236,0 (разл.)	Дигидрохлорид
288	-H	-H	-H	-H	-C ₃ H ₇	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат)	210,0-222,0 (разл.)	Дигидрохлорид
289	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	Белый порошок (этилацетат)	235,5 (разл.)	Дигидрохлорид
290	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат)	257,5 (разл.)	Дигидрохлорид
291	-H	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	Белый порошок (этилацетат)	232,0 (разл.)	Дигидрохлорид
292	-H	-H	-H	-H	-CH ₂ CF ₃	-H	Белый порошок (этилацетат)	238,5-240,5 (разл.)	Дигидрохлорид
293	-H	-H	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	-H	Белый порошок (этилацетат)	209,5 (разл.)	Тригидрохлорид
294	-H	-H	-H	-H	-H	-H	Светло-желтый порошок (этилацетат)	245,5 (разл.)	Дигидрохлорид
295	-H	-H	-H	-H	-CHO	-H	Белый порошок (этилацетат)	207,5-213,0	Гидрохлорид

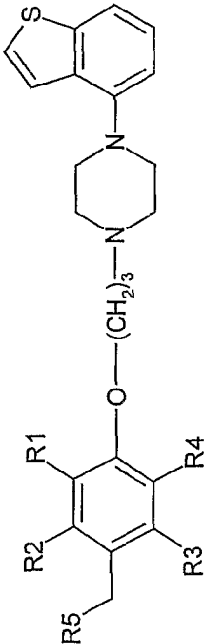
Таблица 49

296	-H	-H	-H	-H	-COCH ₃	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат)	196,5-201,0	Гидрохлорид
297	-H	-H	-H	-H	-COC ₂ H ₅	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат)	194,5-198,0	Гидрохлорид
298	-H	-H	-H	-H	-COC ₆ H ₅	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат)	192,5-195,5	Гидрохлорид
299	-H	-H	-H	-H	-CH ₂ C ₆ H ₅	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат)	236,5 (разл.)	Дигидрохлорид
300	-H	-H	-H	-H	-C ₆ H ₅	-H	Белый порошок (этилацетат)	191,0-193,5	Дигидрохлорид
301	-OCH ₃	-H	-H	-H	-CH ₃	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат/ изо-пропиловый эфир)	101,0-103,0	-
302	-H	-H	-H	-H	-C ₆ H ₅	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат)	207,5-214,5	Тригидрохлорид
303	-H	-H	-H	-Cl	-CH ₃	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат)	259,0 (разл.)	Дигидрохлорид
304	-H	-H	-H	-F	-CH ₃	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат)	247,0 (разл.)	Дигидрохлорид
305	-H	-H	-H	-F	-CH ₃	-H	Белый порошок (этилацетат)	237,0 (разл.)	Дигидрохлорид
306	-H	-H	-H	-F	-CH ₃	-COCH ₃	Белый порошок (этилацетат)	196,0-199,0	Гидрохлорид



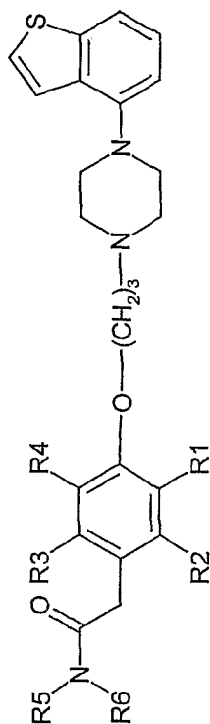
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	R6	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
307	-H	-H	-H	-CH ₃	-CH ₃	-C ₂ H ₅	Белый порошок (этилацетат)	256,5 (разл.)	Дигидрохлорид
308	-H	-H	-H	-CH ₃	-CH ₃	-H	Белый порошок (этилацетат)	254,5 (разл.)	Дигидрохлорид
309	-H	-H	-H	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат)	277,5 (разл.)	Дигидрохлорид
310	-H	-H	-H	-CH ₃	-COCH ₃	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат)	230,0-232,0 (разл.)	Гидрохлорид
311	-OCH ₃	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	Белый порошок (этилацетат)	239,5 (разл.)	Дигидрохлорид
312	-H	-H	-H	-OCH ₃	-CH ₃	-COCH ₃	Белый порошок (этилацетат)	206,0-211,5	Гидрохлорид

Таблица 50



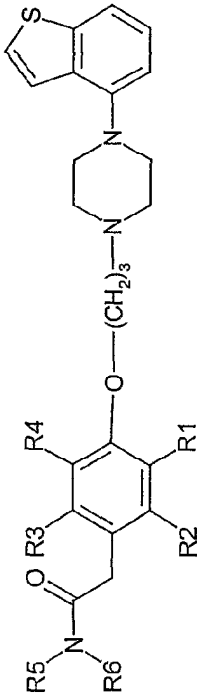
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллиза- ции)	Температура плавления (°C)	Соль
313	-H	-H	-H	-H		Белый порошок (этилацетат)	243,5 (разл.)	Дигидрохлорид
314	-H	-H	-H	-H		Белый порошок (этилацетат)	261,5 (разл.)	Дигидрохлорид
315	-H	-H	-H	-Cl		Белый порошок (этилацетат)	249,0 (разл.)	Дигидрохлорид
316	-H	-H	-H	-Cl		Белый порошок (этилацетат)	253,5 (разл.)	Тригидрохлорид
317	-H	-H	-H	-F		Белый порошок (этилацетат)	252,0 (разл.)	Дигидрохлорид
318	-H	-H	-H	-CH3		Белый порошок (этилацетат)	242,0 (разл.)	Дигидрохлорид

Таблица 51



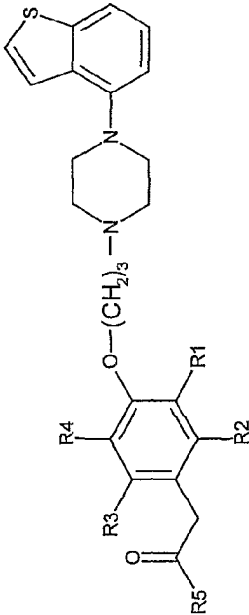
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	R6	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
319	-H	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	Светло-желтый порошок (этилацетат)	179,0-183,5	Гидрохлорид
320	-H	-H	-H	-H	-H	-H	Белый порошок (этилацетат/вода)	150,0-154,5	-
321	-H	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат)	198,0-207,0	Гидрохлорид
322	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	128,0-129,5	-
323	-H	-H	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	112,5-113,5	-
324	-H	-H	-H	-H	-H	-CH ₂ CF ₃	Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	126,0-127,0	-
325	-Cl	-H	-H	-H	-H	-H	Белый порошок (2-пропанол)	161,5-166,0	-
326	-H	-H	-H	-Cl	-H	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат)	194,5-197,0	Гидрохлорид
327	-H	-H	-H	-Cl	-CH ₃	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат)	197,5-201,0	Гидрохлорид
328	-H	-H	-H	-Cl	-H	-C ₂ H ₅	Белый порошок (этилацетат)	227,5 (разл.)	Гидрохлорид
329	-H	-H	-H	-Cl	-H	-CH ₂ CF ₃	Белый порошок (этилацетат)	204,0-206,0	Гидрохлорид
330	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	129,0-130,0	-
331	-H	-H	-H	-OCH ₃	-H	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат)	176,0-178,5	Гидрохлорид
332	-H	-H	-H	-OCH ₃	-CH ₃	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат)	188,5-192,0	Гидрохлорид
333	-H	-H	-H	-OCH ₃	-H	-C ₂ H ₅	Белый порошок (этилацетат)	178,0-184,0	Гидрохлорид
334	-H	-H	-H	-OCH ₃	-H	-CH ₂ CF ₃	Светло-желтый порошок (этилацетат)	187,5-192,0	Гидрохлорид

Таблица 52



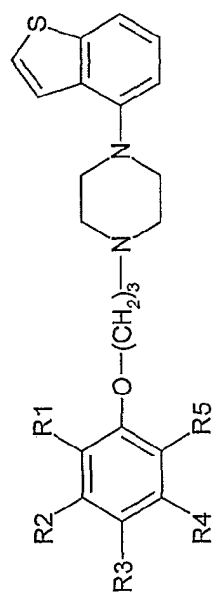
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	R6	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
335	-F	-H	-H	-H	-H	-H	Белый порошок (2-пропанол)	146,5-150,0	-
336	-H	-H	-H	-F	-H	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат)	191,0-193,0	Гидрохлорид
337	-H	-H	-H	-F	-CH ₃	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат)	192,5-197,0	Гидрохлорид
338	-H	-H	-H	-F	-H	-C ₂ H ₅	Белый порошок (этилацетат)	216,0-220,5	Гидрохлорид
339	-H	-H	-H	-F	-H	-CH ₂ CF ₃	Светло-желтый порошок (этилацетат)	197,0-202,0	Гидрохлорид
340	-H	-H	-H	-H	-H	-H	Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	149,5-150,5	-

Таблица 53



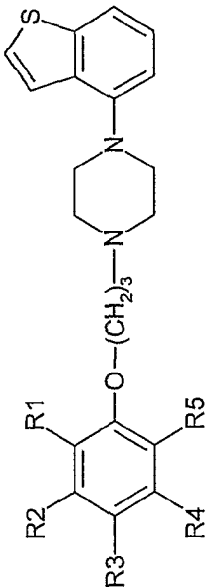
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
341	-H	-H	-H	-H		Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	130,5-131,5	-
342	-H	-H	-H	-H		Белый порошок (этилацетат)	227,5 (разл.)	Дигидрохлорид

Таблица 54



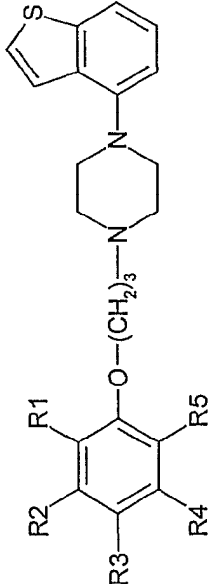
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
343	-H	-H	-NHCOCH ₃	-H	-H	Белый порошок (этанол)	283,0-285,0	Гидрохлорид
344	-H	-H	-NHCO ₂ CH ₃	-H	-H	Светло-желтый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	149,5-150,5	-
345	-H	-H	-NHCO ₂ C ₂ H ₅	-H	-H	Светло-желтый порошок (этанол/этилацетат)	174-176	Дигидрохлорид
346	-H	-H	-NHC ₂ H ₅	-H	-H	Белый порошок (этилацетат)	225 (разл.)	Гидрохлорид
347	-H	-H	-N(CH ₃)CO ₂ CH ₃	-H	-H	Белый порошок (этилацетат)	196,0-202,0	Гидрохлорид
348	-H	-H	-N(CH ₃)COCH ₃	-H	-H	Белый порошок (этанол)	246-247	Гидрохлорид
349	-H	-H	-NH ₂	-H	-H	Белый порошок (этанол, содержащий воду)	266-271 (разл.)	Гидрохлорид
350	-H	-H	-NHCH ₃	-H	-H	Белый порошок (этанол)	264-266	Дигидрохлорид
351	-H	-H	-N(CH ₃) ₂	-H	-H	Белый порошок (этанол)	269-270	Дигидрохлорид
352	-CH ₃	-H	-NH ₂	-H	-OCH ₃	Светло-желтое твердое вещество (этилацетат)	155,0-158,0	-
353	-OCH ₃	-H	-NHCON(CH ₃) ₂	-H	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат)	206,0-210,0	Гидрохлорид
354	-OCH ₃	-H	-NHCHO	-H	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат)	247,5-253,0 (разл.)	Гидрохлорид
355	-OCH ₃	-H	-NHCO ₂ CH ₃	-H	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат)	230,0-235,5	Гидрохлорид

Таблица 55



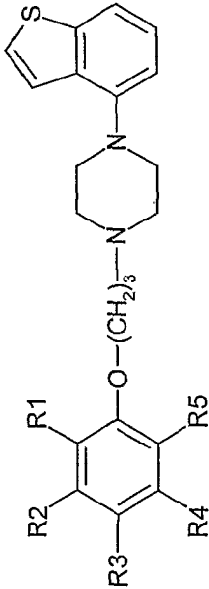
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
356	-H	-H		-H	-H	Белый порошок (этилацетат/2-пропанол)	154,5-156,5	-
357	-H	-H		-H	-H	Белый порошок (2-пропанол)	141,0-144,5	-
358	-OCH3	-H		-H	-CH3	Белый порошок (этанол)	247,5-251,0 (разл.)	Гидрохлорид
359	-CH2OH	-H		-H	-OCH3	Белый порошок (этанол)	144,0-145,0	Гидрохлорид

Таблица 56



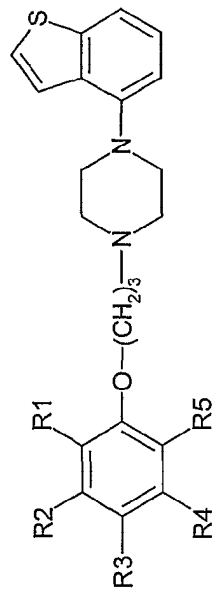
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	ЯМР	Соль
360	-H	-H	-NHCH(CH3)2	-H	-H	¹ H-ЯМР (ДМСО-d ₆) δ м.д.: 1,24 (6H, д, J=6,5 Гц), 2,2-2,4 (2H, м), 3,15-3,8 (12H, м), 4,15 (2H, т, J=6 Гц), 6,99 (1H, д, J=7,5 Гц), 7,11 (2H, д, J=9 Гц), 7,33 (1H, д, J=8,8 Гц), 7,4-7,55 (3H, м), 7,71 (1H, д, J=8 Гц), 7,78 (1H, д, J=5,5 Гц), 10,87 (3H, ушир.).	Тригидрохлорид
361	-OCH ₃	-H	-NHCO ₂ CH ₃	-H	-H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,00-2,15 (2H, м), 2,60-2,70 (2H, м), 2,73 (4H, ушир.с), 3,20 (4H, ушир.с), 3,77 (3H, с), 3,88 (3H, с), 4,10 (2H, т, J=6,6 Гц), 6,52 (1H, ушир.с), 6,74 (1H, д, J=2,5, 8,6 Гц), 6,87 (1H, д, J=8,6 Гц), 6,90 (1H, д, J=7,7 Гц), 7,19 (1H, ушир.с), 7,28 (1H, д, J=7,8, 7,8 Гц), 7,35-7,45 (2H, м), 7,55 (1H, д, J=7,8 Гц).	-
362	-H	-H	-NHCON(CH ₃) ₂	-H	-H	¹ H-ЯМР (ДМСО-d ₆) δ м.д.: 2,20-2,30 (2H, м), 2,91 (6H, с), 3,20-3,40 (6H, м), 3,55 (2H, д, J=12,4 Гц), 3,65 (2H, д, J=11,4 Гц), 4,05 (2H, т, J=6,0 Гц), 6,86 (2H, д, J=9,0 Гц), 6,98 (1H, д, J=7,6 Гц), 7,30-7,40 (3H, м), 7,50 (1H, д, J=5,5 Гц), 7,71 (1H, д, J=8,1 Гц), 7,78 (1H, д, J=5,5 Гц), 8,16 (1H, ушир.с), 11,05 (1H, ушир.с).	Дигидрохлорид
363	-F	-H	-NHCO ₂ CH ₃	-H	-H	¹ H-ЯМР (ДМСО-d ₆) δ м.д.: 2,24 (2H, ушир.с), 3,10-3,25 (2H, м), 3,30-3,50 (4H, м), 3,50-3,60 (2H, м), 3,66 (3H, с), 3,65-3,70 (2H, м), 4,13 (2H, т, J=5,9 Гц), 6,98 (1H, д, J=7,6 Гц), 7,10-7,20 (2H, м), 7,32 (1H, д, J=7,9, 7,9 Гц), 7,40 (1H, д, J=13,3 Гц), 7,50 (1H, д, J=5,5 Гц), 7,71 (1H, д, J=8,1 Гц), 7,77 (1H, д, J=5,5 Гц), 9,69 (1H, ушир.с), 10,56 (1H, ушир.с).	Гидрохлорид

Таблица 56-1



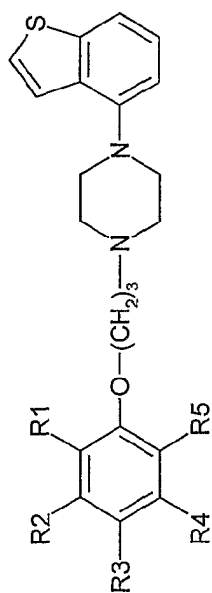
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	ЯМР	Соль
364	-H	-H	-NHCONH ₂	-H	-H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,95-2,10 (2H, м), 2,64 (2H, т, J=7,3 Гц), 2,70-2,75 (4H, м), 3,15-3,20 (4H, м), 4,03 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,83 (2H, ушпр,с), 6,83 (1H, ушпр,с), 6,85-6,95 (3H, м), 7,20 (2H, д, J=8,6 Гц), 7,25-7,30 (1H, м), 7,35-7,45 (2H, м), 7,55 (1H, д, J=8,1 Гц).	-
365	-H	-H	-NHCON(C ₂ H ₅) ₂	-H	-H	¹ H-ЯМР (DMCO-d ₆) δ м.д.: 1,06 (6H, т, J=7,0 Гц), 2,15-2,30 (2H, м), 3,20-3,45 (10H, м), 3,54 (2H, д, J=12 Гц), 3,64 (2H, д, J=12 Гц), 4,03 (2H, т, J=5,9 Гц), 6,84 (2H, д, J=8,9 Гц), 6,97 (1H, д, J=7,7 Гц), 7,25-7,40 (3H, м), 7,49 (1H, д, J=5,6 Гц), 7,70 (1H, д, J=8,1 Гц), 7,76 (1H, д, J=5,6 Гц), 8,01 (1H, с), 10,95 (1H, с).	Дигидрохлорид
366	-H	-H		-H	-H	¹ H-ЯМР (DMCO-d ₆) δ м.д.: 2,05-2,10 (2H, м), 2,67 (2H, т, J=7,3 Гц), 2,76 (4H, ушпр,с), 3,22 (4H, ушпр,с), 4,11 (2H, т, J=6,3 Гц), 6,91 (1H, д, J=7,6 Гц), 7,01 (2H, д, J=8,9 Гц), 7,20 (2H, д, J=9,6 Гц), 7,25-7,35 (3H, м), 7,35-7,45 (2H, м), 7,56 (1H, д, J=8,0 Гц), 7,77 (1H, с).	-
367	-H	-H		-H	-H	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,05-2,15 (2H, м), 2,67 (2H, т, J=7,2 Гц), 2,75 (4H, ушпр,с), 3,21 (4H, ушпр,с), 4,12 (2H, т, J=6,3 Гц), 6,91 (1H, д, J=7,6 Гц), 7,00-7,05 (2H, м), 7,25-7,30 (1H, м), 7,35-7,45 (2H, м), 7,50-7,60 (3H, м), 8,08 (1H, с), 8,45 (1H, с).	-

Таблица 57



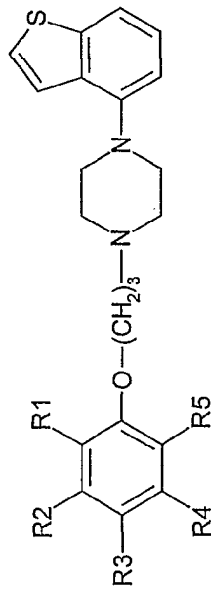
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	Кристаллическая форма (растворитель для перекристалли- зации)	Температура плав- ления (°C)	Соль
368	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	-H	-H	Белый порошок (этилацетат)	224,0-232,0 (разл.)	Дигидрохлорид
369	-H	-H	-H	-NHCO ₂ CH ₃	-H	Белый порошок (этилацетат)	178,0-181,0 (разл.)	Гидрохлорид
370	-H	-H	-CN	-H	-H	Светло-желтый порошок (этилацетат/ изопропиловый эфир)	105,5-107,0	-
371	-H	-H	-CO ₂ H	-H	-H	Белый порошок (хлористоводородная кисло- та/уксусная кислота)	263,0 (разл.)	Гидрохлорид
372	-H	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	-OCH ₃	Белый порошок (этилацетат)	242,0 (разл.)	Гидрохлорид
373	-H	-H	-Br	-H	-H	Белый порошок (этилацетат/ изопропиловый эфир)	119,0-120,0	-
374	-OCH ₃	-H	-CO ₂ H	-H	-H	Белый порошок (вода)	121,0-124,5	-
375	-Cl	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-H	Светло-желтый порошок (этанол/изопропиловый эфир)	122,0-123,5	-
376	-H	-H	-CH ₂ CO ₂ CH ₃	-H	-H	Белый порошок (этилацетат)	213,5-221,5 (разл.)	Гидрохлорид
377	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-F	Белый порошок (этилацетат)	231,5-233,5	Гидрохлорид

Таблица 58



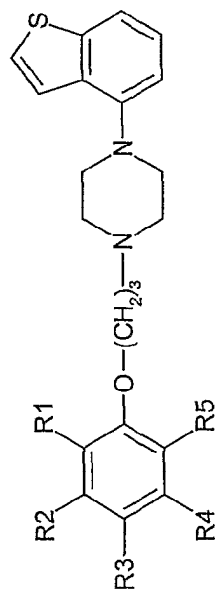
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
378	-H	-H	-CO ₂ H	-H	-Cl	Белый порошок (хлористоводородная кислота/уксусная кислота)	273,0 (разл.)	Гидрохлорид
379	-H	-H	-CH ₂ CO ₂ H	-H	-H	Белый порошок (хлористоводородная кислота/уксусная кислота)	217,0-222,0	Гидрохлорид
380	-H	-H	-CO ₂ H	-H	-F	Белый порошок (хлористоводородная кислота/уксусная кислота)	267,0 (разл.)	Гидрохлорид
381	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ NHCH ₃	-H	-H	Белый порошок (этилацетат)	258,0 (разл.)	Дигидрохлорид
382	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	-H	-H	Белый порошок (этилацетат)	236,5 (разл.)	Дигидрохлорид
383	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃)COCH ₃	-H	-H	Белый порошок (этилацетат)	215,0-217,0	Гидрохлорид
384	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃)COC ₂ H ₅	-H	-H	Белый порошок (этилацетат)	211,0-217,0	Гидрохлорид
385	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃)COC ₆ H ₅	-H	-H	Белый порошок (этилацетат)	210,5-212,0	Гидрохлорид
386	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃)CH ₂ C ₆ H ₅	-H	-H	Белый порошок (этилацетат)	196,0-202,0 (разл.)	Дигидрохлорид
387	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ NHC ₂ H ₅	-H	-H	Белый порошок (этилацетат/ изопропиловый эфир)	230,0 (разл.)	Дигидрохлорид

Таблица 59



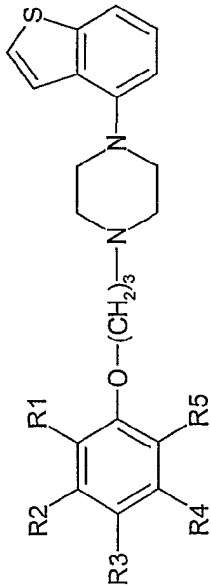
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
388	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	-H	-H	Белый порошок (этилацетат)	223,0 (разл.)	Дигидрохлорид
389	-H	-H	-CH ₂ CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-Cl	Белый порошок (этилацетат)	225,0-228,5	Гидрохлорид
390	-H	-H	-CH ₂ CO ₂ H	-H	-Cl	Белый порошок (хлористоводородная кислота/уксусная кислота)	208,0-209,5	Гидрохлорид
391	-H	-H	-CH ₂ CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-OCH ₃	Белый порошок (этилацетат)	205,5-213,5	Гидрохлорид
392	-CH ₃	-H	-CN	-H	-H	Светло-желтый порошок (Этилацетат/изопропиловый эфир)	105,5-106,0	-
393	-H	-H	-CH ₂ CO ₂ H	-H	-OCH ₃	Белый порошок (хлористоводородная кислота/уксусная кислота)	198,5-201,0	Гидрохлорид
394	-H	-H	-SO ₂ NH ₂	-H	-H	Белый порошок (этанол)	199,0-203,0	-
395	-H	-H	-CO ₂ H	-H	-CH ₃	Белый порошок (хлористоводородная кислота/уксусная кислота)	280,0 (разл.)	Гидрохлорид
396	-H	-H	-CH ₂ CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-F	Белый порошок (этилацетат)	220,5-224,0	Гидрохлорид
397	-H	-H	-CH ₂ CO ₂ H	-H	-F	Белый порошок (хлористоводородная кислота/уксусная кислота)	181,5-184,5	Гидрохлорид

Таблица 60



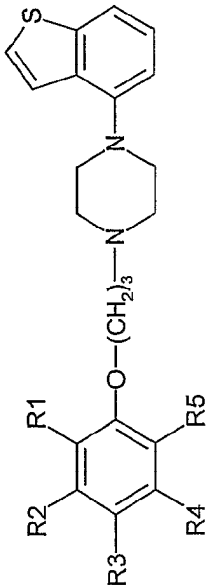
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
398	-H	-H	-CN	-OCH ₃	-H	Белый порошок (этилацетат)	238,0 (разл.)	Гидрохлорид
399	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-Br	Белый порошок (этилацетат)	237,5-242,5 (разл.)	Гидрохлорид
400	-H	-CN	-H	-H	-H	Белый порошок (этилацетат)	217,5-221,0 (разл.)	Гидрохлорид
401	-H	-H	-CO ₂ H	-H	-Br	Белый порошок (хлористоводородная кислота/уксусная кислота)	271,0 (разл.)	Гидрохлорид
402	-H	-H	-H	-CO ₂ H	-H	Белый порошок (хлористоводородная кислота/уксусная кислота)	242,5-244,5	Гидрохлорид
403	-H	-H	-H	-H	-CN	Белый порошок (этилацетат)	221,5-226,0	Гидрохлорид
404	-CN	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-H	Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	128,5-130,0	-
405	-H	-H	-CO ₂ H	-H	-CN	Белый порошок (дихлорметан/вода)	271,0 (разл.)	Гидрохлорид
406	-CONHC ₂ H ₅	-H	-H	-H	-H	Белый порошок (этилацетат)	220,0-227,5	Гидрохлорид
407	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-CF ₃	-H	Белый порошок (этилацетат)	224,5-232,0	Гидрохлорид

Таблица 61



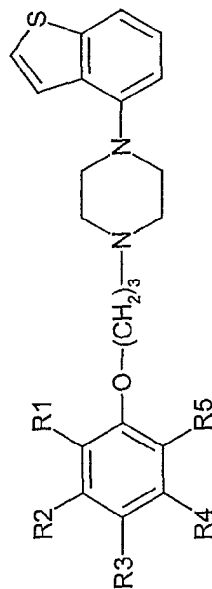
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
408	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-Cl	-H	Белый порошок (этилацетат)	216,5-219,0	Гидрохлорид
409	-H	-H	-CO ₂ H	-Cl	-H	Белый порошок (этилацетат)	259,0 (разл.)	Гидрохлорид
410	-H	-OCH ₃	-CHO	-H	-H	Белый порошок (этилацетат/2-пропанол)	118,0-119,5	-
411	-H	-H	-CO ₂ H	-CF ₃	-H	Белый порошок (вода)	240,0 (разл.)	Гидрохлорид
412	-H	-H	-CN	-CH ₃	-H	Белый порошок (этилацетат)	230,0-237,0	Гидрохлорид
413	-NO ₂	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-H	Светло-желтый порошок (этилацетат/ изопропиловый эфир)	113,0-114,0	-
414	-H	-H	-CHO	-H	-H	Белый порошок (этилацетат)	102,5-105,5	-
415	-H	-H	-CO ₂ H	-H	-NO ₂	Белый порошок (хлористоводородная кислота/уксусная кислота)	259,0 (разл.)	Дигидрохлорид
416	-H	-H	-CH=CHCO ₂ H	-H	-H	Белый порошок (хлористоводородная кислота/вода)	265,0 (разл.)	Гидрохлорид
417	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-CF ₃	Белый порошок (этилацетат)	211,5-221,0	Гидрохлорид

Таблица 62



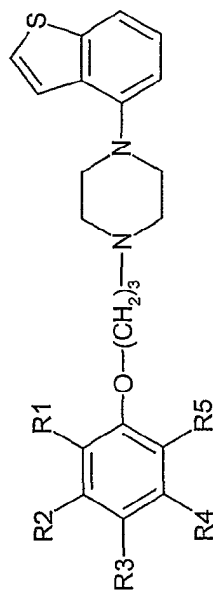
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
418	-H	-H	-CO ₂ H	-H	-CF ₃	Белый порошок (этилацетат)	269,0 (разл.)	Гидрохлорид
419	-H	-CH ₂ CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-H	-H	Белый порошок (этилацетат)	206,0-208,0	Гидрохлорид
420	-H	-H	-CH=CHCONH ₂	-H	-H	Белый порошок (этилацетат)	210,5-215,0	-
421	-H	-CH ₂ CO ₂ H	-H	-H	-H	Светло-желтый порошок (этилацетат)	255,0 (разл.)	Гидрохлорид
422	-H	-H	-CH=CHCONHCH ₃	-H	-H	Белый порошок (95%-2-пропанол)	165,5-169,0	-
423	-H	-H	-CH=CHCON(CH ₃) ₂	-H	-H	Белый порошок (95%-2-пропанол)	130,5-131,5	-
424	-H	-H	-CH=CHCONHC ₂ H ₅	-H	-H	Белый порошок (95%-2-пропанол)	158,0-159,0	-
425	-H	-H	-CH=CHCONHCH ₂ CF ₃	-H	-H	Белый порошок (95%-2-пропанол)	177,5-180,0	-
426	-H	-H	-(CH ₂) ₂ CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-H	Белый порошок (этилацетат)	235,0-237,5	Гидрохлорид
427	-F	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	Белый порошок (этилацетат)	218,5-224,0	Гидрохлорид

Таблица 63



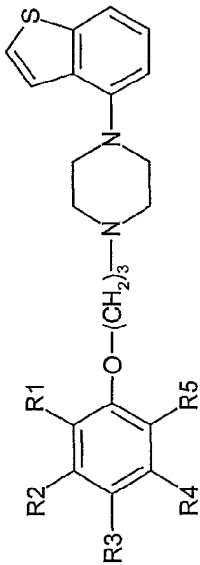
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	Кристаллическая форма (растворитель для перекристал- лизации)	Температура плавления (°C)	Соль
428	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ CO ₂ H	-H	-H	Белый порошок (хлористоводородная кисло- та/уксусная кислота)	240,0 (разл.)	Гидрохлорид
429	-F	-H	-H	-CO ₂ H	-H	Белый порошок (хлористоводородная кисло- та/уксусная кислота)	260,0 (разл.)	Гидрохлорид
430	-Cl	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	Белый порошок (этилацетат)	241,0-245,0	Гидрохлорид
431	-Cl	-H	-H	-CO ₂ H	-H	Белый порошок (хлористоводородная кисло- та/уксусная кислота)	268,0 (разл.)	Гидрохлорид
432	-CH ₃	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	Белый порошок (этилацетат)	238,0-242,0 (разл.)	Гидрохлорид
433	-CH ₃	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-CH ₃	Белый порошок (изопропиловый эфир)	106,0-108,0	-
434	-CH ₃	-H	-H	-CO ₂ H	-H	Белый порошок (хлористоводородная кисло- та/уксусная кислота)	256,5 (разл.)	Гидрохлорид
435	-CH ₃	-H	-CO ₂ H	-H	-CH ₃	Белый порошок (вода)	252,5 (разл.)	Гидрохлорид
436	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	Белый порошок (этилацетат)	225,0-234,0	Гидрохлорид
437	-H	-H	-C(CH ₃) ₂ CO ₂ CH ₃	-H	-H	Белый порошок (этилацетат)	222,0-226,5	Гидрохлорид

Таблица 64



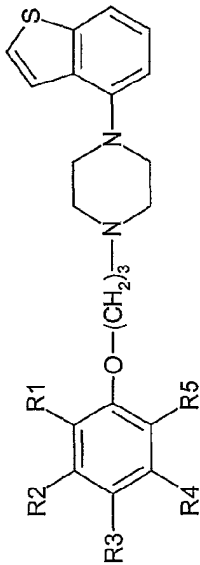
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
438	-OCH ₃	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	Белый порошок (этилацетат)	208,0-213,5	Гидрохлорид
439	-H	-H	-C(CH ₃) ₂ CO ₂ H	-H	-H	Белый порошок (хлористоводородная кислота/уксусная кислота)	257,5 (разл.)	Гидрохлорид
440	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ CONH ₂	-H	-H	Светло-желтый порошок (95%-2-пропанол)	167,5-170,0	-
441	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ CONHCH ₃	-H	-H	Белый порошок (95%-2-пропанол)	128,0-132,0	-
442	-OCH ₃	-H	-H	-CO ₂ H	-H	Белый порошок (хлористоводородная кислота/вода)	250,0 (разл.)	Гидрохлорид
443	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ CONHC ₂ H ₅	-H	-H	Белый порошок (95%-2-пропанол)	130,5-132,0	Гидрохлорид
444	-H	-CH ₂ CONH ₂	-H	-H	-H	Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	132,5-134,0	Гидрохлорид
445	-H	-H	-H	-CH ₂ CONHCH ₃	-H	Белый порошок (этилацетат)	173,5-175,0	Гидрохлорид
446	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-CO ₂ H	-H	Белый порошок (вода)	154,0-155,5	Гидрохлорид
447	-OCH ₃	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-OCH ₃	Белый порошок (этилацетат)	239,0-242,0 (разл.)	Гидрохлорид

Таблица 65



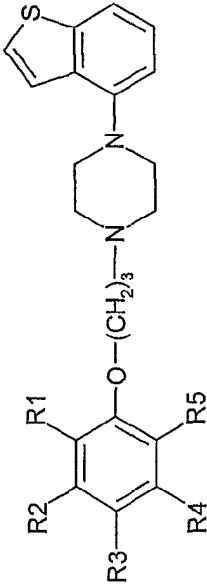
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
448	-OCH ₃	-H	-CO ₂ H	-H	-OCH ₃	Белый порошок (вода)	191,0-196,0	-
449	-H	-H	-CSNHC ₂ H ₅	-H	-H	Светло-желтый порошок (этилацетат/ТГФ)	193,0-196,5	Дигидрохлорид
450	-OCH ₃	-H	-COCH ₃	-H	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат)	243,0 (разл.)	Гидрохлорид
451	-CH ₂ CH=CH ₂	-H	-CO ₂ H	-H	-OCH ₃	Белый порошок (вода)	97,0-102,0	-
452	-C ₃ H ₇	-H	-CO ₂ H	-H	-OCH ₃	Белый порошок (вода)	145,5-150,5	-

Таблица 66

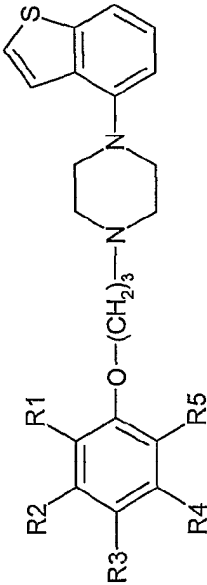


Пример	R1	R2	R3	R4	R5	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
453	-H	-H		-H	-H	Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	112,5-113,5	-
454	-H	-H		-H	-H	Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	112,0-113,0	-

Таблица 67

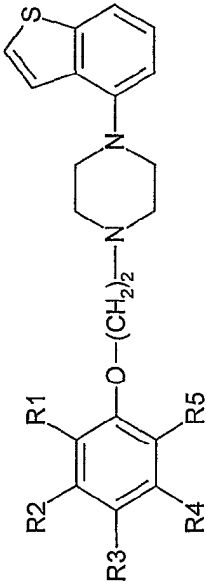


Пример	R1	R2	R3	R4	R5	ЯМР	Соль
455	-H	-H	-F	-H	-H		Гидрохлорид
456	-H	-H	-H	-H	-H	¹ H-ЯМР (DMSO-d ₆) δ м.д.: 2,15-2,30 (2H, м), 3,10-3,25 (2H, м), 3,25-3,60 (4H, м), 3,55-3,75 (4H, м), 4,10 (2H, т, J=6,0 Гц), 6,90-7,10 (4H, м), 7,25-7,40 (3H, м), 7,51 (1H, д, J=5,6 Гц), 7,72 (1H, д, J=8,3 Гц), 7,78 (1H, д, J=5,5 Гц), 10,12 (1H, ушир с).	Гидрохлорид



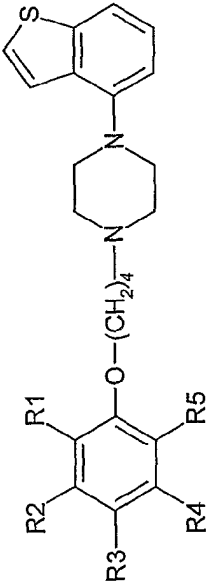
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
457	-H	-H	-H	-H	-NHCOCH ₃	Бесцветные игольчатые кристаллы (этанол)	243,7-244,8	-

Таблица 68



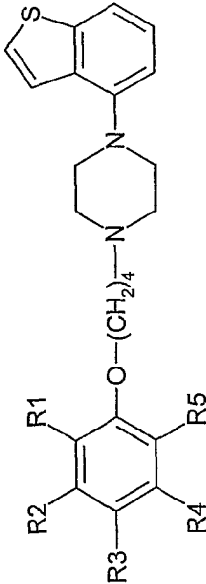
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	ЯМР	Соль
463	-H	-H	-F	-H	-H	¹ H-ЯМР (ДМСО-d ₆) δ м.д.: 3,10-3,25 (2H, м), 3,40-3,75 (8H, м), 4,40-4,45 (2H, м), 6,98 (1H, д, J=7,7 Гц), 7,00-7,25 (4H, м), 7,33 (1H, дд, J=7,9, 7,8 Гц), 7,50 (1H, д, J=5,6 Гц), 7,71 (1H, д, J=8,0 Гц), 7,78 (1H, д, J=5,5 Гц), 10,37 (1H, ушир.с).	Гидрохлорид
464	-H	-H	-H	-H	-H	¹ H-ЯМР (ДМСО-d ₆) δ м.д.: 3,10-3,35 (2H, м), 3,40-3,80 (8H, м), 4,48 (2H, т, J=4,8 Гц), 6,95-7,10 (4H, м), 7,25-7,40 (3H, м), 7,51 (1H, д, J=5,5 Гц), 7,71 (1H, д, J=8,1 Гц), 7,77 (1H, д, J=5,5 Гц), 10,80-11,20 (1H, ушир.).	Гидрохлорид

Таблица 69



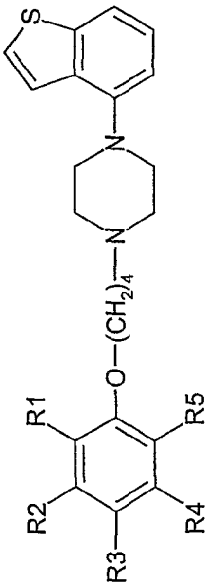
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	ЯМР	Соль
465	-H	-H	-H	-H	-H	¹ H-ЯМР (ДМСО-d ₆) δ м.д.: 1,70-2,00 (4H, м), 3,10-3,40 (6H, м), 3,50-3,80 (4H, м), 4,03 (2H, т, J=5,9 Гц), 6,90-7,00 (5H, м), 7,25-7,40 (3H, м), 7,50 (1H, д, J=5,6 Гц), 7,71 (1H, д, J=8,0 Гц), 7,77 (1H, д, J=5,5 Гц), 10,59 (1H, ушпр.с).	Гидрохлорид
466	-H	-H	-F	-H	-H	¹ H-ЯМР (ДМСО-d ₆) δ м.д.: 1,75-1,95 (4H, м), 3,10-3,50 (6H, м), 3,50-3,65 (4H, м), 4,00 (2H, т, J=5,9 Гц), 6,90-7,00 (3H, м), 7,00-7,20 (2H, м), 7,32 (1H, дд, J=7,9, 7,8 Гц), 7,50 (1H, д, J=5,5 Гц), 7,71 (1H, д, J=8,0 Гц), 7,77 (1H, д, J=5,5 Гц), 10,40-10,60 (1H, ушпр.).	Гидрохлорид
467	-H	-H	-COCH ₃	-H	-OCH ₃	¹ H-ЯМР (ДМСО-d ₆) δ м.д.: 1,80-1,95 (4H, м), 2,52 (3H, с), 3,20-3,35 (6H, м), 3,50-3,65 (4H, м), 3,83 (3H, с), 4,00-4,15 (2H, м), 6,95 (1H, д, J=7,5 Гц), 7,08 (1H, д, J=8,5 Гц), 7,30 (1H, дд, J=7,8, 7,8 Гц), 7,40-7,50 (2H, м), 7,61 (1H, дд, J=1,9, 8,4 Гц), 7,69 (1H, д, J=8,1 Гц), 7,75 (1H, д, J=5,6 Гц), 11,0 (1H, ушпр.с).	Гидрохлорид

Таблица 69-1



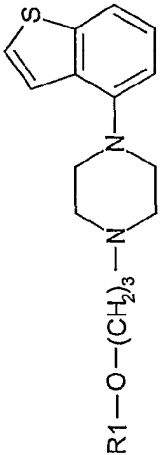
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
468	-H	-H	-NHCO ₂ CH ₃	-H	-H	Белый порошок (этилацетат)	241,0 (разл.)	Гидрохлорид
469	-H	-H	-H	-NHCO ₂ CH ₃	-H	Белый порошок (этилацетат)	203,0-209,5	Гидрохлорид
470	-H	-H	-CN	-H	-H	Белый порошок (этилацетат)	220,0-223,0 (разл.)	Гидрохлорид
471	-H	-H	-CO ₂ H	-H	-H	Белый порошок (хлористоводородная кислота/уксусная кислота)	247,5-250,0 (разл.)	Гидрохлорид
472	-H	-CN	-H	-H	-H	Белый порошок (этилацетат)	196,0-198,5	Гидрохлорид
473	-H	-H	-H	-CO ₂ H	-H	Белый порошок (этилацетат)	255,5-258,5	Гидрохлорид
474	-CN	-H	-H	-H	-H	Белый порошок (этилацетат)	187,5-188,5	Гидрохлорид
475	-H	-H	-H	-CONHCH ₂ CF ₃	-H	Белый порошок (этилацетат/2-пропанол)	137,0 (разл.)	Гидрохлорид
476	-H	-H	-H	-CONHC ₂ H ₅	-H	Светло-желтый порошок (этилацетат/2-пропанол)	130,0-135,0	Гидрохлорид
477	-H	-H	-H	-H	-CO ₂ H	Белый порошок (дихлорметан/вода)	192,0-197,0	Гидрохлорид
478	-H	-CONH ₂	-H	-H	-H	Светло-желтый порошок (2-пропанол)	148,0-151,0	-

Таблица 69-2



Пример	R1	R2	R3	R4	R5	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
479	-H	-H	-H	-CONHCH ₃	-H	Светло-желтый порошок (этилацетат)	234,0-239,0	Гидрохлорид
480	-H	-H	-H	-CON(CH ₃) ₂	-H	Светло-желтый порошок (этилацетат)	135,0-141,5	Гидрохлорид
481	-H	-H	-H	-H	-CONHC ₂ H ₅	Белый порошок (этилацетат)	209,5-213,0	Гидрохлорид

Таблица 70



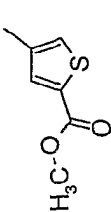
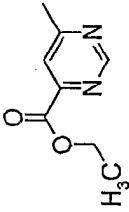
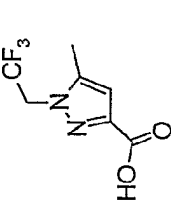
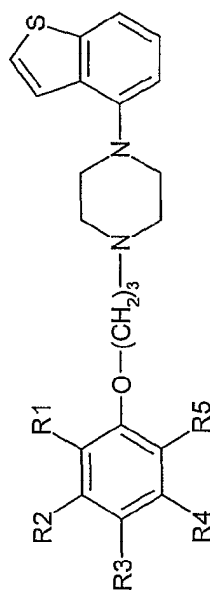
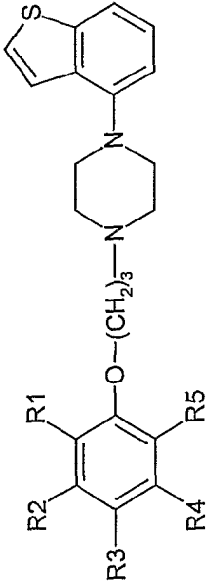
Пример	R1	ЯМР	Соль
482		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,00-2,10 (2H, м), 2,63 (2H, т, J=7,3 Гц), 2,70-2,80 (4H, м), 3,15-3,25 (4H, м), 3,89 (3H, с), 4,00-4,10 (2H, м), 6,57 (1H, д, J=1,9 Гц), 6,91 (1H, д, J=7,6 Гц), 7,20-7,35 (2H, м), 7,35-7,50 (3H, м), 7,56 (1H, д, J=8,0 Гц).	-
483		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,44 (3H, т, 7,0 Гц), 2,01-2,12 (2H, м), 2,63 (2H, т, J=7,5 Гц), 2,67-2,81 (4H, м), 3,12-3,29 (4H, м), 4,44-4,55 (4H, м), 6,90 (1H, д, J=7,5 Гц), 7,27 (1H, дд, J=5,5 Гц, 7,5 Гц), 7,40 (2H, дд, J=5,5 Гц, 8,0 Гц), 7,44 (1H, д, J=1,0 Гц), 7,55 (1H, д, J=8,0 Гц), 8,90 (1H, д, J=1,0 Гц).	-
484		¹ H-ЯМР (ДМСО-d ₆) δ м.д.: 1,83-2,00 (2H, м), 2,59-2,70 (4H, м), 3,00-3,15 (4H, м), 3,17 (1H, д, J=4,5 Гц), 3,31 (1H, д, J=4,5 Гц), 4,15 (2H, т, J=6,0 Гц), 4,77 (2H, кв, J=8,8 Гц), 6,90 (1H, д, J=7,3 Гц), 7,27 (1H, т, J=7,8 Гц), 7,40 (1H, д, J=5,5 Гц), 7,61 (1H, д, J=8,0 Гц), 7,69 (1H, д, J=5,5 Гц).	-

Таблица 71



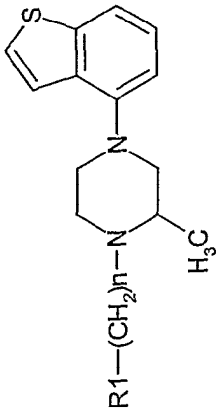
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	ЯМР	Соль
485	-H	-H	$-(CH_2)_2N(CH_3)CO_2C(CH_3)_3$	-H	-H	^1H -ЯМР ($CDCl_3$) δ м.д.: 1,43 (9H, c), 1,97-2,07 (2H, м), 2,64 (2H, т, J=7,5 Гц), 2,69-2,87 (6H, м), 2,81 (3H, c), 3,15-3,27 (4H, м), 3,38 (2H, т, J=7,5 Гц), 4,04 (2H, т, J=6,3 Гц), 6,83-6,92 (3H, м), 7,02-7,15 (2H, м), 7,28 (1H, т, J=7,8 Гц), 7,37-7,43 (2H, м), 7,55 (1H, д, J=8,0 Гц).	-
486	-H	-H		-H	-H	^1H -ЯМР ($CDCl_3$) δ м.д.: 1,60-2,10 (6H, м), 2,30-2,40 (2H, м), 2,47 (3H, c), 2,60-2,70 (1H, м), 2,74 (4H, ушпир.), 2,85-3,00 (2H, м), 3,20 (4H, ушпир.), 3,90-4,10 (4H, м), 6,85-6,95 (2H, м), 7,07 (1H, д, J=8,6 Гц), 7,25-7,45 (3H, м), 7,56 (1H, д, J=8,0 Гц), 7,69 (2H, д, J=8,2 Гц).	-
487	-H	-H		-H	$-CO_2H$	^1H -ЯМР ($DMCO-d_6$) δ м.д.: 2,20-2,43 (2H, м), 3,17-3,77 (10H, м), 4,30 (2H, т, J=6,0 Гц), 6,90-7,20 (2H, м), 7,30-7,40 (2H, м), 7,50-7,63 (1H, м), 7,70-7,79 (4H, м), 11,00 (1H, ушпир.), 12,71 (1H, ушпир.).	-
488	$-OCH_3$	-H	$-CO_2CH_3$	-H	$-CH_3$	^1H -ЯМР ($CDCl_3$) δ м.д.: 1,95-2,10 (2H, м), 2,31 (3H, c), 2,60-2,80 (6H, м), 3,10-3,30 (4H, м), 3,89 (6H, c), 4,10 (2H, т, J=6,4 Гц), 6,90 (1H, д, J=0,5, 7,6 Гц), 7,27 (1H, д, J=7,8, 7,8 Гц), 7,35-7,45 (3H, м), 7,50-7,60 (2H, м).	-
489	$-OCH_3$	-H	$-CO_2H$	-H	$-CH_3$	^1H -ЯМР ($DMCO-d_6$) δ м.д.: 1,90-2,05 (2H, м), 2,26 (3H, c), 2,55-3,30 (10H, м), 3,85 (3H, c), 4,03 (2H, т, J=6,1 Гц), 6,93 (1H, д, J=7,6 Гц), 7,29 (1H, д, J=7,8, 7,8 Гц), 7,35-7,50 (3H, м), 7,65 (1H, д, J=8,0 Гц), 7,72 (1H, д, J=5,5 Гц), 11,50-13,50 (1H, ушпир.).	-

Таблица 71-1



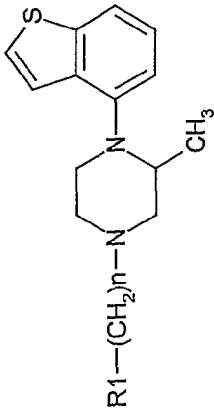
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	ЯМР	Соль
490	-CH ₂ CH=CH ₂	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	-OCH ₃	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,98-2,09 (2H, м), 2,70-2,83 (6H, м), 3,13-3,30 (4H, м), 3,45 (2H, д, J=6,5 Гц), 3,89 (3H, с), 4,10 (2H, т, J=6,4 Гц), 5,04-5,11 (2H, м), 5,91-6,09 (1H, м), 6,90 (1H, д, J=7,5 Гц), 7,24-7,31 (1H, м), 7,38-7,44 (2H, м), 7,47-7,57 (3H, м).	-
491	-C ₃ H ₇	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	-OCH ₃	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 0,97 (3H, т, J=7,3 Гц), 1,52-1,74 (2H, м), 1,93-2,13 (2H, м), 2,57-2,85 (6H, м), 3,07-3,30 (4H, м), 3,89 (6H, с), 4,09 (2H, т, J=6,3 Гц), 6,90 (1H, д, J=7,5 Гц), 7,24-7,31 (1H, м), 7,38-7,45 (3H, м), 7,52-7,57 (2H, м).	-

Таблица 72



Пример	R1	n	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
492		3	Белый порошок (этилацетат)	129,0-138,5	Гидрохлорид
493		3	Белый порошок (этилацетат)	130,0-136,0	Гидрохлорид
494		3	Белый порошок		Фумарат
495		4	Белый порошок (ацетонитрил)	154-156	Дигидрохлорид

Таблица 73



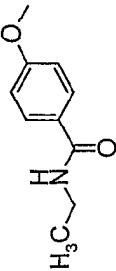
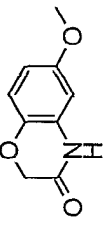
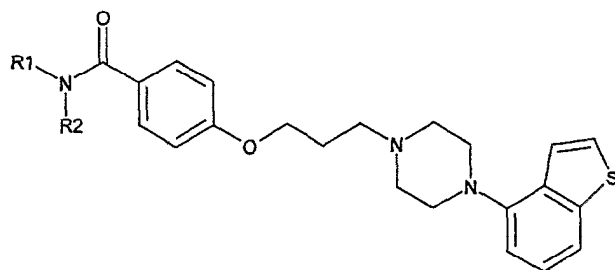
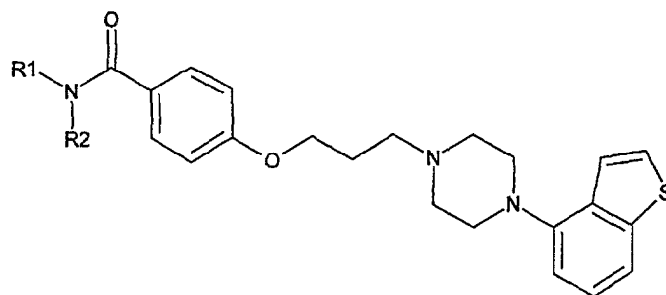
Пример	R1	n	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
496		3	Белый порошок (этилацетат)	151,5-156,5	Гидрохлорид
497		4	Белый порошок (этанол/этилацетат)	220-225	Дигидрохлорид

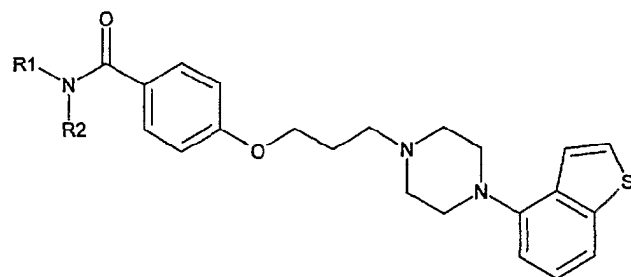
Таблица 74



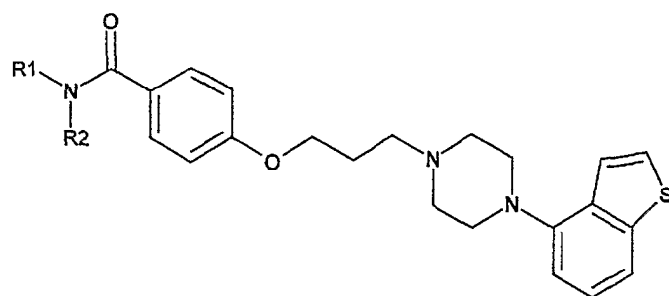
Пример	R1	R2	МС (M+1)
498	-H	-цикло -C ₆ H ₁₁	478
499	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	508
500	-CH ₂ CH ₂ OH	-CH ₂ CH ₂ OH	484
501	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	481
502	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	512
503	-C ₃ H ₇	-CH ₂ -цикло -C ₃ H ₅	492
504	-CH ₂ CH=CH ₂	-цикло -C ₅ H ₉	504
505	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	452
506	-H	-C ₄ H ₉	452
507	-H	-C(CH ₃) ₃	452
508	-H	-цикло -C ₇ H ₁₃	492
509	-C ₂ H ₅	-цикло -C ₆ H ₁₁	506
510	-C ₂ H ₅	-CH(CH ₃) ₂	466
511	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	452
512	-H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	454
513	-H	-CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	468
514	-H	-(CH ₂) ₃ OC ₂ H ₅	482
515	-H	-1-CH ₃ -циклогексил	492
516	-H	-CH ₂ -цикло -C ₃ H ₅	450
517	-H	-CH ₂ -цикло -C ₆ H ₁₁	492
518	-H	-CH ₂ CO ₂ CH ₃	468
519	-H	-CH ₂ CONH ₂	453
520	-CH ₃	-CH ₂ CO ₂ CH ₃	482
521	-H	-CH ₂ CCH	434
522	-CH ₃	-CH(CH ₃) ₂	452
523	-H	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃) ₂	466
524	-H	-CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃	480
525	-H	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	467
526	-CH ₃	-CH ₂ -цикло -C ₃ H ₅	464
527	-H	-CH ₂ CF ₃	478
528	-CH ₃	-цикло -C ₆ H ₁₁	492
529	-C ₂ H ₅	-CH ₂ CH ₂ OH	468
530	-CH ₂ CH ₂ OH	-цикло -C ₆ H ₁₁	522
531	-H	-цикло -C ₅ H ₉	464
532	-H	-3-пиридил	473
533	-H	-4-пиридил	473
534	-CH ₂ CH ₂ OH	-C ₆ H ₅	516



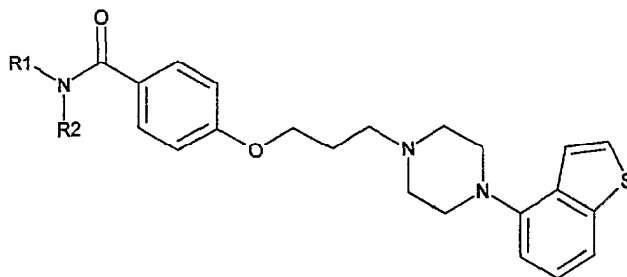
Пример	R1	R2	МС (M+1)
535	-H	-C ₆ H ₅	435
536	-H	-CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃	468
537	-H	-CH(C ₂ H ₅) ₂	449
538	-H	-CH ₂ CN	566
539	-H	-(CH ₂) ₃ OCH ₃	523
540	-H	-CH ₂ CH ₂ CN	523
541	-(CH ₂) ₃ N(CH ₃) ₂	-(CH ₂) ₃ N(CH ₃) ₂	481
542	-CH ₃	-(CH ₂) ₃ N(C ₂ H ₅) ₂	482
543	-C ₂ H ₅	-(CH ₂) ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	523
544	-H	-(CH ₂) ₂ NHCOCH ₃	481
545	-H	-(CH ₂) ₅ OH	495
546	-H	-(CH ₂) ₂ N(I-Pr) ₂	524
547	-H	-(CH ₂) ₃ N(CH ₃) ₂	524
548	-H	-(CH ₂) ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	563
549	-CH ₃	-(CH ₂) ₃ CO ₂ C ₂ H ₅	509
550	-H	-(CH ₂) ₄ CO ₂ C ₂ H ₅	493
551	- цикло-C ₅ H ₉	-(CH ₂) ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	528
552	-CH ₃	-(CH ₂) ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	484
553	-H	-NHCH ₂ CF ₃	496
554	-H	-CH ₂ CF ₂ CF ₃	482
555	-H	-CH ₂ CH(OCH ₃) ₂	442
556	-H	-(CH ₂) ₃ OCH(CH ₃) ₂	467
557	-H	-(CH ₂) ₂ OCH(CH ₃) ₂	470
558	-H	-CH ₂ CH ₂ F	435
559	-H	-CH ₂ CONHCH ₃	468
560	-H	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	449



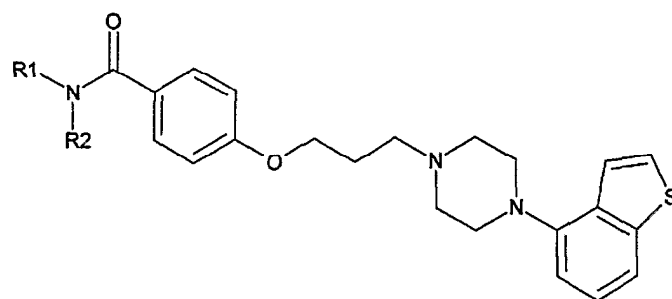
Пример	R1	R2	МС (М+1)
561	-H		510
562	-H		524
563	-H		495
564	-H		496
565	-H		482
566	-H		467
567	-H		466
568	-H		480
569	-H		568
570	-H		554



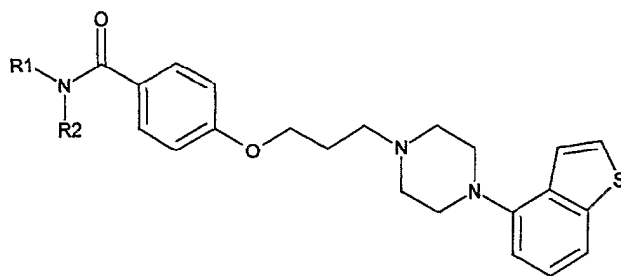
Пример	R1	R2	МС (М+1)
571	-H		496
572	-H		482
573	-H		468
574	-H		470
575	-H		450
576	-H		509
577	-H		481
578	-H		450
579	-H		478



Пример	R1	R2	МС (М+1)
580	-H		494
581	-H		492
582	-H		536
583	-CH ₃		516
584	-CH ₃		520
585	-H		551
586	-H		506
587	-H		502
588	-H		502
589	-H		502

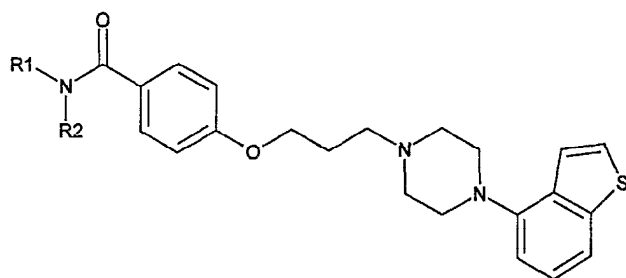


Пример	R1	R2	МС (М+1)
590	-H		506
591	-H		506
592	-H		540
593	-H		554
594	-H		554
595	-H		487
596	-H		533
597	-CH ₃		515
598	-H		487

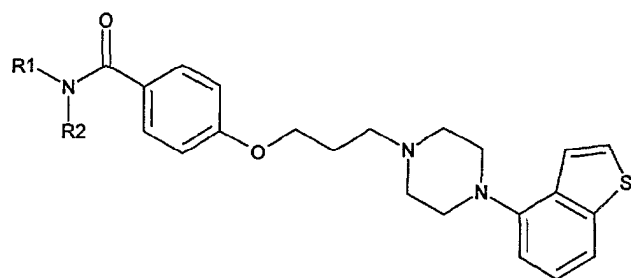


Пример	R1	R2	МС (M+1)
599	-H		487
600	-H		487
601	-C ₂ H ₅		529
602	-C ₂ H ₅		515
603	-H		501
604	-H		501
605	-H		501
606	-CH ₃		507
607	-CH ₃		535
608	-H		535

Таблица 81

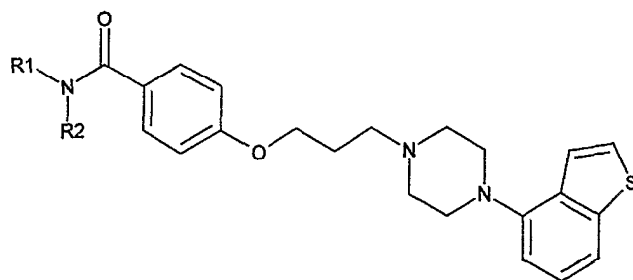


Пример	R1	R2	МС(М+1)
609	-H		551
610	-H		579
611	-H		479
612	-H		493
613	-H		507
614	-H		565
615	-H		465
616	-H		479
617	-H		493
618	-H		507



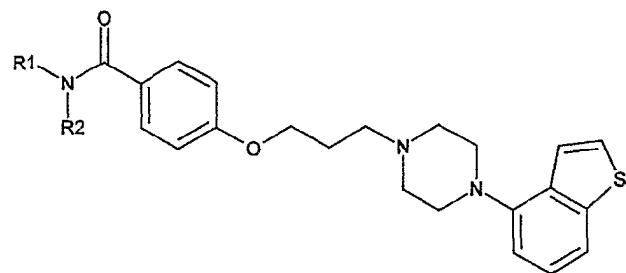
Пример	R1	R2	МС (М+1)
619	-H		507
620	-H		521
621	-H		507
622	-H		536
623	-H		507
624	-H		509
625	-H		523
626	-H		476
627	-H		490
628	-H		504

Таблица 83



Пример	R1	R2	МС (M+1)
629	-H		476
630	-H		480
631	-H		480
632	-C ₂ H ₅		522
633	-H		494
634	-H		482
635	-H		496
636	-H		492
637	-H		506
638	-H		492

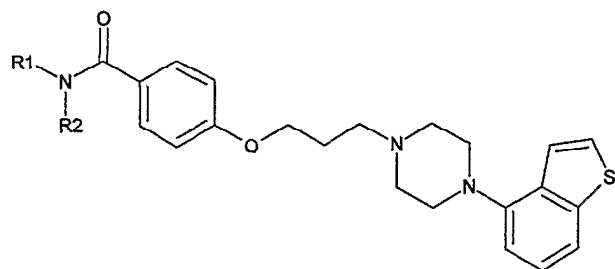
Таблица 84



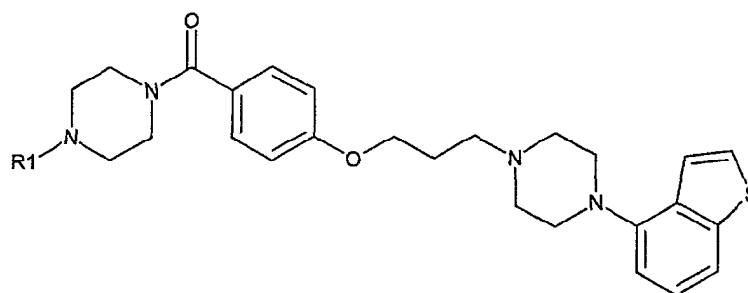
Пример	R1	R2	МС (М+1)
639	-H		506
640	-H		489
641	-H		503
642	-H		489
643	-H		490
644	-H		538
645	-H		528
646	-H		518
647	-H		518
648	-H		504

Таблица 85

Пример	R1	R2	МС (M+1)
649	-H		520
650	-H		504
651	-H		533
652	-H		490
653	-H		479
654	-H		494
655	-H		491
656	-H		502
657	-H		526
658	-H		533

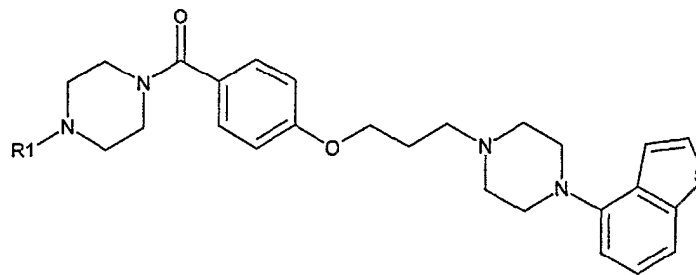


Пример	R1	R2	МС (M+1)
659	-H		512
660	-H		511
661	-H		539
662	-H		528
663	-H		523
664	-H		523
665	-H		555
666	-H		571
667	-H		555
668	-H		570



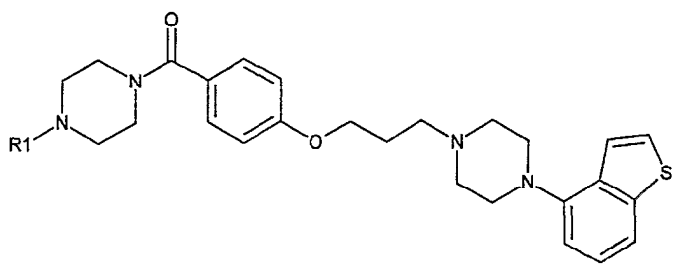
Пример	R1	МС (M+1)
669	-H	465
670	-C ₄ H ₉	521
671	-CH(C ₂ H ₅) ₂	535
672	-CH(CH ₃) ₂	507
673	-C(CH ₃) ₃	535
674	-C ₃ H ₇	507
675	-C ₂ H ₅	493
676	-C ₆ H ₁₃	549
677	-cyclo-C ₅ H ₉	533
678	-cyclo-C ₇ H ₁₃	561
679	-CH ₂ CH ₂ OH	509
680	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	523
681	-(CH ₂) ₃ OCH ₃	537
682	-(CH ₂) ₄ OCH ₃	551
683	-CO ₂ C ₂ H ₅	537
684	-CO ₂ C(CH ₃) ₃	565
685	-COCH ₃	507
686	-(CH ₂) ₃ N(CH ₃) ₂	550
687	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	536

Таблица 88

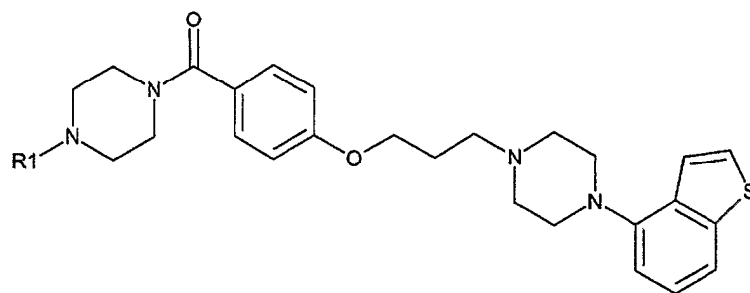


Пример	R1	МС (M+1)
688		576
689		578
690		562
691		551
692		565
693		549
694		576
695		576
696		576
697		556
698		556

Таблица 89

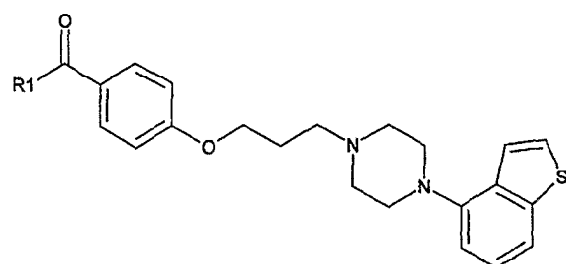


Пример	R1	МС (M+1)
699		556
700		570
701		570
702		632
703		559
704		545
705		561
706	-4- пиридил	542
707	-3-пиридил	542
708	-2-пиридил	542
709		567
710		556
711		556

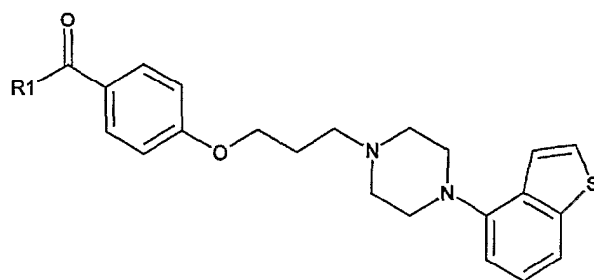


Пример	R1	МС (M+1)
712		610
713		598

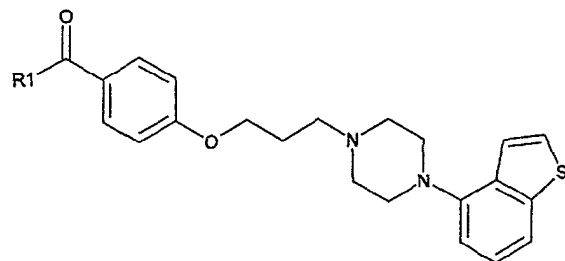
Таблица 91



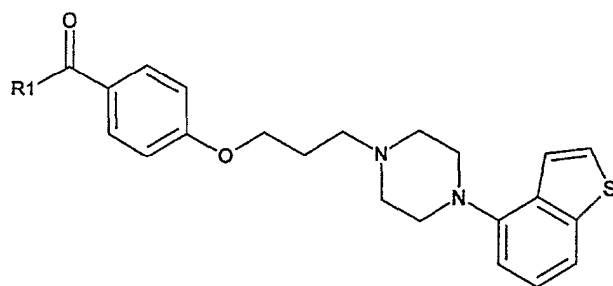
Пример	R1	МС (M+1)
714		450
715		480
716		493
717		466
718		507
719		549
720		507
721		533
722		547
723		562
724		535



Пример	R1	МС (M+1)
725		464
726		492
727		480
728		480
729		494
730		494
731		549
732		507
733		494
734		564

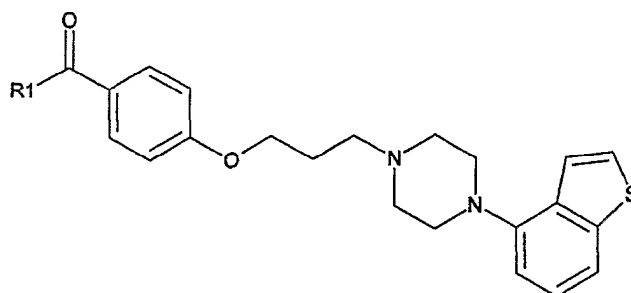


Пример	R1	МС (М+1)
735		536
736		536
737		536
738		521
739		579
740		547
741		576
742		562
743		549
744		576
745		522



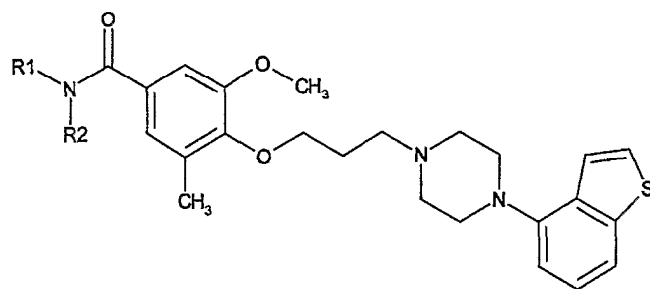
Пример	R1	МС (M+1)
746		478
747		482
748		494
749		563
750		479
751		493
752		556
753		476
754		468
755		504

Таблица 95



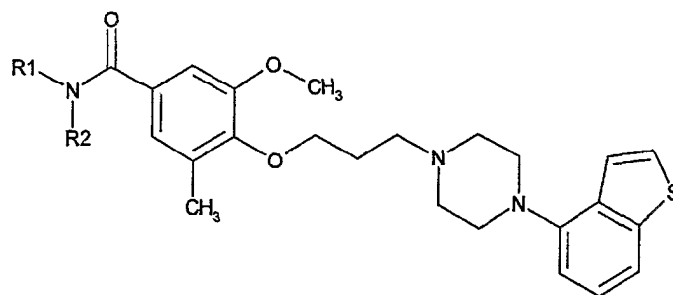
Пример	R1	МС (M+1)
756		600
757		498
758		512
759		551

Таблица 96

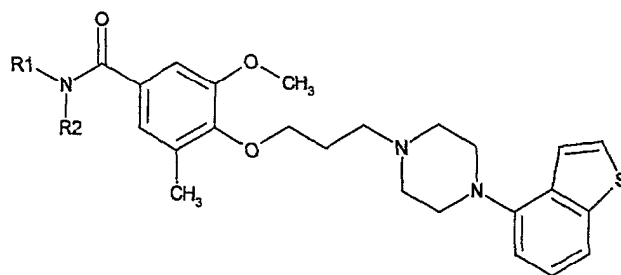


Пример	R1	R2	МС (M+1)
760	-H	-цикло-C ₆ H ₁₁	522
761	-H	-CH(CH ₃) ₂	482
762	-H	-C ₄ H ₉	496
763	-H	-цикло-C ₃ H ₅	480
764	-H	-цикло-C ₇ H ₁₃	536
765	-H	-CH ₂ C ₆ H ₅	530
766	-H	-C ₃ H ₇	482
767	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	496
768	-H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	498
769	-H	-CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	512
770	-H	-(CH ₂) ₃ OC ₂ H ₅	526
771	-H	-1-CH ₃ -циклогексил	536
772	-H	-(CH ₂) ₂ OC ₆ H ₅	560
773	-H	-цикло-C ₅ H ₉	508
774	-H	-CH ₂ -цикло-C ₃ H ₅	494
775	-H	-CH ₂ -цикло-C ₆ H ₁₁	536
776	-H	-CH(CH ₃)C ₆ H ₅	544
777	-H	-(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	544
778	-H	-CH ₂ CO ₂ CH ₃	512
779	-H	-CH ₂ CONH ₂	497
780	-H	-CH ₂ CCH	478
781	-H	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃) ₂	510
782	-H	-CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃	524
783	-H	-CH ₂ C(CH ₃) ₃	510
784	-CH ₃	-цикло-C ₆ H ₁₁	536
785	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	496
786	-H	-C(CH ₃) ₃	496
787	-CH ₃	-CH ₂ C ₆ H ₅	544
788	-C ₂ H ₅	-CH(CH ₃) ₂	510
789	-CH ₃	-CH ₂ CO ₂ CH ₃	526
790	-CH ₃	-CH(CH ₃) ₂	496
791	-CH ₃	-CH ₂ -цикло-C ₃ H ₅	508
792	-H	-CH ₂ CF ₃	522
793	-H	-CH(C ₂ H ₅) ₂	510

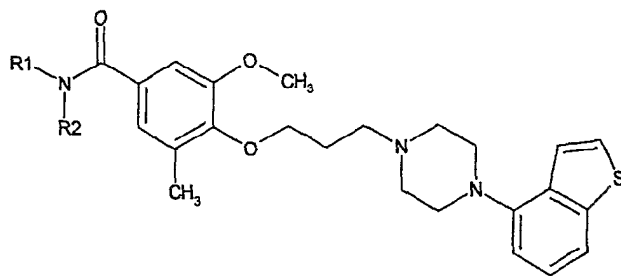
Таблица 97



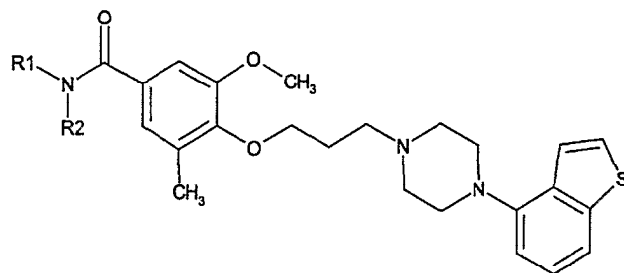
Пример	R1	R2	МС (M+1)
794	-H	-(CH ₂) ₃ OCH ₃	512
795	-H	-CH ₂ CH ₂ OH	484
796	-H	-CH ₂ CN	479
797	-C ₂ H ₅	-2-пиридил	545
798	-H	-3- пиридил	517
799	-H	-C ₆ H ₅	516
800	-H	-(CH ₂) ₂ NHCOCH ₃	525
801	-H	-CH ₂ CH(C ₂ H ₅) ₂	524
802	-H	-CH ₂ CH(OCH ₃) ₂	528
803	-H	-(CH ₂) ₃ OCH(CH ₃) ₂	540
804	-H	-(CH ₂) ₂ OCH(CH ₃) ₂	526
805	-H	-CH ₂ CH ₂ F	486
806	-H	-CH ₂ CONHCH ₃	511
807	-H	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	514
808	-H	-CH ₂ CHF ₂	504



Пример	R1	R2	MC (M+1)
809	-H		554
810	-H		568
811	-H		539
812	-H		598
813	-H		540
814	-H		526
815	-H		511
816	-H		494
817	-H		540
818	-H		612
819	-C ₂ H ₅		522

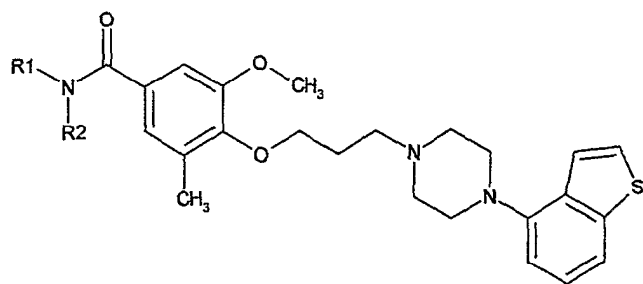


Пример	R1	R2	MC (M+1)
820	-H		526
821	-H		512
822	-H		514
823	-H		496
824	-H		494
825	-H		522
826	-H		538
827	-H		536
828	-H		580
829	-CH3		560
830	-CH3		544

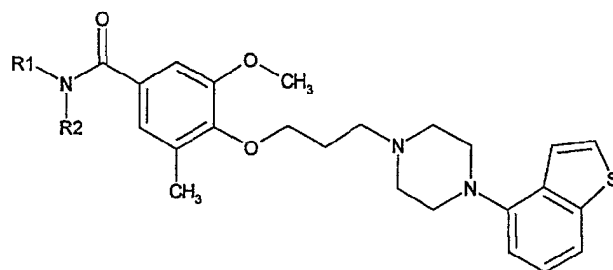


Пример	R1	R2	МС (M+1)
831	-CH ₃		564
832	-H		562
833	-H		562
834	-H		584
835	-H		600
836	-H		572
837	-H		550
838	-H		546
839	-H		546
840	-H		546
841	-H		550

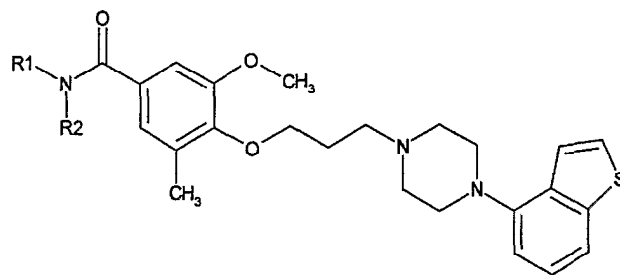
Таблица 101



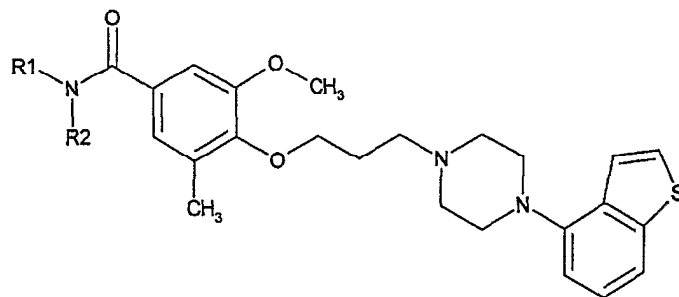
Пример	R1	R2	МС (M+1)
842	-H		550
843	-H		530
844	-H		558
845	-H		574
846	-H		576
847	-H		592
848	-H		581
849	-H		580
850	-H		576
851	-H		576



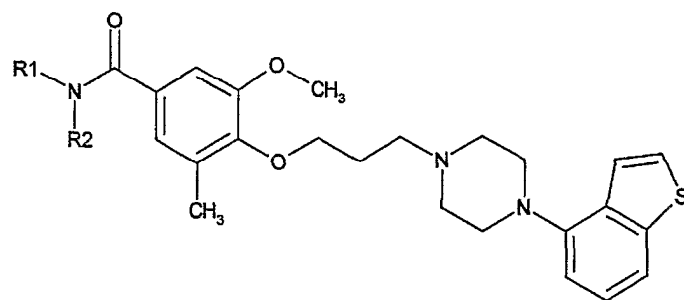
Пример	R1	R2	MC (M+1)
852	-H		560
853	-H		603
854	-H		576
855	-H		556
856	-H		558
857	-H		564
858	-H		564
859	-H		564
860	-H		572
861	-H		560
862	-H		560



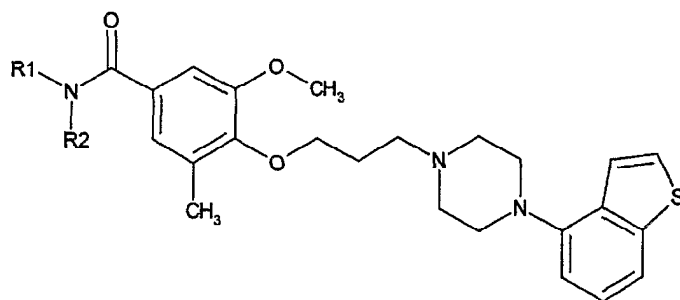
Пример	R1	R2	МС (М+1)
863	-H		574
864	-H		574
865	-H		578
866	-H		598
867	-H		614
868	-H		574
869	-H		548
870	-H		590
871	-H		544
872	-H		562
873	-H		602



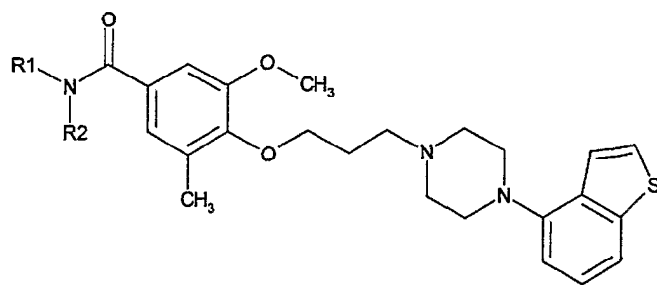
Пример	R1	R2	МС (M+1)
874	-H		588
875	-H		587
876	-H		560
877	-H		562
878	-H		574
879	-H		578
880	-H		558
881	-H		558
882	-H		578
883	-H		562



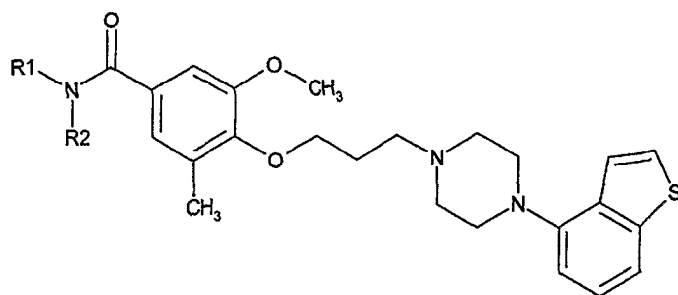
Пример	R1	R2	МС (M+1)
884	-H		590
885	-H		574
886	-H		630
887	-CH ₃		558
888	-CH ₃		588
889	-CH ₃		574
890	-H		598
891	-H		548
892	-H		598
893	-H		548



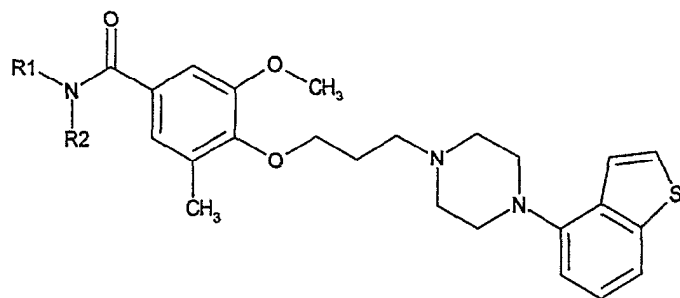
Пример	R1	R2	МС (M+1)
894	-H		566
895	-H		614
896	-H		562
897	-H		562
898	-H		562
899	-H		580
900	-H		612
901	-H		612
902	-H		612



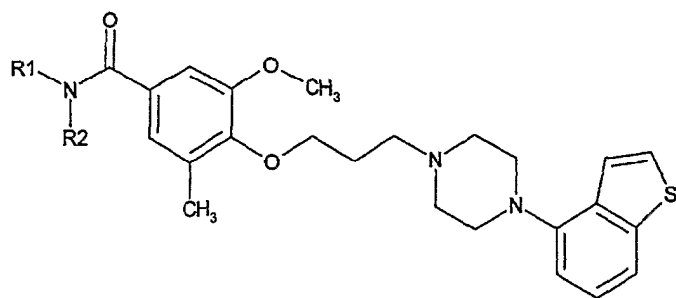
Пример	R1	R2	MC (M+1)
903	-H		576
904	-H		576
905	-H		576
906	-H		594
907	-H		626
908	-H		626
909	-H		626
910	-H		566
911	-H		628



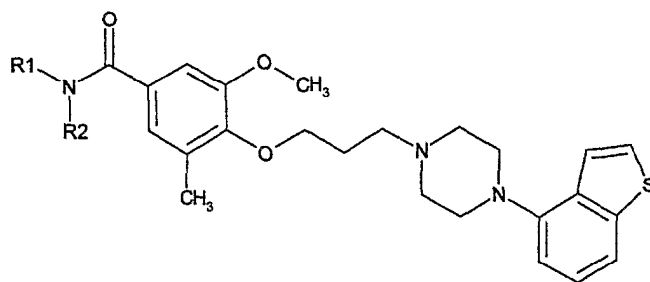
Пример	R1	R2	MC (M+1)
912	-H		602
913	-H		606
914	-C ₂ H ₅		584
915	-H		566
916	-H		580
917	-H		531
918	-H		531
919	-H		531
920	-H		545
921	-C ₂ H ₅		573



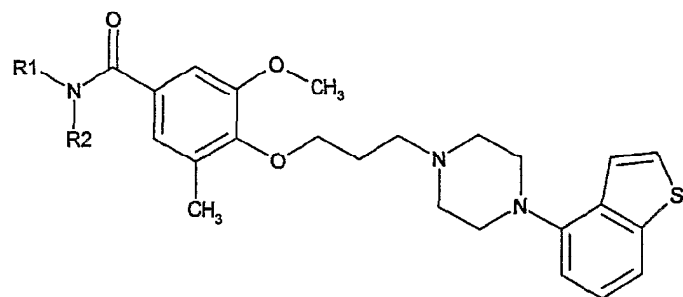
Пример	R1	R2	MC (M+1)
922	-C ₂ H ₅		559
923	-H		545
924	-H		545
925	-H		579
926	-CH ₃		675
927	-H		565
928	-H		551
929	-H		520
930	-H		534
931	-H		548



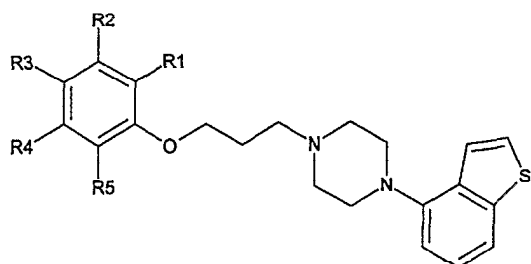
Пример	R1	R2	МС (M+1)
932	-H		520
933	-H		524
934	-H		524
935	-H		538
936	-H		526
937	-H		540
938	-H		536
939	-H		550
940	-H		536
941	-H		550



Пример	R1	R2	МС (M+1)
942	-H		533
943	-H		533
944	-H		562
945	-H		548
946	-H		548
947	-H		577
948	-H		592
949	-H		534
950	-H		537
951	-H		546
952	-H		556

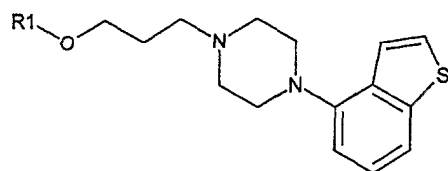


Пример	R1	R2	МС (М+1)
953	-H		583
954	-H		598
955	-H		570
956	-H		572
957	-H		599
958	-H		615
959	-H		598



Пример	R1	R2	R3	R4	R5	МС (M+1)
960	-H	-H	-NHCOCH ₃	-H	-H	410
961	-H	-NHCOCH ₃	-H	-H	-H	410
962	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	383
963	-H	-H	-Cl	-H	-H	387
964	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	367
965	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	421
966	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	437
967	-H	-H	-SCH ₃	-H	-H	399
968	-H	-H	-C ₆ H ₅	-H	-H	429
969	-H	-H	-OCH ₂ C ₆ H ₅	-H	-H	459
970	-H	-H	-NO ₂	-H	-H	398
971	-H	-H	-COCH ₃	-H	-H	395
972	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	-H	413
973	-OCH ₃	-H	-H	-H	-OCH ₃	413
974	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	413
975	-H	-CH ₃	-H	-H	-H	367
976	-CH ₃	-H	-H	-H	-CH ₃	381
977	-F	-H	-H	-H	-H	371
978	-H	-F	-H	-H	-H	371
979	-H	-H	-F	-H	-H	371
980	-F	-H	-F	-H	-H	389
981	-H	-F	-H	-H	-F	389
982	-F	-H	-H	-H	-F	389
983	-F	-H	-H	-CH ₃	-H	385
984	-H	-H	-CH ₂ CO ₂ CH ₃	-H	-H	425
985	-CH ₃	-H	-COCH ₃	-H	-H	409
986	-H	-OC ₆ H ₅	-H	-H	-H	445
987		-H	-H	-H	-H	420
988	-H	-H		-H	-H	419

Таблица 114



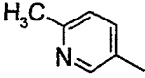
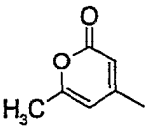
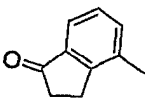
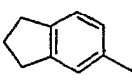
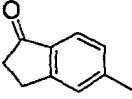
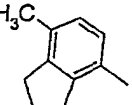
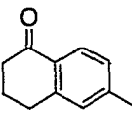
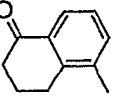
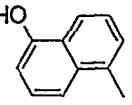
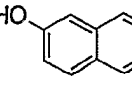
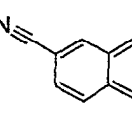
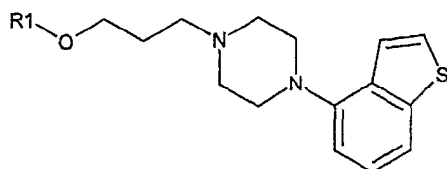
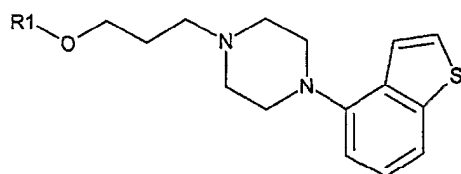
Пример	R1	МС (M+1)
989	-3-пиридил	354
990		368
991		385
992		407
993		393
994		407
995		407
996		421
997		421
998		419
999		419
1000		428

Таблица 115



Пример	R1	МС (M+1)
1001	<chem>COc1ccc2cc(C)ccc2c1</chem>	433
1002	<chem>COc1ccc2cc(C)ccc2c1</chem>	433
1003	<chem>Clc1ccc2cc(C)ccc2c1</chem>	437
1004	<chem>O=C1OCc2cc(C)ccc21</chem>	409
1005	<chem>CC1(C)OC2=CC=CC=C2C1</chem>	423
1006	<chem>O=C1OCc2cc(C)ccc21</chem>	409
1007	<chem>O=C1OC2=CC=CC=C2C1</chem>	421
1008	<chem>CC1=C(C(=O)OC2=CC=CC=C2C1=O)C</chem>	435
1009	<chem>COc1ccc2c(c1)oc(=O)c(C)c2</chem>	451
1010	<chem>O=C1OC2=CC=CC=C2S1</chem>	427
1011	<chem>Cc1nc2ccccc2o1</chem>	394

Таблица 116



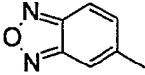
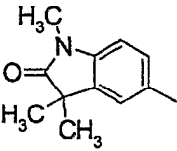
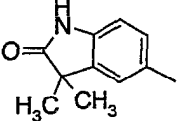
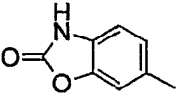
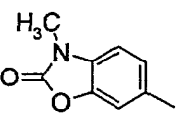
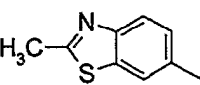
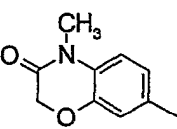
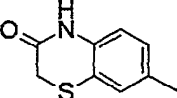
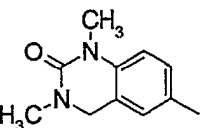
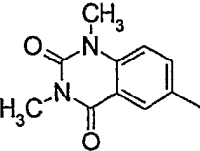
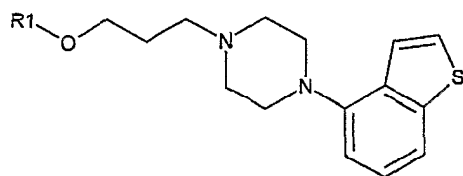
Пример	R1	МС (M+1)
1012		395
1013		450
1014		436
1015		410
1016		424
1017		424
1018	-2-бензотиазолил	410
1019		438
1020		440
1021		451
1022		465

Таблица 117



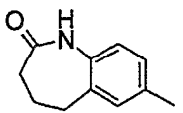
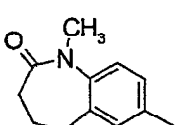
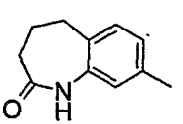
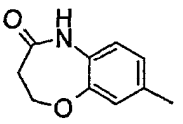
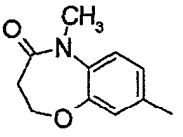
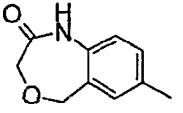
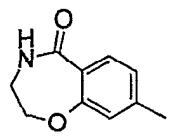
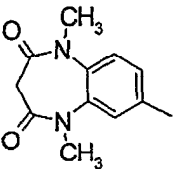
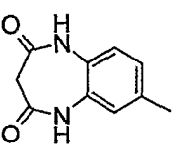
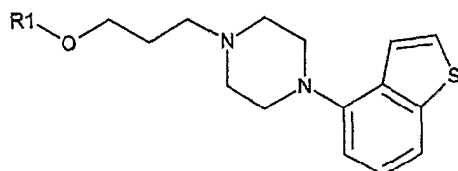
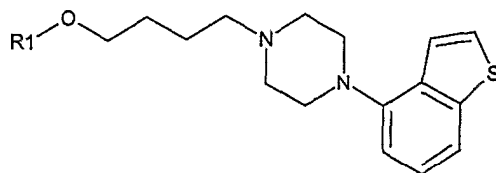
Пример	R1	МС (M+1)
1023		465
1024		436
1025		450
1026		436
1027		438
1028		452
1029		438
1030		438
1031		479
1032		451

Таблица 118



Пример	R1	МС (M+1)
1033		465
1034		479
1035		450
1036		443

Таблица 119



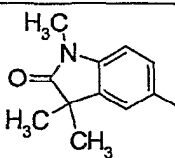
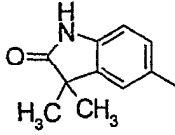
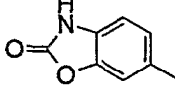
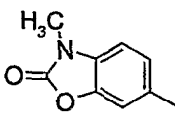
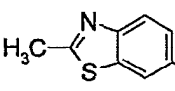
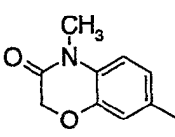
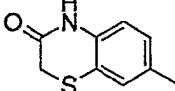
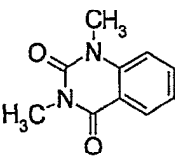
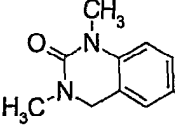
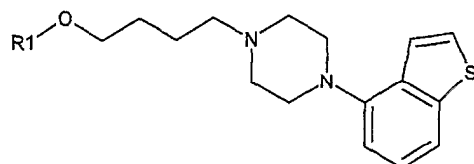
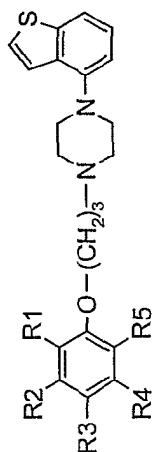
Пример	R1	МС (M+1)
1037		464
1038		450
1039		424
1040		438
1041		438
1042		452
1043		454
1044		479
1045		465

Таблица 120



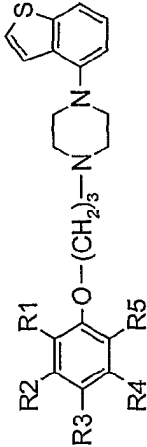
Пример	R1	МС (M+1)
1046		479
1047		450
1048		464
1049		450
1050		466
1051		465
1052		493
1053		479
1054		493
1055		464

Таблица 121



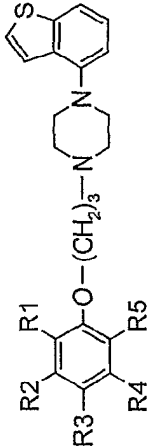
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
1056	-OCH ₃	-H	-NHCO ₂ C ₂ H ₅	-H	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат)	235,5-237,5	Гидрохлорид
1057	-CH ₃	-H	-CONHCH ₃	-H	-OH	Белый порошок (этилацетат)	246,5 (разл.)	Гидрохлорид
1058	-CH ₃	-H	-Br	-H	-OCH ₃	Белый порошок (этанол/этилацетат)	265,0 (разл.)	Гидрохлорид
1059	-OCH ₃	-H	-NHCOCH ₂ NHCO ₂ C(CH ₃) ₃	-H	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат/ изопропиловый эфир)	140,5-142,5	-
1060	-CH ₃	-H	-NHCOCH ₂ NH ₂	-H	-OCH ₃	Белый порошок (метанол/вода)	268,0 (разл.)	Дигидрохлорид
1061	-OCH ₃	-H	-NHCOCH ₂ NHCOCH ₃	-H	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат/ изопропиловый эфир)	167,5-170,5	-
1062	-OCH ₃	-H	-NHCOCH ₂ NHCO ₂ CH ₃	-H	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат/ изопропиловый эфир)	157,0-159,5	-
1063	-CH ₃	-H	-NHCOCH ₂ NHCHO	-H	-OCH ₃	Белый порошок (дихлорметан/вода)	235,5 (разл.)	Гидрохлорид

Таблица 122



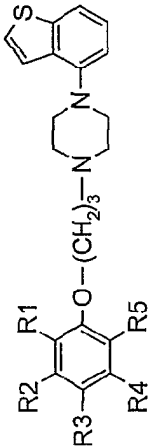
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	Кристаллическая форма (растворитель для перекристал- лизации)	Температура плавл- ения (°C)	Соль
1064	-CH ₃	-H	-CONHCH ₃	-H	-O(CH ₂) ₂ N(CH ₃) ₂	Белый порошок (этилацетат)	235,5-240,5 (разл.)	Дигидрохлорид
1065	-CH ₃	-H	-CONHCH ₃	-H	-O(CH ₂) ₂ OCH ₃	Белый порошок (изопропиловый спирт/изопропиловый эфир)	194,0-197,5	Гидрохлорид
1066	-CH ₃	-H	-CONHCH ₃	-H	-OCH ₂ CF ₃	Светло-желтый порошок (этилацетат/ изопропиловый эфир)	156,0-157,5	Гидрохлорид

Таблица 123



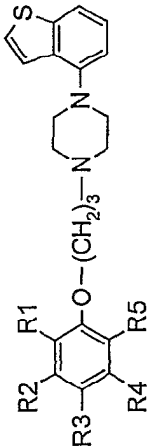
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
1067	-H	-H		-H	-H	Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	114,0-115,5	-
1068	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	Белый порошок (этанол/этилацетат)	245,0 (разл.)	Гидрохлорид
1069	-H	-H		-H	-H	Белый порошок (этилацетат)	217,0-224,5 (разл.)	Гидрохлорид
1070	-OCH ₃	-H		-H	-CHO	Белый порошок (этанол)	218,0 (разл.)	Гидрохлорид
1071	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₂ OH	Белый порошок (этанол)	224,0-226,5 (разл.)	Гидрохлорид
1072	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₂ OCH ₃	Белый порошок (этанол)	224,0-226,0	Гидрохлорид

Таблица 124



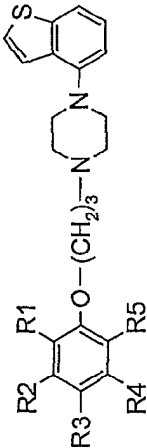
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
1073	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₂ N(CH ₃) ₂	Белый порошок (этанол/эфир)	151,0-152,0	Дифумарат
1074	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	Светло-желтый порошок (этанол/вода)	264,0 (разл.)	Гидрохлорид
1075	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	Светло-желтый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	143,5-151,0	-
1076	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат)	246,5-249,0 (разл.)	Гидрохлорид
1077	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	Светло-желтый порошок (этилацетат)	234,0-240,0 (разл.)	Дигидрохлорид
1078	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	Белый порошок (метанол/вода)	286,5 (разл.)	Дигидрохлорид

Таблица 125



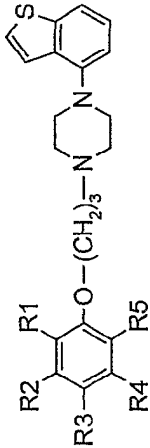
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
1079	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	Белый порошок (этанол/вода)	218,0-221,5	Гидрохлорид
1080	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	Белый порошок (этанол/этилацетат)	223,0-228,0	Гидрохлорид
1081	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	139,5-142,0	-
1082	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат)	270,0 (разл.)	Тригидрохлорид
1083	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат)	257,0-261,0 (разл.)	Гидрохлорид
1084	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₂ OH	Белый порошок (этилацетат)	217,5-221,0	Гидрохлорид

Таблица 126



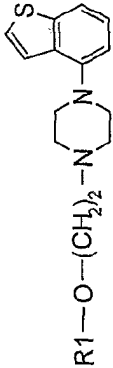
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
1085	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат)	250,0 (разл.)	Гидрохлорид
1086	-OCH ₃	-H		-H	-CHO	Светло-желтый порошок (этилацетат)	225,0 (разл.)	Гидрохлорид
1087	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₂ OH	Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	128,0-130,0	-
1088	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат)	246,0 (разл.)	Гидрохлорид
1089	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат)	248,0-251,0 (разл.)	Дигидрохлорид

Таблица 127



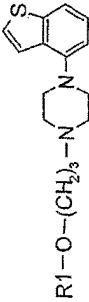
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	ЯМР	Соль
1090	$-NH_2$	$-H$	$-CONHC_2H_5$	$-H$	$-H$	^1H -ЯМР ($CDCl_3$) δ м.д.: 1,23 (3H, т, $J=7,4$ Гц), 2,00-2,15 (2H, м), 2,67 (2H, т, $J=7,3$ Гц), 2,75 (4H, ушир.с), 3,21 (4H, ушир.с), 3,40-3,50 (2H, м), 3,50-4,30 (2H, ушир.), 4,13 (2H, т, $J=6,5$ Гц), 5,99 (1H, ушир.с), 6,80 (1H, д, $J=8,4$ Гц), 6,90 (1H, д, $J=7,6$ Гц), 7,08 (1H, д, $J=2,1$, 8,3 Гц), 7,19 (1H, д, $J=2,1$ Гц), 7,25-7,30 (1H, м), 7,35-7,45 (2H, м), 7,55 (1H, д, $J=8,0$ Гц).	-

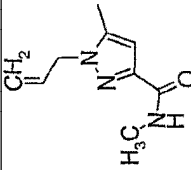
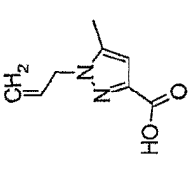
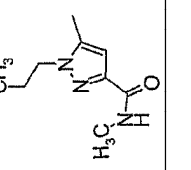
Таблица 128



Пример	R1	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
1091		Белый порошок (этанол/этилацетат)	166,0-171,0	-
1092		Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	138,5-141,0	-

Таблица 129



Пример	R1	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
1093		Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	138,5-140,5	-
1094		Белый порошок (этанол)	233,5 (разл.)	Гидрохлорид
1095		Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	147,0-148,5	-

5
10
15
20
25
30
35
40
45
50

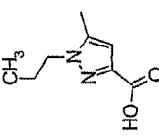
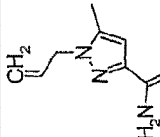
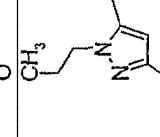
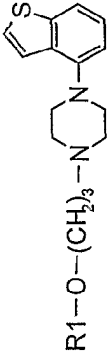
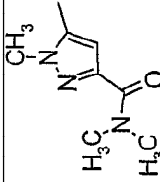
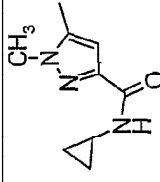
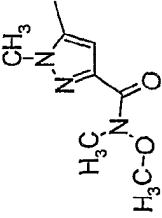
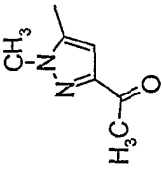
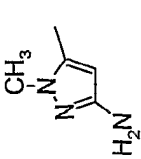
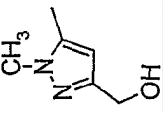
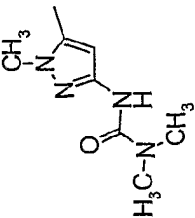
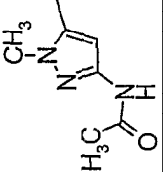
1096		Белый порошок (вода)	115,0-121,0	-
1097		Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	129,0-130,5	-
1098		Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	139,0-140,5	-

Таблица 130



Пример	R1	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
1099		Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	128,5-131,5	-
1100		Белый порошок (изопропиловый спирт/этилацетат)	227,0 (разл.)	Гидрохлорид

1101		Белый порошок (этанол/этилацетат)	211,0-213,5	Гидрохлорид
1102		Белый порошок (этанол/вода)	245,0 (разл.)	Гидрохлорид
1103		Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	112,0-113,0	-
1104		Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	123,5-126,0	-
1105		Светло-желтый порошок (этилацетат)	174,0-176,5	Гидрохлорид
1106		Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	137,0-139,0	-

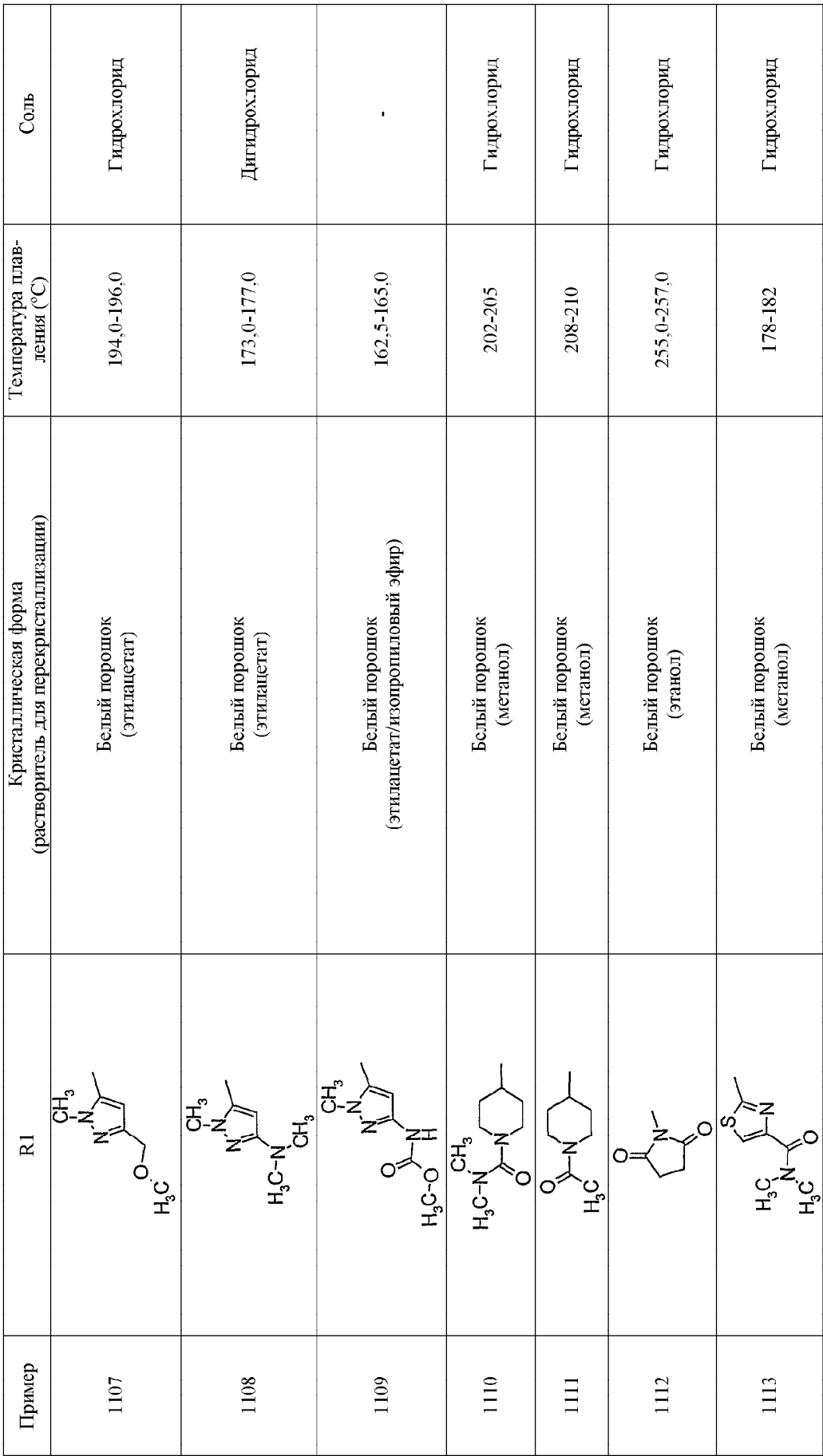
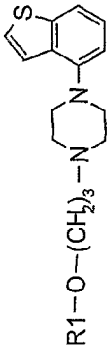


Таблица 132



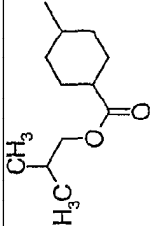
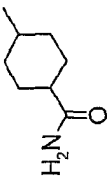
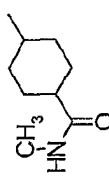
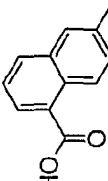
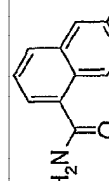
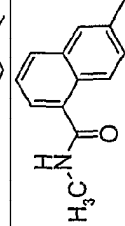
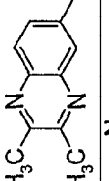
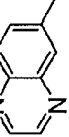
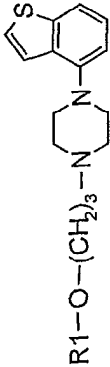
Пример	R1	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
1114		Белый порошок (этилацетат)	199,0-201,5	Гидрохлорид
1115		Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	107,5-108,5	-
1116		Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	110,0-112,0	-
1117		Белый порошок (вода)	203,0-210,0	-
1118		Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	167,0-169,0	-
1119		Белый порошок (этилацетат)	138,0-140,0	-
1120		Белый порошок (этилацетат/гексан)	115	-
1121		Светло-коричневый порошок (этанол)	134,7	-

Таблица 134



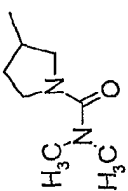
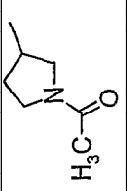
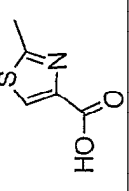
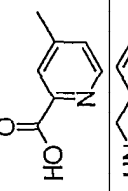
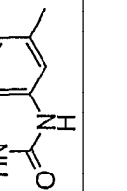
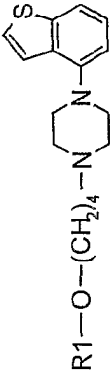
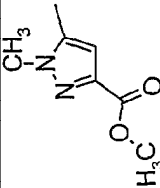
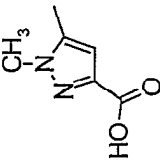
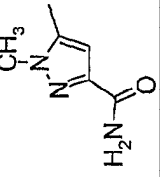
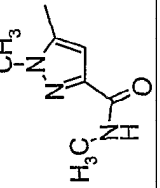
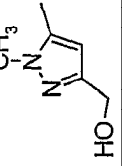
Пример	R1	Температура плавления (°C)	Соль
1127		¹ H-ЯМР (DMSO-d ₆) δ м.д.: 1,80-2,10 (4H, м), 2,74 (6H, с), 3,10-3,70 (16H, м), 4,00-4,10 (1H, м), 6,97 (1H, д, J=7,5 Гц), 7,32 (1H, т, J=7,9 Гц), 7,49 (1H, д, J=5,6 Гц), 7,71 (1H, д, J=8,0 Гц), 7,77 (1H, д, J=5,5 Гц), 10,91 (1H, ушир.с).	Гидрохлорид
1128		¹ H-ЯМР (DMSO-d ₆) δ м.д.: 1,80-2,10 (4H, м), 1,93 (3H, с), 3,10-3,60 (16H, м), 3,90-4,10 (1H, м), 6,95 (1H, д, J=7,5 Гц), 7,30 (1H, т, J=7,9 Гц), 7,47 (1H, д, J=5,5 Гц), 7,68 (1H, д, J=8,0 Гц), 7,75 (1H, д, J=5,5 Гц), 11,30 (1H, ушир.с).	Гидрохлорид
1129		¹ H-ЯМР (DMSO-d ₆) δ м.д.: 2,20-2,40 (2H, м), 2,70-3,70 (10H, м), 4,55 (2H, т, J=5,9 Гц), 6,98 (1H, д, J=7,5 Гц), 7,32 (1H, т, J=7,9 Гц), 7,50 (1H, д, J=5,5 Гц), 7,71 (1H, д, J=8,0 Гц), 7,77 (1H, д, J=5,5 Гц), 7,89 (1H, с), 10,97 (1H, ушир.с), 12,93 (1H, ушир.с).	Гидрохлорид
1130		¹ H-ЯМР (DMSO-d ₆) δ м.д.: 2,25-2,35 (2H, м), 3,20-4,00 (10H, м), 4,30 (2H, т, J=5,8 Гц), 6,97 (1H, д, J=7,5 Гц), 7,24 (1H, дд, J=5,5, 2,8 Гц), 7,31 (1H, т, J=7,8 Гц), 7,49 (1H, д, J=5,4 Гц), 7,59 (1H, д, J=2,5 Гц), 7,70 (1H, д, J=8,1 Гц), 7,76 (1H, д, J=5,5 Гц), 8,53 (1H, д, J=5,7 Гц), 10,99 (1H, ушир.с).	Гидрохлорид
1131		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,89-2,13 (2H, м), 2,52-2,83 (6H, м), 3,03-3,3 (4H, м), 4,01 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,46 (2H, ушир.с), 5,30 (1H, ушир.с), 6,51 (1H, дд, J=8,3, 2,3 Гц), 6,83-6,96 (2H, м), 7,19-7,45 (3H, м), 7,48 (1H, ушир.с), 7,55 (1H, д, J=8,0 Гц).	Фумарат

Таблица 135



Пример	R1	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
1132		Светло-коричневый порошок (этанол/этилацетат)	103,5-106,0	-
1133		Светло-коричневый порошок (дихлорметан/вода)	140,5-144,0	-
1134		Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	143,0-144,5	-
1135		Белый порошок (этанол/этилацетат)	211,0-213,5	Гидрохлорид
1136		Белый порошок (этилацетат)	207,5-209,5	Гидрохлорид

5
10
15
20
25
30
35
40
45
50

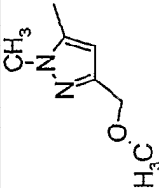
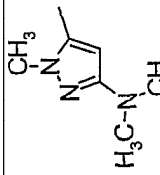
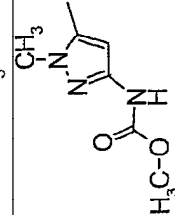
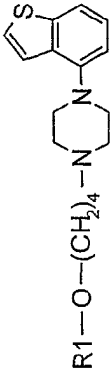
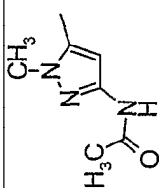
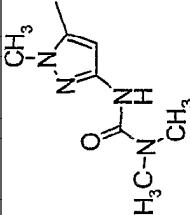
1137		Белый порошок (этанол)	167,0-168,5	Гидрохлорид
1138		Белый порошок (этилацетат)	156,5-158,5	Гидрохлорид
1139		Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	157,5-161,5	-

Таблица 136



Пример	R1	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
1140		Белый порошок (этилацетат)	203,5-206,0	Гидрохлорид
1141		Белый порошок (этилацетат)	186,0-187,5	Гидрохлорид

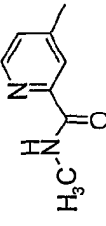
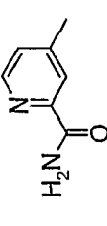
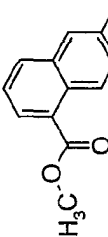
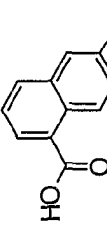
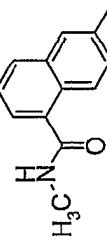
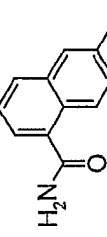
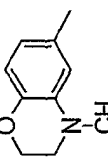
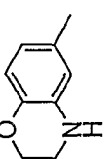
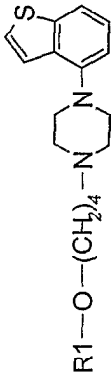
1142		Белый порошок (этилацетат)	203,0-207,0	Гидрохлорид
1143		Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	146,5-148,0	-
1144		Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	96,5-97,0	-
1145		Белый порошок (уксусная кислота)	254,0 (разл.)	Дигидрохлорид
1146		Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	124,0-126,5	-
1147		Белый порошок (этанол/этилацетат)	181,5-183,5	-
1148		Белый порошок (этилацетат)	230,2-231,5	Гидрохлорид
1149		Белый порошок (этилацетат)	207,4-209,6	Гидрохлорид

Таблица 137



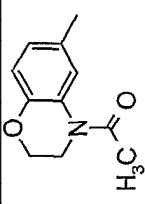
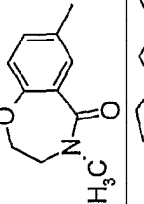
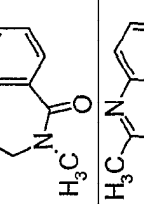
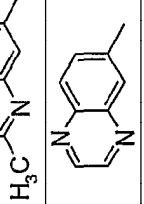
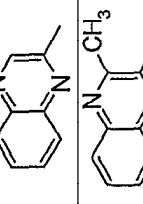
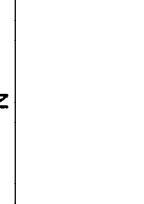
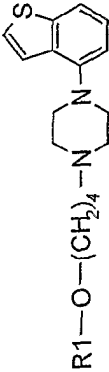
Пример	R1	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
1150		Белый порошок (этилацетат)	213,8-215,2	Гидрохлорид
1151		Белый порошок (этилацетат)	217,0-218,0	Гидрохлорид
1152		Белый порошок (этилацетат)	231,6-232,9	Гидрохлорид
1153		Светло-желтый порошок (этанол)	135,7	-
1154		Светло-коричневый порошок (этанол)	238,1-240,1	Гидрохлорид
1155		Белый порошок (этанол)	210,4	Гидрохлорид
1156		Белый порошок (этанол)	94,1	-

Таблица 138



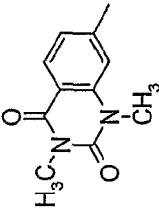
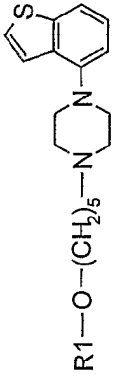
Пример	R I	ЯМР	Соль
1157		^1H -ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,72-1,83 (2H, м), 1,83-1,98 (2H, м), 2,48-2,59 (2H, м), 2,64-2,81 (4H, м), 3,12-3,28 (4H, м), 3,46 (3H, с), 3,58 (3H, с), 4,13 (2H, т, J=6,3 Гц), 6,62 (1H, д, J=2,1 Гц), 6,80 (1H, дд, J=8,8, 2,1 Гц), 6,90 (1H, д, J=7,6 Гц), 7,20-7,31 (1H, м), 7,35-7,43 (2H, м), 7,55 (1H, д, J=8,0 Гц), 8,15 (1H, д, J=8,8 Гц).	-

Таблица 139



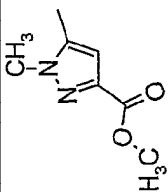
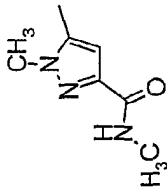
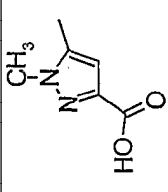
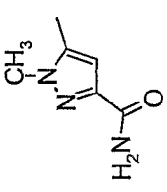
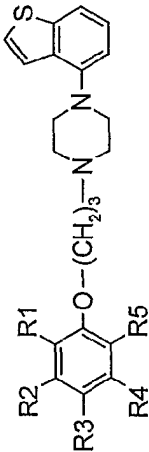
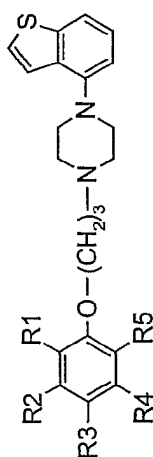
Пример	R1	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
1158		Белый порошок (этилацетат)	200,5-201,5	Гидрохлорид
1159		Белый порошок (этанол/этилацетат)	225,0-230,0	Гидрохлорид
1160		Белый порошок (дихлорметан/вода)	156,0-158,5	-
1161		Белый порошок (этанол/этилацетат)	169,0-171,5	-

Таблица 140

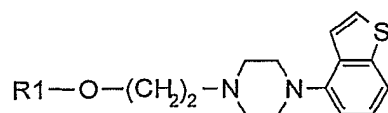


Пример	R1	R2	R3	R4	R5	ЯМР
1162	-OCH ₃	-H	-NHCO ₂ C(CH ₃) ₃	-H	-CH ₃	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,51 (9H, c), 1,95-2,10 (2H, м), 2,24 (3H, c), 2,66-2,81 (6H, м), 3,14-3,31 (2H, м), 3,84 (3H, c), 3,95 (2H, т, J=6,3 Гц), 6,36 (1H, ушпр.), 6,60 (1H, д, J=2,5 Гц), 6,87-6,92 (1H, м), 7,01 (1H, д, J=2,0 Гц), 7,24-7,31 (1H, м), 7,37-7,44 (2H, м), 7,55 (1H, д, J=8,0 Гц).
1163	-OCH ₃	-H	-I	-H	-CH ₃	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,92-2,10 (2H, м), 2,23 (3H, c), 2,57-2,86 (6H, м), 3,11-3,31 (4H, м), 3,82 (3H, c), 3,98 (2H, т, J=6,4 Гц), 6,90 (1H, д, J=7,6 Гц), 7,03 (1H, д, J=2,0 Гц), 7,13 (1H, д, J=1,6 Гц), 7,22-7,34 (1H, м), 7,40 (1H, д, J=5,5 Гц, 9,3 Гц), 7,55 (1H, д, J=8,0 Гц).
1164	-OCH ₃	-H	-NHCONH(CH ₂) ₂ Cl	-H	-CH ₃	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,94-2,13 (2H, м), 2,26 (3H, c), 2,60-2,90 (6H, м), 3,12-3,33 (4H, м), 3,49-3,75 (4H, м), 3,83 (3H, c), 3,97 (2H, т, J=6,4 Гц), 5,22 (1H, ушпр.), 6,25 (1H, ушпр.), 6,59 (1H, д, J=2,3 Гц), 6,86 (1H, д, J=2,3 Гц), 6,91 (1H, д, J=7,4 Гц), 7,21-7,33 (1H, м), 7,41 (1H, д, J=5,6 Гц, 7,6 Гц), 7,56 (1H, д, J=8,0 Гц).
1165	-OCH ₃	-H	-NH(CH ₂) ₂ NH ₂	-H	-CH ₃	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,91-2,08 (2H, м), 2,22 (3H, c), 2,62-2,81 (6H, м), 2,95 (2H, т, J=5,7 Гц), 3,08-3,27 (6H, м), 3,80 (3H, c), 3,91 (2H, т, J=6,4 Гц), 6,05 (1H, д, J=2,6 Гц), 6,10 (1H, д, J=2,6 Гц), 6,90 (1H, д, J=7,5 Гц), 7,20-7,32 (1H, м), 7,34-7,46 (2H, м), 7,55 (1H, д, J=8,0 Гц).
1166	-OCH ₃	-H	-NH(CH ₂) ₂ NHCOCH ₂ Cl	-H	-CH ₃	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,91-2,11 (2H, м), 2,23 (3H, c), 2,60-2,84 (6H, м), 3,11-3,26 (4H, м), 3,26-3,36 (2H, м), 3,45-3,63 (2H, м), 3,81 (3H, c), 3,91 (2H, т, J=6,4 Гц), 4,06 (2H, c), 6,04 (1H, д, J=2,5 Гц), 6,10 (1H, д, J=2,5 Гц), 6,78-6,96 (2H, м), 7,21-7,33 (1H, м), 7,35-7,47 (2H, м), 7,55 (1H, д, J=8,1 Гц).

Таблица 141



Пример	R1	R2	R3	R4	R5	ЯМР
1167	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₂ Cl	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,00-2,17 (2H, м), 2,63-2,83 (6H, м), 3,14-3,28 (2H, м), 3,89 (3H, с), 3,98-4,17 (4H, м), 4,40-4,54 (2H, м), 4,69 (2H, м), 6,77 (1H, д, J=2,5 Гц), 6,91 (1H, д, J=2,5 Гц), 7,21-7,32 (1H, м), 7,35-7,46 (2H, м), 7,55 (1H, д, J=9,3 Гц).
1168	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,48 (9H, с), 1,93-2,12 (2H, м), 2,26 (3H, с), 2,60-2,86 (6H, м), 2,95-3,12 (4H, м), 3,14-3,31 (4H, м), 3,50-3,67 (4H, м), 3,83 (3H, с), 3,94 (2H, т, J=6,3 Гц), 6,33 (1H, д, J=2,5 Гц), 6,38 (1H, д, J=2,5 Гц), 6,90 (1H, д, J=7,5 Гц), 7,19-7,33 (1H, м), 7,41 (2H, д, J=5,5 Гц, 9,3 Гц), 7,55 (1H, д, J=8,0 Гц).
1169	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,92-2,09 (2H, м), 2,26 (3H, с), 2,61-2,81 (6H, м), 2,98-3,12 (8H, м), 3,14-3,25 (4H, м), 3,83 (3H, с), 3,94 (2H, т, J=6,4 Гц), 6,33 (1H, д, J=2,5 Гц), 6,38 (1H, д, J=2,5 Гц), 6,90 (1H, д, J=7,0 Гц), 7,20-7,33 (1H, м), 7,34-7,45 (2H, м), 7,55 (1H, д, J=8,0 Гц).
1170	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,50 (9H, с), 1,95-2,11 (2H, м), 2,27 (3H, с), 2,59-2,82 (6H, м), 3,12-3,27 (4H, м), 3,63-3,81 (4H, м), 3,83 (3H, с), 4,01 (2H, т, J=6,4 Гц), 4,24 (2H, с), 6,61-6,71 (2H, м), 6,90 (1H, д, J=7,6 Гц), 7,21-7,33 (1H, м), 7,41 (2H, д, J=5,5 Гц, 9,8 Гц), 7,55 (1H, д, J=8,1 Гц).
1171	-OCH ₃	-H		-H	-CHO	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,49 (9H, с), 1,96-2,12 (2H, м), 2,60-2,82 (6H, м), 3,04-3,16 (4H, м), 3,16-3,28 (4H, м), 3,52-3,64 (4H, м), 3,89 (3H, с), 4,14 (2H, т, J=6,3 Гц), 6,78 (1H, д, J=2,8 Гц), 6,86-6,96 (2H, м), 7,20-7,33 (1H, м), 7,35-7,46 (2H, м), 7,55 (1H, д, J=8,0 Гц), 10,44 (1H, с).
1172	-OCH ₃	-H		-H	-CHO	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,97-2,13 (2H, м), 2,59-2,83 (6H, м), 2,96-3,09 (4H, м), 3,09-3,17 (4H, м), 3,17-3,28 (4H, м), 3,89 (3H, с), 4,13 (2H, т, J=6,5 Гц), 6,79 (1H, д, J=2,7 Гц), 6,86-6,96 (2H, м), 7,20-7,34 (1H, м), 7,36-7,45 (2H, м), 7,55 (1H, д, J=8,1 Гц), 10,44 (1H, с).



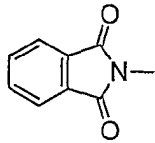
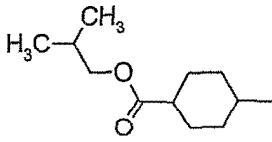
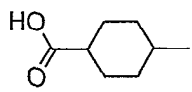
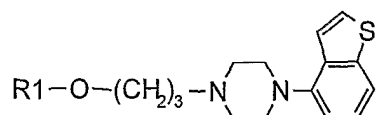
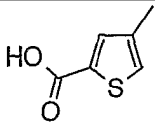
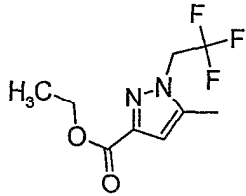
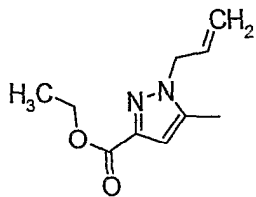
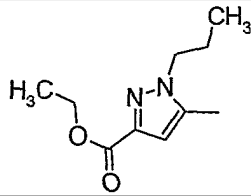
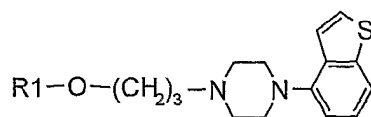
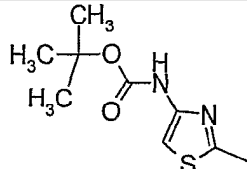
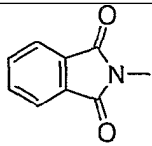
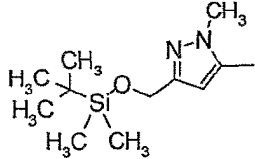
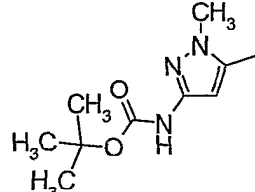
Пример	R1	ЯМР
1173		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,70-2,87 (4H, м), 2,95 (2H, т, J=5,1 Гц), 2,99-3,14 (4H, м), 4,42 (2H, т, J=5,1 Гц), 6,78 (1H, дд, J=0,6 Гц, 7,6 Гц), 7,18-7,30 (1H, м), 7,38 (2H, с), 7,54 (1H, д, J=8,0 Гц), 7,69-7,80 (2H, м), 7,80-7,89 (2H, м).
1174		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 0,93 (6H, д, J=6,7 Гц), 1,41-1,75 (5H, м), 1,75-2,02 (4H, м), 2,23-2,48 (1H, м), 2,65-2,87 (6H, м), 3,06-3,25 (4H, м), 3,42-3,54 (1H, м), 3,62 (2H, т, J=6,2 Гц), 3,85 (2H, д, J=6,5 Гц), 6,89 (1H, д, J=7,6 Гц), 7,20-7,34 (1H, м), 7,34-7,46 (2H, м), 7,54 (1H, д, J=8,0 Гц).
1175		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,41-1,75 (4H, м), 1,75-2,01 (4H, м), 2,18-2,44 (1H, м), 2,72-3,04 (6H, м), 3,14-3,31 (4H, м), 3,44-3,54 (1H, м), 3,64 (2H, т, J=6,0 Гц), 6,88 (1H, д, J=7,6 Гц), 7,20-7,31 (1H, м), 7,31-7,44 (2H, м), 7,55 (1H, д, J=8,0 Гц).

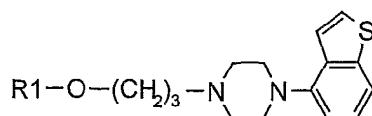
Таблица 143



Пример	R1	ЯМР
1176		¹ H-ЯМР (DMCO-d ₆) δ м.д.: 1,85-1,95 (2H, м), 2,57 (2H, т, J=7,1 Гц), 2,60-2,75 (4H, м), 3,05-3,15 (4H, м), 4,03 (2H, т, J=6,3 Гц), 6,85-6,95 (2H, м), 7,20-7,31 (2H, м), 7,35-7,41 (1H, м), 7,60 (1H, д, J=8,1 Гц), 7,68 (1H, д, J=5,5 Гц).
1177		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,39 (3H, т, J=7,0 Гц), 2,00-2,11 (2H, м), 2,60 (2H, т, J=7,0 Гц), 2,63-2,80 (4H, м), 3,09-3,25 (4H, м), 4,24 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,40 (2H, кв, J=7,0 Гц), 4,64 (2H, кв, J=8,3 Гц), 6,12 (1H, с), 6,90 (1H, дд, J=0,5 Гц, 7,5 Гц), 7,25-7,31 (1H, м), 7,38-7,43 (2H, м), 7,56 (1H, д, J=8,1 Гц).
1178		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,39 (3H, т, J=7,0 Гц), 2,00-2,06 (2H, м), 2,60 (2H, т, J=7,5 Гц), 2,67-2,83 (4H, м), 3,13-3,28 (4H, м), 4,18 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,39 (2H, кв, J=7,0 Гц), 4,61 (2H, м), 5,08-5,23 (2H, м), 5,87-6,09 (1H, м), 6,11 (1H, с), 6,75 (1H, дд, J=0,6 Гц, 7,5 Гц), 7,25-7,37 (1H, м), 7,40-7,43 (2H, м), 7,65 (1H, д, J=8,0 Гц).
1179		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 0,91 (3H, т, J=7,5 Гц), 1,38 (3H, т, J=7,0 Гц), 1,72-1,93 (2H, м), 1,98-2,13 (2H, м), 2,61 (2H, т, J=7,3 Гц), 2,67-2,83 (4H, м), 3,09-3,28 (4H, м), 4,01 (2H, т, J=7,0 Гц), 4,18 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,39 (2H, кв, J=7,0 Гц), 6,08 (1H, с), 6,90 (1H, дд, J=0,7 Гц, 7,5 Гц), 7,25-7,30 (1H, м), 7,37-7,43 (2H, м), 7,56 (1H, д, J=8,0 Гц).

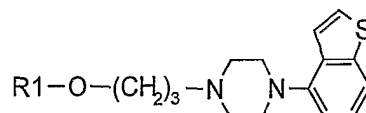


Пример	R1	ЯМР
1180		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,51 (9H, с), 1,97-2,12 (2H, м), 2,52-2,67 (2H, м), 2,67-2,80 (4H, м), 3,07-3,29 (4H, м), 4,38 (2H, т, J=6,3 Гц), 6,52 (1H, ушир.), 6,90 (1H, д, J=7,6 Гц), 7,03 (1H, ушир.), 7,21-7,33 (1H, м), 7,40 (2H, дд, J=5,6 Гц, 7,3 Гц), 7,55 (1H, д, J=8,0 Гц).
1181		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,95-2,13 (2H, м), 2,65-2,83 (6H, м), 3,09-3,27 (4H, м), 4,33 (2H, т, J=6,4 Гц), 6,89 (1H, д, J=7,6 Гц), 7,20-7,32 (1H, м), 7,40 (1H, дд, J=5,6 Гц, 9,0 Гц), 7,54 (1H, д, J=8,0 Гц), 7,71-7,80 (2H, м), 7,80-7,90 (2H, м).
1182		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 0,10 (6H, с), 0,92 (9H, с), 1,93-2,13 (2H, м), 2,62 (2H, т, J=7,5 Гц), 2,70-2,83 (4H, м), 3,09-3,28 (4H, м), 3,59 (3H, с), 4,13 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,60 (2H, с), 5,54 (1H, с), 6,90 (1H, дд, J=0,7 Гц, 7,5 Гц), 7,20-7,33 (1H, м), 7,35-7,48 (2H, м), 7,55 (1H, д, J=8,0 Гц).
1183		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,50 (9H, с), 1,94-2,12 (2H, м), 2,60 (2H, т, J=7,0 Гц), 2,66-2,80 (4H, м), 3,10-3,27 (4H, м), 3,52 (3H, с), 4,15 (2H, т, J=6,4 Гц), 5,85 (1H, с), 6,81-6,97 (2H, м), 7,20-7,33 (1H, м), 7,35-7,45 (2H, м), 7,55 (1H, д, J=8,0 Гц).

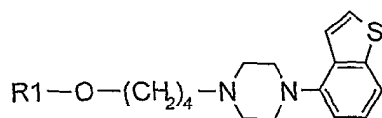


Пример	R1	ЯМР
1184		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 2,01-2,20 (2H, м), 2,62-2,87 (6H, м), 3,10-3,30 (4H, м), 3,99 (3H, с), 4,20 (2H, т, J=6,3 Гц), 6,91 (1H, дд, J=0,7 Гц, 7,6 Гц), 7,20 (1H, д, J=2,6 Гц), 7,22-7,34 (2H, м), 7,35-7,50 (3H, м), 7,55 (1H, д, J=8,1 Гц), 7,90 (1H, д, J=8,1 Гц), 8,03 (1H, дд, J=1,2 Гц, 7,3 Гц), 8,83 (1H, д, J=9,4 Гц).
1185		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,46 (9H, с), 1,45-1,60 (2H, м), 1,75-1,90 (4H, м), 2,50-2,60 (2H, м), 2,65-2,80 (4H, м), 3,05-3,25 (6H, м), 3,40-3,50 (1H, м), 3,53 (2H, т, J=6,4 Гц), 3,70-3,80 (2H, м), 6,89 (1H, дд, J=7,6, 0,7 Гц), 7,20-7,30 (1H, м), 7,35-7,45 (2H, м), 7,54 (1H, д, J=8,0 Гц), 8,02 (1H, с).
1186		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,30-1,60 (2H, м), 1,75-2,00 (4H, м), 2,50-2,75 (4H, м), 3,05-3,25 (6H, м), 3,30-3,40 (1H, м), 3,55 (2H, т, J=6,5 Гц), 6,90 (1H, д, J=7,6 Гц), 7,20-7,30 (1H, м), 7,35-7,45 (2H, м), 7,55 (1H, д, J=8,1 Гц).
1187		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,38 (3H, т, J=7,1 Гц), 2,00-2,10 (2H, м), 2,60 (2H, т, J=7,1 Гц), 2,65-2,75 (4H, м), 3,15-3,25 (4H, м), 3,72 (3H, с), 4,17 (2H, т, J=6,4 Гц), 4,38 (2H, кв, J=7,1 Гц), 6,08 (1H, с), 6,89 (1H, д, J=7,6 Гц), 7,20-7,30 (1H, м), 7,35-7,45 (2H, м), 7,54 (1H, д, J=8,1 Гц).
1188		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,94-2,10 (2H, м), 2,60 (2H, т, J=7,1 Гц), 2,65-2,78 (4H, м), 3,10-3,25 (4H, м), 3,57 (3H, с), 4,15 (2H, т, J=6,3 Гц), 5,93 (1H, с), 6,89 (1H, д, J=7,5 Гц), 7,12-7,32 (3H, м), 7,33-7,45 (4H, м), 7,55 (1H, д, J=8,0 Гц), 7,93 (1H, ушпир.).

Таблица 146



Пример	R1	ЯМР
1189		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,75-2,00 (4H, м), 2,50-2,60 (2H, м), 2,70-2,75 (4H, м), 3,15-3,25 (4H, м), 3,35-3,80 (6H, м), 4,00-4,05 (1H, м), 6,91 (1H, дд, J=7,6, 0,5 Гц), 7,25-7,35 (1H, м), 7,35-7,45 (2H, м), 7,56 (1H, д, J=8,0 Гц).
1190		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,75-1,95 (4H, м), 2,51 (2H, т, J=7,1 Гц), 2,50-2,75 (8H, м), 3,10-3,20 (4H, м), 3,46 (2H, т, J=6,3 Гц), 4,00-4,10 (1H, м), 6,88 (1H, д, J=7,1 Гц), 7,20-7,30 (1H, м), 7,30-7,45 (2H, м), 7,53 (1H, д, J=8,0 Гц).



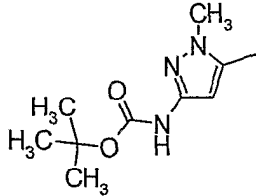
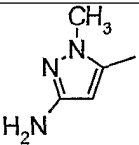
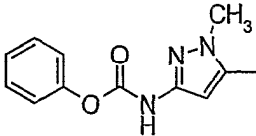
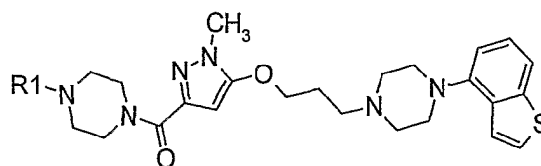
Пример	R1	ЯМР
1191		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,50 (9H, с), 1,59-1,77 (2H, м), 1,77-1,93 (2H, м), 2,50 (2H, т, J=7,3 Гц), 2,61-2,80 (4H, м), 3,11-3,27 (4H, м), 3,54 (3H, с), 4,09 (2H, т, J=6,3 Гц), 5,85 (1H, с), 6,90 (1H, д, J=7,5 Гц), 7,23-7,32 (1H, м), 7,36-7,45 (2H, м), 7,55 (1H, д, J=8,0 Гц), 7,80 (1H, ушир.).
1192		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,64-1,93 (4H, м), 2,51 (2H, т, J=7,3 Гц), 2,61-2,79 (4H, м), 3,11-3,29 (4H, м), 3,46 (3H, с), 3,49 (2H, ушир.), 4,02 (2H, т, J=6,2 Гц), 4,94 (1H, с), 6,90 (1H, дд, J=0,7 Гц, 7,6 Гц), 7,22-7,33 (1H, м), 7,35-7,46 (2H, м), 7,55 (1H, д, J=8,0 Гц).
1193		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,64-1,78 (2H, м), 1,78-1,94 (2H, м), 2,50 (2H, т, J=7,3 Гц), 2,61-2,81 (4H, м), 3,10-3,28 (4H, м), 3,57 (3H, с), 4,09 (2H, т, J=6,3 Гц), 5,92 (1H, с), 6,77-6,98 (4H, м), 7,11-7,32 (2H, м), 7,32-7,47 (4H, м), 7,55 (1H, д, J=8,0 Гц), 8,47 (1H, ушир.).

Таблица 148



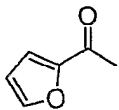
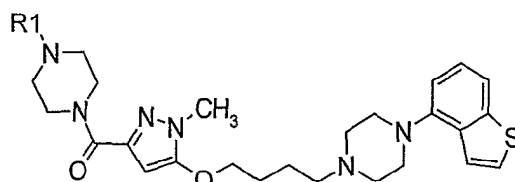
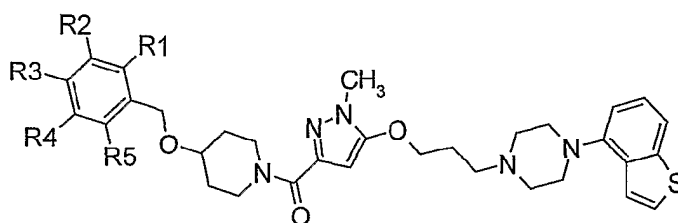
Пример	R1	МС (M+1)
1194	-CO ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	603
1195	-CO ₂ C ₂ H ₅	541
1196	-COCH ₃	511
1197	-CO ₂ C(CH ₃) ₃	569
1198	-COC ₆ H ₅	573
1199	-COC ₃ H ₇	539
1200		563

Таблица 149



Пример	R1	МС (M+1)
1201	$-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{C}_6\text{H}_5$	617
1202	$-\text{CO}_2\text{C}_2\text{H}_5$	555
1203	$-\text{COCH}_3$	525
1204	$-\text{CO}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$	583
1205	$-\text{COC}_6\text{H}_5$	587
1206	$-\text{COC}_3\text{H}_7$	553
1207		577

Таблица 150

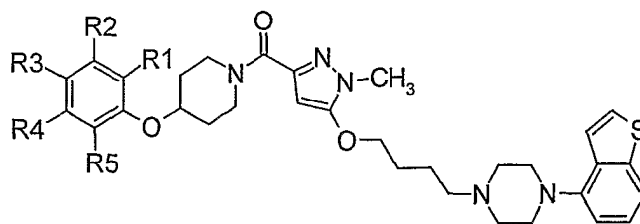


Пример	R1	R2	R3	R4	R5	МС (M+1)
1208	-H	-H	-H	-Cl	-H	608
1209	-H	-H	-H	-H	-F	592
1210	-H	-H	-H	-H	-Cl	608
1211	-H	-H	-Cl	-Cl	-H	642
1212	-H	-H	-H	$-\text{OCH}_3$	-H	604
1213	-H	$-\text{OCH}_3$	-H	$-\text{OCH}_3$	-H	634
1214	-H	-H	$-\text{CH}_3$	-H	-H	588
1215	-H	-H	-H	$-\text{CH}_3$	-H	588
1216	-H	-H	-H	-H	$-\text{CH}_3$	588
1217	-H	-H	-F	-H	-H	592
1218	-H	-H	-H	-F	-H	592
1219	-H	-H	$-\text{OCF}_3$	-H	-H	658
1220	-H	-H	-H	$-\text{OCF}_3$	-H	658
1221	-H	-H	-H	-H	$-\text{OCF}_3$	658
1222	-H	-H	$-\text{OCH}_3$	-Cl	-H	638
1223	-H	-H	-H	-Br	-H	652
1224	-H	-H	$-\text{OCH}_3$	-H	-H	604
1225	-H	-H	-H	-H	-H	574

10

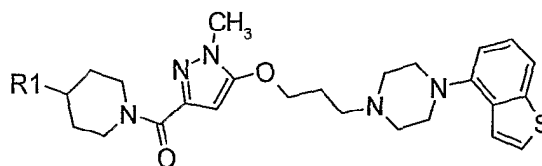
30

40



Пример	R1	R2	R3	R4	R5	MC (M+1)
1256	-H	-H	-CN	-H	-H	599
1257	-H	-H	-H	-H	-OCH ₃	604
1258	-H	-H	-H	-OCH ₃	-H	604
1259	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	604
1260	-H	-H	-H	-H	-H	574
1261	-H	-H	-H	-H	-Cl	608
1262	-H	-H	-H	-Cl	-H	608
1263	-H	-H	-Cl	-H	-H	608
1264	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	588
1265	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	588
1266	-H	-H	-F	-H	-H	592
1267	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	642

Таблица 154



Пример	R1	MC (M+1)
1268	$-\text{OCH}_3$	498
1269	$-\text{CH}_2\text{CONHC}_2\text{H}_5$	553
1270	$-\text{OH}$	484
1271	$-\text{CO}_2\text{C}_2\text{H}_5$	540
1272	$-\text{CONH}_2$	511
1273	$-\text{CH}_2\text{OH}$	498
1274	$-\text{N}(\text{CH}_3)\text{CO}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$	597
1275	$-\text{NHCO}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$	583
1276	$-\text{CO}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$	568
1277	$-\text{NHCOCH}_3$	525
1278	$-\text{N}(\text{CH}_3)\text{COCH}_3$	539
1279	$-\text{COOH}$	512
1280	$-\text{N}(\text{CH}_3)\text{CO}(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$	567
1281	$-\text{NHCO}(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$	553

Таблица 155

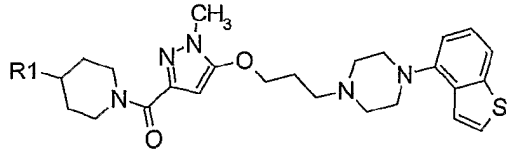
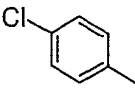
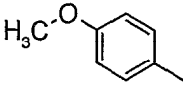
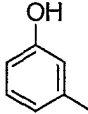
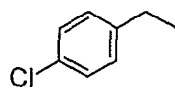
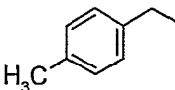
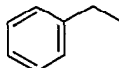
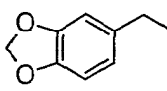
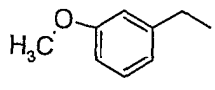
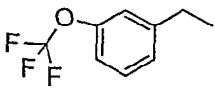
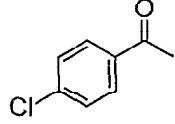
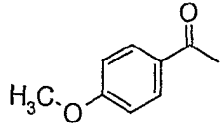
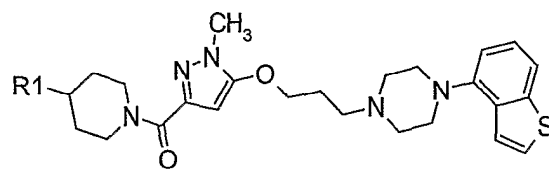
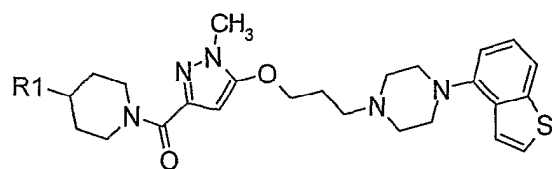
		
Пример	R1	МС (M+1)
1282		578
1283		574
1284		560
1285		592
1286		572
1287		558
1288		602
1289		588
1290		642
1291		606
1292		602

Таблица 156

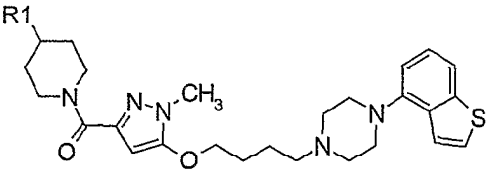
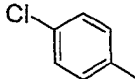
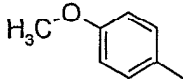
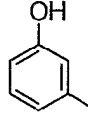
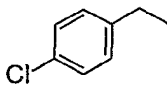
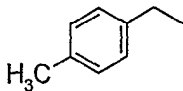
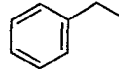
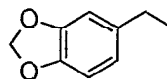
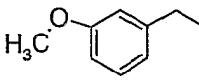
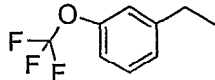
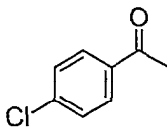
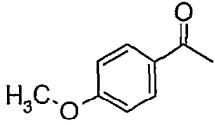


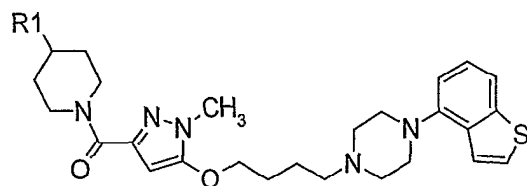
Пример	R1	МС (M+1)
1293		590
1294		572
1295		545
1296		561
1297		561
1298		575
1299		575
1300		587
1301		601

Таблица 157



Пример	R1	МС (M+1)
1302		651
1303		655
1304		593
1305		621

		
Пример	R1	МС (M+1)
1306		592
1307		588
1308		574
1309		606
1310		586
1311		572
1312		616
1313		602
1314		656
1315		620
1316		616



Пример	R1	МС (M+1)
1317	$-\text{OCH}_3$	512
1318	$-\text{CH}_2\text{CONHC}_2\text{H}_5$	567
1319	$-\text{OH}$	498
1320	$-\text{CO}_2\text{C}_2\text{H}_5$	554
1321	$-\text{CONH}_2$	525
1322	$-\text{CH}_2\text{OH}$	512
1323	$-\text{N}(\text{CH}_3)\text{CO}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$	611
1324	$-\text{NHCO}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$	597
1325	$-\text{CO}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$	582
1326	$-\text{NHCOCH}_3$	539
1327	$-\text{N}(\text{CH}_3)\text{COCH}_3$	553
1328	$-\text{N}(\text{CH}_3)\text{CO}(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$	581
1329	$-\text{NHCO}(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$	567
1330	$-\text{COOH}$	526

Таблица 160

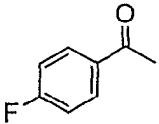
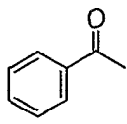
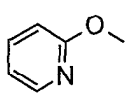
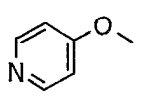
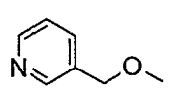
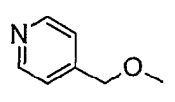
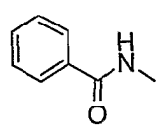
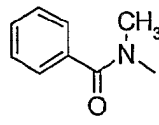
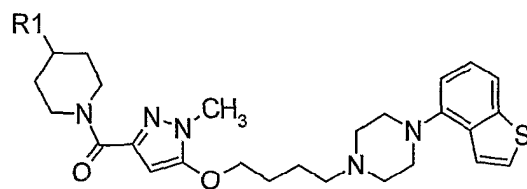
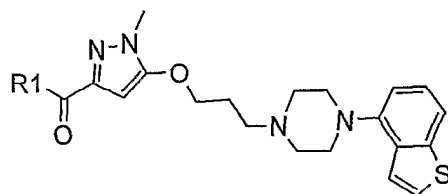
Пример	R1	МС (M+1)
1331		604
1332		586
1333		559
1334		575
1335		575
1336		589
1337		589
1338		601
1339		615

Таблица 161



Пример	R1	МС (M+1)
1340		665
1341		669
1342		607
1343		635

Таблица 162



Пример	R1	МС (М+1)
1344		644
1345		630
1346		497
1347		599
1348		511
1349		587
1350		573
1351		525
1352		553
1353		539

Таблица 163

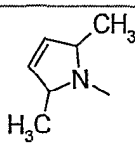
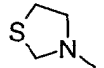
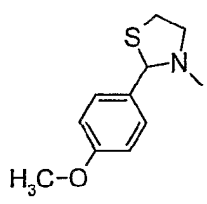
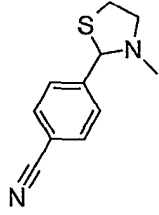
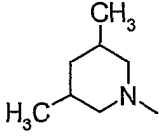
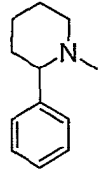
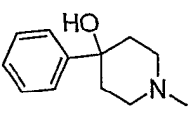
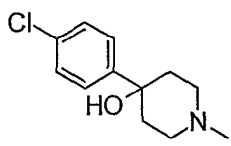
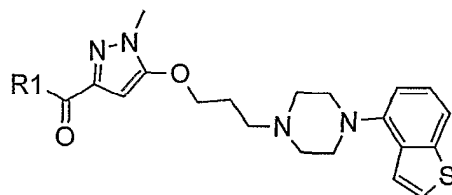
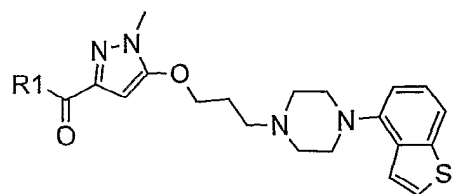
Пример	R1	МС (M+1)
1354		480
1355		472
1356		578
1357		573
1358		496
1359		544
1360		560
1361		594

Таблица 164

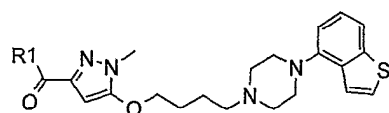


Пример	R1	МС (M+1)
1362		540
1363		600
1364		627
1365		484
1366		540
1367		512
1368		574
1369		526
1370		614



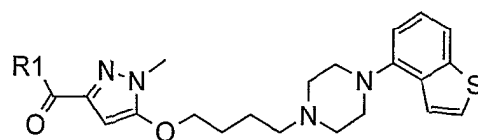
Пример	R1	МС (M+1)
1371		543
1372		486
1373		470
1374		498
1375		546
1376		559
1377		539
1378		483
1379		593
1380		573

Таблица 166



Пример	R1	МС (M+1)
1381		468
1382		658
1383		644
1384		511
1385		613
1386		484
1387		525
1388		601
1389		587
1390		539
1391		567
1392		553

Стр.: 310

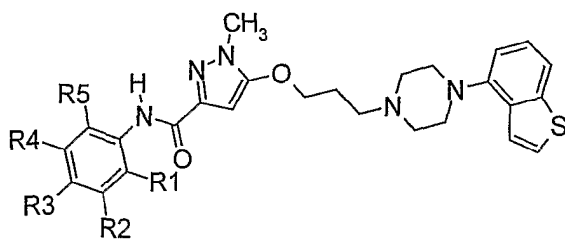


Пример	R1	МС(M+1)
1402		554
1403		614
1404		641
1405		498
1406		554
1407		526
1408		588
1409		540
1410		628

Таблица 169

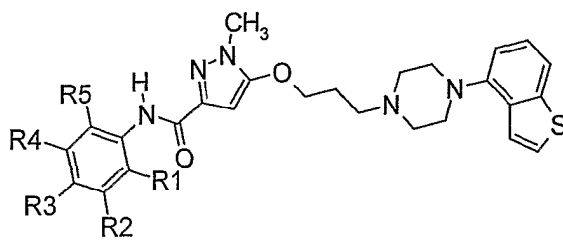
Пример	R1	МС (M+1)
1411		557
1412		500
1413		484
1414		512
1415		560
1416		573
1417		553
1418		497
1419		607
1420		587

Таблица 170



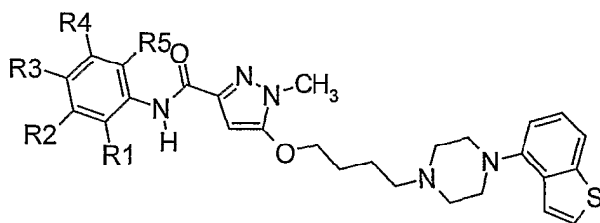
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	МС (М+1)
1421	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	560
1422	-H	-H	-H	-H	-SO ₂ NH ₂	555
1423	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	506
1424	-H	-H	-H	-OCH ₃	-H	506
1425	-H	-H	-COCH ₃	-H	-H	518
1426	-H	-H	-H	-H	-CO ₂ CH ₃	534
1427	-H	-H	-OCH ₃	-H	-OCH ₃	536
1428	-OCH ₃	-H	-H	-OCH ₃	-H	536
1429	-H	-OCH ₃	-H	-OCH ₃	-H	536
1430	-OCH ₃	-H	-H	-NHCOCH ₃	-H	563
1431	-H	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	536
1432	-H	-H	-N(CH ₃) ₂	-H	-H	519
1433	-H	-H	-H	-COCH ₃	-H	518
1434	-H	-H	-H	-NHCOCH ₃	-H	533
1435	-H	-H	-NHCOCH ₃	-H	-H	533
1436	-H	-CN	-H	-H	-H	501
1437	-OCH ₃	-H	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	564
1438	-H	-H	-OC ₆ H ₅	-H	-H	568
1439	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	592
1440	-H	-H	-OH	-Cl	-H	526
1441	-Cl	-H	-H	-NHCOCH ₃	-H	567
1442	-H	-CN	-H	-H	-Cl	535
1443	-Cl	-H	-H	-CONH ₂	-H	553
1444	-H	-H	-NO ₂	-H	-H	521
1445	-H	-H	-CN	-H	-H	501

Таблица 171



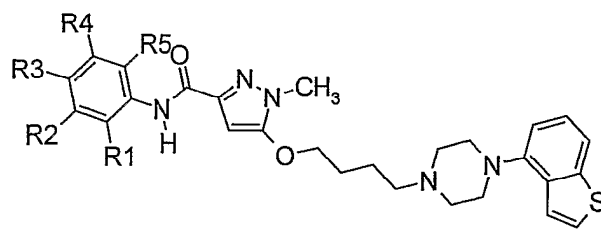
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	MC (M+1)
1446	-H	-H		-H	-H	558
1447	-H	-H		-H	-H	584
1448	-H	-H		-H	-H	561
1449	-H	-H		-H	-H	605
1450	-H	-H	-H		-H	587
1451	-H	-H	-H		-H	542

Таблица 172

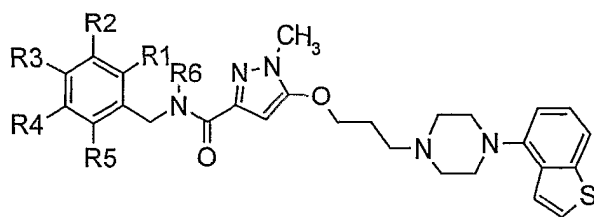


Пример	R1	R2	R3	R4	R5	МС (М+1)
1452	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	574
1453	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	520
1454	-H	-OCH ₃	-H	-H	-H	520
1455	-H	-H	-COCH ₃	-H	-H	532
1456	-CO ₂ CH ₃	-H	-H	-H	-H	548
1457	-OCH ₃	-H	-OCH ₃	-H	-H	550
1458	-H	-OCH ₃	-H	-H	-OCH ₃	550
1459	-H	-OCH ₃	-H	-OCH ₃	-H	550
1460	-H	-NHCOCH ₃	-H	-H	-OCH ₃	577
1461	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	550
1462	-H	-H	-N(CH ₃) ₂	-H	-H	533
1463	-H	-COCH ₃	-H	-H	-H	532
1464	-H	-NHCOCH ₃	-H	-H	-H	547
1465	-H	-H	-NHCOCH ₃	-H	-H	547
1466	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	-H	-OCH ₃	578
1467	-H	-H	-OC ₆ H ₅	-H	-H	582
1468	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	606
1469	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	-H	550
1470	-H	-Cl	-OH	-H	-H	540
1471	-H	-OCH ₂ C ₆ H ₅	-H	-H	-H	596
1472	-H	-H	-NHSO ₂ CH ₃	-H	-H	583
1473	-H	-H	-CONHC ₆ H ₅	-H	-H	609
1474	-H	-H	-CONHCH ₃	-H	-H	547
1475	-H	-H	-NHC ₆ H ₅	-H	-H	581
1476	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ OH	-H	-H	534
1477	-H	-H	-CCH	-H	-H	514
1478	-H	-H	-COC ₃ H ₇	-H	-H	560
1479	-NHCOCH ₃	-H	-H	-H	-H	547
1480	-H	-CONHCH ₃	-H	-H	-H	547

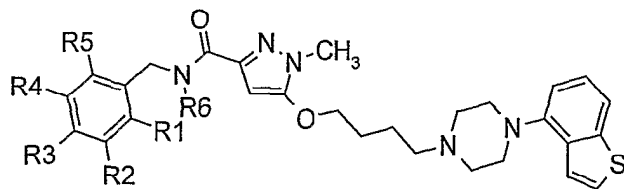
Таблица 173



Пример	R1	R2	R3	R4	R5	MC (M+1)
1481	-H	-H		-H	-H	573
1482	-H	-H		-H	-H	572
1483	-H		-H	-H	-H	601
1484	-H		-H	-H	-H	556
1485	-H		-H	-H	-H	557

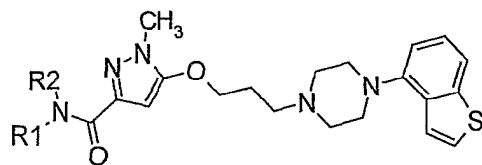


Пример	R1	R2	R3	R4	R5	R6	МС (M+1)
1486	-H	-H	-H	-H	-H	-H	490
1487	-Cl	-H	-H	-H	-H	-H	524
1488	-H	-Cl	-H	-H	-H	-H	524
1489	-H	-H	-Cl	-H	-H	-H	524
1490	-H	-H	-H	-H	-H	-CH ₂ CONHCH ₃	561
1491	-H	-H	-OC ₂ H ₅	-H	-H	-CH ₃	548
1492	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	-CH ₃	564
1493	-H	-H	-OC ₂ H ₅	-H	-H	-C ₂ H ₅	562
1494	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	-H	520
1495	-H	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	520
1496	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	-CH ₃	588
1497	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	-H	574
1498	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	-H	550
1499	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	-C ₂ H ₅	578
1500	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	520
1501	-H	-OCH ₃	-H	-OCH ₃	-H	-H	550
1502	-H	-OC ₄ H ₉	-H	-OC ₄ H ₉	-H	-H	634
1503	-OC ₂ H ₅	-H	-H	-H	-H	-H	534
1504	-H	-H	-H	-H	-H	-(CH ₂) ₃ OH	548
1505	-H	-Cl	-OCHF ₂	-H	-H	-H	590
1506	-H	-OCF ₃	-H	-H	-H	-H	574
1507	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	-CH ₃	534



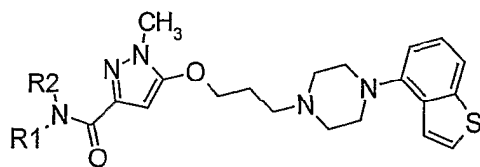
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	R6	МС (М+1)
1508	-H	-H	-H	-H	-H	-H	504
1509	-Cl	-H	-H	-H	-H	-H	538
1510	-H	-Cl	-H	-H	-H	-H	538
1511	-H	-H	-Cl	-H	-H	-H	538
1512	-H	-H	-H	-H	-H	-CH ₂ CONHCH ₃	575
1513	-H	-H	-OC ₂ H ₅	-H	-H	-CH ₃	562
1514	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	-CH ₃	578
1515	-H	-H	-OC ₂ H ₅	-H	-H	-C ₂ H ₅	576
1516	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	-H	534
1517	-H	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	534
1518	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	-CH ₃	602
1519	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	-H	588
1520	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	-H	564
1521	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	-C ₂ H ₅	592
1522	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	534
1523	-H	-OCH ₃	-H	-OCH ₃	-H	-H	564
1524	-H	-OC ₄ H ₉	-H	-OC ₄ H ₉	-H	-H	648
1525	-OC ₂ H ₅	-H	-H	-H	-H	-H	548
1526	-H	-H	-H	-H	-H	-(CH ₂) ₃ OH	562
1527	-H	-Cl	-OCHF ₂	-H	-H	-H	604
1528	-H	-OCF ₃	-H	-H	-H	-H	588
1529	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	-CH ₃	548

Таблица 176

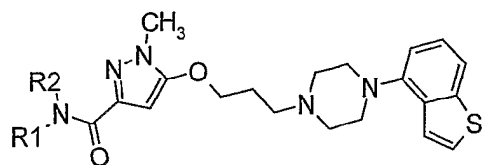


Пример	R1	R2	MC (M+1)
1530	-цикло-C ₆ H ₁₁	-CH ₃	496
1531	-цикло-C ₆ H ₁₁	-H	482
1532	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	512
1533	-CH ₂ CH ₂ OH	-CH ₂ CH ₂ OH	488
1534	-CH ₂ CH ₂ OH	-C ₂ H ₅	472
1535	-цикло-C ₆ H ₁₁	-CH ₂ CH ₂ OH	526
1536	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	516
1537	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	456
1538	-C ₄ H ₉	-H	456
1539	-C(CH ₃) ₃	-H	456
1540	-цикло-C ₃ H ₅	-H	440
1541	-CH ₃	-H	414
1542	-C ₂ H ₅	-H	428
1543	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	456
1544	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	-H	458
1545	-CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	-H	472
1546	-(CH ₂) ₃ OC ₂ H ₅	-H	486
1547	-(CH ₂) ₂ OC ₆ H ₅	-H	520
1548	-CH ₂ -цикло-C ₃ H ₅	-H	454
1549	-(CH ₂) ₂ NHCOCH ₃	-H	485
1550	-(CH ₂) ₅ OH	-H	486
1551	-(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	-H	504
1552	-CH ₂ CO ₂ CH ₃	-H	472
1553	-CH ₂ CONH ₂	-H	457
1554	-CH(CO ₂ C ₂ H ₅) ₂	-H	558
1555	-CH(CH ₃)CO ₂ C ₂ H ₅	-H	500
1556	-CH ₂ CO ₂ CH ₃	-CH ₃	486
1557	-CH ₂ CCH	-H	438
1558	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	470
1559	-(CH ₂) ₃ CO ₂ C ₂ H ₅	-CH ₃	528
1560	-(CH ₂) ₄ CO ₂ C ₂ H ₅	-H	528
1561	-CH(CONH ₂) ₂	-H	500
1562	-CH ₂ CF ₃	-H	482
1563	-NHCH ₂ CF ₃	-H	497
1564	-CH ₃	-CH ₃	428
1565	-(CH ₂) ₃ OCH(CH ₃) ₂	-H	500

Таблица 177

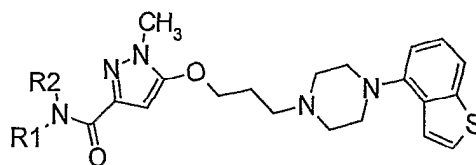


Пример	R1	R2	MC (M+1)
1566	-CH ₂ CN	-H	439
1567	-(CH ₂) ₂ OCH(CH ₃) ₂	-H	486
1568	-CH(C ₂ H ₅)CH ₂ OCH ₃	-H	486
1569	-CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	-H	472
1570	-CH ₂ CH ₂ F	-H	446
1571	-CH ₂ CH(OH)CH ₂ OH	-H	474
1572	-CH ₂ CONHCH ₃	-H	471
1573	-(CH ₂) ₂ SCH ₃	-H	474
1574	-CH ₂ CH ₂ OH	-H	444
1575	-C ₆ H ₁₃	-H	484
1576	-CH ₂ CON(CH ₃) ₂	-CH ₃	499
1577	-(CH ₂) ₂ N(CH ₃)COCH ₃	-H	499
1578	-(CH ₂) ₂ N(CH ₃)CO(CH ₂) ₂ CH ₃	-H	527

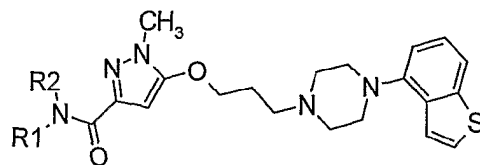


Пример	R1	R2	MC(M+1)
1579		-CH ₃	519
1580		-C ₂ H ₅	526
1581		-H	518
1582		-H	491
1583		-H	491
1584		-H	491
1585		-H	480
1586		-C ₂ H ₅	533
1587		-C ₂ H ₅	578
1588		-CH ₃	534
1589		-C ₂ H ₅	591
1590		-C ₂ H ₅	633

Таблица 179

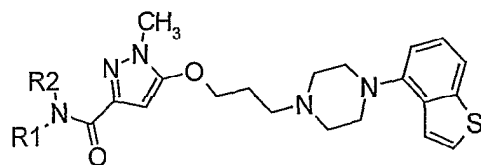


Пример	R1	R2	МС(M+1)
1591		-C ₂ H ₅	631
1592		-CH ₃	601
1593		-CH ₃	539
1594		-CH ₃	548
1595		-C ₂ H ₅	562
1596		-C ₂ H ₅	592
1597		-H	454
1598		-H	534
1599		-H	534
1600		-H	538
1601		-H	534
1602		-H	498
1603		-H	508

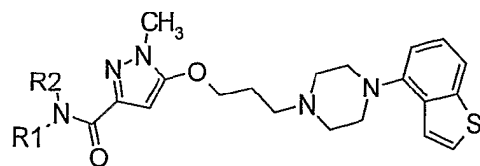


Пример	R1	R2	МС (М+1)
10 1604		-H	562
15 1605		-H	548
20 1606		-H	578
25 1607		-H	514
30 1608		-H	528
35 1609		-H	537
40 1610		-H	499
45 1611		-H	547
50 1612		-H	601
1613		-H	552
1614		-H	484

Таблица 181

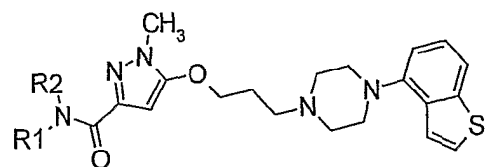


Пример	R1	R2	МС (М+1)
1615		-H	471
1616		-H	485
1617		-CH ₃	577
1618		-CH ₃	561
1619		-H	534
1620		-H	518
1621		-H	518
1622		-H	545
1623		-H	559
1624		-H	505
1625		-CH(CH ₃) ₂	547
1626		-CH ₃	619



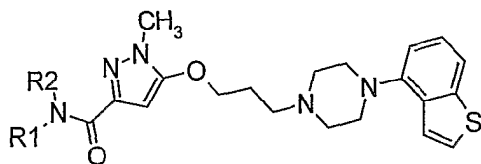
Пример	R1	R2	МС (M+1)
1627		-CH ₃	615
1628		-CH ₃	615
1629		-CH ₃	615
1630		-CH ₃	635
1631		-CH ₃	635
1632		-C ₄ H ₉	657
1633		-CH(CH ₃) ₂	643
1634		-H	583
1635		-H	569
1636		-C ₂ H ₅	573
1637		-H	540

Таблица 183

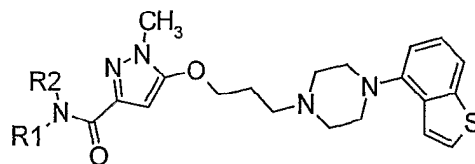


Пример	R1	R2	МС(M+1)	MW
1638		-H	558	557.72
1639		-H	558	557.68
1640		-H	572	571.70
1641		-H	543	542.71
1642		-H	530	529.67
1643		-H	559	558.63
1644		-H	525	524.69
1645		-H	484	483.64
1646		-H	506	505.65
1647		-H	486	485.61
1648		-H	505	504.66
1649		-H	505	504.66

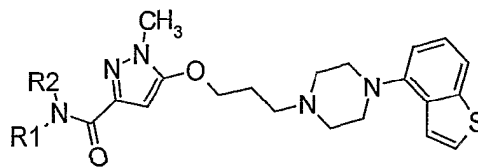
Таблица 184



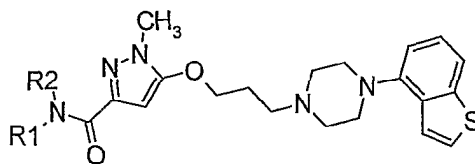
Пример	R1	R2	MC (M+1)
1650		-H	494
1651		-H	494
1652		-H	493
1653		-H	522
1654		-H	508
1655		-H	508
1656		-H	480
1657		-H	497
1658		-H	510
1659		-H	532
1660		-H	454
1661		-H	524



Пример	R1	R2	МС(M+1)
1662		-H	498
1663		-H	588
1664		-CH ₃	580
1665		-H	516
1666		-H	494
1667		-H	505
1668		-H	562
1669		-H	543
1670		-H	574
1671		-H	574

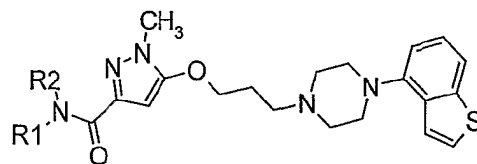


Пример	R1	R2	МС(M+1)
1672		-H	484
1673		-H	587
1674		-H	573
1675		-H	561
1676		-H	615
1677		-H	559
1678		-H	573
1679		-H	587
1680		-H	525
1681		-H	511



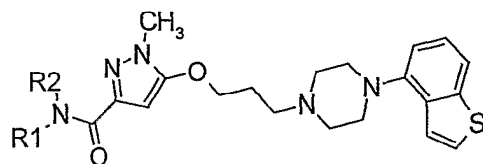
Пример	R1	R2	MC(M+1)
1682		-H	553
1683		-H	497
1684		-H	511
1685		-H	525
1686		-H	553
1687		-H	539
1688		-H	581
1689		-H	525
1690		-H	539
1691		-H	553
1692		-H	477

Таблица 188

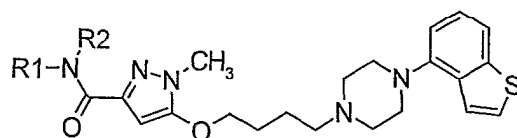


Пример	R1	R2	МС(M+1)
1693		-H	516
1694		-H	477
1695		-H	507
1696		-H	575
1697		-H	515
1698		-H	483
1699		-H	540
1700		-H	467
1701		-H	443
1702		-H	481
1703		-H	557

Таблица 189

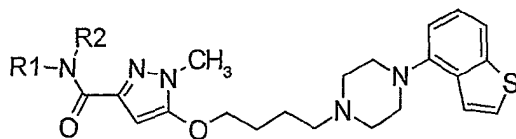


Пример	R1	R2	МС(M+1)
1704		-H	531
1705		-H	540
1706		-H	527
1707		-H	498
1708		-H	509
1709		-H	532
1710		-H	481
1711		-H	480
1712		-H	497
1713		-H	467



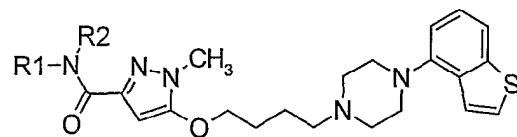
Пример	R1	R2	МС(M+1)
1714	-CH ₃	-цикло-C ₆ H ₁₁	510
1715	-H	-цикло-C ₆ H ₁₁	496
1716	-H	-CH(CH ₃) ₂	456
1717	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	526
1718	-CH ₂ CH ₂ OH	-CH ₂ CH ₂ OH	502
1719	-C ₂ H ₅	-CH ₂ CH ₂ OH	486
1720	-CH ₂ CH ₂ OH	-цикло-C ₆ H ₁₁	540
1721	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	530
1722	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	470
1723	-H	-C ₄ H ₉	470
1724	-H	-C(CH ₃) ₃	470
1725	-H	-цикло-C ₃ H ₅	454
1726	-H	-CH ₃	428
1727	-H	-C ₂ H ₅	442
1728	-H	-C ₃ H ₇	456
1729	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	470
1730	-H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	472
1731	-H	-CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	486
1732	-H	-(CH ₂) ₃ OC ₂ H ₅	500
1733	-H	-(CH ₂) ₂ OC ₆ H ₅	534
1734	-H	-CH ₂ -цикло-C ₃ H ₅	468
1735	-H	-(CH ₂) ₂ NHCOCH ₃	499
1736	-H	-(CH ₂) ₅ OH	500
1737	-H	-(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	518
1738	-H	-CH ₂ CO ₂ CH ₃	486
1739	-H	-CH ₂ CONH ₂	471
1740	-H	-CH(CO ₂ C ₂ H ₅) ₂	572
1741	-H	-CH(CH ₃)CO ₂ C ₂ H ₅	514
1742	-CH ₃	-CH ₂ CO ₂ CH ₃	500
1743	-H	-CH ₂ CCH	452
1744	-H	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃) ₂	484
1745	-CH ₃	-(CH ₂) ₃ CO ₂ C ₂ H ₅	542
1746	-H	-(CH ₂) ₄ CO ₂ C ₂ H ₅	542
1747	-H	-CH(CONH ₂) ₂	514
1748	-H	-CH ₂ CF ₃	496
1749	-H	-NHCH ₂ CF ₃	511

Таблица 191



Пример	R1	R2	МС (М+1)
1750	-CH ₃	-CH ₃	442
1751	-H	-CH ₂ CH(OCH ₃) ₂	502
1752	-H	-(CH ₂) ₃ OCH(CH ₃) ₂	514
1753	-H	-CH ₂ CN	453
1754	-H	-(CH ₂) ₃ OCH ₃	486
1755	-H	-(CH ₂) ₂ OCH(CH ₃) ₂	500
1756	-H	-CH(C ₂ H ₅)CH ₂ OCH ₃	500
1757	-H	-CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	486
1758	-H	-CH ₂ CH ₂ F	460
1759	-H	-CH ₂ CH(OH)CH ₂ OH	488
1760	-H	-CH ₂ CONHCH ₃	485
1761	-H	-(CH ₂) ₂ SCH ₃	488
1762	-H	-CH ₂ CH ₂ OH	458
1763	-H	-C ₆ H ₁₃	498
1764	-CH ₃	-CH ₂ CON(CH ₃) ₂	513
1765	-H	-(CH ₂) ₂ N(CH ₃)COCH ₃	513
1766	-H	-(CH ₂) ₂ N(CH ₃)CO(CH ₂) ₂ CH ₃	541

Таблица 192



Пример	R1	R2	МС (М+1)
1767		-CH ₃	533
1768		-C ₂ H ₅	540
1769		-H	532
1770		-H	505
1771		-H	505
1772		-H	505
1773		-H	494
1774		-C ₂ H ₅	547
1775		-C ₂ H ₅	592
1776		-CH ₃	548
1777		-C ₂ H ₅	605
1778		-C ₂ H ₅	647

Таблица 193

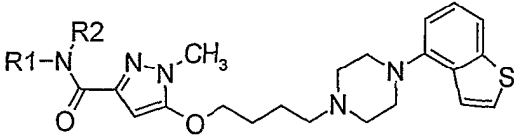
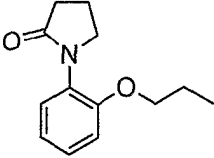
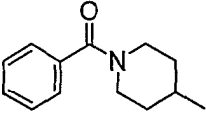
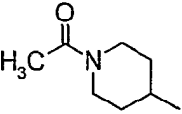
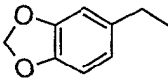
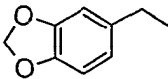
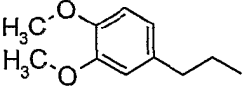
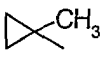
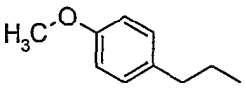
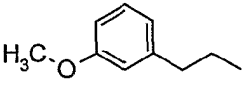
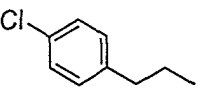
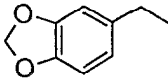
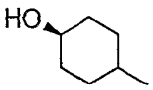
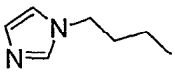
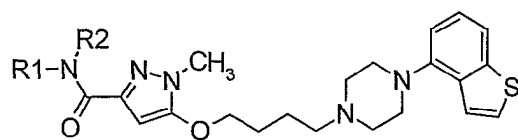
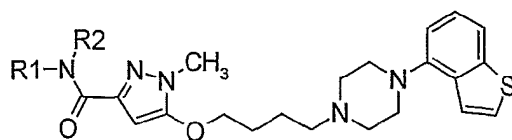
				
Пример	R1	R2	МС (М+1)	
1779		-C ₂ H ₅	645	
1780		-CH ₃	615	
1781		-CH ₃	553	
1782		-CH ₃	562	
1783		-C ₂ H ₅	576	
1784		-C ₂ H ₅	606	
1785		-H	468	
1786		-H	548	
1787		-H	548	
1788		-H	552	
1789		-H	548	
1790		-H	512	
1791		-H	522	

Таблица 194

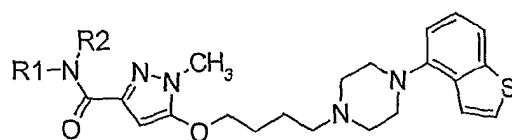


Пример	R1	R2	MC (M+1)
1792		-H	576
1793		-H	562
1794		-H	592
1795		-H	528
1796		-H	542
1797		-H	551
1798		-H	513
1799		-H	561
1800		-H	615
1801		-H	566
1802		-H	498



Пример	R1	R2	МС(M+1)
1803		-H	485
1804		-H	499
1805		-CH ₃	591
1806		-CH ₃	575
1807		-H	548
1808		-H	532
1809		-H	532
1810		-H	559
1811		-H	573
1812		-H	519
1813		-CH(CH ₃) ₂	561
1814		-H	470

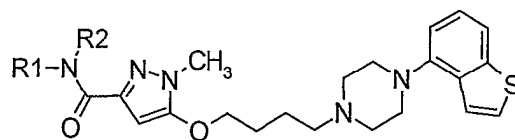
Таблица 196



Пример	R1	R2	MC (M+1)
1815		-CH ₃	633
1816		-CH ₃	629
1817		-CH ₃	629
1818		-CH ₃	629
1819		-CH ₃	649
1820		-C ₄ H ₉	649
1821		-C ₄ H ₉	671
1822		-CH(CH ₃) ₂	657
1823		-H	597
1824		-H	583
1825		-C ₂ H ₅	587

Стр.: 340

Таблица 198

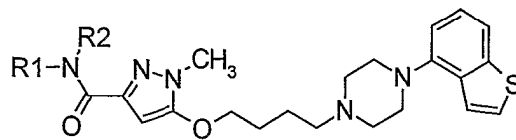


Пример	R1	R2	MC(M+1)
1837		-H	519
1838		-H	519
1839		-H	508
1840		-H	508
1841		-H	507
1842		-H	536
1843		-H	522
1844		-H	522
1845		-H	494
1846		-H	511
1847		-H	524
1848		-H	546
1849		-H	538

Таблица 199

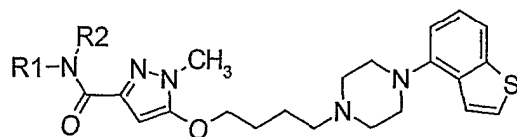
Пример	R1	R2	МС(M+1)
1850		-H	512
1851		-H	602
1852		-CH ₃	594
1853		-H	530
1854		-H	508
1855		-H	519
1856		-H	576
1857		-H	557
1858		-H	588
1859		-H	588
1860		-H	498

Таблица 200

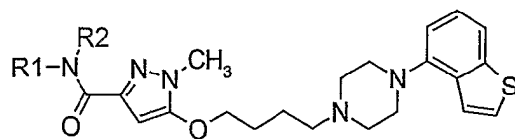


Пример	R1	R2	MC(M+1)
1861		-H	601
1862		-H	587
1863		-H	575
1864		-H	629
1865		-H	573
1866		-H	587
1867		-H	601
1868		-H	539
1869		-H	525
1870		-H	567

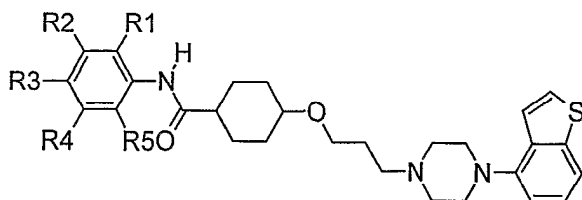
Пример	R1	R2	МС(M+1)
1871		-H	511
1872		-H	525
1873		-H	539
1874		-H	567
1875		-H	553
1876		-H	595
1877		-H	539
1878		-H	553
1879		-H	567
1880		-H	491
1881		-H	530



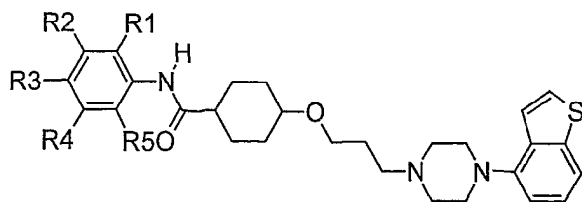
Пример	R1	R2	МС(M+1)
1882		-H	541
1883		-H	505
1884		-CH ₃	520
1885		-CH ₃	612
1886		-H	521
1887		-H	589
1888		-H	529
1889		-H	577
1890		-H	505
1891		-H	497
1892		-H	541



Пример	R1	R2	МС(M+1)
1893		-H	456
1894		-H	545
1895		-H	508
1896		-H	546
1897		-H	494
1898		-H	555

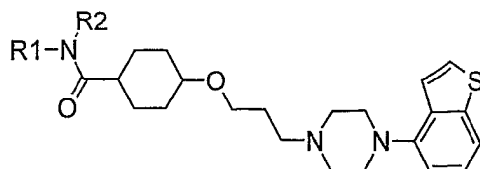


Пример	R1	R2	R3	R4	R5	MC(M+1)
1899	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	562
1900	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	508
1901	-H	-OCH ₃	-H	-H	-H	508
1902	-OCH ₃	-H	-OCH ₃	-H	-H	538
1903	-H	-OCH ₃	-H	-H	-OCH ₃	538
1904	-H	-OCH ₃	-H	-OCH ₃	-H	538
1905	-H	-NHCOCH ₃	-H	-H	-OCH ₃	565
1906	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	538
1907	-H	-H	-N(CH ₃) ₂	-H	-H	521
1908	-H	-COCH ₃	-H	-H	-H	520
1909	-H	-NHCOCH ₃	-H	-H	-H	535
1910	-H	-H	-NHCOCH ₃	-H	-H	535
1911	-H	-H	-H	-CN	-H	503
1912	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	-H	-OCH ₃	566
1913	-H	-H	-OC ₆ H ₅	-H	-H	570
1914	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	594
1915	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	-H	538
1916	-H	-Cl	-OH	-H	-H	528
1917	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-H	-H	-Cl	584
1918	-H	-H	-CN	-H	-H	503
1919	-H	-OCH ₂ C ₆ H ₅	-H	-H	-H	584
1920	-H	-H	-NHCO ₂ CH ₃	-H	-H	571
1921	-H	-H	-CONHC ₆ H ₅	-H	-H	597
1922	-H	-H	-CONHCH ₃	-H	-H	535
1923	-H	-H	-NHC ₆ H ₅	-H	-H	569
1924	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ OH	-H	-H	522
1925	-H	-H	-C≡CH	-H	-H	502
1926	-NHCOCH ₃	-H	-H	-H	-H	535
1927	-H	-CONHCH ₃	-H	-H	-H	535



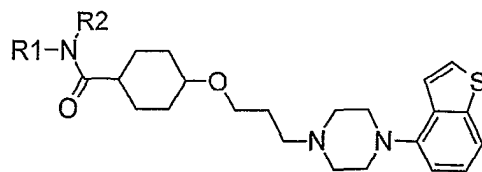
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	MC(M+1)
1928	-H	-H		-H	-H	561
1929	-H	-H		-H	-H	607
1930	-H		-H	-H	-H	589
1931	-H		-H	-H	-H	545

Таблица 206



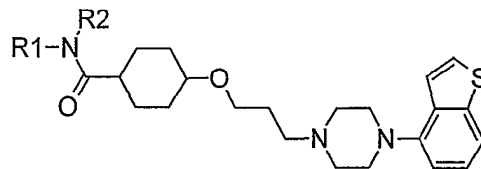
Пример	R1	R2	МС(M+1)
1932	-CH ₃	-цикло-C ₆ H ₁₁	498
1933	-цикло-C ₆ H ₁₁	-H	484
1934	-C ₄ H ₉	-C ₄ H ₉	514
1935	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	514
1936	-CH ₂ CH ₂ OH	-CH ₂ CH ₂ OH	490
1937	-C ₂ H ₅	-CH ₂ CH ₂ OH	474
1938	-CH ₂ CH ₂ OH	-цикло-C ₆ H ₁₁	528
1939	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	518
1940	-C ₃ H ₇	-CH ₂ -цикло-C ₃ H ₅	498
1941	-цикло-C ₅ H ₉	-CH ₂ CH=CH ₂	510
1942	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	458
1943	-C ₄ H ₉	-H	458
1944	-C(CH ₃) ₃	-H	458
1945	-цикло-C ₃ H ₅	-H	442
1946	-C ₂ H ₅	-H	430
1947	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	-H	460
1948	-C ₄ H ₉	-C ₂ H ₅	486
1949	-CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	-H	474
1950	-(CH ₂) ₃ OC ₂ H ₅	-H	488
1951	-цикло-C ₅ H ₉	-H	470
1952	-CH ₂ -цикло-C ₃ H ₅	-H	456
1953	-CH ₂ -цикло-C ₆ H ₁₁	-H	498
1954	-(CH ₂) ₂ NHCOCH ₃	-H	487
1955	-(CH ₂) ₅ OH	-H	488
1956	-CH ₂ CONH ₂	-H	459
1957	-CH ₂ C≡CH	-H	440
1958	-CH ₃	-CH(CH ₃) ₂	458
1959	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	472
1960	-CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃	-H	486
1961	-CH ₂ C(CH ₃) ₃	-H	472
1962	-CH ₂ CH(C ₂ H ₅) ₂	-H	486
1963	-CH(CONH ₂) ₂	-H	502
1964	-CH ₂ -цикло-C ₃ H ₅	-CH ₃	470
1965	-CH(CONH ₂) ₂	-H	499

Таблица 207

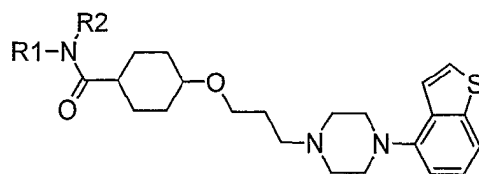


Пример	R1	R2	МС(M+1)
1966	-CH ₃	-CH ₃	430
1967	-(CH ₂) ₃ OCH(CH ₃) ₂	-H	502
1968	-CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃	-H	486
1969	-CH(C ₂ H ₅) ₂	-H	472
1970	-CH ₂ CN	-H	441
1971	-(CH ₂) ₃ OCH ₃	-H	474
1972	-(CH ₂) ₂ OCH(CH ₃) ₂	-H	488
1973	-CH(C ₂ H ₅)CH ₂ OCH ₃	-H	488
1974	-CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	-H	474
1975	-CH ₂ CH ₂ F	-H	448
1976	-CH ₂ CH(OH)CH ₂ OH	-H	476
1977	-CH ₂ CONHCH ₃	-H	473
1978	-(CH ₂) ₂ SCH ₃	-H	476
1979	-CH ₂ CH ₂ OH	-H	446
1980	-CH ₂ CHF ₂	-H	466
1981	-C ₆ H ₁₃	-H	486
1982	-CH ₂ CH ₂ NHCONH ₂	-H	488

Таблица 208



Пример	R1	R2	MC (M+1)
1983		-CH ₃	508
1984		-H	479
1985		-H	479
1986		-H	479
1987		-H	493
1988		-H	509
1989		-H	493
1990		-H	485
1991		-H	486
1992		-H	500
1993		-H	470
1994		-H	496
1995		-H	529



10

15

20

25

30

35

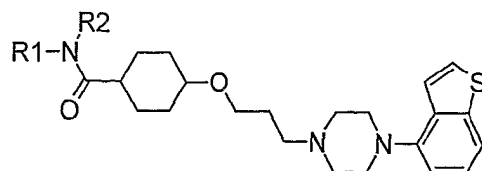
40

45

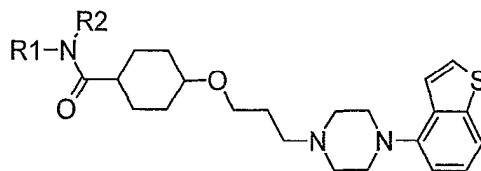
50

Пример	R1	R2	МС (M+1)
1996		-H	511
1997		-H	469
1998		-H	518
1999		-H	517
2000		-H	533
2001		-H	518
2002		-H	551
2003		-H	529
2004		-H	529
2005		-H	543
2006		-H	577

Таблица 210

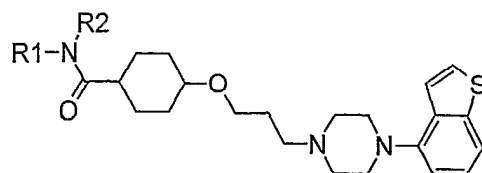


Пример	R1	R2	MC (M+1)
2007		-H	565
2008		-H	561
2009		-H	444
2010		-C ₂ H ₅	528
2011		-H	482
2012		-H	456
2013		-H	484
2014		-H	500
2015		-H	510
2016		-H	473
2017		-H	487
2018		-H	472
2019		-H	498



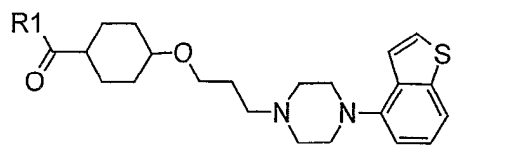
Пример	R1	R2	MC (M+1)
2020		-H	498
2021		-C ₂ H ₅	484
2022		-H	527
2023		-H	486
2024		-H	488
2025		-H	502
2026		-H	496
2027		-H	496
2028		-H	495
2029		-H	524
2030		-H	524
2031		-H	510
2032		-H	510

Таблица 212

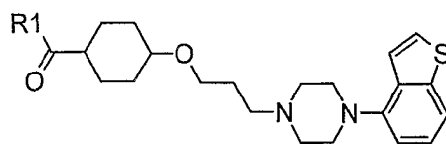


Пример	R1	R2	MC (M+1)
2033		-H	512
2034		-H	498
2035		-H	482
2036		-H	499
2037		-H	512
2038		-H	456
2039		-H	500
2040		-H	482
2041		-H	496
2042		-H	486
2043		-CH ₃	510
2044		-CH ₃	524
2045		-CH ₃	525
2046		-H	510

Таблица 213

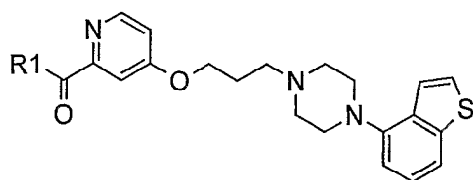


Пример	R1	МС (M+1)
2047		456
2048		486
2049		499
2050		472
2051		513
2052		482
2053		474
2054		488
2055		472
2056		500
2057		498
2058		470



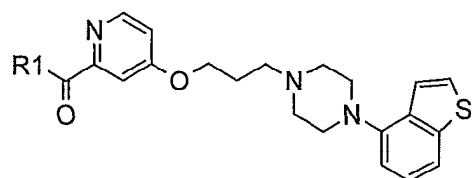
Пример	R1	МС (M+1)
2059		486
2060		484
2061		484
2062		498
2063		486
2064		513
2065		500
2066		500
2067		527
2068		514
2069		528
2070		513
2071		485

Таблица 215



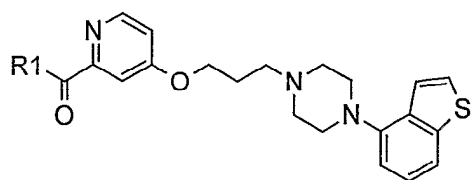
Пример	R1	МС (M+1)
2072		523
2073		483
2074		477
2075		469
2076		467
2077		495
2078		556
2079		513
2080		552
2081		494

Таблица 216



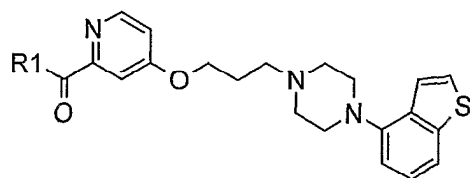
Пример	R1	МС (М+1)
2082		557
2083		591
2084		591
2085		571
2086		571
2087		575
2088		510
2089		508
2090		479
2091		479

Таблица 217

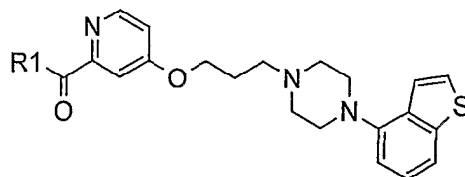


Пример	R1	МС (М+1)
2092		481
2093		508
2094		495
2095		509
2096		495
2097		557
2098		508
2099		495
2100		540

Таблица 218

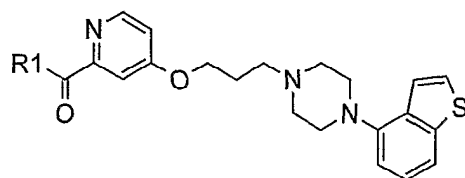


Пример	R1	МС (M+1)
2101		564
2102		550
2103		481
2104		494
2105		499
2106		527
2107		550
2108		545
2109		575



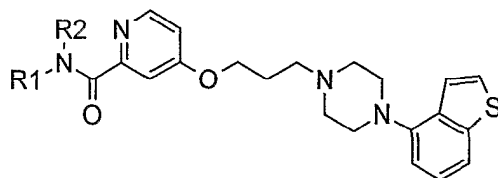
Пример	R1	МС (М+1)
2110		570
2111		563
2112		493
2113		522
2114		523
2115		480
2116		557
2117		520
2118		533

Таблица 220

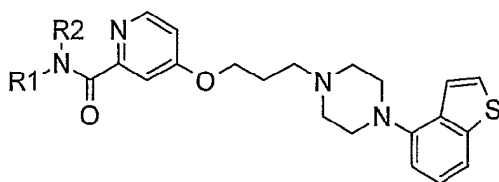


Пример	R1	МС М+1)
2119		560
2120		481
2121		543
2122		542
2123		542

Таблица 221

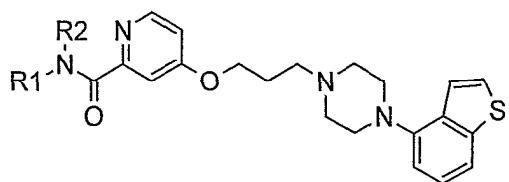


Пример	R1	R2	МС (M+1)
2124	-CH ₃	-цикло -C ₆ H ₁₁	493
2125	-H	-цикло -C ₆ H ₁₁	479
2126	-CH ₂ CH ₂ OH	-CH ₂ CH ₂ OH	485
2127	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	482
2128	-H	-C ₄ H ₉	453
2129	-H	-цикло -C ₃ H ₅	437
2130	-H	-CH ₂ C ₆ H ₅	487
2131	-CH ₃	-CH ₂ C ₆ H ₅	501
2132	-C ₂ H ₅	-CH(CH ₃) ₂	467
2133	-H	-CH ₃	411
2134	-H	-C ₂ H ₅	425
2135	-H	-C ₃ H ₇	439
2136	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	453
2137	-H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	455
2138	-H	-CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	469
2139	-H	-(CH ₂) ₂ OC ₆ H ₅	517
2140	-H	-цикло -C ₅ H ₉	465
2141	-H	-CH ₂ -цикло -C ₆ H ₁₁	493
2142	-H	-CH(CH ₃)C ₆ H ₅	501
2143	-H	-CH ₂ CONH ₂	454

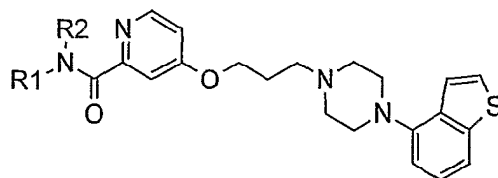


Пример	R1	R2	МС (М+1)
2144	-H	-CH(CH ₃) ₂	439
2145	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	453
2146	-H	-(CH ₂) ₅ OH	483
2147	-H	-CH ₂ CCH	435
2148	-CH ₃	-CH(CH ₃) ₂	453
2149	-H	-CH ₂ C(CH ₃) ₃	467
2150	-H	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	468
2151	-H	-CH(CONH ₂) ₂	497
2152	-CH ₃	-CH ₂ -цикло -C ₃ H ₅	465
2153	-CH ₃	-(CH ₂) ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	510
2154	-H	-CH ₂ CF ₃	479
2155	-H	-NHCH ₂ CF ₃	494
2156	-CH ₃	-CH ₃	425
2157	-H	-CH ₂ CH(OCH ₃) ₂	485
2158	-H	-(CH ₂) ₃ OCH(CH ₃) ₂	497
2159	-H	-CH(C ₂ H ₅) ₂	467
2160	-H	-CH ₂ CN	436
2161	-H	-(CH ₂) ₂ OCH(CH ₃) ₂	483
2162	-H	-CH(C ₂ H ₅)CH ₂ OCH ₃	483
2163	-H	-CH ₂ CH ₂ F	443
2164	-H	-CH ₂ CONHCH ₃	468
2165	-H	-(CH ₂) ₂ SCH ₃	471
2166	-H	-CH ₂ CHF ₂	461
2167	-CH ₃	-(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ NHCH ₃	512

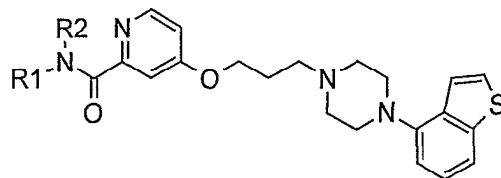
Таблица 223



Пример	R1	R2	МС (М+1)
2168	-CH ₃		508
2169	-H		515
2170	-H		521
2171	-H		521
2172	-H		521
2173	-H		488
2174	-H		488
2175	-H		488
2176	-H		477
2177	-CH ₃		536

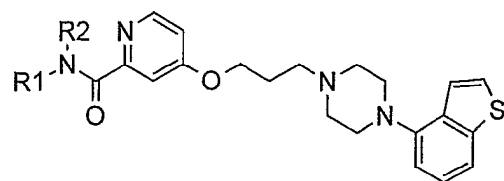


Пример	R1	R2	МС (M+1)
2178	-CH ₃		531
2179	-H		451
2180	-H		517
2181	-H		517
2182	-H		555
2183	-H		571
2184	-H		531
2185	-H		552
2186	-H		495
2187	-H		505



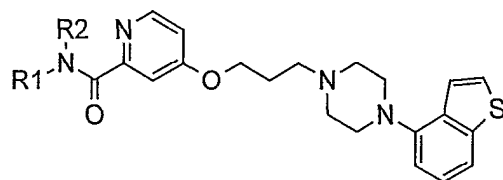
Пример	R1	R2	МС (М+1)
2188	-H		547
2189	-H		501
2190	-H		505
2191	-H		496
2192	-H		544
2193	-H		481
2194	-H		468
2195	-H		517
2196	-H		508

Таблица 226

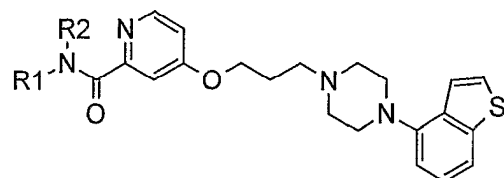


Пример	R1	R2	МС (M+1)
2197	-H		508
2198	-H		494
2199	-H		510
2200	-H		453
2201	-H		467
2202	-H		555
2203	-H		537
2204	-H		527
2205	-H		527
2206	-H		493

Таблица 227

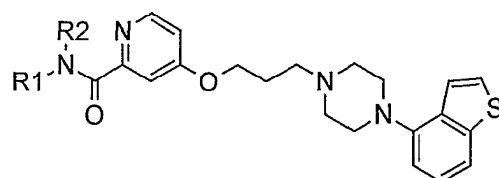


Пример	R1	R2	МС (М+1)
2207	-H		556
2208	-H		555
2209	-H		555
2210	-C ₂ H ₅		479
2211	-H		522
2212	-H		481
2213	-H		503
2214	-H		483
2215	-H		497



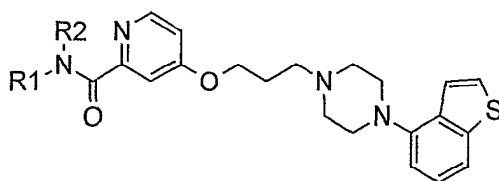
Пример	R1	R2	MC(M+1)
2216	-H		491
2217	-H		491
2218	-H		490
2219	-H		519
2220	-H		505
2221	-H		505
2222	-H		507
2223	-H		493

Таблица 229



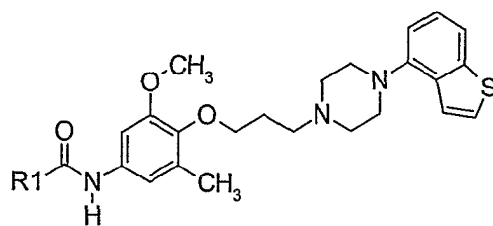
Пример	R1	R2	МС:(М+1)
2224	-H		477
2225	-H		494
2226	-H		529
2227	-H		451
2228	-H		495
2229	-H		505
2230	-H		519
2231	-H		519
2232	-H		519

Таблица 230

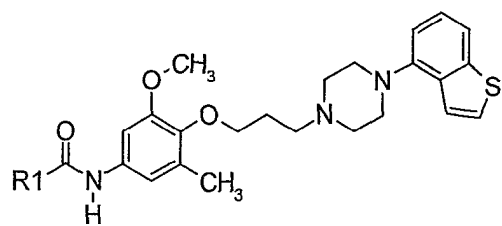


Пример	R1	R2	МС (М+1)
2233	-H		537
2234	-H		543
2235	-H		513
2236	-H		513
2237	-H		502
2238	-H		506

Таблица 231

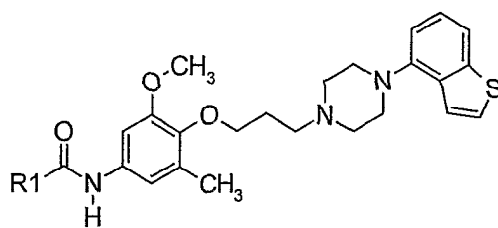


Пример	R1	МС (М+1)
2239	-2-пиридил	517
2240	-3-пиридил	517
2241	-4-пиридил	517
2242	-2-фурил	506
2243	-2-тиенил	522
2244	-3-фурил	506
2245	-3-тиенил	522
2246	-CH ₃	454
2247	-C ₂ H ₅	468
2248	-C ₃ H ₇	482
2249	-CH(CH ₃) ₂	482
2250	-цикло-C ₃ H ₅	480
2251	-цикло-C ₅ H ₉	508
2252	-цикло-C ₆ H ₁₁	522
2253	-CH ₂ -цикло-C ₃ H ₅	494
2254	-CH ₂ -цикло-C ₆ H ₁₁	536
2255	-CH ₂ OCH ₃	484
2256	-CH ₂ N(CH ₃) ₂	497
2257	-(CH ₂) ₃ N(CH ₃) ₂	525
2258	-(CH ₂) ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	539
2259	-CH ₂ NHCHO	497
2260	-CH ₂ N(CH ₂ CH ₂ OH) ₂	557
2261	-CH ₂ N(CH ₃)CO ₂ C(CH ₃) ₃	583
2262	-(CH ₂) ₃ NHCO ₂ C(CH ₃) ₃	597
2263	-CH ₂ NHCH ₃	483
2264	-(CH ₂) ₃ NH ₂	497
2265	-CH ₂ NHCOCH ₃	511



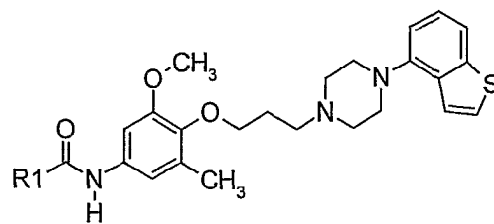
Пример	R1	МС(M+1)
2266		547
2267		551
2268		585
2269		563
2270		551
2271		533
2272		567
2273		551
2274		505

Таблица 233



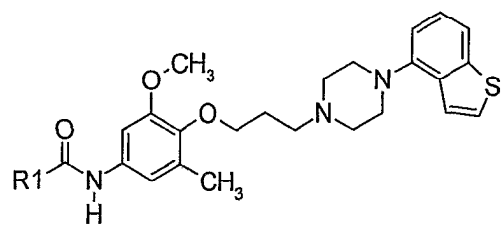
Пример	R1	МС (M+1)
2275		556
2276		551
2277		519
2278		535
2279		518
2280		532
2281		523
2282		534
2283		590

Таблица 234



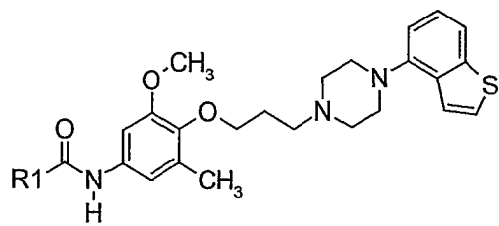
Пример	R1	МС(M+1)
2284		556
2285		589
2286		521
2287		523
2288		535
2289		549
2290		520
2291		520

Таблица 235



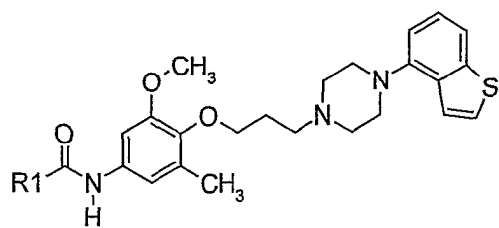
Пример	R1	МС(M+1)
2292		520
2293		521
2294		521
2295		565
2296		579
2297		523
2298		541
2299		510
2300		524

Таблица 236



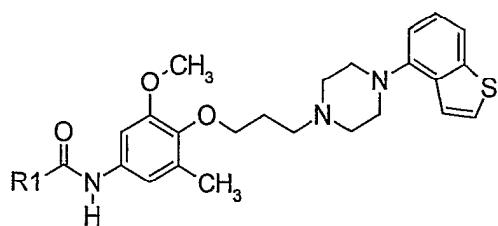
Пример	R1	МС (М+1)
2301		623
2302		609
2303		595
2304		595
2305		623
2306		623
2307		523
2308		509
2309		495

Таблица 237



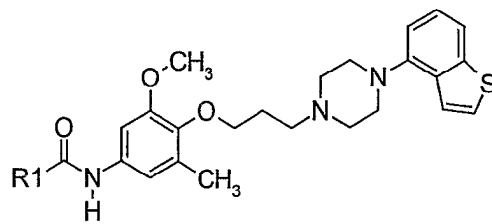
Пример	R1	МС (M+1)
2310		495
2311		523
2312		523

Таблица 238

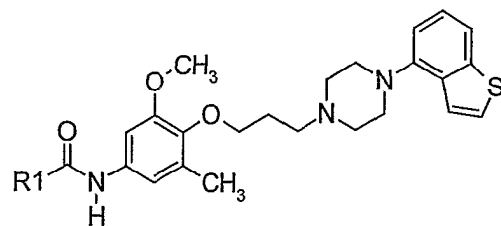


Пример	R1	МС(M+1)
2313		545
2314		531
2315		531
2316		531
2317		536
2318		536
2319		522
2320		551
2321		543

Таблица 239

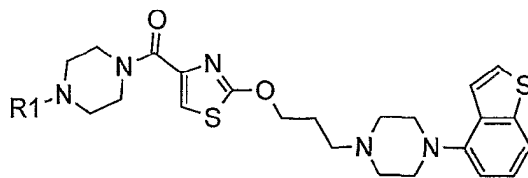


Пример	R1	МС(M+1)
2322		543
2323		563
2324		543
2325		556
2326		551
2327		532
2328		582
2329		520
2330		522



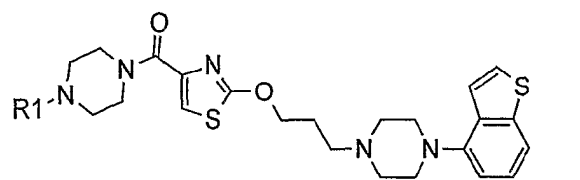
Пример	R1	МС (М+1)
2331		538
2332		532
2333		637
2334		651
2335		673
2336		537
2337		551
2338		573

Таблица 241



Пример	R1	МС(M+1)
2339	-2-пиридил	549
2340	-C ₄ H ₉	528
2341	-CH(CH ₃) ₂	514
2342	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	543
2343	-4-пиридил	549
2344	-C ₆ H ₅	548
2345	-C ₃ H ₇	514
2346	-CH ₃	486
2347	-3-пиридил	549
2348	-C ₆ H ₁₃	556
2349	-C ₂ H ₅	500
2350	-CH ₂ CH ₂ OH	516
2351	-COCH ₃	514
2352	-цикло-C ₆ H ₁₁	554
2353	-SO ₂ C ₂ H ₅	564

Таблица 242



Пример	R1	МС(M+1)
2354		563
2355		563
2356		563
2357		550
2358		569
2359		634
2360		550
2361		566
2362		577

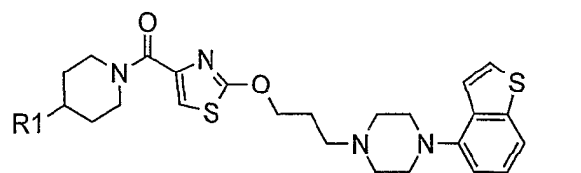
Таблица 243

Пример	R1	МС(M+1)
2363		577
2364		583
2365		555
2366		540

Таблица 244

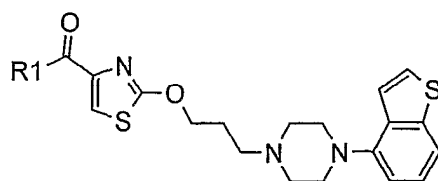
Пример	R1	МС(M+1)
2367	-OCH ₃	501
2368	-цикло -C ₆ H ₁₁	553
2369	-C ₆ H ₅	547
2370	-OCH ₂ C ₆ H ₅	577
2371	-OC ₆ H ₅	563
2372	-OH	487
2373	-CONH ₂	514
2374	-CH ₂ OH	501
2375	-C ₂ H ₅	499
2376	-NHCOCH ₃	528
2377	-COC ₆ H ₅	575
2378	-2-пиридил	548

Таблица 245



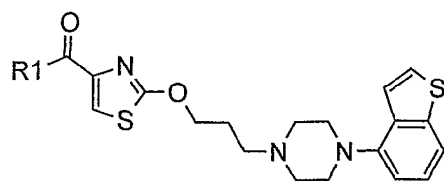
Пример	R1	МС(M+1)
2379		554
2380		578
2381		578
2382		556
2383		564
2384		564

Таблица 246



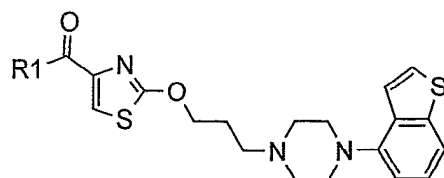
Пример	R1	МС(M+1)
2385		485
2386		502
2387		525
2388		489
2389		475
2390		511
2391		539
2392		547
2393		576

Таблица 247



Пример	R1	МС(M+1)
2394		519
2395		563
2396		558
2397		519
2398		505
2399		500
2400		548
2401		563
2402		487

Таблица 248



Пример	R1	МС(M+1)
2403		515
2404		577
2405		473
2406		546
2407		570
2408		505
2409		533
2410		486
2411		545

Таблица 249

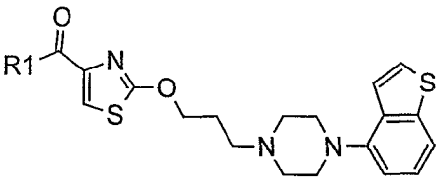
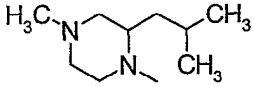
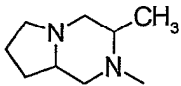
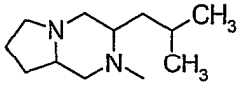
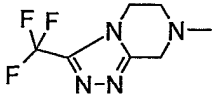
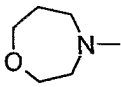
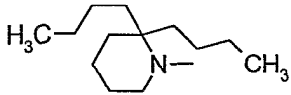
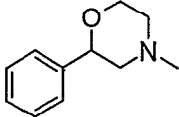
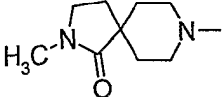
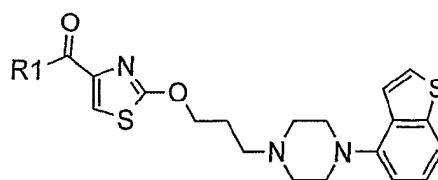
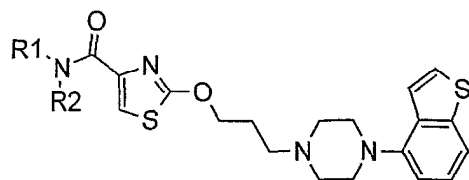
		
Пример	R1	МС(M+1)
2412		542
2413		526
2414		568
2415		539
2416		578
2417		487
2418		583
2419		549
2420		554

Таблица 250



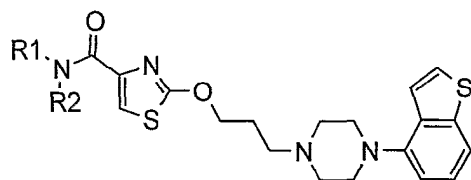
Пример	R1	МС(M+1)
2421		548
2422		546
2423		553
2424		561
2425		526
2426		443

Таблица 251

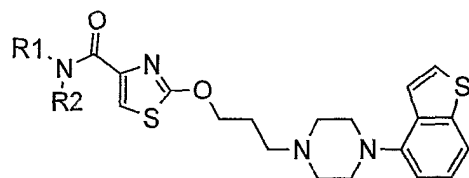


Пример	R1	R2	МС (М+1)
2427	-цикло-C ₆ H ₁₁	-CH ₃	499
2428	-H	-цикло-C ₆ H ₁₁	485
2429	-H	-CH(CH ₃) ₂	445
2430	-C ₄ H ₉	-C ₄ H ₉	515
2431	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	515
2432	-CH ₂ CH ₂ OH	-CH ₂ CH ₂ OH	491
2433	-CH ₂ CH ₂ OH	-C ₂ H ₅	475
2434	-C ₆ H ₁₃	-C ₆ H ₁₃	571
2435	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	-CH ₃	488
2436	-цикло-C ₆ H ₁₁	-CH ₂ CH ₂ OH	529
2437	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	519
2438	-(CH ₂) ₃ N(CH ₃) ₂	-(CH ₂) ₃ N(CH ₃) ₂	573
2439	-(CH ₂) ₃ N(C ₂ H ₅) ₂	-CH ₃	530
2440	-CH ₂ CH=CH ₂	-цикло-C ₆ H ₉	511
2441	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	459
2442	-H	-C(CH ₃) ₃	459
2443	-H	-цикло-C ₃ H ₅	443
2444	-H	-цикло-C ₇ H ₁₃	499
2445	-H	-CH ₂ C ₆ H ₅	493
2446	-C ₃ H ₇	-(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅	563
2447	-CH ₂ CONHCH ₃	-CH ₂ C ₆ H ₅	564
2448	-CH ₂ C ₆ H ₅	-цикло-C ₆ H ₁₁	575
2449	-(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	-CH ₃	521
2450	-CH ₂ C ₆ H ₅	-CH ₃	507
2451	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	-CH ₂ C ₆ H ₅	564
2452	-CH ₂ C ₆ H ₅	-C ₅ H ₁₁	563

Таблица 252

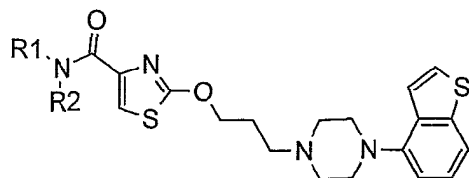


Пример	R1	R2	МС(М+1)
2453	-CH ₂ C ₆ H ₅	-CH ₂ C ₆ H ₅	583
2454	-CH ₂ C ₆ H ₅	-C ₂ H ₅	521
2455	-CH ₂ C ₆ H ₅	-CH(CH ₃) ₂	535
2456	-CH ₂ CH ₂ CN	-CH ₂ C ₆ H ₅	546
2457	-(CH ₂) ₂ OC ₆ H ₅	-CH ₃	537
2458	-цикло-C ₆ H ₁₁	-C ₂ H ₅	513
2459	-CH(CH ₃) ₂	-C ₂ H ₅	473
2460	-H	-C ₂ H ₅	431
2461	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	459
2462	-H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	461
2463	-C ₂ H ₅	-C ₄ H ₉	487
2464	-H	-CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	475
2465	-H	-(CH ₂) ₃ OC ₂ H ₅	489
2466	-CH ₂ C ₆ H ₅	-C ₆ H ₅	569
2467	-C ₆ H ₅	-C ₂ H ₅	507
2468	-C ₆ H ₅	-цикло-C ₆ H ₁₁	561
2469	-CH ₂ CH ₂ CN	-C ₆ H ₅	532
2470	-2-пиридил	-C ₂ H ₅	508
2471	-H	-C ₆ H ₅	479
2472	-H	-3-пиридил	480
2473	-H	-2-пиридил	480
2474	-H	-4-пиридил	480
2475	-C ₆ H ₅	-CH ₃	493
2476	-H	-CH ₂ -цикло-C ₆ H ₁₁	499
2477	-H	-(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅	521
2478	-H	-(CH ₂) ₂ NHCOCH ₃	488
2479	-H	-(CH ₂) ₅ OH	489



Пример	R1	R2	MC(M+1)
2480	-H	-(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	507
2481	-H	-CH ₂ CONH ₂	460
2482	-H	-CH ₂ CCH	441
2483	-C ₅ H ₁₁	-CH ₃	487
2484	-H	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃) ₂	473
2485	-H	-CH ₂ C(CH ₃) ₃	473
2486	-H	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	474
2487	-CH ₂ C ₆ H ₅	-(CH ₂) ₃ OH	551
2488	-CH ₃	-CH ₂ -цикло-C ₃ H ₅	471
2489	-H	-CH ₂ CF ₃	485
2490	-H	-NHCH ₂ CF ₃	500
2491	-CH ₃	-CH ₃	431
2492	-H	-(CH ₂) ₃ OCH(CH ₃) ₂	503
2493	-H	-CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃	487
2494	-H	-CH ₂ CN	442
2495	-H	-(CH ₂) ₃ OCH ₃	475
2496	-H	-(CH ₂) ₂ OCH(CH ₃) ₂	489
2497	-H	-CH ₂ CH ₂ CN	456
2498	-H	-CH ₂ CONHCH ₃	474
2499	-H	-(CH ₂)SCCH ₃	477
2500	-H	-CH ₂ CHF ₂	467
2501	-H	-CH ₂ CH ₂ OH	447
2502	-H	-C ₆ H ₁₃	487
2503	-CH ₂ CON(CH ₃) ₂	-CH ₃	502
2504	-CH ₂ C ₆ H ₅	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	551
2505	-H	-(CH ₂) ₂ NHCONH ₂	489

Таблица 254

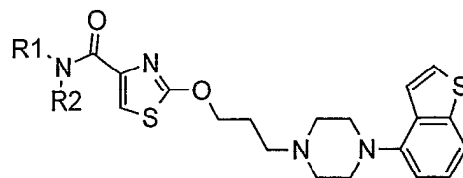


Пример	R1	R2	MC(M+1)
2506		-CH ₃	522
2507		-CH ₃	514
2508		-C ₂ H ₅	529
2509		-H	494
2510		-H	494
2511		-H	494
2512		-H	483
2513		-C ₂ H ₅	536
2514		-CH ₃	542
2515		-C ₂ H ₅	547

Таблица 255

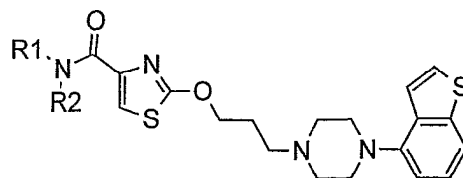
Пример	R1	R2	MC(M+1)
2516		-CH ₃	564
2517		-C ₂ H ₅	522
2518		-H	457
2519		-H	485
2520		-CH ₃	507
2521		-H	509
2522		-H	521
2523		-H	529
2524		-H	544
2525		-H	519

Таблица 256



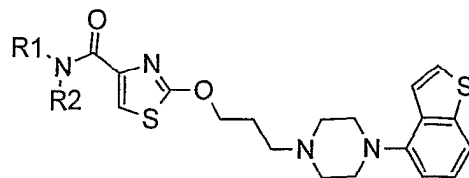
Пример	R1	R2	МС (М+1)
2526		-H	530
2527		-H	530
2528		-H	571
2529		-H	518
2530		-H	558
2531		-H	486
2532		-H	552
2533		-H	471
2534		-H	562

Таблица 257



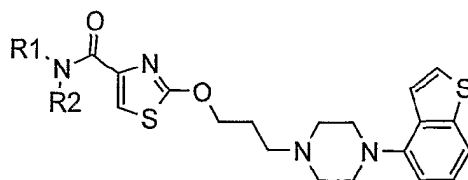
Пример	R1	R2	МС(M+1)
2535		-H	572
2536		-H	536
2537		-H	523
2538		-H	534
2539		-H	570
2540		-H	540
2541		-H	533
2542		-H	519
2543		-H	487

Таблица 258



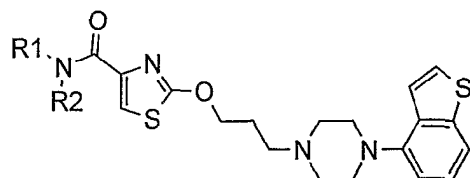
Пример	R1	R2	МС (М+1)
2544		-H	497
2545		-H	501
2546		-H	545
2547		-H	535
2548		-H	545
2549		-H	546
2550		-H	530
2551		-H	483

Таблица 259



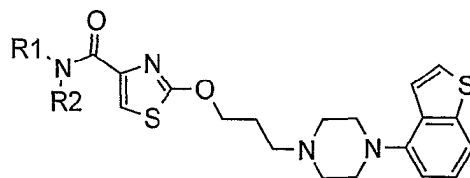
Пример	R1	R2	МС (М+1)
2552		-H	562
2553		-H	532
2554		-H	545
2555		-H	560
2556		-H	559
2557		-H	559
2558		-H	546
2559		-H	511
2560		-H	530

Таблица 260

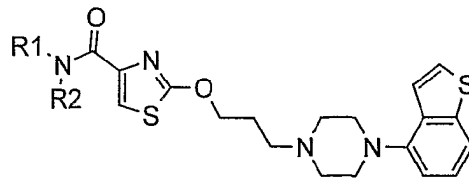


Пример	R1	R2	МС(M+1)
2561		-H	508
2562		-H	514
2563		-H	514
2564		-H	500
2565		-H	514
2566		-H	516
2567		-H	530
2568		-H	561
2569		-H	543
2570		-H	546

Таблица 261

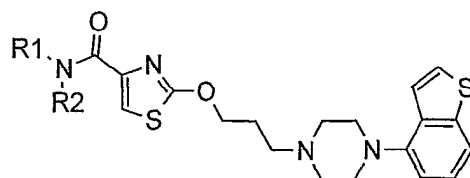


Пример	R1	R2	МС (М+1)
2571		-H	533
2572		-H	499
2573		-H	528
2574		-H	487
2575		-H	509
2576		-H	508
2577		-H	508
2578		-H	497
2579		-H	497
2580		-H	496

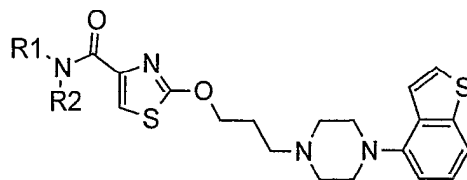


Пример	R1	R2	МС (М+1)
2581		-H	525
2582		-H	511
2583		-H	511
2584		-H	513
2585		-H	499
2586		-H	483
2587		-H	500
2588		-H	513
2589		-H	535
2590		-H	457

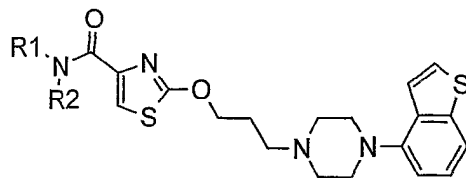
Таблица 263



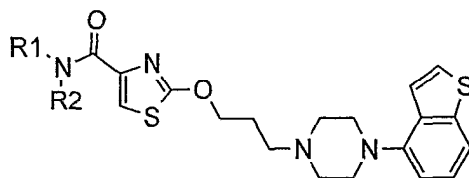
Пример	R1	R2	МС (М+1)
2591		-H	527
2592		-H	554
2593		-H	549
2594		-H	519
2595		-H	519
2596		-H	497
2597		-H	546
2598		-H	497
2599		-H	528
2600		-H	487



Пример	R1	R2	МС (М+1)
2601		-H	575
2602		-CH ₃	511
2603		-CH ₃	525
2604		-CH ₃	557
2605		-CH ₃	528
2606		-CH ₃	544
2607		-H	547
2608		-CH ₃	526
2609		-CH ₃	564

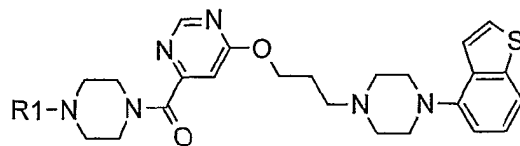


Пример	R1	R2	MC(M+1)
2610		-CH ₃	574
2611		-CH ₃	547
2612		-H	511
2613		-CH ₃	561
2614		-CH ₃	564
2615		-H	512
2616		-H	515
2617		-CH ₃	560
2618		-H	566



Пример	R1	R2	МС (M+1)
2619		-H	573
2620		-CH ₃	571
2621		-CH ₃	584
2622		-CH ₃	587
2623		-H	560
2624		-H	547
2625		-H	549

Таблица 267



Пример	R1	МС (M+1)
2626	-2-пиридил	544
2627	-C ₄ H ₉	523
2628	-CH(CH ₃) ₂	509
2629	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	538
2630	-4-пиридил	544
2631	-C ₆ H ₅	543
2632	-C ₃ H ₇	509
2633	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	525
2634	-CH ₃	481
2635	-3-пиридил	544
2636	-C ₆ H ₁₃	551
2637	-C ₂ H ₅	495
2638	-CH ₂ CH ₂ OH	511
2639	-COCH ₃	509
2640	-цикло-C ₆ H ₁₁	549
2641	-SO ₂ C ₂ H ₅	559

Таблица 268

Пример	R1	МС(M+1)
2642		558
2643		558
2644		558
2645		545
2646		564
2647		629
2648		545
2649		551
2650		561

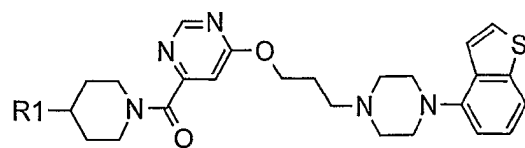
Таблица 269

Пример	R1	МС (M+1)
2651		572
2652		572
2653		578
2654		550
2655		535

Таблица 270

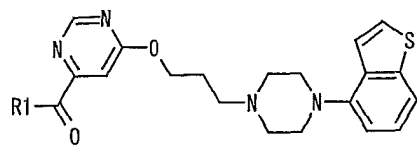
Пример	R1	МС (M+1)
2656	-OCH ₃	496
2657	-цикло-C ₆ H ₁₁	548
2658	-C ₆ H ₅	542
2659	-OCH ₂ C ₆ H ₅	572
2660	-OC ₆ H ₅	558
2661	-OH	482
2662	-CONH ₂	509
2663	-C ₂ H ₅	494
2664	-NHCOCH ₃	523
2665	-COC ₆ H ₅	570
2666	-2-пиридил	543

Таблица 271

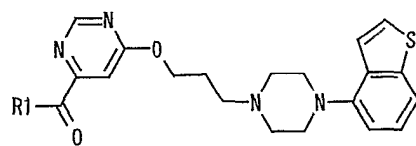


Пример	R1	МС (М+1)
2667		549
2668		573
2669		573
2670		551
2671		559
2672		559

Таблица 272

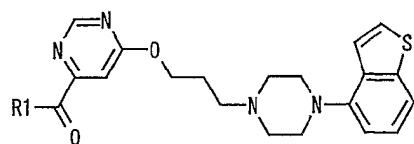


Пример	R1	МС (М+1)
2673		480
2674		520
2675		484
2676		470
2677		506
2678		534
2679		542
2680		571
2681		514
2682		558



Пример	R1	МС (М+1)
2683		553
2684		514
2685		500
2686		495
2687		543
2688		558
2689		510
2690		572
2691		468

Таблица 274



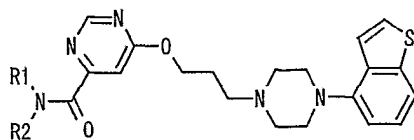
Пример	R1	МС (М+1)
2692		541
2693		565
2694		500
2695		528
2696		481
2697		540
2698		537
2699		521
2700		563
2701		534

Таблица 275

Пример	R1	МС(M+1)
2702		573
2703		482
2704		578
2705		544
2706		549
2707		543
2708		541
2709		548

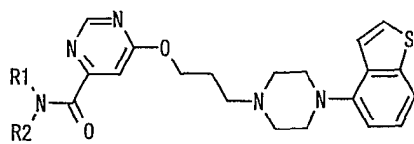
Таблица 276

Пример	R1	МС(M+1)
2710		556
2711		521
2712		438

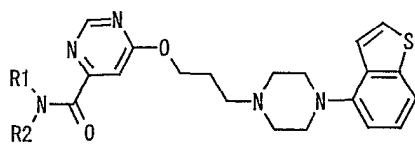


Пример	R1	R2	МС (М+1)
2713	-цикло-C ₆ H ₁₁	-CH ₃	494
2714	-H	-CH(CH ₃) ₂	440
2715	-C ₄ H ₉	-C ₄ H ₉	510
2716	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	510
2717	-CH ₂ CH ₂ OH	-CH ₂ CH ₂ OH	486
2718	-C ₆ H ₁₃	-C ₆ H ₁₃	566
2719	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	-CH ₃	483
2720	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	514
2721	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	568
2722	-(CH ₂) ₃ N(C ₂ H ₅) ₂	-CH ₃	525
2723	-CH ₂ CH=CH ₂	-цикло-C ₅ H ₉	506
2724	-H	-C ₄ H ₉	454
2725	-H	-цикло-C ₃ H ₅	438
2726	-H	-цикло-C ₇ H ₁₃	494
2727	-H	-CH ₂ C ₆ H ₅	488
2728	-C ₃ H ₇	-(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅	558
2729	-CH ₂ CONHCH ₃	-CH ₂ C ₆ H ₅	559
2730	-CH ₂ C ₆ H ₅	-цикло-C ₆ H ₁₁	570
2731	-(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	-CH ₃	516
2732	-CH ₂ C ₆ H ₅	-CH ₃	502
2733	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	-CH ₂ C ₆ H ₅	559
2734	-CH ₂ C ₆ H ₅	-C ₅ H ₁₁	558
2735	-CH ₂ C ₆ H ₅	-CH ₂ C ₆ H ₅	578
2736	-CH ₂ C ₆ H ₅	-C ₂ H ₅	516
2737	-CH ₂ C ₆ H ₅	-CH(CH ₃) ₂	530
2738	-CH ₂ CH ₂ CN	-CH ₂ C ₆ H ₅	541
2739	-(CH ₂) ₂ OC ₆ H ₅	-CH ₃	532
2740	-цикло-C ₆ H ₁₁	-C ₂ H ₅	508

Таблица 278

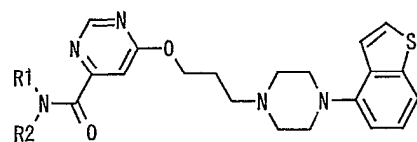


Пример	R1	R2	MC(M+1)
2741	$-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	$-\text{C}_2\text{H}_5$	468
2742	$-\text{H}$	$-\text{C}_2\text{H}_5$	426
2743	$-\text{H}$	$-\text{C}_3\text{H}_7$	440
2744	$-\text{H}$	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$	456
2745	$-\text{CH}_2\text{-цикло-C}_6\text{H}_{11}$	$-\text{C}_2\text{H}_5$	522
2746	$-\text{C}_2\text{H}_5$	$-\text{C}_4\text{H}_9$	482
2747	$-\text{H}$	$-\text{1-CH}_3\text{-циклогексил}$	494
2748	$-\text{H}$	$-(\text{CH}_2)_2\text{OC}_6\text{H}_5$	518
2749	$-\text{CH}_2\text{C}_6\text{H}_5$	$-\text{C}_6\text{H}_5$	564
2750	$-\text{C}_6\text{H}_5$	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$	518
2751	$-\text{C}_6\text{H}_5$	$-\text{C}_2\text{H}_5$	502
2752	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CN}$	$-\text{C}_6\text{H}_5$	527
2753	$-\text{2-пиридил}$	$-\text{C}_2\text{H}_5$	503
2754	$-\text{H}$	$-\text{C}_6\text{H}_5$	474
2755	$-\text{H}$	$-\text{3-пиридил}$	475
2756	$-\text{H}$	$-\text{2-пиридил}$	475
2757	$-\text{H}$	$-\text{4-пиридил}$	475
2758	$-\text{C}_6\text{H}_5$	$-\text{CH}_3$	488
2759	$-\text{H}$	$-\text{CH}_2\text{-цикло-C}_6\text{H}_{11}$	494
2760	$-\text{H}$	$-(\text{CH}_2)_3\text{C}_6\text{H}_5$	516
2761	$-\text{H}$	$-(\text{CH}_2)_2\text{C}_6\text{H}_5$	502
2762	$-\text{H}$	$-\text{CH}_2\text{CONH}_2$	455
2763	$-\text{H}$	$-\text{CH}_2\text{CCH}$	436
2764	$-\text{C}_6\text{H}_{11}$	$-\text{CH}_3$	482
2765	$-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	$-\text{CH}_3$	454
2766	$-\text{H}$	$-(\text{CH}_2)_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	468
2767	$-\text{H}$	$-\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$	468
2768	$-\text{H}$	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$	469



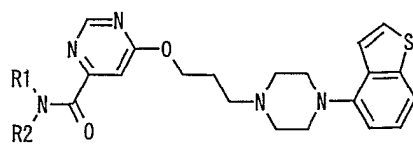
Пример	R1	R2	МС (M+1)
2769	$-\text{CH}_2\text{C}_6\text{H}_5$	$-(\text{CH}_2)_3\text{OH}$	546
2770	$-\text{CH}_3$	$-\text{CH}_2\text{-цикло-C}_3\text{H}_5$	466
2771	$-\text{H}$	$-\text{CH}_2\text{CF}_3$	480
2772	$-\text{H}$	$-\text{NHCH}_2\text{CF}_3$	495
2773	$-\text{CH}_3$	$-\text{CH}_3$	426
2774	$-\text{H}$	$-(\text{CH}_2)_3\text{OCH}(\text{CH}_3)_2$	498
2775	$-\text{H}$	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$	482
2776	$-\text{H}$	$-\text{CH}_2\text{CN}$	437
2777	$-\text{H}$	$-(\text{CH}_2)_3\text{OCH}_3$	470
2778	$-\text{H}$	$-(\text{CH}_2)_2\text{OCH}(\text{CH}_3)_2$	484
2779	$-\text{H}$	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CN}$	451
2780	$-\text{H}$	$-\text{CH}_2\text{CONHCH}_3$	469
2781	$-\text{H}$	$-(\text{CH}_2)\text{SCH}_3$	472
2782	$-\text{H}$	$-\text{CH}_2\text{CHF}_2$	462
2783	$-\text{H}$	$-\text{C}_6\text{H}_{13}$	482
2784	$-\text{CH}_2\text{CON}(\text{CH}_3)_2$	$-\text{CH}_3$	497
2785	$-\text{CH}_2\text{C}_6\text{H}_5$	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$	546
2786	$-\text{H}$	$-(\text{CH}_2)_2\text{NHCONH}_2$	484

Таблица 280



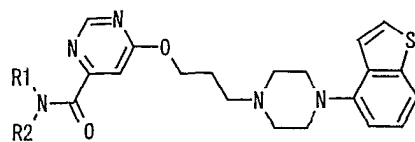
Пример	R1	R2	MC(M+1)
2787		-CH ₃	517
2788		-CH ₃	509
2789		-C ₂ H ₅	524
2790		-H	489
2791		-H	489
2792		-H	489
2793		-H	478
2794		-C ₂ H ₅	531
2795		-CH ₃	537
2796		-C ₂ H ₅	542

Таблица 281



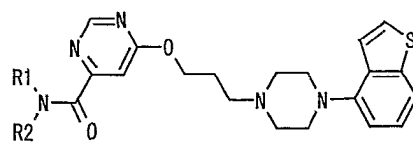
Пример	R1	R2	MC (M+1)
2797		-CH ₃	559
2798		-C ₂ H ₅	517
2799		-H	452
2800		-H	480
2801		-CH ₃	536
2802		-CH ₃	502
2803		-H	508
2804		-H	504
2805		-H	516
2806		-H	524
2807		-H	539

Таблица 282



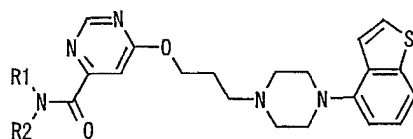
Пример	R1	R2	МС (M+1)
2808		-H	514
2809		-H	525
2810		-H	525
2811		-H	566
2812		-H	513
2813		-H	553
2814		-H	481
2815		-H	476
2816		-H	519
2817		-H	547

Таблица 283



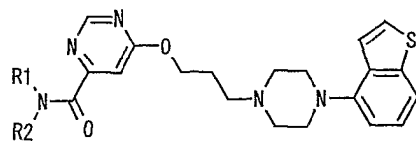
Пример	R1	R2	MC(M+1)
2818		-H	465
2819		-H	466
2820		-H	479
2821		-H	557
2822		-H	567
2823		-H	531
2824		-H	518
2825		-H	529
2826		-H	565

Таблица 284



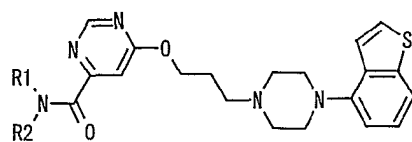
Пример	R1	R2	MC(M+1)
2827		-H	535
2828		-H	514
2829		-H	492
2830		-H	525
2831		-H	496
2832		-H	493
2833		-H	540
2834		-H	530
2835		-H	540

Таблица 285



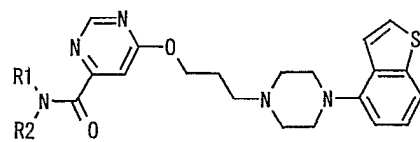
Пример	R1	R2	MC(M+1)
2836		-H	541
2837		-H	525
2838		-H	478
2839		-H	476
2840		-H	495
2841		-H	465
2842		-H	557
2843		-H	527
2844		-H	540

Таблица 286



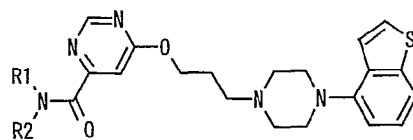
Пример	R1	R2	МС(M+1)
2845		-H	555
2846		-H	554
2847		-H	554
2848		-H	541
2849		-H	506
2850		-H	525
2851		-H	503
2852		-H	509
2853		-H	509
2854		-H	495

Таблица 287



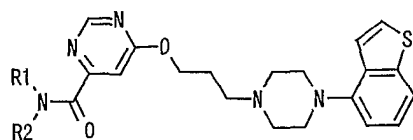
Пример	R1	R2	МС (M+1)
2855		-H	509
2856		-H	511
2857		-H	525
2858		-H	556
2859		-H	538
2860		-H	541
2861		-H	528
2862		-H	494
2863		-H	523
2864		-H	482

Таблица 288



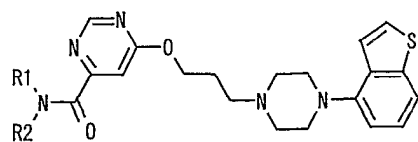
Пример	R1	R2	MC(M+1)
2865		-H	504
2866		-H	503
2867		-H	503
2868		-H	492
2869		-H	492
2870		-H	491
2871		-H	520
2872		-H	506
2873		-H	506
2874		-H	508

Таблица 289



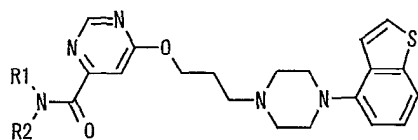
Пример	R1	R2	МС(M+1)
2875		-H	494
2876		-H	478
2877		-H	495
2878		-H	508
2879		-H	530
2880		-H	452
2881		-H	522
2882		-H	495
2883		-H	549
2884		-H	544
2885		-H	514

Таблица 290



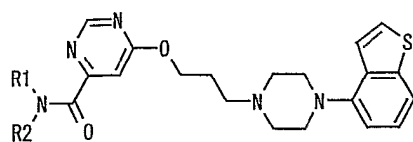
Пример	R1	R2	МС (M+1)
2886		-H	514
2887		-H	492
2888		-H	541
2889		-H	492
2890		-H	482
2891		-H	570
2892		-CH ₃	506
2893		-CH ₃	520
2894		-CH ₃	552
2895		-CH ₃	523
2896		-CH ₃	539

Таблица 291



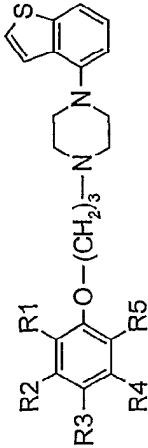
Пример	R1	R2	МС (М+1)
2897		-H	542
2898		-CH ₃	521
2899		-CH ₃	559
2900		-CH ₃	569
2901		-CH ₃	542
2902		-H	506
2903		-CH ₃	556
2904		-CH ₃	559
2905		-H	507

Таблица 292



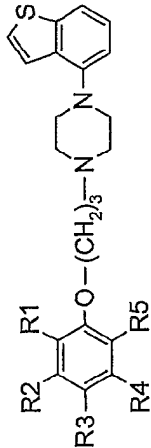
Пример	R1	R2	МС (М+1)
2906		-H	510
2907		-CH ₃	555
2908		-H	561
2909		-H	568
2910		-CH ₃	566
2911		-CH ₃	579
2912		-CH ₃	582
2913		-H	544

Таблица 293



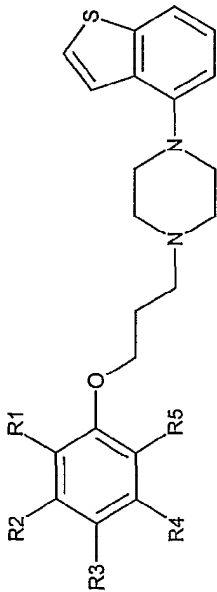
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
2914	-CH ₃	-H		-H	-OCH ₃	Белый порошок (этилацетат)	230,0 (разл.)	Гидрохлорид
2915	-CH ₃	-H		-H	-OCH ₃			
2916	-CH ₃	-H		-H	-OCH ₃	Белый порошок (этилацетат)	235,0 (разл.)	Гидрохлорид
2917	-CH ₃	-H		-H	-OCH ₃	Белый порошок (этилацетат)	227,0 (разл.)	Гидрохлорид
2918	-CH ₃	-H		-H	-OCH ₃	Белый порошок (этилацетат)	240,0 (разл.)	Гидрохлорид
2919	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат)	211,0-213,5	Гидрохлорид

Таблица 294



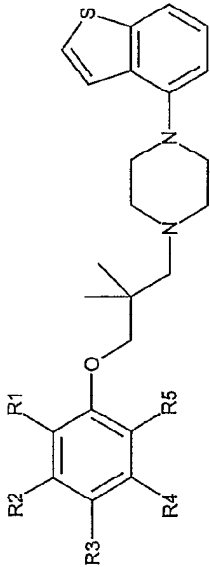
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
2920	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат)	207,5-210,0	Гидрохлорид
2921	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	Белый порошок (этанол/этилацетат)	247,0 (разл.)	-
2922	-CH ₃	-H	-CONHCH ₃	-H	-OC ₃ H ₇	Белый порошок (этанол)	178,5-179,5	Гидрохлорид
2923	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃			Гидрохлорид
2924	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	Белый порошок (этилацетат)	248,5-257,5	Гидрохлорид

Таблица 295



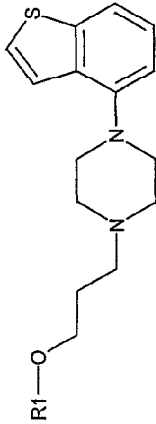
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	ЯМР	Соль
2925	-CH ₃	-H		-H	-OCH ₃	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,36-1,65 (4H, м), 1,88-2,11 (3H, м), 2,25 (3H, с), 2,47 (3H, с), 2,60-2,82 (8H, м), 3,12-3,29 (4H, м), 3,47-3,63 (2H, м), 3,82 (3H, с), 3,93 (2H, т, J=6,4 Гц), 6,34 (1H, д, J=2,7 Гц), 6,40 (1H, д, J=2,7 Гц), 6,90 (1H, д, J=7,1 Гц), 7,21-7,34 (1H, м), 7,40 (2H, дд, J=5,5 Гц, 9,9 Гц), 7,55 (1H, д, J=8,0 Гц).	-
2926	-CH ₃	-H		-H	-OCH ₃	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,48 (9H, с), 1,67-1,92 (4H, м), 1,95-2,11 (2H, м), 2,25 (3H, с), 2,61-2,87 (12H, м), 3,11-3,28 (4H, м), 3,54-3,70 (2H, м), 3,83 (3H, с), 3,94 (2H, т, J=6,3 Гц), 6,34 (1H, д, J=2,6 Гц), 6,39 (1H, д, J=2,6 Гц), 6,90 (1H, д, J=6,9 Гц), 7,17-7,34 (1H, м), 7,35-7,47 (2H, м), 7,55 (1H, д, J=8,0 Гц).	-
2927	-CH ₃	-H		-H	-OCH ₃	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,96-2,11 (2H, м), 2,27 (3H, с), 2,57 (4H, т, J=6,0 Гц), 2,64-2,84 (6H, м), 3,13-3,27 (14H, м), 3,51 (4H, т, J=6,0 Гц), 3,84 (3H, с), 3,96 (2H, т, J=6,4 Гц), 6,38 (1H, д, J=2,7 Гц), 6,20 (1H, д, J=2,7 Гц), 6,90 (1H, д, J=7,5 Гц), 7,21-7,32 (1H, м), 7,40 (2H, дд, J=5,5 Гц, 10,0 Гц), 7,55 (1H, д, J=8,1 Гц).	-
2928	-CH ₃	-H		-H	-OCH ₃	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,83-1,95 (4H, м), 1,95-2,10 (2H, м), 2,25 (3H, с), 2,61-2,81 (6H, м), 3,07-3,28 (14H, м), 3,82 (3H, с), 3,93 (2H, т, J=6,5 Гц), 6,30-6,43 (2H, м), 6,90 (1H, д, J=7,5 Гц), 7,29-7,34 (1H, м), 7,41 (2H, дд, J=6,0 Гц, 10,0 Гц), 7,55 (1H, д, J=7,9 Гц).	-

Таблица 296



Пример	R1	R2	R3	R4	R5	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
2929	-OCH ₃	-H	-CONH ₂	-H	-CH ₃	Белый порошок (этанол)	189,0-192,5	Гидрохлорид
2930	-OCH ₃	-H	-CONHCH ₃	-H	-CH ₃	Белый порошок (изопропиловый спирт/вода)	165,5-167,0	-

Таблица 297



Пример	R1	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
2931		Белый порошок (этилацетат/метанол)	214-217	Гидрохлорид
2932		Белый порошок (этилацетат/метанол)	218-222	1/2 фумарат
2933		Бесцветные игольчатые кристаллы (этанол)	195-196	-
2934		Белый порошок (этилацетат)	145-146	-

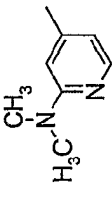
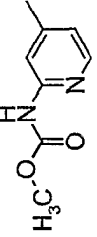
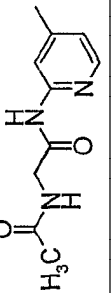
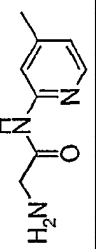
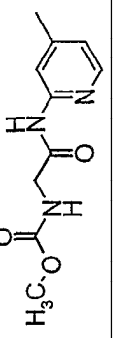
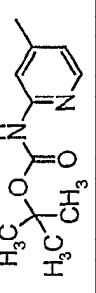
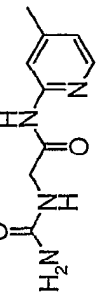
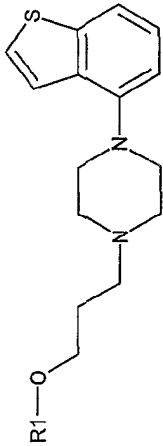
2935		Белый порошок (этанол/этилацетат)	219-221	Дигидрохлорид
2936		Белый порошок (этилацетат)	162-164	-
2937		Белый порошок (этанол/эфир)	208, 5-209, 5	Дигидрохлорид
2938		Белый порошок (н-гексан/этилацетат)	137-139	-
2939		Белый порошок (этанол)	137-139	-
2940		Белый порошок (этилацетат)	163-165	-
2941		Белый порошок (этилацетат)	196-199	-

Таблица 298



Пример	R1	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
2942		Белый порошок (этилацетат)	197-199	-
2943		Белый порошок (этанол)	232-233	Дигидрохлорид
2944		Белый порошок (этанол/эфир)	255-257	Гидрохлорид
2945		Белый порошок (этанол)	169,5-172,5	-
2946		Белый порошок (этанол)	195,0-196,5	-
2947		Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	151,5-153,5	-
2948		Белый порошок (этилацетат)	235,0 (разл.)	Гидрохлорид

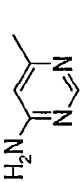
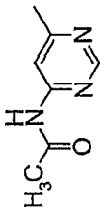
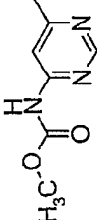
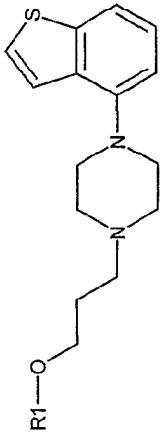
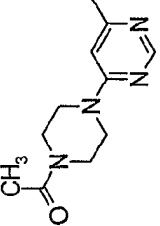
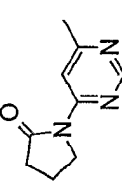
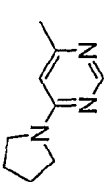
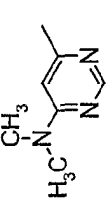
2949				
2950		Белый порошок (этилацетат)	224,0-227,5	Гидрохлорид
2951		Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	175,0-178,5	-

Таблица 299



Пример	R1	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
2952		Белый порошок (этилацетат)	169,0-173,0	Тригидрохлорид
2953				
2954		Белый порошок (этилацетат)	210,0-217,0	Дигидрохлорид
2955		Белый порошок (этилацетат)	181,0-188,0	Дигидрохлорид

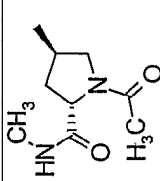
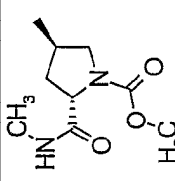
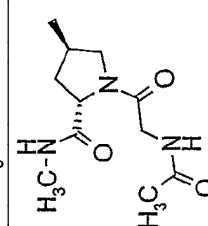
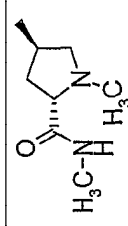
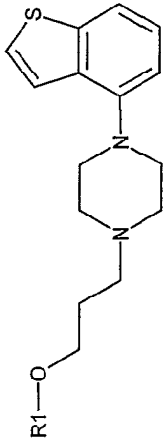
2956		Белый порошок (этанол/этилацетат)	163,5-167,0	Гидрохлорид
2957		Белый порошок (этилацетат/простой эфир)	172,5-176,5	Гидрохлорид
2958		Белый порошок (этилацетат/простой эфир)	145,0-151,0	Дигидрохлорид
2959		Белый порошок (этанол/этилацетат)	144,0-150,0	Дигидрохлорид

Таблица 300



Пример	R1	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
2960		Белый порошок (этилацетат/простой эфир)	177-182	Дигидрохлорид
2961		Белый порошок (этилацетат/простой эфир)	198-201	Гидрохлорид
2962		Белый порошок (этилацетат/простой эфир)	195-200	Гидрохлорид
2963		Белый порошок (этилацетат/простой эфир)	215-218	Гидрохлорид
2964		Белый порошок (этилацетат/простой эфир)	152-157	Гидрохлорид
2965		Белый порошок (этилацетат/простой эфир)	158-161	Гидрохлорид

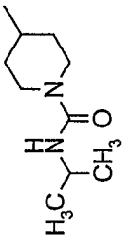
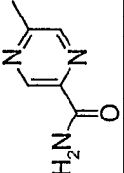
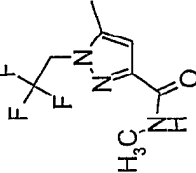
2966		Белый порошок (этилацетат/простой эфир)	168-172	Гидрохлорид
2967		Белый порошок (этилацетат)	178,5-181,5	-
2968		Белый порошок (этилацетат)	228,0 (разл.)	Гидрохлорид

Таблица 301

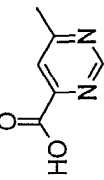
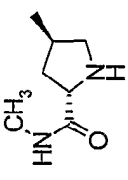
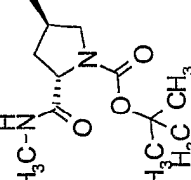
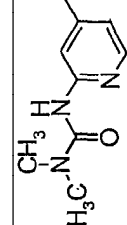
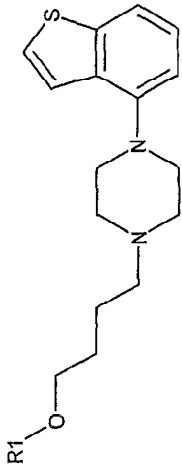
Пример	R1	ЯМР	Соль
2969		¹ H-ЯМР (DMSO-d ₆) δ м.д.: 1,95-2,10 (2H, м), 2,85-2,95 (2H, м), 3,00-3,15 (4H, м), 3,15-3,30 (4H, м), 4,41 (2H, т, J=5,8 Гц), 6,89 (1H, д, J=5,0 Гц), 7,15 (1H, с), 7,26 (1H, т, J=7,9 Гц), 7,43 (1H, д, J=5,5 Гц), 7,63 (1H, д, J=8,0 Гц), 7,71 (1H, д, J=5,5 Гц), 8,73 (1H, с).	-
2970		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,72-1,98 (4H, м), 2,30-2,46 (1H, м), 2,46-2,58 (2H, м), 2,62-2,77 (5H, м), 2,80 (3H, д, J=5,1 Гц), 3,04-3,29 (5H, м), 3,38-3,55 (2H, м), 3,83-4,04 (2H, м), 6,90 (1H, дд, J=0,5 Гц, 7,6 Гц), 7,22-7,34 (1H, м), 7,34-7,47 (2H, м), 7,55 (1H, д, J=8,0 Гц), 7,63 (1H, ушир.).	
2971		¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ м.д.: 1,46 (9H, с), 1,70-1,89 (2H, м), 1,90-2,17 (1H, м), 2,44-2,60 (2H, м), 2,62-2,75 (4H, м), 2,81 (3H, д, J=4,7 Гц), 3,09-3,26 (4H, м), 3,39-3,57 (4H, м), 3,93-4,21 (1H, м), 4,21-4,46 (1H, м), 6,65-6,95 (1H, ушир.), 6,90 (1H, д, J=7,0 Гц), 7,20-7,34 (1H, м), 7,35-7,45 (2H, м), 7,55 (1H, д, J=8,0 Гц).	
Пример	R1	МС (M+1)	Соль
2972		440	Гидрохлорид
2973		360	Малеат

Таблица 302



Пример	RI	Кристаллическая форма (растворитель для перекристаллизации)	Температура плавления (°C)	Соль
2974		Белый порошок (этилацетат/эфир)	215,5-216,5	Гидрохлорид
2975				
2976		Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	132,5-135,0	-
2977		Белый порошок (2-пропанол вода)	180,0-182,0	-
2978		Белый порошок (этилацетат)	216,0-220,2	Гидрохлорид
2979		Белый порошок (этилацетат)	203,0-207,0	Гидрохлорид

5

10

15

20

25

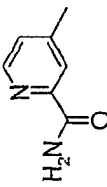
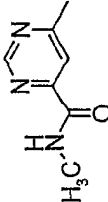
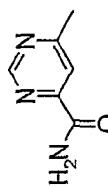
30

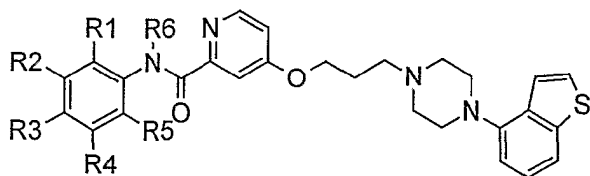
35

40

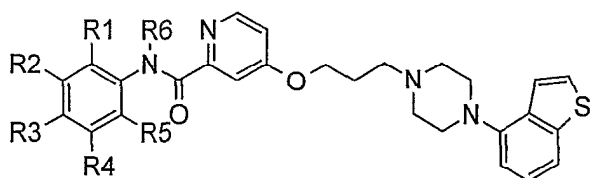
45

50

2980		Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	146,5-148,0	-
2981		Белый порошок (этилацетат)	197,0-201,0	Гидрохлорид
2982		Белый порошок (этилацетат/изопропиловый эфир)	133,0-134,5	-

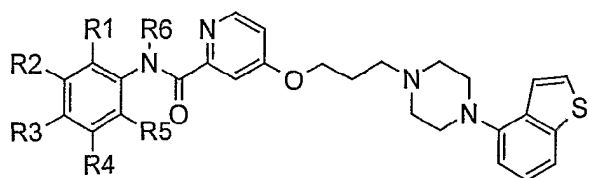


Пример	R1	R2	R3	R4	R5	R6	MC (M+1)
2983	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	517
2984	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	-CH ₃	501
2985	-H	-H	-Cl	-H	-H	-CH ₃	521
2986	-H	-SCH ₃	-H	-H	-H	-H	519
2987	-SCH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	519
2988	-H	-Cl	-Cl	-H	-H	-H	541
2989	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	-H	557
2990	-H	-H	-H	-H	-H	-H	473
2991	-H	-H	-Cl	-H	-H	-H	507
2992	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	-H	503
2993	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	503
2994	-H	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	503
2995	-Cl	-H	-H	-H	-H	-H	507
2996	-H	-Cl	-H	-H	-H	-H	507
2997	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	-H	487
2998	-OCH ₃	-H	-OCH ₃	-H	-H	-H	533
2999	-N(CH ₃) ₂	-H	-H	-H	-H	-H	516
3000	-1-пиррил	-H	-H	-H	-H	-H	538
3001	-H	-Cl	-H	-H	-OCH ₃	-H	537
3002	-H	-OCH ₃	-H	-H	-OCH ₃	-H	533
3003	-H	-OCH ₃	-H	-OCH ₃	-H	-H	533
3004	-OCH ₃	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	517
3005	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	-H	533
3006	-C(CH ₃)=CH ₂	-H	-H	-H	-H	-H	513
3007	-H	-OCF ₃	-H	-H	-H	-H	557
3008	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	487
3009	-H	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	487
3010	-F	-H	-H	-H	-H	-H	491



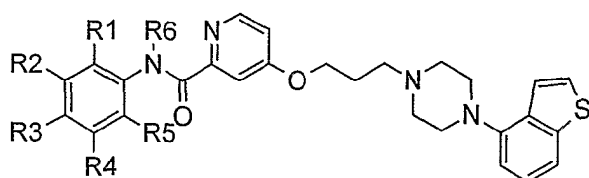
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	R6	MC (M+1)
3011	-H	-H	-F	-H	-H	-H	491
3012	-H	-N(CH ₃) ₂	-H	-H	-H	-H	516
3013	-H	-H	-N(CH ₃) ₂	-H	-H	-H	516
3014	-CF ₃	-H	-H	-H	-H	-H	541
3015	-H	-CF ₃	-H	-H	-H	-H	541
3016	-H	-NHCOCH ₃	-H	-H	-H	-H	530
3017	-H	-H	-NHCOCH ₃	-H	-H	-H	530
3018	-H	-H	-H	-H	-CN	-H	498
3019	-H	-H	-H	-CN	-H	-H	498
3020	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	501
3021	-H	-CH ₃	-H	-H	-H	-CH ₃	501
3022	-H	-Cl	-H	-H	-H	-CH ₃	521
3023	-H	-H	-OH	-H	-H	-CH ₃	503
3024	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	501
3025	-CH ₃	-H	-CH ₃	-H	-H	-H	501
3026	-CH ₃	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	501
3027	-H	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-H	501
3028	-H	-CH ₃	-H	-CH ₃	-H	-H	501
3029	-F	-F	-H	-H	-H	-H	509
3030	-H	-F	-F	-H	-H	-H	509
3031	-H	-F	-H	-F	-H	-H	509
3032	-H	-F	-OCH ₃	-H	-H	-H	521
3033	-H	-OCH ₃	-CH ₃	-H	-H	-H	517
3034	-H	-Cl	-OCH ₃	-H	-H	-H	537
3035	-H	-Cl	-CH ₃	-H	-H	-H	521
3036	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	533
3037	-H	-Cl	-OH	-H	-H	-H	523
3038	-Cl	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	521

Таблица 305



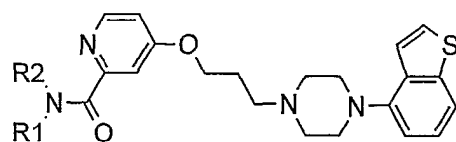
Пример	R1	R2	R3	R4	R5	R6	МС (М+1)
3039	-H	-CONH ₂	-H	-H	-Cl	-H	550
3040	-CH ₃	-H	-Br	-H	-CH ₃	-H	579
3041	-H	-H	-CN	-H	-H	-H	498
3042	-H	-H	-SCH ₃	-H	-H	-H	519
3043	-H	-H	-CH(CH ₃) ₂	-H	-H	-H	515
3044	-H	-H	-2-фурил	-H	-H	-H	539

Таблица 306

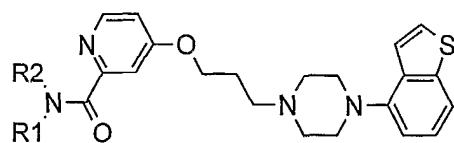


Пример	R1	R2	R3	R4	R5	R6	МС (М+1)
3045	-H		-H	-H	-H	-H	539
3046	-H		-H	-H	-H	-H	540
3047	-H		-H	-H	-H	-H	542
3048	-H	-H		-H	-H	-H	554
3049	-H		-H	-H	-H	-H	553
3050	-H	-H		-H	-H	-H	553
3051	-H		-H	-H	-H	-H	540

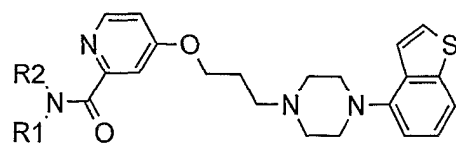
Таблица 307



Пример	R1	R2	МС (M+1)
3052		-H	474
3053		-H	523
3054		-H	513
3055		-H	474
3056		-H	474
3057		-H	524
3058		-H	504
3059		-H	512
3060		-H	560

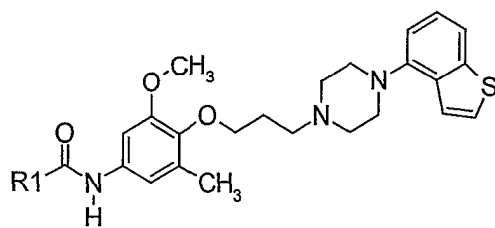


Пример	R1	R2	МС (М+1)
3061		-H	556
3062		-H	556
3063		-H	572
3064		-H	488
3065		-H	480
3066		-H	524
3067		-H	546
3068		-H	478



Пример	R1	R2	МС (M+1)
3069		-H	556
3070		-H	528
3071		-H	564
3072		-H	534
3073		-H	513
3074		-H	491
3075		-H	506
3076		-H	492
3077		-H	529

Стр.: 452



Пример	R1	МС (М+1)
3086		553
3087		525
3088		567
3089		499
3090		497
3091		543
3092		549
3093		559

Испытание на связывание с допаминовым D ₂ рецептором		
	Испытуемое соединение	K _i (нМ)
5	Соединение примера 3	1,5
	Соединение примера 4	1,9
	Соединение примера 6	0,7
	Соединение примера 7	0,8
10	Соединение примера 11	0,2
	Соединение примера 14	0,3
	Соединение примера 15	0,4
	Соединение примера 17	0,6
15	Соединение примера 26	2,6
	Соединение примера 27	1,5
	Соединение примера 32	2,5
20	Соединение примера 40	3,1
	Соединение примера 48	2,3
	Соединение примера 58	2,0
	Соединение примера 61	5,0
25	Соединение примера 62	1,6
	Соединение примера 72	3,4
	Соединение примера 73	1,3
	Соединение примера 76	2,5
30	Соединение примера 80	1,6
	Соединение примера 94	2,4
	Соединение примера 95	1,9
	Соединение примера 112	1,0
35	Соединение примера 115	1,6
	Соединение примера 121	1,1
	Соединение примера 123	0,7
	Соединение примера 125	2,0
40	Соединение примера 127	0,4
	Соединение примера 133	0,3
	Соединение примера 144	0,4
	Соединение примера 146	0,1
45	Соединение примера 160	0,4
	Соединение примера 169	0,9
	Соединение примера 170	1,0
50	Соединение примера 186	1,3
	Соединение примера 190	1,2

5	Соединение примера 232	1,1
	Соединение примера 241	0,4
	Соединение примера 243	0,2
	Соединение примера 252	0,3
	Соединение примера 271	1,2
10	Соединение примера 281	0,3
	Соединение примера 286	0,2
	Соединение примера 301	0,2
	Соединение примера 303	1,0
	Соединение примера 307	0,3
15	Соединение примера 313	0,7
	Соединение примера 314	0,8
	Соединение примера 323	1,5
	Соединение примера 340	1,9
	Соединение примера 343	0,9
20	Соединение примера 345	1,6
	Соединение примера 354	0,2
	Соединение примера 358	0,2
	Соединение примера 359	0,2
	Соединение примера 363	2,0
25	Соединение примера 368	0,4
	Соединение примера 382	0,5
	Соединение примера 394	3,8
	Соединение примера 453	0,9
	Соединение примера 462	0,4
30	Соединение примера 546	0,6
	Соединение примера 650	1,2
	Соединение примера 706	1,0
	Соединение примера 802	0,6
	Соединение примера 1014	3,3
40	Соединение примера 1016	2,2
	Соединение примера 1026	1,9
	Соединение примера 1027	1,9
	Соединение примера 1034	2,1
	Соединение примера 1059	0,4
45	Соединение примера 1060	0,1
	Соединение примера 1061	0,1
	Соединение примера 1071	0,1
	Соединение примера 1076	1,2
	Соединение примера 1079	0,4
50	Соединение примера 1080	0,6

5	Соединение примера 1083	0,3
	Соединение примера 1084	0,1
	Соединение примера 1086	1,0
	Соединение примера 1087	0,3
	Соединение примера 1089	1,0
10	Соединение примера 1106	1,0
	Соединение примера 1110	1,2
	Соединение примера 1113	0,7
	Соединение примера 1138	1,4

15

20

25

30

35

40

45

50

Испытание на связывание с серотониновым 5-HT _{2A} рецептором	
Испытуемое соединение	Ki (нМ)
5 Соединение примера 3	6,0
Соединение примера 4	7,7
Соединение примера 6	3,3
Соединение примера 7	2,9
10 Соединение примера 11	4,4
Соединение примера 14	2,4
Соединение примера 15	5,9
Соединение примера 17	3,4
15 Соединение примера 26	0,8
Соединение примера 27	1,0
Соединение примера 32	1,4
Соединение примера 40	0,6
20 Соединение примера 48	3,8
Соединение примера 58	4,9
Соединение примера 61	4,9
25 Соединение примера 62	4,7
Соединение примера 72	3,4
Соединение примера 73	5,6
Соединение примера 76	1,7
30 Соединение примера 80	3,3
Соединение примера 94	2,0
Соединение примера 95	2,3
Соединение примера 112	0,7
35 Соединение примера 115	3,7
Соединение примера 121	1,5
Соединение примера 123	1,4
Соединение примера 125	3,9
40 Соединение примера 127	2,4
Соединение примера 133	4,7
Соединение примера 144	1,4
Соединение примера 146	2,4
45 Соединение примера 160	0,6
Соединение примера 169	2,6
Соединение примера 170	3,3
Соединение примера 186	2,0
50 Соединение примера 190	0,6

5	Соединение примера 232	2,7
	Соединение примера 241	0,7
	Соединение примера 243	0,5
	Соединение примера 252	0,3
	Соединение примера 271	0,6
10	Соединение примера 281	0,6
	Соединение примера 286	0,8
	Соединение примера 301	0,4
	Соединение примера 303	2,5
	Соединение примера 307	0,7
15	Соединение примера 313	1,1
	Соединение примера 314	0,8
	Соединение примера 323	0,7
	Соединение примера 340	4,8
	Соединение примера 343	0,5
20	Соединение примера 345	1,9
	Соединение примера 354	0,6
	Соединение примера 358	1,1
	Соединение примера 359	1,1
	Соединение примера 363	1,1
25	Соединение примера 368	0,7
	Соединение примера 382	0,6
	Соединение примера 394	4,7
	Соединение примера 453	1,2
	Соединение примера 462	1,7
30	Соединение примера 546	0,7
	Соединение примера 650	0,6
	Соединение примера 706	0,9
	Соединение примера 802	1,4
	Соединение примера 1014	4,2
40	Соединение примера 1016	2,3
	Соединение примера 1026	3,5
	Соединение примера 1027	2,0
	Соединение примера 1034	3,1
	Соединение примера 1059	3,8
45	Соединение примера 1060	1,2
	Соединение примера 1061	1,2
	Соединение примера 1071	1,3
	Соединение примера 1076	12,4
	Соединение примера 1079	2,8
50	Соединение примера 1080	3,4

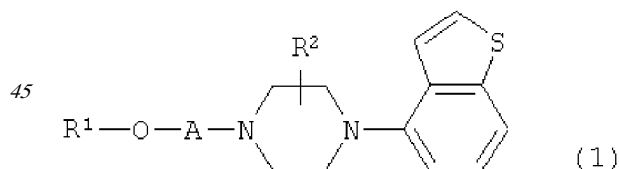
5	Соединение примера 1083	1,5
	Соединение примера 1084	1,4
	Соединение примера 1086	5,8
	Соединение примера 1087	2,6
	Соединение примера 1089	13,9
	Соединение примера 1106	7,1
10	Соединение примера 1110	4,9
	Соединение примера 1113	5,0
	Соединение примера 1138	19,7

Таблица 314

15	Испытуемое соединение	Коэффициент ингибирования поглощения серотонина (%) (300 нМ)
	Соединение примера 11	95,2
	Соединение примера 15	95,3
	Соединение примера 802	96,6
20	Соединение примера 1071	94,4
	Соединение примера 1076	87,8
	Соединение примера 1089	85,0
	Соединение примера 1083	96,3
25	Соединение примера 1106	69,9
	Соединение примера 1079	82,3
	Соединение примера 1080	95,6
	Соединение примера 1138	67,2
30	Соединение примера 1059	97,2
	Соединение примера 1060	97,5
	Соединение примера 1061	97,5
35	Соединение примера 1110	38,5
	Соединение примера 1086	98,6
	Соединение примера 1087	97,1
	Соединение примера 1113	59,3

Формула изобретения

1. Гетероциклическое соединение или его соль, представленное формулой (1):



где R² представляет собой атом водорода или низшую алкильную группу;

50 А представляет собой низшую алкиленовую группу или низшую алкениленовую группу и

R¹ представляет собой цикло(C₃-C₈)алкильную группу, ароматическую группу или гетероциклическую группу, выбранную из группы, состоящей из групп (I)-(IV),

определенных ниже:

(I) цикло(C₃-C₈)алкильная группа;

(II) ароматическая группа, выбранная из фенильной группы, нафтильной группы, дигидроинденильной группы и тетрагидронафтильной группы;

(III) насыщенная или ненасыщенная гетеромоноциклическая группа, содержащая 1-4 гетероатома, выбранных из группы, состоящей из атома азота, атома кислорода и атома серы; и

(IV) конденсированная с бензолом гетероциклическая группа, которая содержит 1-4 гетероатома, выбранных из группы, состоящей из атома азота, атома кислорода и атома серы, и которая выбрана из группы, состоящей из (1)

тетрагидрохиноксалинильной группы, (2) тетрагидрохиназолинильной группы, (3) дигидрохиназолинильной группы, (4) индолинильной группы, (5) индолильной группы, (6) изоиндолинильной группы, (7) бензимидазолильной группы, (8)

дигидробензимидазолильной группы, (9) тетрагидробензазепининой группы, (10) тетрагидробензодиазепининой группы, (11) гексагидробензазоцинильной группы, (12) дигидробензоксазининой группы, (13) дигидробензоксазолинильной группы, (14) бензизоксазолинильной группы, (15) бензоксадиазолинильной группы, (16)

тетрагидробензоксазепининой группы, (17) дигидробензотиазининой группы, (18) бензотиазолинильной группы, (19) бензоксатиолинильной группы, (20) хроменильной группы, (21) дигидробензофурильной группы, (22) карбазолинильной группы, (23) дибензофурильной группы и (24) хиноксалинильной группы;

причем в качестве заместителя в цикло(C₃-C₈)алкильной группе, ароматической группе и гетероциклической группе, представленных символом R¹, может присутствовать по крайней мере одна группа, выбранная из группы, состоящей из групп (1)-(66), определенных ниже:

(1) низшая алкильная группа,

(2) низшая алкенильная группа,

(3) галогензамещенная низшая алкильная группа,

(4) низшая алкоксигруппа,

(5) арилоксигруппа,

(6) низшая алкилтиогруппа,

(7) галогензамещенная низшая алкоксигруппа,

(8) гидроксигруппа,

(9) защищенная гидроксигруппа,

(10) гидроксизамещенная алкильная группа,

(11) защищенная гидроксизамещенная алкильная группа,

(12) атом галогена,

(13) цианогруппа,

(14) арильная группа,

(15) нитрогруппа,

(16) аминогруппа,

(17) аминогруппа, содержащая в качестве заместителя группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алканоильной группы, низшей алкоксикарбонильной группы, низшей алкилсульфонильной группы, карбамоильной группы, низшей алкилкарбамоильной группы, амино(низшей)алканоильной группы, низшей алканоиламино(низшей)алканоильной группы и низшей алкоксикарбониламино(низшей)алканоильной группы,

(18) низшая алканоильная группа,

(19) арилсульфонильная группа, которая может содержать низшую алкильную группу(ы) в арильной группе,

(20) карбоксигруппа,

(21) низшая алкоксикарбонильная группа,

(22) карбокси(низшая)алкильная группа,

(23) низшая алкоксикарбонил(низшая)алкильная группа,

(24) низшая алканоиламино(низшая)алканоильная группа,

(25) карбокси(низшая)алкенильная группа,

(26) низшая алкоксикарбонил(низшая)алкенильная группа,

(27) карбамоил(низшая)алкенильная группа, которая может содержать в качестве заместителя группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алкильной группы и галогензамещенной низшей алкильной группы,

(28) карбамоильная группа, которая может содержать в качестве заместителя группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из групп (i)-(lxxviii), определенных ниже:

(i) низшая алкильная группа,

(ii) низшая алкоксигруппа,

(iii) гидроксиз(низшая)алкильная группа,

(iv) низшая алкокси(низшая)алкильная группа,

(v) арилокси(низшая)алкильная группа,

(vi) галогензамещенная низшая алкильная группа,

(vii) амино(низшая)алкильная группа, которая может содержать группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алканоильной группы, ароильной группы и карбамоильной группы,

(viii) цикло(C₃-C₈)алкильная группа, которая может содержать группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алкильной группы,

гидроксигруппы, низшей алкоксикарбонильной группы и

фенил(низшей)алкоксигруппы, в качестве заместителя,

(ix) цикло(C₃-C₈)алкилзамещенная низшая алкильная группа,

(x) низшая алкенильная группа,

(xi) карбамоил(низшая)алкильная группа, которая может содержать группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алкильной группы, фенильной группы, которая может содержать низшую алкильную группу(ы), и фенильной группы (или групп), которая(ые) может(могут) содержать низшую алкоксигруппу(ы) в качестве заместителя,

(xii) низшая алкоксикарбонил(низшая)алкильная группа,

(xiii) фурил(низшая)алкильная группа (которая может содержать низшую алкильную группу(ы) в качестве заместителя в фурильной группе),

(xiv) тетрагидрофурил(низшая)алкильная группа,

(xv) 1,3-диоксоланил(низшая)алкильная группа,

(xvi) тетрагидропиранил(низшая)алкильная группа,

(xvii) пирролил(низшая)алкильная группа (которая может содержать низшую алкильную группу(ы) в качестве заместителя в пирролильной группе),

(xviii) низшая алкильная группа, замещенная дигидропиразолильной группой, которая может содержать оксогруппу(ы),

(xix) пиразолил(низшая)алкильная группа (которая может содержать низшую алкильную группу(ы) в качестве заместителя в пиразолильной группе),

(xx) имидазолил(низшая)алкильная группа,

- (xxi) пиридил(низшая)алкильная группа,
 (xxii) пиразинил(низшая)алкильная группа (которая может содержать низшую алкильную группу(ы) в качестве заместителя в пиразинильной группе),
 5 (xxiii) пирролидинил(низшая)алкильная группа (которая может содержать группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из оксогруппы (-групп) и низшей алкильной группы, в качестве заместителя в пирролидинильной группе),
 (xxiv) пиперидил(низшая)алкильная группа (которая может содержать группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из бензоильной группы и низшей
 10 алканоильной группы, в качестве заместителя в пиперидильной группе),
 (xxv) пиперазинил(низшая)алкильная группа (которая может содержать низшую алкильную группу(ы) в качестве заместителя в пиперазинильной группе),
 (xxvi) морфолинил(низшая)алкильная группа,
 (xxvii) тиенил(низшая)алкильная группа (которая может содержать низшую
 15 алкильную группу(ы) в качестве заместителя в тиенильной группе),
 (xxviii) тиазолил(низшая)алкильная группа,
 (xxix) дигидробензофурил(низшая)алкильная группа,
 (xxx) бензопиранил(низшая)алкильная группа (которая может содержать
 20 оксогруппу(ы) в качестве заместителя в бензопиранильной группе),
 (xxxi) бензимидазолил(низшая)алкильная группа,
 (xxxii) индолил(низшая)алкильная группа (которая может содержать низшую алкоксикарбонильную группу(ы) в низшей алкильной группе),
 (xxxiii) имидазолил(низшая)алкильная группа, которая содержит заместитель(и),
 25 выбранный(е) из группы, состоящей из карбамоильной группы и низшей алкоксикарбонильной группы, в низшей алкильной группе,
 (xxxiv) пиридилная группа, которая может содержать группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алкоксигруппы и низшей
 30 алкилтио(низшей)алкильной группы, в качестве заместителя,
 (xxxv) пирролидинильная группа, которая может содержать группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алкоксикарбонильной группы, низшей алканоильной группы и ароильной группы, в качестве заместителя,
 35 (xxxvi) пиперидильная группа, которая может содержать группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алкоксикарбонильной группы, низшей алканоильной группы и ароильной группы, которая может содержать группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из
 40 низшей алкильной группы и атома галогена, в качестве заместителя,
 (xxxvii) тетрагидрофурильная группа, которая может содержать оксогруппу(ы),
 (xxxviii) гексагидроазепинильная группа, которая может содержать оксогруппу(ы),
 (xxxix) пиразолильная группа, которая может содержать группу(ы),
 45 выбранныую(ые) из группы, состоящей из низшей алкильной группы, арильной группы и фурильной группы, в качестве заместителя,
 (xl) тиазолильная группа,
 (xli) тиадиазолильная группа, которая может содержать низшую алкильную группу(ы),
 50 (xlii) изоксазолильная группа, которая может содержать низшую алкильную группу(ы),
 (xliii) индазолильная группа,
 (xliv) индолильная группа,

(xlv) тетрагидробензотиазолильная группа,

(xlvi) тетрагидрохинолильная группа, которая может содержать группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алкоксигруппы, атома галогена и оксогруппы, в качестве заместителя,

(xlvii) хинолильная группа, которая может содержать низшую алкильную группу(ы),

(xlviii) бензодиоксолил(низшая)алкильная группа,

(xlix) арильная группа, которая может содержать в качестве заместителя

группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из атома галогена; низшей алкильной группы; низшей алкоксигруппы; галогензамещенной низшей алкильной группы; галогензамещенной низшей алкоксигруппы; низшей алкенильной группы; аминогруппы, которая может содержать группу(ы), выбранную(ые) из группы,

состоящей из низшей алканойльной группы, низшей алкилсульфонильной группы, низшей алкильной группы и арильной группы; сульфамойльной группы; низшей алкилтиогруппы; низшей алканойльной группы; низшей алкоксикарбонильной группы; пирролильной группы; низшей алкинильной группы; цианогруппы; нитрогруппы; арилоксигруппы; арил(низшей)алкоксигруппы; гидроксигруппы;

гидрокси(низшей)алкильной группы; карбамойльной группы, которая может содержать группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алкильной группы и арильной группы; пиразолильной группы; пирролидинильной группы, которая может содержать оксогруппу(ы); оксазолильной группы; имидазолильной группы, которая может содержать низшую алкильную группу(ы); дигидрофурильной группы, которая может содержать оксогруппу(ы); тиазолидинил(низшей)алкильной группы, которая может содержать оксогруппу(ы);

имидазолил(низшей)алканойльной группы и пиперидинилкарбонильной группы,

(I) циано(низшая)алкильная группа,

(Ii) дигидрохинолильная группа, которая может содержать группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алкильной группы и оксогруппы,

(Iii) галогензамещенная низшая алкиламиногруппа,

(Iiii) низшая алкилтио(низшая)алкильная группа,

(Iiv) амидиногруппа, которая может содержать низшую алкильную группу(ы),

(Iv) амидино(низшая)алкильная группа,

(Ivi) низшая алкенилокси(низшая)алкильная группа,

(Ivii) ариламиногруппа, которая может содержать заместитель(и), выбранный(е) из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алкоксигруппы, галогензамещенной низшей алкильной группы и галогензамещенной низшей алкоксигруппы, в арильной группе,

(Iviii) арил(низшая)алкенильная группа,

(Iix) пиридиламиногруппа, которая может содержать низшую алкильную группу(ы),

(Ix) арил(низшая)алкильная группа (которая может содержать в арильной группе и/или низшей алкильной группе группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из атома галогена, низшей алкильной группы, галогензамещенной низшей алкильной группы, галогензамещенной низшей алкоксигруппы, низшей алкоксигруппы, карбамойльной группы и низшей алкоксикарбонильной группы, в качестве заместителя),

(Ixi) низшая алкинильная группа,

(Ixii) арилокси(низшая)алкильная группа (которая может содержать в качестве

заместителя в арильной группе группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алкоксигруппы; карбамоильной группы, которая может содержать группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алкоксигруппы и низшей алкильной группы; и пирролидинильной группы, которая может содержать оксогруппу(ы)),

(Iхiii) изоксазолидинильная группа, которая может содержать оксогруппу(ы),

(Iхiv) дигидроинденильная группа,

(Iхv) арил(низшая)алкокси(низшая)алкильная группа,

(Iхvi) тетрагидропиранильная группа,

(Iхvii) азетидинильная группа, которая может содержать группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алканоильной группы и ароильной группы,

(Iхviii) азетидинил(низшая)алкильная группа, которая может содержать группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алканоильной группы и ароильной группы,

(Iхix) тетразолильная группа,

(Iхx) индолинильная группа, которая может содержать оксогруппу(ы),

(Iхxi) триазолильная группа, которая может содержать группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алкильной группы и низшей алкилтиогруппы,

(Iхxii) имидазолильная группа, которая может содержать карбамоильную группу(ы),

(Iхxiii) оксазолильная группа, которая может содержать низшую алкильную группу(ы),

(Iхxiv) изотиазолильная группа, которая может содержать низшую алкильную группу(ы),

(Iхxv) бензимидазолильная группа,

(Iхxvi) дигидробензотиазолильная группа, которая может содержать оксогруппу(ы),

(Iхxvii) тиенильная группа, которая может содержать низшую алкоксикарбонильную группу(ы), и

(Iхxviii) оксазолил(низшая)алкильная группа, которая может содержать низшую алкильную группу(ы),

(29) амино(низшая)алкильная группа, которая может содержать группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алкильной группы,

галогензамещенной низшей алкильной группы, низшей алкоксикарбонильной

группы, низшей алканоильной группы, арильной группы, арил(низшей)алкильной группы, ароильной группы и аминзамещенной алкильной группы (которая может содержать низшую алкильную группу(ы) в качестве заместителя в аминогруппе), в аминогруппе,

(30) низшая алкильная группа, замещенная карбамоильной группой, которая может содержать группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алкильной группы и галогензамещенной низшей алкильной группы,

(31) тиокарбамоильная группа, которая может содержать низшую алкильную группу(ы),

(32) сульфамойльная группа,

(33) оксазолидинильная группа, которая может содержать оксогруппу(ы),

(34) имидазолидинильная группа, которая может содержать заместитель(и), выбранный(е) из группы, состоящей из оксогруппы и низшей алкильной группы,

(35) пирролидинильная группа, которая может содержать оксогруппу(ы),

(36) имидазолильная группа,

(37) триазолильная группа,

(38) изоксазолильная группа,

5 (39) пиперидильная группа, которая может содержать заместитель(и),
выбранный(е) из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей
алканоильной группы, арилсульфонильной группы, оксогруппы, гидроксигруппы и
аминогруппы, которая может содержать группу(ы), выбранную(ые) из группы,
10 состоящей из низшей алкильной группы, низшей алканоильной группы, низшей
алкоксикарбонильной группы и низшей алканоиламино(низшей)алканоильной
группы,

(40) пиперидилкарбонильная группа, которая может содержать заместитель(и),
выбранный(е) из группы, состоящей из низшей алкильной группы, гидроксигруппы,
15 гидрокси(низшей)алкильной группы, низшей алканоильной группы,
карбокси(низшей)алкильной группы, низшей алкилкарбамоил(низшей)алкильной
группы, карбамоильной группы, низшей алкоксигруппы, карбоксигруппы, низшей
алкоксикарбонильной группы, аминогруппы (в которой могут присутствовать 1-2
20 группы, выбранные из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей
алканоильной группы, низшей алкоксикарбонильной группы и ароильной группы),
пиперидильной группы (в которой может(могут) присутствовать группа(ы),
выбранная(ые) из группы, состоящей из низшей алканоильной группы, низшей
алкоксикарбонильной группы и ароильной группы), пиперазинильной группы (в
25 которой может(могут) присутствовать низшая алкильная группа(ы) в качестве
заместителя), 1,4-диокса-8-азаспиро[4.5]децильной группы, морфолинийной
группы, гексагидро-1,4-дiazепинильной группы (в которой может(могут)
присутствовать низшая алкильная группа(ы) в качестве заместителя), пиридинильной
30 группы, пиридилоксигруппы, пиридил(низшей)алкоксигруппы,
тетрагидрохинолильной группы (в которой может(могут) присутствовать
оксогруппа(ы)), бензодиоксолильной группы, арил(низшей)алкоксигруппы (которая
может содержать группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из атома
галогена, низшей алкильной группы, низшей алкоксигруппы и галогензамещенной
35 низшей алкоксигруппы, в арильной группе), арильной группы (в которой
может(могут) присутствовать группа(ы), выбранная(ые) из группы, состоящей из
атома галогена, низшей алкоксигруппы, гидроксигруппы), арилоксигруппы (которая
может содержать в арильной группе группу(ы), выбранную(ые) из группы,
40 состоящей из цианогруппы, атома галогена, низшей алкильной группы, низшей
алкоксигруппы и галогензамещенной низшей алкильной группы),
арил(низшей)алкильной группы (которая может содержать в арильной группе
группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из атома галогена, низшей
алкильной группы, низшей алкоксигруппы и галогензамещенной низшей алкильной
45 группы) и ароильной группы (которая может содержать в арильной группе
группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из атома галогена и низшей
алкоксигруппы),

(41) пирролидинилкарбонильная группа, которая может содержать в качестве
50 заместителя группу, выбранную из группы, состоящей из
гидрокси(низшей)алкильной группы, карбамоильной группы, гидроксигруппы,
аминогруппы (которая может содержать в аминогруппе группу(ы), выбранную(ые)
из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алканоильной группы и

ароильной группы), морфолинил(низшей)алкильной группы, пирролидинил(низшей)алкильной группы, пиперидил(низшей)алкильной группы, пиперазинил(низшей)алкильной группы (которая может содержать в качестве заместителя в пиперазинильной группе низшую алкильную группу(ы)),
 5 амино(низшей)алкильной группы (которая может содержать в качестве заместителя в аминогруппе низшую алкильную группу(ы)), арилоксигруппы (которая может содержать галогензамещенную низшую алкоксигруппу(ы) в арильной группе), арилокси(низшей)алкильной группы (которая может содержать галогензамещенную
 10 низшую алкоксигруппу(ы) в арильной группе) и тетрагидрохинолильной группы (в которой может присутствовать оксогруппа(ы)),

(42) пиперазинилкарбонильная группа, которая может содержать в качестве заместителя группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алкильной группы, цикло(C₃-C₈)алкильной группы, низшей алканоильной группы,
 15 гидроксид(низшей)алкильной группы, низшей алкоксид(низшей)алкильной группы, низшей алкоксикарбонильной группы, амино(низшей)алкильной группы (которая может содержать низшую алкильную группу(ы) в качестве заместителя в аминогруппе), пиперидил(низшей)алкильной группы (которая может содержать
 20 низшую алкильную группу(ы) в качестве заместителя в пиперидильной группе), морфолинил(низшей)алкильной группы, пирролидинил(низшей)алкильной группы, 1,3-диоксоланил(низшей)алкильной группы,

тетрагидрофурил(низшей)алкильной группы, пиридил(низшей)алкильной группы (которая может содержать фенильную группу(ы) в качестве заместителя в низшей
 25 алкильной группе), имидазолил(низшей)алкильной группы; фурил(низшей)алкильной группы,

пирролидинилкарбонил(низшей)алкильной группы, пиперидильной группы, которая может содержать низшую алкильную группу(ы) в качестве заместителя,
 30 пиридил(низшей)алкильной группы (которая может содержать в качестве заместителя в пиридил(низшей)алкильной группе группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алкильной группы, цианогруппы и галогензамещенной низшей алкильной группы), тиено[2,3-*b*]пиридил(низшей)алкильной группы, арильной группы (в которой может(могут)
 35 присутствовать группа(ы), выбранная(ые) из группы, состоящей из атома галогена и низшей алкильной группы), ароильной группы, фурилкарбонильной группы, арил(низшей)алкоксикарбонильной группы и оксогруппы,

(43) гексагидроазепинилкарбонильная группа,

(44) гексагидро-1,4-дiazепинилкарбонильная группа, которая может содержать
 40 заместитель(и), выбранный(е) из группы, состоящей из низшей алкильной группы и пиридил(низшей)алкильной группы,

(45) дигидропирролилкарбонильная группа, которая может содержать низшую алкильную группу(ы),

(46) тиоморфолинилкарбонильная группа,

(47) морфолинилкарбонильная группа, которая может содержать группу(ы),
 45 выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алкильной группы, пиперидил(низшей)алкильной группы и арильной группы,

(48) тиазолидинилкарбонильная группа, которая может содержать арильную
 50 группу(ы), которая может содержать группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из низшей алкоксигруппы и цианогруппы,

(49) азабицикло[3.2.2]нонилкарбонильная группа,

(50) 8-азабицикло[3.2.1]октилкарбонильная группа, которая может содержать

галогензамещенную или незамещенную арилоксигруппу(ы),

(51) индолинилкарбонильная группа,

(52) тетрагидрохинолилкарбонильная группа,

(53) тетрагидропиридо[3,4-b]индолилкарбонильная группа,

(54) морфолинил(низшая)алкильная группа,

(55) пиперазинил(низшая)алкильная группа, которая может содержать низшую алкильную группу(ы) в пиперазинильной группе,

(56) морфолинилкарбонил(низшая)алкильная группа,

(57) пиперазинилкарбонил(низшая)алкильная группа, которая может содержать низшую алкильную группу(ы) в пиперазинильной группе,

(58) оксогруппа,

(59) амино(низшая)алкоксигруппа (которая может содержать низшую алкильную группу(ы) в аминогруппе),

(60) низшая алкокси(низшая)алкоксигруппа,

(61) пиперазинильная группа, которая может содержать группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из оксогруппы, низшей алкильной группы, низшей алканоильной группы и низшей алкоксикарбонильной группы,

(62) морфолинильная группа,

(63) 1,3,8-триазаспиро[4.5]деканилкарбонильная группа, которая может содержать группу(ы), выбранную(ые) из группы, состоящей из оксогруппы и арильной группы,

(64) тетрагидропиридилкарбонильная группа, которая может содержать пиридинильную группу(ы),

(65) имидазолидинилкарбонильная группа, которая может содержать тиоксогруппу(ы), и

(66) 1,4-диокса-8-азаспиро[4.5]деканильная группа.

2. Соединение по п.1, где

R^1 представляет собой цикло(C_5 - C_6)алкильную группу, ароматическую группу или гетероциклическую группу, выбранную из группы, состоящей из групп (I)-(IV), определенных ниже:

(I) цикло(C_5 - C_6)алкильная группа;

(II) ароматическая группа, выбранная из фенильной группы, нафтильной группы, дигидроинденильной группы и тетрагидронафтильной группы;

(III) насыщенная или ненасыщенная гетеромоноциклическая группа, которая содержит 1-2 гетероатома, выбранных из группы, состоящей из атома азота, атома кислорода и атома серы, и которая выбрана из группы, состоящей из пирролидинильной группы, пиперидильной группы, пиразолильной группы, пиридинильной группы, пиримидинильной группы, пиразинильной группы, изоксазолильной группы, тиазолильной группы, пиранильной группы и тиенильной группы; и

(IV) конденсированная с бензолом гетероциклическая группа, которая содержит 1-4 гетероатома, выбранных из группы, состоящей из атома азота, атома кислорода и атома серы, и которая выбрана из группы, состоящей из (1) тетрагидрохиноксалинильной группы, (2) тетрагидрохиназолинильной группы, (3) дигидрохиназолинильной группы, (4) индолинильной группы, (5) индолильной группы, (6) изоиндолинильной группы, (7) бензимидазолинильной группы, (8) дигидробензимидазолильной группы, (9) тетрагидробензазепинильной группы, (10) тетрагидробензодиазепинильной группы, (11) гексагидробензазоцинильной группы,

(12) дигидробензоксазинильной группы, (13) дигидробензоксазолильной группы, (14) бензизоксазолильной группы, (15) бензоксадиазолильной группы, (16) тетрагидробензоксазепинильной группы, (17) дигидробензотиазинильной группы, (18) бензотиазолильной группы, (19) бензоксатиолильной группы, (20) хроменильной группы, (21) дигидробензофурильной группы, (22) карбазолильной группы, (23) дибензофурильной группы и (24) хиноксалинильной группы;

причем в ароматической группе и гетероциклической группе, представленных символом R^1 , могут присутствовать в качестве заместителя(ей) 1-5 групп, выбранных из группы, состоящей из групп (1)-(66), определенных ниже:

- (1) низшая алкильная группа,
- (2) низшая алкенильная группа,
- (3) галогензамещенная низшая алкильная группа,
- (4) низшая алкоксигруппа,
- (5) феноксигруппа,
- (6) низшая алкилтиогруппа,
- (7) галогензамещенная низшая алкоксигруппа,
- (8) гидроксигруппа,
- (9) фенил(низшая)алкоксигруппа,
- (10) гидроксид(низшая)алкильная группа,
- (11) низшая алкоксид(низшая)алкильная группа,
- (12) атом галогена,
- (13) цианогруппа,
- (14) фенильная группа,
- (15) нитрогруппа,
- (16) аминогруппа,
- (17) аминогруппа, содержащая в качестве заместителя(ей) 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алканоильной группы, низшей алкоксикарбонильной группы, низшей алкилсульфонильной группы, карбамоильной группы, низшей алкилкарбамоильной группы, аминод(низшей)алканоильной группы, низшей алканоиламинод(низшей)алканоильной группы и низшей алкоксикарбониламинод(низшей)алканоильной группы,
- (18) низшая алканоильная группа,
- (19) фенилсульфонильная группа, которая может содержать одну низшую алкильную группу в фенильной группе,
- (20) карбоксигруппа,
- (21) низшая алкоксикарбонильная группа,
- (22) карбоксид(низшая)алкильная группа,
- (23) низшая алкоксикарбонил(низшая)алкильная группа,
- (24) низшая алканоиламинод(низшая)алканоильная группа,
- (25) карбоксид(низшая)алкенильная группа,
- (26) низшая алкоксикарбонил(низшая)алкенильная группа,
- (27) карбамоил(низшая)алкенильная группа, которая может содержать в качестве заместителя(ей) 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы и низшей алкильной группы, замещенной 1-3 атомами галогена,
- (28) карбамоильная группа, которая может содержать в качестве заместителя(ей) 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из групп (i)-(lxxviii), определенных ниже:
 - (i) низшая алкильная группа,

- (ii) низшая алкоксигруппа,
- (iii) гидроксизамещенная алкильная группа,
- (iv) низшая алкоксизамещенная алкильная группа,
- (v) феноксизамещенная алкильная группа,
- 5 (vi) галогензамещенная низшая алкильная группа,
- (vii) аминоксизамещенная алкильная группа, которая может содержать 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей, алканоильной группы, бензоильной группы и карбамоильной группы,
- 10 (viii) цикло(C₃-C₈)алкильная группа, которая может содержать 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, гидроксигруппы, низшей алкоксикарбонильной группы и фенил(низшей)алкоксигруппы, в качестве заместителя(ей),
- (ix) цикло(C₃-C₈)алкилзамещенная низшая алкильная группа,
- 15 (x) низшая алкенильная группа,
- (xi) низшая алкильная группа, содержащая 1-2 карбамоильных группы, которые могут содержать в качестве заместителя(ей) 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, фенильной группы, которая может
- 20 содержать одну низшую алкильную группу, и фенильной группы, которая может содержать одну низшую алкоксигруппу,
- (xii) низшая алкильная группа, содержащая 1-2 низших алкоксикарбонильных групп,
- (xiii) фурил(низшая)алкильная группа (которая может содержать 1-2 низших алкильных группы в качестве заместителя(ей) в фурильной группе),
- 25 (xiv) тетрагидрофурил(низшая)алкильная группа,
- (xv) 1,3-диоксоланил(низшая)алкильная группа,
- (xvi) тетрагидропиранил(низшая)алкильная группа,
- 30 (xvii) пирролил(низшая)алкильная группа (которая может содержать 1-2 низших алкильных группы в качестве заместителя(ей) в пиррольной группе),
- (xviii) низшая алкильная группа, замещенная дигидропиразолильной группой, которая может содержать одну оксогруппу,
- (xix) пиразолил(низшая)алкильная группа (которая может содержать 1-3 низших алкильных группы в качестве заместителя(ей) в пиразолильной группе),
- 35 (xx) имидазолил(низшая)алкильная группа,
- (xxi) пиридил(низшая)алкильная группа,
- (xxii) пиразинил(низшая)алкильная группа (которая может содержать 1-3
- 40 (предпочтительно 1) низших алкильных группы в качестве заместителя(ей) в пиразинильной группе),
- (xxiii) пирролидинил(низшая)алкильная группа (которая может содержать 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из оксогруппы и низшей алкильной группы, в качестве заместителя(ей) в пирролидинильной группе),
- 45 (xxiv) пиперидил(низшая)алкильная группа (которая может содержать 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из бензоильной группы и низшей алканоильной группы, в качестве заместителя(ей) в пиперидильной группе),
- (xxv) пиперазинил(низшая)алкильная группа (которая может содержать 1-3
- 50 низших алкильных группы в качестве заместителя(ей) в пиперазинильной группе),
- (xxvi) морфолинил(низшая)алкильная группа,
- (xxvii) тиенил(низшая)алкильная группа (которая может содержать 1-3 низших алкильных группы в качестве заместителя(ей) в тиенильной группе),

- (xxviii) тиазолил(низшая)алкильная группа,
 (xxix) дигидробензофурил(низшая)алкильная группа,
 (xxx) бензопиранил(низшая)алкильная группа (которая может содержать одну оксогруппу в качестве заместителя в бензопиранильной группе),
 5 (xxxi) бензимидазолил(низшая)алкильная группа,
 (xxxii) индолил(низшая)алкильная группа, которая может содержать 1-3 низших алкоксикарбонильных группы в низшей алкильной группе),
 (xxxiii) имидазолил(низшая)алкильная группа, которая содержит 1-3 заместителя,
 10 выбранных из группы, состоящей из карбамоильной группы и низшей алкоксикарбонильной группы, в низшей алкильной группе,
 (xxxiv) пиридилная группа, которая может содержать 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алкоксигруппы и низшей алкилтио(низшей)алкильной группы, в качестве заместителя(ей),
 15 (xxxv) пирролидинильная группа, которая может содержать 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алкоксикарбонильной группы, низшей алканоильной группы и бензоильной группы, в качестве заместителя(ей),
 20 (xxxvi) пиперидильная группа, которая может содержать 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алкоксикарбонильной группы, низшей алканоильной группы и бензоильной группы (которая может содержать 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы и атома галогена, в качестве заместителя(ей) в фенильной группе),
 25 (xxxvii) тетрагидрофурильная группа, которая может содержать одну оксогруппу,
 (xxxviii) гексагидроазепинильная группа, которая может содержать одну оксогруппу,
 (xxxix) пиразолильная группа, которая может содержать 1-3 группы, выбранных
 30 из группы, состоящей из низшей алкильной группы, фенильной группы и фурильной группы, в качестве заместителя(ей),
 (xl) тиазолильная группа,
 (xli) тиadiaзолильная группа, которая может содержать 1-3 низших алкильных группы,
 35 (xlii) изоксазолильная группа, которая может содержать 1-3 низших алкильных группы,
 (xliii) индазолильная группа,
 (xliv) индолильная группа,
 40 (xlv) тетрагидробензотиазолильная группа,
 (xlvi) тетрагидрохинолильная группа, которая может содержать 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алкоксигруппы, атома галогена и оксогруппы, в качестве заместителя(ей),
 (xlvii) хинолильная группа, которая может содержать 1-3 низших алкильных
 45 группы,
 (xlviii) бензодиоксилил(низшая)алкильная группа,
 (xlix) фенильная группа или нафтильная группа, которая может содержать в качестве заместителя(ей) 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из
 50 атома галогена; низшей алкильной группы; низшей алкоксигруппы; галогензамещенной низшей алкильной группы; галогензамещенной низшей алкоксигруппы; низшей алкенильной группы; аминогруппы, которая может содержать 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алканоильной

группы, низшей алкилсульфонильной группы, низшей алкильной группы и арильной группы; сульфамойльной группы; низшей алкилтиогруппы; низшей алканоильной группы; низшей алкоксикарбонильной группы; пиррольной группы; низшей алкинильной группы; цианогруппы; нитрогруппы; фенилоксигруппы;

5 фенил(низшей)алкоксигруппы; гидроксигруппы;

гидрокси(низшей)алкильной группы; карбамоильной группы, которая может содержать 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы и фенильной группы; пиразолильной группы; пирролидинильной группы,

10 которая может содержать одну оксогруппу; оксазолильной группы; имидазолильной группы, которая может содержать 1-3 низших алкильных группы;

дигидрофурильной группы, которая может содержать одну оксогруппу;

тиазолидинил(низшей)алкильной группы, которая может содержать две оксогруппы;

имидазолил(низшей)алканоильной группы и пиперидинилкарбонильной группы,

15 (I) циано(низшая)алкильная группа,

(ii) дигидрохинолильная группа, которая может содержать 1-3 группы,

выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы и оксогруппы,

(iii) галогензамещенная низшая алкиламиногруппа,

20 (iii) низшая алкилтио(низшая)алкильная группа,

(iv) амидиногруппа, которая может содержать низшую алкильную группу,

(iv) амидино(низшая)алкильная группа,

(vi) низшая алкенилокси(низшая)алкильная группа,

25 (vii) фениламиногруппа, которая может содержать 1-3 заместителя, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алкоксигруппы, галогензамещенной низшей алкильной группы и галогензамещенной низшей алкоксигруппы, в фенильной группе,

(viii) фенил(низшая)алкенильная группа,

30 (ix) пиридиламиногруппа, которая может содержать 1-3 низших алкильных группы,

(ix) фенил(низшая)алкильная группа (которая может содержать в качестве заместителя(ей) в фенильной группе и/или низшей алкильной группе 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из атома галогена, низшей алкильной группы, галогензамещенной низшей алкильной группы, галогензамещенной низшей алкоксигруппы, низшей алкоксигруппы, карбамоильной группы и низшей алкоксикарбонильной группы),

(xi) низшая алкинильная группа,

40 (xii) фенилокси(низшая)алкильная группа (которая может содержать в качестве заместителя(ей) в фенильной группе 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкоксигруппы, N-низший алкокси-N-низшей алкилкарбамоильной группы и оксопирролидинильной группы),

(xiii) изоксазолидинильная группа, которая может содержать одну оксогруппу,

45 (xiv) дигидроинденильная группа,

(xv) фенил(низшая)алкокси(низшая)алкильная группа,

(xvi) тетрагидропиранильная группа,

(xvii) азетидинильная группа, которая может содержать 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алканоильной группы и бензоильной группы,

50 (xviii) азетидинил(низшая)алкильная группа, которая может содержать 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алканоильной группы и бензоильной группы,

- (Ixi) тетразолильная группа,
 (Ixx) индолинильная группа, которая может содержать одну оксогруппу,
 (Ixxi) триазолильная группа, которая может содержать 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы и низшей алкилтиогруппы,
 5 (Ixxii) имидазолильная группа, которая может содержать 1-3 карбамоильных группы,
 (Ixxiii) оксазолильная группа, которая может содержать 1-3 низших алкильных группы,
 10 (Ixxiv) изотиазолильная группа, которая может содержать 1-3 низших алкильных группы,
 (Ixxv) бензимидазолильная группа,
 (Ixxvi) дигидробензотиазолильная группа, которая может содержать одну оксогруппу,
 15 (Ixxvii) тиенильная группа, которая может содержать 1-3 низших алкоксикарбонильных группы, и
 (Ixxviii) оксазолил(низшая)алкильная группа, которая может содержать 1-3 низших алкильных группы,
 20 (29) амино(низшая)алкильная группа, которая может содержать 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, галогензамещенной низшей алкильной группы, низшей алкоксикарбонильной группы, низшей алканоильной группы, фенильной группы, фенил(низшей)алкильной группы, бензоильной группы и аминозамещенной алкильной группы (которая может
 25 содержать 1-2 низших алкильных группы в качестве заместителя(ей) в аминогруппе), в аминогруппе,
 (30) низшая алкильная группа, замещенная одной карбамоильной группой, которая может содержать 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы и галогензамещенной низшей алкильной группы,
 30 (31) тиокарбамоильная группа, которая может содержать 1-2 низших алкильных группы,
 (32) сульфамойльная группа,
 (33) оксазолидинильная группа, которая может содержать одну оксогруппу,
 35 (34) имидазолидинильная группа, которая может содержать 1-2 заместителя, выбранных из группы, состоящей из оксогруппы и низшей алкильной группы,
 (35) пирролидинильная группа, которая может содержать одну оксогруппу,
 (36) имидазолильная группа,
 40 (37) триазолильная группа,
 (38) изоксазолильная группа,
 (39) пиперидильная группа, которая может содержать 1-3 заместителя, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алканоильной группы, низшей алкилфенилсульфонильной группы, оксогруппы, гидроксигруппы и
 45 аминогруппы, которая может содержать 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алканоильной группы, низшей алкоксикарбонильной группы и низшей алканоиламино(низшей)алканоильной группы,
 50 (40) пиперидилкарбонильная группа, которая может содержать 1-3 заместителя, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, гидроксигруппы, гидроксизамещенной алкильной группы, низшей алканоильной группы, карбокси(низшей)алкильной группы, низшей алкилкарбамоил(низшей)алкильной

группы, карбамоильной группы, низшей алкоксигруппы, карбоксигруппы, низшей
 алкоксикарбонильной группы, аминогруппы (в которой могут присутствовать 1-2
 группы, выбранные из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей
 алканоильной группы, низшей алкоксикарбонильной группы и бензоильной
 5 группы), пиперидильной группы (в которой могут присутствовать 1-3 группы,
 выбранных из группы, состоящей из низшей алканоильной группы, низшей
 алкоксикарбонильной группы и бензоильной группы), пиперазинильной группы (в
 которой могут присутствовать 1-3 низших алкильных группы в качестве
 10 заместителя(ей)), 1,4-диокса-8-азаспиро[4.5]децильной группы, морфолинильной
 группы, гексагидро-1,4-дiazепинильной группы (в которой может присутствовать
 одна низшая алкильная группа в качестве заместителя), пиридилной группы,
 пиридилоксигруппы, пиридил(низшей)алкоксигруппы, тетрагидрохинолильной
 группы (в которой может присутствовать одна оксогруппа), бензодиоксолильной
 15 группы, фенил(низшей)алкоксигруппы (которая может содержать в фенильной
 группе 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из атома галогена, низшей
 алкильной группы, низшей алкоксигруппы и галогензамещенной низшей
 алкоксигруппы), фенильной группы, (в которой могут присутствовать 1-3 группы,
 20 выбранных из группы, состоящей из атома галогена, низшей алкоксигруппы и
 гидроксигруппы), фенилоксигруппы (которая может содержать в фенильной
 группе 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из цианогруппы, атома
 галогена, низшей алкильной группы, низшей алкоксигруппы и галогензамещенной
 низшей алкильной группы), фенил(низшей)алкильной группы (в фенильной группе
 25 могут присутствовать 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из атома
 галогена, низшей алкильной группы, низшей алкоксигруппы и галогензамещенной
 низшей алкильной группы) и бензоильной группы (которая может содержать в
 фенильной группе 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из атома галогена и
 30 низшей алкоксигруппы),

(41) пирролидинилкарбонильная группа, которая может содержать в качестве
 заместителя(ей) 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из
 гидроксид(низшей)алкильной группы, карбамоильной группы, гидроксигруппы,
 аминогруппы (которая может содержать в аминогруппе 1-2 группы, выбранных из
 35 группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алканоильной группы и
 бензоильной группы), морфолинил(низшей)алкильной группы,
 пирролидинил(низшей)алкильной группы, пиперидил(низшей)алкильной группы,
 пиперазинил(низшей)алкильной группы (которая может содержать в качестве
 40 заместителя в пиперазинильной группе одну низшую алкильную группу),
 аминод(низшей)алкильной группы (которая может содержать в качестве заместителя
 в аминогруппе 1-2 низших алкильных группы), фенилоксигруппы (которая может
 содержать 1-3 галогензамещенных низших алкоксигруппы в фенильной группе),
 фенилокси(низшей)алкильной группы (которая может содержать 1-3
 45 галогензамещенных низших алкоксигруппы в фенильной группе) и
 тетрагидрохинолильной группы (в которой может присутствовать оксогруппа),

(42) пиперазинилкарбонильная группа, которая может содержать в качестве
 заместителя(ей) 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей, алкильной
 50 группы, цикло(C₃-C₈)алкильной группы, низшей алканоильной группы,
 гидроксид(низшей)алкильной группы, низшей алкоксид(низшей)алкильной группы,
 низшей алкоксикарбонильной группы, аминод(низшей)алкильной группы (которая
 может содержать 1-2 низших алкильных группы в качестве заместителя(ей) в

- аминогруппе), пиперидил(низшей)алкильной группы (которая может содержать 1-2 низших алкильных группы в качестве заместителя(ей) в пиперидильной группе), морфолинил(низшей)алкильной группы, пирролидинил(низшей)алкильной группы, 1,3-диоксоранил(низшей)алкильной группы, тетрагидрофурил(низшей)алкильной
- 5 группы, пиридил(низшей)алкильной группы (которая может содержать 1-2 фенильные группы в качестве заместителя(ей) в низшей алкильной группе), имидазолил(низшей)алкильной группы, фурил(низшей)алкильной группы, пирролидинилкарбонил(низшей)алкильной группы, пиперидильной группы, которая
- 10 может содержать 1-2 низших алкильных группы в качестве заместителя(ей), пиридийной группы (которая может содержать в качестве заместителя(ей) в пиридийной группе 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, цианогруппы и галогензамещенной низшей алкильной группы), тиено[2,3-b]пиридийной группы, фенильной группы (в которой могут
- 15 присутствовать 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из атома галогена и низшей алкильной группы), бензоильной группы, фурилкарбонильной группы, фенил(низшей)алкоксикарбонильной группы и оксогруппы,
- (43) гексагидроазепинилкарбонильная группа,
- 20 (44) гексагидро-1,4-дiazепинилкарбонильная группа, которая может содержать 1-3 заместителя, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы и пиридийной группы,
- (45) дигидропирролилкарбонильная группа, которая может содержать 1-3 низших алкильных группы,
- 25 (46) тиоморфолинилкарбонильная группа,
- (47) морфолинилкарбонильная группа, которая может содержать 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы,
- пиперидил(низшей)алкильной группы и фенильной группы,
- 30 (48) тиазолидинилкарбонильная группа, которая может содержать 1-3 фенильных группы, которые могут содержать 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкоксигруппы и цианогруппы,
- (49) азабицикло[3.2.2]нонилкарбонильная группа,
- (50) 8-азабицикло[3.2.1]октилкарбонильная группа, которая может содержать 1-3
- 35 галогензамещенных или незамещенных фенилоксигруппы,
- (51) индолинилкарбонильная группа,
- (52) тетрагидрохинолилкарбонильная группа,
- (53) тетрагидропиридо[3.4-b]индолилкарбонильная группа,
- 40 (54) морфолинил(низшая)алкильная группа,
- (55) пиперазинил(низшая)алкильная группа, которая может содержать 1-3 низших алкильных группы в пиперазинильной группе,
- (56) морфолинилкарбонил(низшая)алкильная группа,
- (57) пиперазинилкарбонил(низшая)алкильная группа, которая может содержать 1-
- 45 3 низших алкильных группы в пиперазинильной группе,
- (58) оксогруппа,
- (59) амино(низшая)алкоксигруппа (которая может содержать 1-2 низших алкильных группы в аминогруппе),
- 50 (60) низшая алкокси(низшая)алкоксигруппа,
- (61) пиперазинильная группа, которая может содержать 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из оксогруппы, низшей алкильной группы, низшей алканоильной группы и низшей алкоксикарбонильной группы,

(62) морфолинильная группа,
 (63) 1,3,8-триазаспиро[4.5]деканилкарбонильная группа, которая может
 содержать 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из оксогруппы и фенильной
 группы,

(64) тетрагидропиридилкарбонильная группа, которая может содержать 1-3
 пиридинных группы,

(65) имидазолидинилкарбонильная группа, которая может содержать одну
 тиоксогруппу, и

(66) 1,4-диокса-8-азаспиро[4.5]деканильная группа.

3. Соединение по п.1 или 2, где А представляет собой низшую алкиленовую
 группу.

4. Соединение по п.3, где R¹ представляет собой цикло(C₅-C₆)алкильную группу,
 ароматическую группу или гетероциклическую группу, выбранную из группы,
 состоящей из групп (I)-(III), определенных ниже:

(I) цикло(C₅-C₆)алкильная группа,

(II) фенильная группа и

(III) насыщенная или ненасыщенная гетеромоноциклическая группа,
 содержащая 1-2 атома азота, выбранная из группы, состоящей из пирролидинильной
 группы, пиперидильной группы, пиразолильной группы, пиридинильной группы,
 пиримидинильной группы и тиазолильной группы, причем

в цикло(C₅-C₆)алкильной группе, ароматической группе и гетероциклической
 группе, представленных символом R¹, могут присутствовать в качестве
 заместителя(ей) 1-5 групп, выбранных из группы, состоящей из групп (1)-(66),
 определенных в п.2.

5. Соединение по п.4, где R¹ представляет собой (I) цикло(C₅-C₆)алкильную
 группу, причем в цикло(C₅-C₆)алкильной группе, представленной символом R¹,
 могут присутствовать в качестве заместителя(ей) 1-5 групп, выбранных из группы,
 состоящей из групп (1)-(66), определенных в п.2.

6. Соединение по п.4, где R¹ представляет собой (II) фенильную группу, причем в
 ароматической группе, представленной символом R¹, могут присутствовать в
 качестве заместителя(ей) 1-5 групп, выбранных из группы, состоящей из групп (1)-
 (66), определенных в п.2.

7. Соединение по п.4, где R¹ представляет собой (III) насыщенную или
 ненасыщенную гетеромоноциклическую группу, содержащую 1-2 атома азота,
 выбранную из пирролидинильной группы, пиперидильной группы, пиразолильной
 группы, пиридинильной группы, пиримидинильной группы и тиазолильной группы,
 причем в гетероциклической группе, представленной символом R¹, могут
 присутствовать в качестве заместителя(ей) 1-5 групп, выбранных из группы,
 состоящей из групп (1)-(66), определенных в п.2.

8. Соединение по п.4, где R¹ представляет собой цикло(C₅-C₆)алкильную группу,
 ароматическую группу или гетероциклическую группу, выбранную из группы,
 состоящей из групп (I)-(III), определенных ниже:

(I) цикло(C₅-C₆)алкильная группа,

(II) фенильная группа и

(III) насыщенная или ненасыщенная гетеромоноциклическая группа,
 содержащая 1-2 атома азота, выбранная из пирролидинильной группы,
 пиперидильной группы, пиразолильной группы, пиридинильной группы,

пиримидинильной группы и тиазолильной группы, причем

в цикло(C₅-C₆)алкильной группе, ароматической группе и гетероциклической группе, представленных символом R¹, могут присутствовать в качестве

заместителя(ей) 1-5 групп, выбранных из группы, состоящей из групп (1), (4), (10), (17), (18), (21), (28), (29), (30), (33), (34), (35), (36), (39), (61) и (62), определенных ниже:

(1) низшая алкильная группа,

(4) низшая алкоксигруппа,

(10) гидроксизамещенная алкильная группа,

(17) аминогруппа, содержащая 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алканойльной группы, низшей

алкоксикарбонильной группы, низшей алкилсульфонильной группы, карбамоильной группы, низшей алкилкарбамоильной группы, аминозамещенной алканойльной группы, низшей алканойламино(замещенной) алканойльной группы и низшей

алкоксикарбонилламино(замещенной) алканойльной группы, в качестве заместителя(ей),

(18) низшая алканойльная группа,

(21) низшая алкоксикарбонильная группа,

(28) карбамоильная группа, которая может содержать в качестве заместителя(ей)

1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из групп (i), (ii), (iv), (xii) и (xxi), определенных ниже:

(i) низшая алкильная группа,

(ii) низшая алкоксигруппа,

(iv) низшая алкоксизамещенная алкильная группа,

(xii) низшая алкильная группа, содержащая 1-2 низших алкоксикарбонильных групп,

(xxi) пиримидил(замещенная) алкильная группа,

(29) аминозамещенная алкильная группа, которая может содержать в аминогруппе 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы,

галогензамещенной низшей алкильной группы, низшей алкоксикарбонильной группы, низшей алканойльной группы, фенильной группы, фенил(замещенная) алкильной группы, бензоильной группы и аминозамещенной низшей алкильной группы

(которая может содержать 1-2 низших алкильных группы в качестве заместителя(ей) в аминогруппе),

(30) низшая алкильная группа, замещенная одной карбамоильной группой, которая может содержать 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы и галогензамещенной низшей алкильной группы,

(33) оксазолидинильная группа, которая может содержать одну оксогруппу,

(34) имидазолидинильная группа, которая может содержать 1-2 заместителя, выбранных из группы, состоящей из оксогруппы и низшей алкильной группы,

(35) пирролидинильная группа, которая может содержать одну оксогруппу,

(36) имидазолильная группа,

(39) пиперидильная группа, которая может содержать 1-3 заместителя, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алканойльной группы, низшей алкилфенилсульфонильной группы, оксогруппы, гидроксигруппы и аминогруппы, которая может содержать 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, низшей алканойльной группы, низшей алкоксикарбонильной группы и низшей алканойламино(замещенной) алканойльной группы,

(61) пиперазинильная группа, которая может содержать 1-3 группы, выбранных из

группы, состоящей из оксогруппы, низшей алкильной группы, низшей алканоильной группы и низшей алкоксикарбонильной группы, и

(62) морфолинильная группа.

9. Соединение по п.8, где R^1 представляет собой (I) циклогексильную группу, причем в цикло(C_5 - C_6)алкильной группе, представленной символом R^1 , могут присутствовать в качестве заместителя(ей) 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из групп (1), (4), (10), (17), (18), (21), (28), (29), (30), (33), (34), (35), (36), (39), (61) и (62), определенных в п.8.

10. Соединение по п.8, где R^1 представляет собой (II) фенильную группу, причем в ароматической группе, представленной символом R^1 , могут присутствовать в качестве заместителя(ей) 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из групп (1), (4), (10), (17), (18), (21), (28), (29), (30), (33), (34), (35), (36), (39), (61) и (62),

определенных в п.8.

11. Соединение по п.10, где R^1 представляет собой (II) фенильную группу, причем в ароматической группе, представленной символом R^1 , могут присутствовать в качестве заместителя(ей) 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из групп (1), (4), (10), (17), (18), (28), (33), (35), (39) и (61), определенных ниже:

(1) низшая алкильная группа,

(4) низшая алкоксигруппа,

(10) гидроксиз(низшая)алкильная группа,

(17) аминогруппа, содержащая в качестве заместителя(ей) 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы, аминонизшей алканоильной группы, низшей алканоиламинонизшей алканоильной группы и низшей алкоксикарбониламинонизшей алканоильной группы,

(18) низшая алканоильная группа,

(28) карбамоильная группа, содержащая одну низшую алкоксиз(низшую)алкильную группу,

(33) оксазолидинильная группа, которая может содержать одну оксогруппу,

(35) пирролидинильная группа, которая может содержать одну оксогруппу,

(39) пиперидильная группа и

(61) пиперазинильная группа, которая может содержать 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из оксогруппы, низшей алканоильной группы и низшей алкоксикарбонильной группы.

12. Соединение по п.11, где R^1 представляет собой фенильную группу, содержащую, в фенильной группе, одну низшую алкильную группу, одну низшую алкоксигруппу и одну аминогруппу, содержащую 1 или 2 низших алкильных группы в аминогруппе;

фенильную группу, содержащую, в фенильной группе, одну низшую алкильную группу, одну низшую алкоксигруппу и одну карбамоильную группу, содержащую одну низшую алкильную группу, которая содержит две низших алкоксигруппы в низшей алкильной группе;

фенильную группу, содержащую, в фенильной группе, одну гидроксиз(низшую)алкильную группу, одну низшую алкоксигруппу и одну оксазолидинильную группу, содержащую одну оксогруппу в оксазолидинильной группе;

фенильную группу, содержащую, в фенильной группе, одну низшую алкильную группу, одну низшую алкоксигруппу и одну пирролидинильную группу;

фенильную группу, содержащую, в фенильной группе, одну низшую алкильную группу, одну низшую алкоксигруппу и одну пиперидильную группу;

фенильную группу, содержащую, в фенильной группе, одну низшую алкильную группу, одну низшую алкоксигруппу и одну пиперазильную группу, содержащую
5 одну низшую алканоильную группу в пиперазильной группе;

фенильную группу, содержащую, в фенильной группе, одну низшую алкильную группу, одну низшую алкоксигруппу и одну пиперазильную группу, содержащую одну низшую алканоильную группу и одну оксогруппу в пиперазильной группе;

10 фенильную группу, содержащую, в фенильной группе, одну низшую алкильную группу, одну низшую алкоксигруппу и одну пиперазильную группу, содержащую одну низшую алкоксикарбонильную группу и одну оксогруппу в пиперазильной группе;

15 фенильную группу, содержащую, в фенильной группе, одну низшую алкильную группу, одну низшую алкоксигруппу и одну N-[(N-низший алкоксикарбониламино)низший алканоил]аминогруппу;

фенильную группу, содержащую, в фенильной группе, одну низшую алкильную группу, одну низшую алкоксигруппу и одну N-
20 (амино(низший)алканоил)аминогруппу;

фенильную группу, содержащую, в фенильной группе, одну низшую алкильную группу, одну низшую алкоксигруппу и одну N-[(N-низший алканоиламино)низший алканоил]аминогруппу;

25 фенильную группу, содержащую, в фенильной группе, одну низшую алкоксигруппу, одну низшую алканоильную группу и одну пиперазильную группу, содержащую одну низшую алкоксикарбонильную группу в пиперазильной группе; или

30 фенильную группу, содержащую, в фенильной группе, одну низшую алкоксигруппу, одну гидроксизамещенную алкильную группу и одну пиперазильную группу, содержащую одну низшую алкоксикарбонильную группу в пиперазильной группе.

13. Соединение по п.12, выбранное из группы, состоящей из

35 (1) N-метил-4-[3-{4-(бензо[b]тиофен-4-ил)пиперазин-1-ил}пропокси]-3-метокси-5-метиланилина;

(2) 4-[3-{4-(бензо[b]тиофен-4-ил)пиперазин-1-ил}пропокси]-N,N-диметил-3-метокси-5-метиланилина;

40 (3) 4-[3-{4-(бензо[b]тиофен-4-ил)пиперазин-1-ил}пропокси]-N-(2,2-диметоксиэтил)-3-метокси-5-метилбензамида;

(4) 1-(бензо[b]тиофен-4-ил)-4-[3-{2-метокси-6-метил-4-(пирролидин-1-ил)феноксипропил}пиперазина;

(5) 1-(бензо[b]тиофен-4-ил)-4-[3-{2-метокси-6-метил-4-(пиперидин-1-ил)феноксипропил}пиперазина;

45 (6) 1-ацетил-4-{4-[3-{4-(бензо[b]тиофен-4-ил)пиперазин-1-ил}пропокси]-3-метокси-5-метилфенил}пиперазина;

(7) 4-ацетил-1-{4-[3-{4-(бензо[b]тиофен-4-ил)пиперазин-1-ил}пропокси]-3-метокси-5-метилфенил}пиперазин-2-она;

50 (8) 4-{4-[3-{4-(бензо[b]тиофен-4-ил)пиперазин-1-ил}пропокси]-3-метокси-5-метилфенил}-3-оксо-1-метоксикарбонилпиперазина;

(9) трет-бутил N-(N-{4-[3-{4-(бензо[b]тиофен-4-ил)пиперазин-1-ил}пропокси]-3-метокси-5-метилфенил}карбамоилметил)карбамата;

(10) 2-амино-N-{4-[3-{4-(бензо[b]тиофен-4-ил)пиперазин-1-ил}пропокси]-3-метокси-5-метил фенил}ацетамида;

(11) 2-ацетиламино-N-{4-[3-{4-(бензо[b]тиофен-4-ил)пиперазин-1-ил}пропокси]-3-метокси-5-метилфенил}ацетамида;

(12) 4-{4-[3-{4-(бензо[b]тиофен-4-ил)пиперазин-1-ил}пропокси]-3-формил-5-метоксифенил}-1-метоксикарбонилпиперазина и

(13) 4-{4-[3-{4-(бензо[b]тиофен-4-ил)пиперазин-1-ил}пропокси]-3-гидроксиметил-5-метоксифенил}-1-метоксикарбонилпиперазина;

или его соль.

14. Соединение по п.8, где R^1 представляет собой насыщенную или ненасыщенную гетеромоноциклическую группу, содержащую 1-2 атома азота, выбранную из пиперидильной группы, пиразолильной группы и тиазолильной группы, причем в гетероциклической группе, представленной символом R^1 , могут присутствовать в качестве заместителя(ей) 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из групп (1), (4), (10), (17), (18), (21), (28), (29), (30), (33), (34), (35), (36), (39), (61) и (62), определенных в п.8.

15. Соединение по п.14, где R^1 представляет собой (III) насыщенную или ненасыщенную гетеромоноциклическую группу, содержащую 1-2 атома азота, выбранную из пиперидильной группы, пиразолильной группы и тиазолильной группы, причем в гетероциклической группе, представленной символом R^1 , могут присутствовать в качестве заместителя(ей) 1-3 группы, выбранных из группы, состоящей из групп (1), (17) и (28), определенных ниже:

(1) низшая алкильная группа;

(17) аминогруппа, содержащая 1-2 группы, выбранных из группы, состоящей из низшей алкильной группы и низшей алканоильной группы, в качестве заместителя(ей); и

(28) карбамоильная группа, которая может содержать 1-2 низших алкильных группы.

16. Соединение по п.15, где R^1 представляет собой:

пиразолильную группу, содержащую одну низшую алкильную группу и одну низшую алканоиламиногруппу;

пиразолильную группу, содержащую одну низшую алкильную группу и одну N,N-ди(низшую)алкиламиногруппу;

пиперидильную группу, содержащую одну N,N-ди(низшую)алкилкарбамоильную группу; или

тиазолильную группу, содержащую одну N,N-ди(низшую)алкилкарбамоильную группу.

17. Фармацевтическая композиция, обладающая активностью в качестве частичного агониста допаминовых D_2 рецепторов, и/или антагониста

серотониновых $5-HT_{2A}$ рецепторов, и/или антагониста адреналиновых α_1

рецепторов, и/или ингибитора поглощения серотонина, и/или ингибитора обратного захвата серотонина, содержащая гетероциклическое соединение формулы (1) или его соль по любому из пп.1-16, в качестве активного компонента и фармацевтически приемлемый носитель.

18. Фармацевтическая композиция по п.17 для лечения или предотвращения расстройств центральной нервной системы.

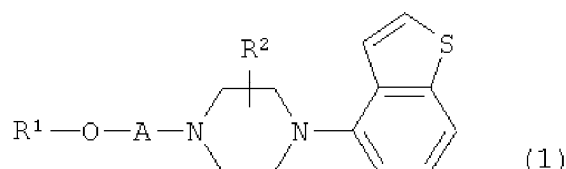
19. Фармацевтическая композиция по п.18 для лечения или предотвращения

расстройств центральной нервной системы, выбранных из группы, состоящей из шизофрении; резистентной, трудноизлечимой или хронической шизофрении; эмоционального расстройства; психотического расстройства; расстройства настроения; биполярного расстройства I типа; биполярного расстройства II типа; депрессии; эндогенной депрессии; классической депрессии; меланхолической и резистентной депрессии; дистимического расстройства; циклотимического расстройства; панической атаки; панического расстройства; агорафобии; социальной фобии; обсессивно-компульсивного расстройства; посттравматического стрессового расстройства; расстройства генерализованной тревоги; острого стрессового расстройства; истерии; соматизированного расстройства; конверсивного расстройства; болевого расстройства; ипохондрии; искусственного расстройства; диссоциативного расстройства; сексуальной дисфункции; расстройства полового влечения; расстройства полового возбуждения; эректильной дисфункции; нервно-психической анорексии; нервно-психической булимии; расстройства сна; регулируемого расстройства; злоупотребления алкоголем; алкогольной интоксикации; лекарственной аддикции; интоксикации стимуляторами; наркомании; ангедонии; ятрогенной ангедонии; ангедонии психического или ментального происхождения; ангедонии, связанной с депрессией; ангедонии, связанной с шизофренией; делирии; когнитивного расстройства; когнитивного расстройства, связанного с болезнью Альцгеймера, болезнью Паркинсона и другими нейродегенеративными заболеваниями; когнитивного расстройства, вызванного болезнью Альцгеймера, болезнью Паркинсона и сопутствующими нейродегенеративными заболеваниями; когнитивного расстройства из-за шизофрении; когнитивного расстройства, вызванного резистентной, трудноизлечимой или хронической шизофренией; рвоты; болезни движения; ожирения; мигрени; боли (в том числе продолжительной, тупой); задержки умственного развития; аутичного расстройства (аутизма); болезни Туретта; расстройства, выражающегося в тике; расстройства, проявляющегося в дефиците внимания и гиперактивности; кондуктивного расстройства и синдрома Дауна.

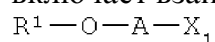
20. Способ получения фармацевтической композиции, включающий смешивание гетероциклического соединения формулы (1) или его соли по любому из пп.1-16 с фармацевтически приемлемым носителем.

21. Применение гетероциклического соединения формулы (1) или его соли по любому из пп.1-16 в качестве частичного агониста допаминовых D₂ рецепторов, и/или антагониста серотониновых 5-HT_{2A} рецепторов, и/или антагониста адреналиновых α₁ рецепторов, и/или ингибитора поглощения серотонина, и/или ингибитора обратного захвата серотонина.

22. Способ получения гетероциклического соединения, представленного формулой (1):

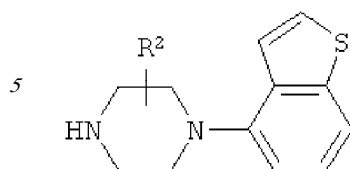


50 [где R¹, R² и A - такие, как определено в п.1] или его соли, отличающийся тем, что включает взаимодействие соединения, представленного формулой:



[где R¹ и A - такие, как определено выше, и X₁ представляет собой атом галогена]

или группу, которая вызывает реакцию замещения, такую же, как при атоме галогена], или его соли с соединением, представленным формулой:



[где R² - такой, как определено выше], или его солью.

10

15

20

25

30

35

40

45

50