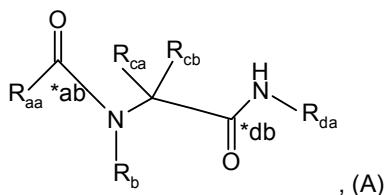


1. Спосіб одержання циклічної сполуки, що включає стадії:

а) одержання сполуки, що являє собою N-[(аліфатична, аліциклічна або ароматична група)карбоніл]-2-аміноацетамід формули



де

R_{aa} являє собою необов'язково заміщену аліфатичну групу, необов'язково заміщену аліциклічну групу або необов'язково заміщену ароматичну групу;

R_b являє собою необов'язково заміщену аліфатичну групу, необов'язково заміщену аліциклічну групу або необов'язково заміщену ароматичну групу;

R_{ca} і R_{cb}, незалежно, являють собою водень, необов'язково заміщену аліфатичну групу, необов'язково заміщену аліциклічну групу або необов'язково заміщену ароматичну групу;

R_{da} являє собою необов'язково заміщену аліфатичну групу, необов'язково заміщену аліциклічну групу або необов'язково заміщену ароматичну групу; і

R_{aa} заміщений первинною або вторинною захищеною аміногрупою, яка після відщеплення захисної групи може взаємодіяти з атомом вуглецю *ab або *db або щонайменше з одним з R_b, R_{ca} або R_{cb}, де кожний з них при цьому є заміщеним щонайменше однією функціональністю активованої карбонової кислоти, з утворенням 5-7-членного циклу; або

R_b заміщений первинною або вторинною захищеною аміногрупою, яка після відщеплення захисної групи може взаємодіяти з атомом вуглецю

*ab або *db або щонайменше з одним з R_{aa}, R_{ca} або R_{cb}, де кожний з них при цьому є заміщеним щонайменше однією функціональністю активованої карбонової кислоти, з утворенням 5-7-членного циклу; або

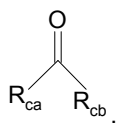
R_{ca} і R_{cb}, незалежно, заміщені первинною або вторинною захищеною аміногрупою, яка після відщеплення захисної групи може взаємодіяти з атомом вуглецю *ab або *db або щонайменше з одним з R_{aa}, R_b, R_{ca}, R_{cb} або R_{da}, де кожний з них при цьому є заміщеним щонайменше однією функціональністю активованої карбонової кислоти, з утворенням 5-7-членного циклу; або

R_{da} заміщений первинною або вторинною захищеною аміногрупою, яка після відщеплення захисної групи може взаємодіяти щонайменше з одним з R_{ca} або R_{cb}, де кожний з них при цьому є заміщеним щонайменше однією функціональністю активованої карбонової кислоти, з утворенням 5-7-членного циклу,

за умови, що коли R_{aa} заміщений первинною або вторинною захищеною аміногрупою, яка після відщеплення захисної групи може взаємодіяти з R_b, заміщеним щонайменше функціональністю активованої карбонової кислоти, тоді R_{aa} є іншою групою, ніж заміщена аліфатична група або заміщена аліциклічна група,

яке здійснюється шляхом взаємодії наступних чотирьох сполук:

карбонільної сполуки формули



аміну формули

NH₂R_b,

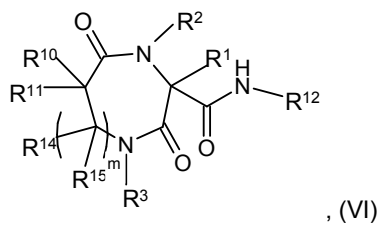
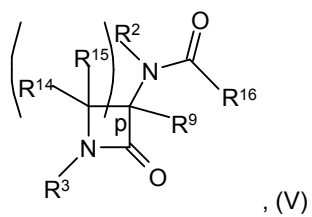
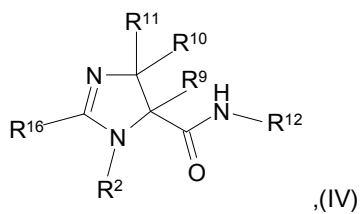
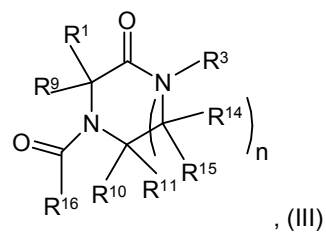
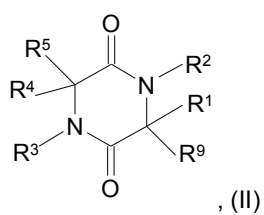
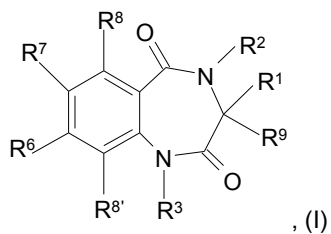
ізонітрилу формули

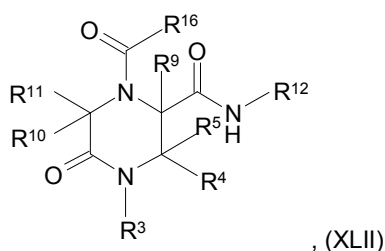
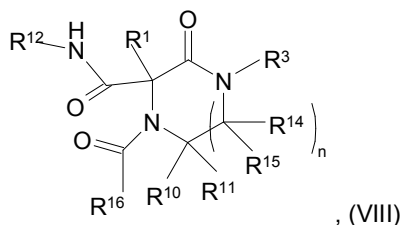
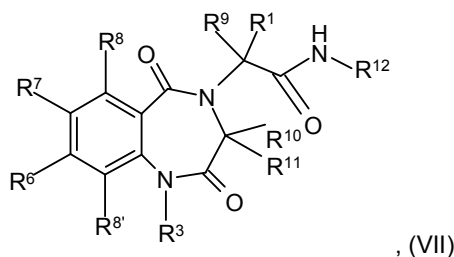
$\text{NCR}_{\text{da}} \text{ i}$

кислоти формули

$\text{R}_{\text{aa}}\text{CO}_2\text{H}; \text{ i}$

б) відщеплення захисної групи і циклізація зазначеного N-[(аліфатична, аліциклічна або ароматична група)карбоніл]-2-аміноацетаміду формули (A) з утворенням циклізованої сполуки, вибраної з групи, що складається із сполук, представлених формулами





де

$n = 1$ або 2 ;

$m = 0$ або 1 ;

$p = 2$;

R^1 і R^9 незалежно вибирають з водню, алкілу, аралкілу, арилу, конденсованого арилциклоалкілу, конденсованого арилгетероциклілу, циклоалкілу, гетероаралкілу, гетероарилу, конденсованого гетероарилциклоалкілу, конденсованого гетероарилгетероциклілу і гетероциклілу;

R^2 вибирають з алкілу, аралкілу, арилу, гетероаралкілу, гетероарилу, конденсованого гетероарилциклоалкілу і конденсованого гетероарилгетероциклілу;

R^3 вибирають з водню, C_{1-4} -алкілу, аралкілу і гетероаралкілу;

R^4 і R^5 незалежно вибирають з водню, алкілу, аралкілу і гетероаралкілу;

R^6 , R^7 , R^8 і $R^{8'}$ незалежно вибирають з водню і C_{1-4} -алкілу;

R^{10} і R^{11} незалежно вибирають з водню, алкілу, аралкілу і гетероаралкілу;

R^{14} і R^{15} незалежно вибирають з водню; або,

коли $n=1$ і R^{11} і R^{14} відсутні, R^{10} і R^{15} , узяті разом із сусідніми атомами вуглецю, через які вони зв'язані, утворюють 6-членний арил; або,

коли $n=1$ і R^{11} і R^{14} присутні, R^{10} і R^{15} , узяті разом із сусідніми атомами вуглецю, через які вони зв'язані, утворюють 5-7-членний циклоалкіл;

або, коли $n=2$ і сусідні R^{11} і R^{14} відсутні, R^{10} і сусідній R^{15} , узяті разом із сусідніми атомами вуглецю, через які вони зв'язані, утворюють 6-членний арил;

R^{12} вибирають з алкілу, аралкілу, арилу, конденсованого арилциклоалкілу, конденсованого арилгетероциклілу,

циклоалкілу, гетероаралкілу, гетероарилу, конденсованого гетероарилциклоалкілу, конденсованого гетероарилгетероциклілу і гетероциклілу; і

R^{16} вибирають з алкілу, аралкілу, арилу, конденсованого арилциклоалкілу, конденсованого арилгетероциклілу, гетероаралкілу, гетероарилу, конденсованого гетероарилциклоалкілу і конденсованого гетероарилгетероциклілу.

2. Спосіб за п. 1, де

R_{aa} заміщений первинною або вторинною захищеною аміногрупою, яка після відщеплення захисної групи може взаємодіяти з *db-вуглецем або щонайменше з одним з R_{ca} і R_{cb} , де кожний з них при цьому є заміщеним щонайменше функціональністю активованої карбонової кислоти, з утворенням 5-7-членного циклу.

3. Спосіб за п. 1, де

R_{aa} заміщений первинною або вторинною захищеною аміногрупою, яка після відщеплення захисної групи може взаємодіяти з R_b , заміщеним функціональністю активованої карбонової кислоти, з утворенням 5-7-членного циклу.

4. Спосіб за п. 1, де

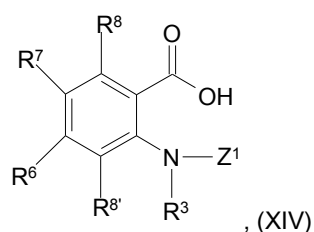
R_b заміщений первинною або вторинною захищеною аміногрупою, яка після відщеплення захисної групи може взаємодіяти з *db-вуглецем або щонайменше з одним з R_{ca} і R_{cb} , де кожний з них при цьому є заміщеним щонайменше функціональністю активованої карбонової кислоти, з утворенням 5-7-членного циклу.

5. Спосіб за п. 1, де

щонайменше один з R_{ca} і R_{cb} , незалежно, заміщений первинною або вторинною захищеною аміногрупою, яка після відщеплення захисної групи може взаємодіяти з *ab- або *db-вуглецем або з R_b , який заміщений функціональністю активованої карбонової кислоти, з утворенням 5-7-членного циклу.

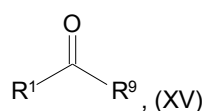
6. Спосіб за п. 1, де:

кислота являє собою сполуку формули

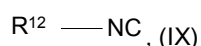


де Z^1 являє собою прийнятну захисну групу для аміногрупи;

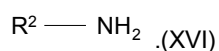
карбоніл являє собою сполуку формули



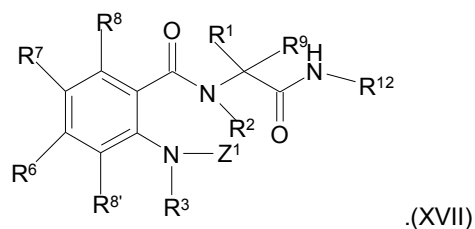
ізонітрил являє собою сполуку формули



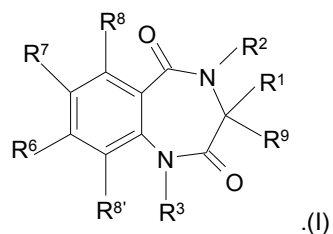
амін являє собою сполуку формули



7. Спосіб за п. 6, де N-[(аліфатична, аліциклічна або ароматична група)карбоніл]-2-аміноацетамід являє собою сполуку формули

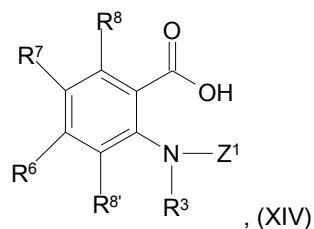


8. Спосіб за п. 1, де циклізований продукт являє собою сполуку формули



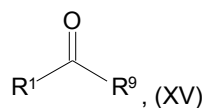
9. Спосіб за п. 1, де

кислота являє собою сполуку формули

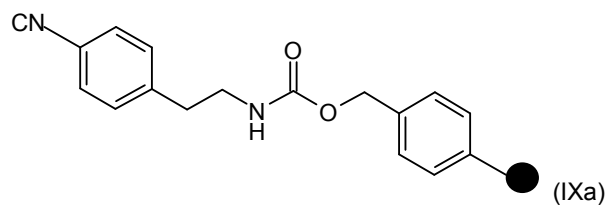


де Z^1 являє собою прийнятну захисну групу для аміногрупи;

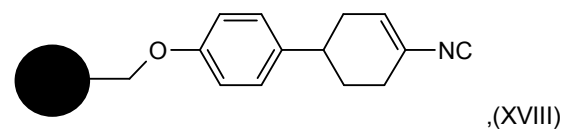
карбоніл являє собою сполуку формули



ізонітрил вибирають із групи сполук, представлених формулами



та

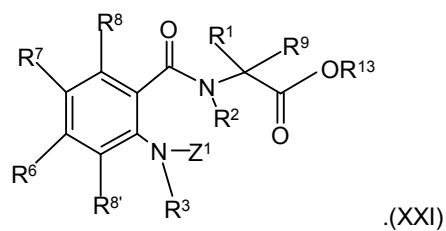


де \bullet являє собою тверду смолу-носіє; і

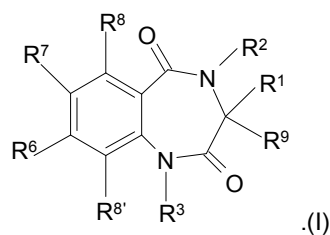
амін являє собою сполуку формули

$R^2 - NH_2$ (XVI).

10. Спосіб за п. 1, де N-[(аліфатична, аліциклічна або ароматична група)карбоніл]-2-аміноацетамід являє собою сполуку формули

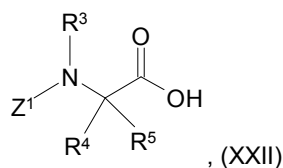


11. Спосіб за п. 10, де циклізований продукт являє собою сполуку формули



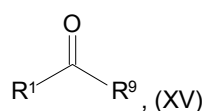
12. Спосіб за п. 1, де

кислота являє собою сполуку формули

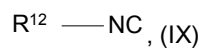


де Z^1 являє собою прийнятну захисну групу для аміногрупи;

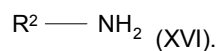
карбоніл являє собою сполуку формули



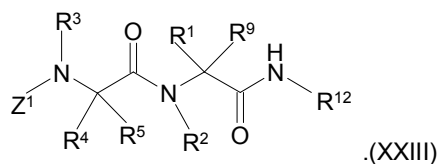
ізонітрil являє собою сполуку формули



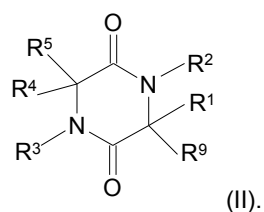
амін являє собою сполуку формули



13. Спосіб за п. 12, де N-[(аліфатична, аліциклічна або ароматична група)карбоніл]-2-аміноацетамід являє собою сполуку формули

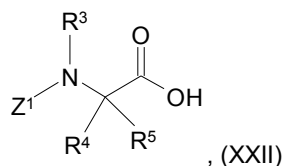


14. Спосіб за п. 13, де замкнута в цикл сполука являє собою сполуку формули



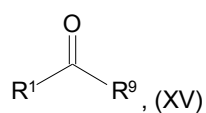
15. Спосіб за п. 1, де

кислота являє собою сполуку формули

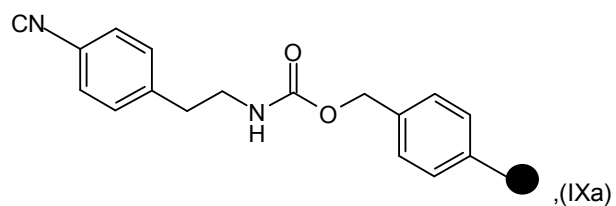


де Z^1 являє собою прийнятну захисну групу для аміногрупи;

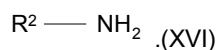
карбоніл являє собою сполуку формули



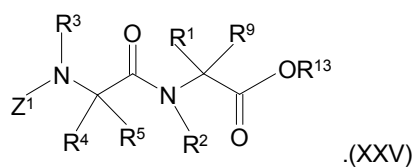
ізонітрил являє собою сполуку формули



і амін являє собою сполуку формули

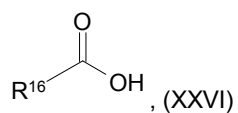


16. Спосіб за п. 15, де N-[(аліфатична, аліциклічна або ароматична група)карбоніл]-2-аміноацетамід являє собою сполуку формули

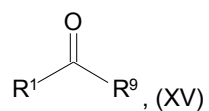


17. Спосіб за п. 1, де

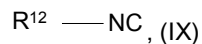
кислота являє собою сполуку формули



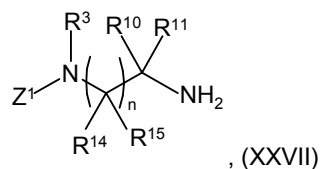
карбоніл являє собою сполуку формули



ізонітрил являє собою сполуку формули

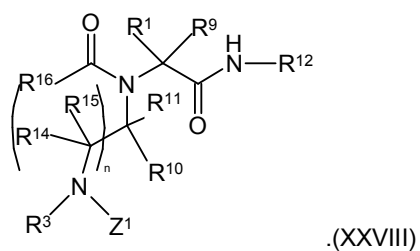


і амін являє собою сполуку формули

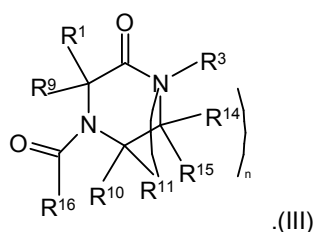


де Z^1 являє собою прийнятну захисну групу для аміногрупи.

18. Спосіб за п. 17, де N-[(аліфатична, аліциклічна або ароматична група)карбоніл]-2-аміноацетамід являє собою сполуку формули

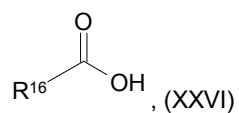


19. Спосіб за п. 18, де замкнута в цикл сполука являє собою сполуку формули

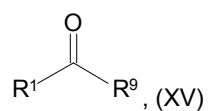


20. Спосіб за п. 1, де

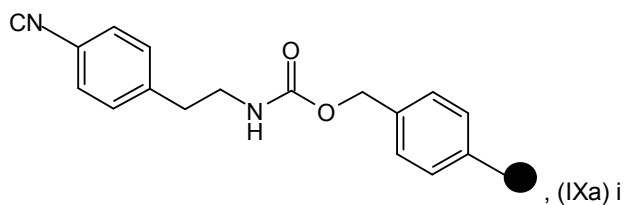
кислота являє собою сполуку формули



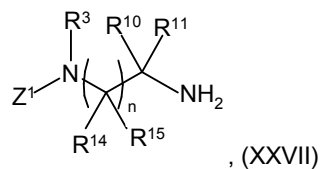
карбоніл являє собою сполуку формули



ізонітрил являє собою сполуку формули

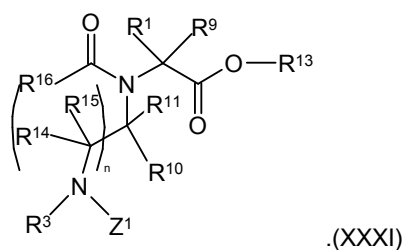


амін являє собою сполуку формули



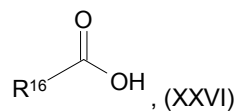
де Z^1 являє собою прийнятну захисну групу для аміногрупи.

21. Спосіб за п. 20, де N-[(аліфатична, аліциклічна або ароматична група)карбоніл]-2-аміноацетамід являє собою сполуку формули

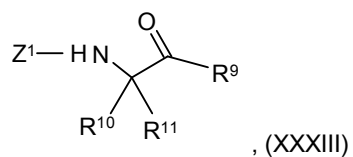


22. Спосіб за п. 1, де

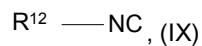
кислота являє собою сполуку формули



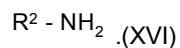
карбоніл являє собою сполуку формули



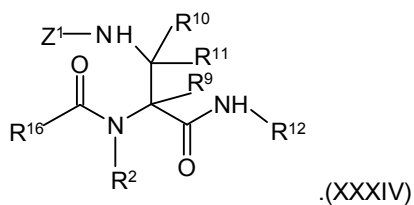
де Z^1 являє собою прийнятну захисну групу для аміногрупи; ізонітрил являє собою сполуку формули



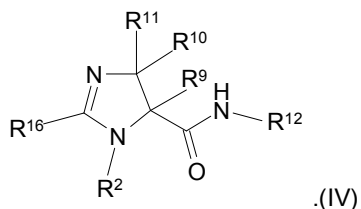
i амін являє собою сполуку формули



23. Спосіб за п. 22, де N-[(аліфатична, аліциклічна або ароматична група)карбоніл]-2-аміноацетамід являє собою сполуку формули

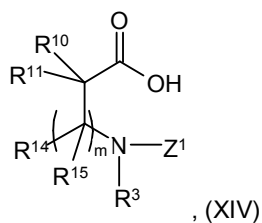


24. Спосіб за п. 23, де замкнута в цикл сполука являє собою сполуку формули



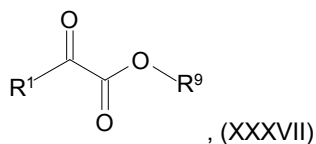
25. Спосіб за п. 1, де

кислота являє собою сполуку формули



де Z^1 являє собою прийнятну захисну групу для аміногрупи;

карбоніл являє собою сполуку формули



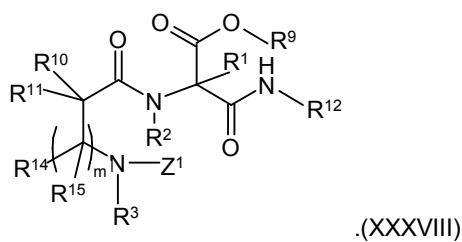
ізонітрил являє собою сполуку формули

$R^{12}-NC$, (IX) і

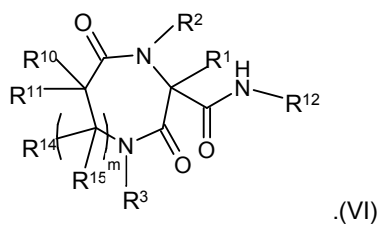
амін являє собою сполуку формули

$R^2 - NH_2$.(XVI)

26. Спосіб за п. 25, де N-[(аліфатична, аліциклічна або ароматична група)карбоніл]-2-аміноацетамід являє собою сполуку формули:

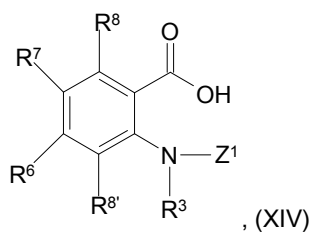


27. Спосіб за п. 26, де замкнута в цикл сполука являє собою сполуку формули



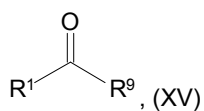
28. Спосіб за п. 1, де

кислота являє собою сполуку формули

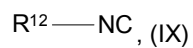


де Z^1 являє собою прийнятну захисну групу для аміногрупи;

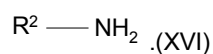
карбоніл являє собою сполуку формули



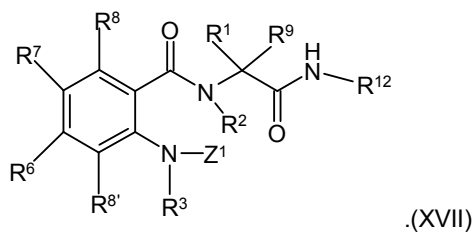
ізонітрил являє собою сполуку формули



і амін являє собою сполуку формули

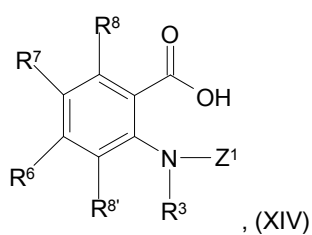


29. Спосіб за п. 28, де N-[(аліфатична, аліциклічна або ароматична група)карбоніл]-2-аміноацетамід являє собою сполуку формули



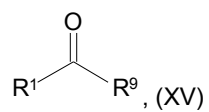
30. Спосіб за п. 1, де

кислота являє собою сполуку формули

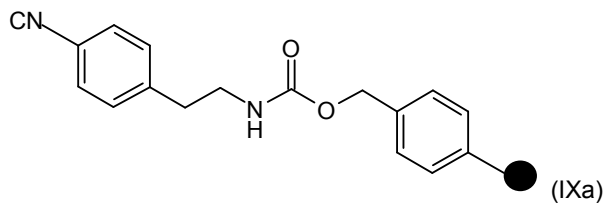


де Z^1 являє собою прийнятну захисну групу для аміногрупи;

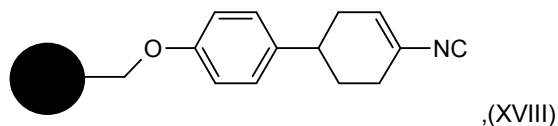
карбоніл являє собою сполуку формули



ізонітрил вибирають із групи сполук, представлених формулами

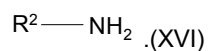


та

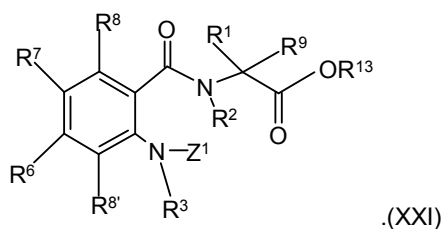


де \bullet являє собою тверду смолу-носіє; і

амін являє собою сполуку формули

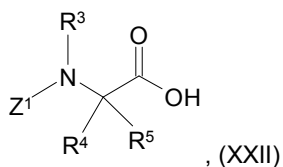


31. Спосіб за п. 30, де N-[(аліфатична, аліциклічна або ароматична група)карбоніл]-2-аміноацетамід являє собою сполуку формули

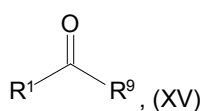


32. Спосіб за п. 1, де

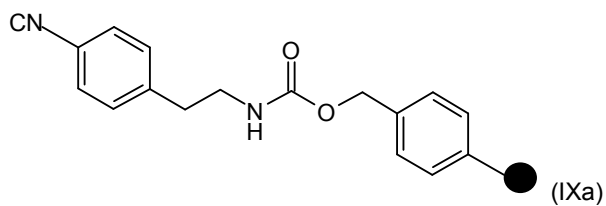
кислота являє собою сполуку формули



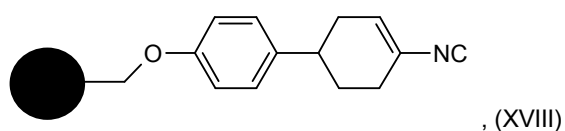
де Z^1 являє собою прийнятну захисну групу для аміногрупи; карбоніл являє собою сполуку формули



ізонітрил вибирають із групи сполук, представлених формулами

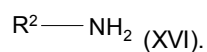


та

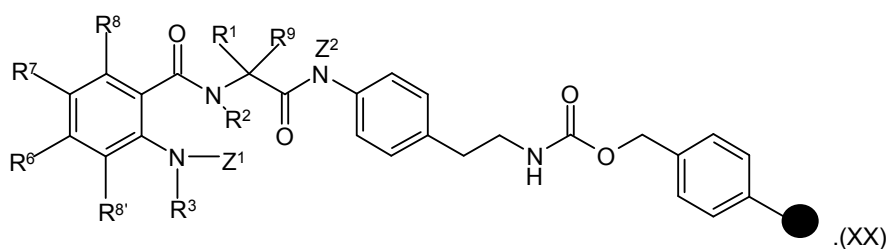


де являє собою тверду смолу-носіє; і

амін являє собою сполуку формули

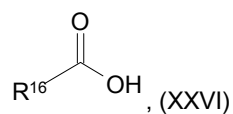


33. Спосіб за п. 1, де N-[(аліфатична, аліциклічна або ароматична група)карбоніл]-2-аміноацетамід являє собою сполуку формули

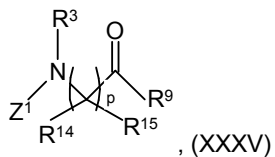


34. Спосіб за п. 1, де

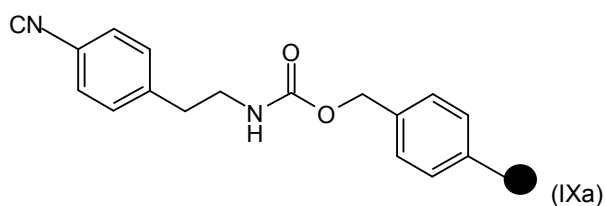
кислота являє собою сполуку формули



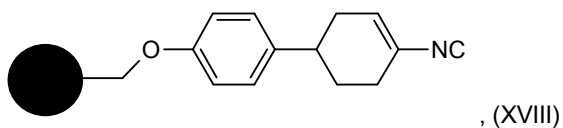
карбоніл являє собою сполуку формули



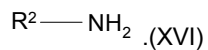
ізонітрил вибирають із групи сполук, представлених формулами



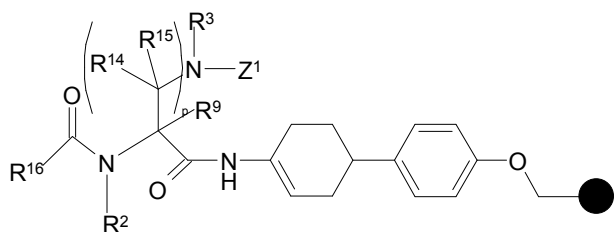
та



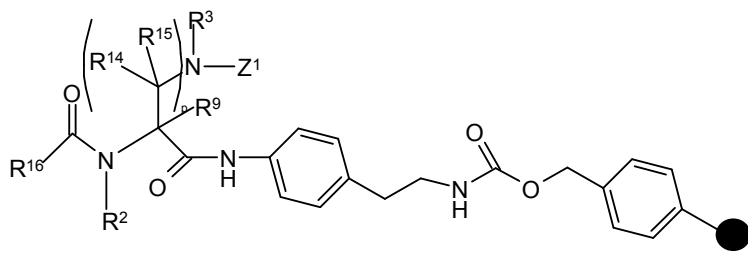
амін являє собою сполуку формули



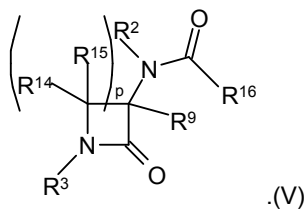
35. Спосіб за п. 34, де N-[(аліфатична, аліциклічна або ароматична група)карбоніл]-2-аміноацетамід вибирають із групи сполук, представлених формулами



та

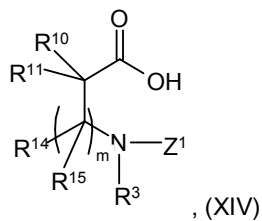


36. Спосіб за п. 35, де циклізований продукт являє собою сполуку формули

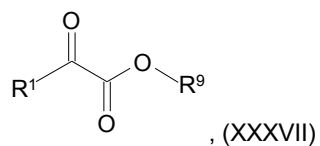


37. Спосіб за п. 1, де

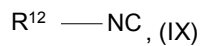
кислота являє собою сполуку формули



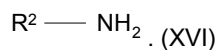
карбоніл являє собою сполуку формули



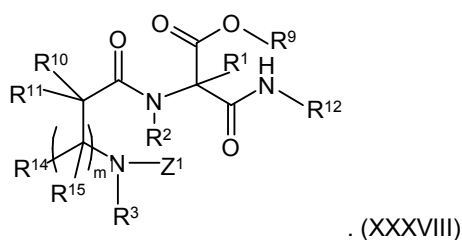
ізонітрил являє собою сполуку формули



і амін являє собою сполуку формули

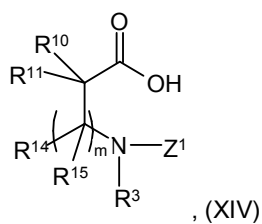


38. Спосіб за п. 37, де N-[(аліфатична, аліциклічна або ароматична група)карбоніл]-2-аміноацетамід являє собою сполуку формули

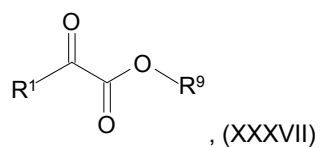


39. Спосіб за п. 1, де

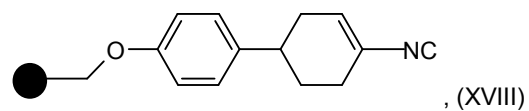
кислота являє собою сполуку формули



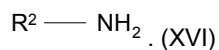
карбоніл являє собою сполуку формули



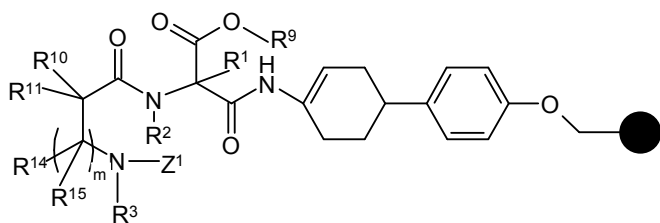
ізонітрил являє собою сполуку формули



амін являє собою сполуку формули

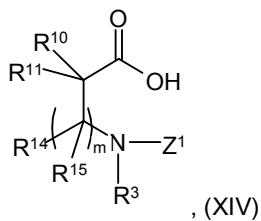


40. Спосіб за п. 39, де N-[(аліфатична, аліциклічна або ароматична група)карбоніл]-2-аміноацетамід являє собою сполуку формули

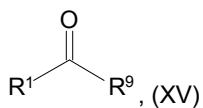


41. Спосіб за п. 1, де

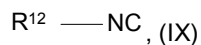
кислота являє собою сполуку формули



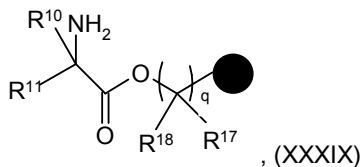
карбоніл являє собою сполуку формули



ізонітрил являє собою сполуку формули

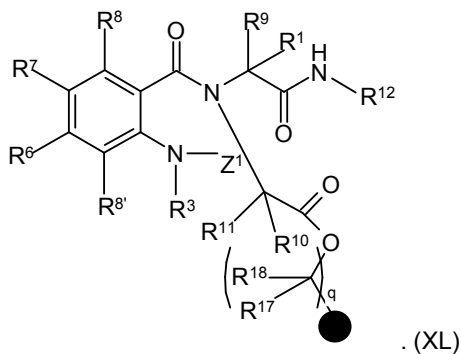


амін являє собою сполуку формули

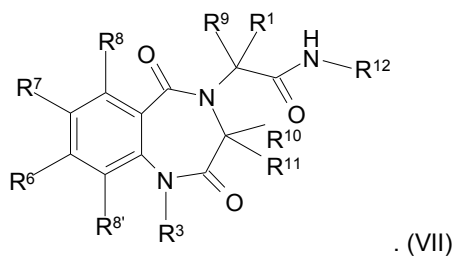


де q= 1,2,3.

42. Спосіб за п. 41, де N-[аліфатична, аліциклічна або ароматична група]карбоніл]-2-аміноацетамід являє собою сполуку формули

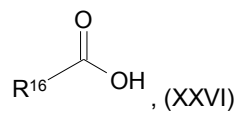


43. Спосіб за п. 42, де циклізований продукт являє собою сполуку формули

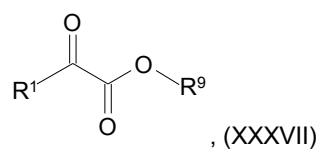


44. Спосіб за п. 1, де

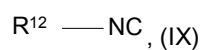
кислота являє собою сполуку формули



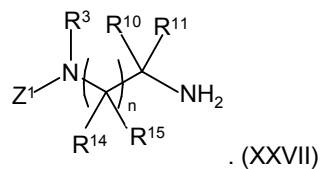
карбоніл являє собою сполуку формули



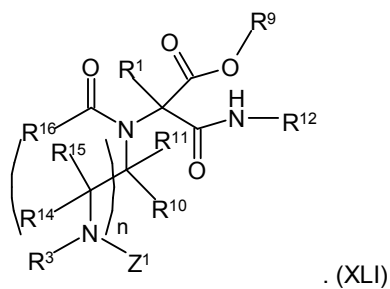
ізонітрил являє собою сполуку формули



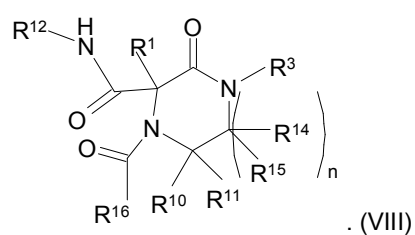
і амін являє собою сполуку формули



45. Спосіб за п. 44, де N-[(аліфатична, аліциклічна або ароматична група)карбоніл]-2-аміноацетамід являє собою сполуку формули

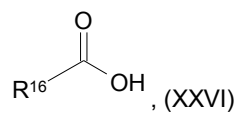


46. Спосіб за п. 45, де циклізований продукт являє собою сполуку формули

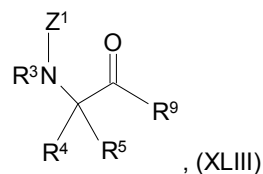


47. Спосіб за п. 1, де

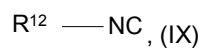
кислота являє собою сполуку формули



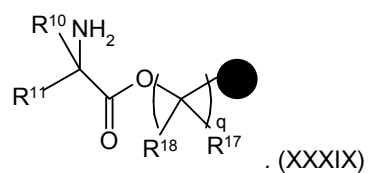
карбоніл являє собою сполуку формули



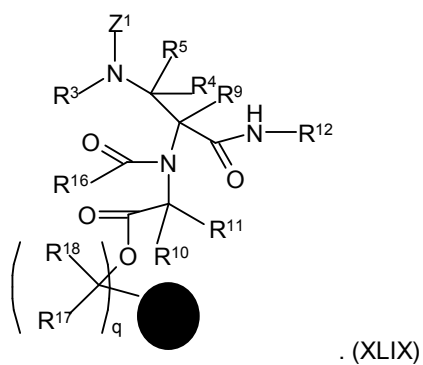
ізонітрил являє собою сполуку формули



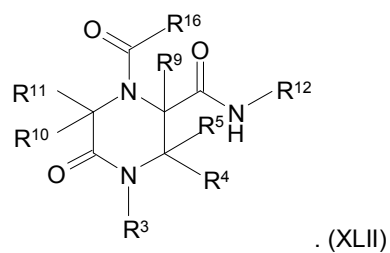
і амін являє собою сполуку формули



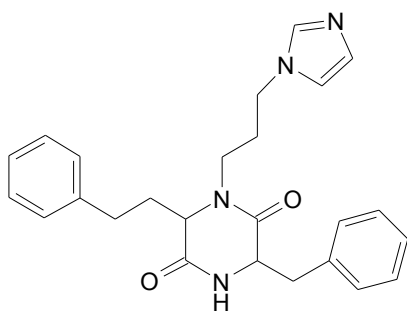
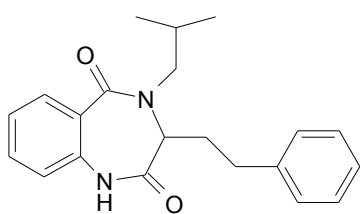
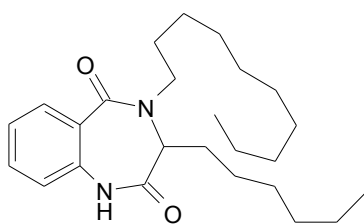
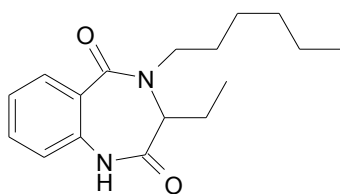
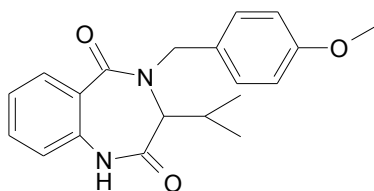
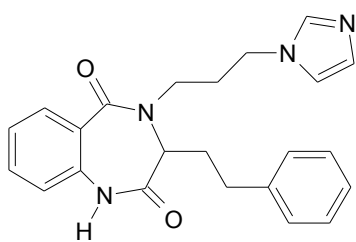
48. Спосіб за п. 47, де N-[(аліфатична або ароматична група)карбоніл]-2-аміноацетамід являє собою сполуку формули

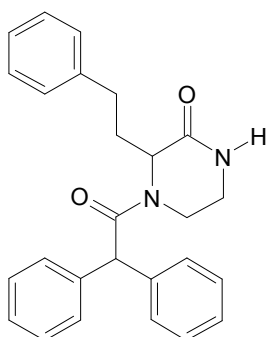
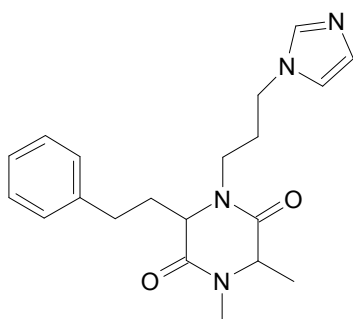
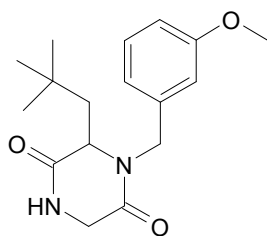
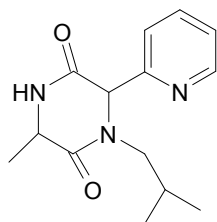
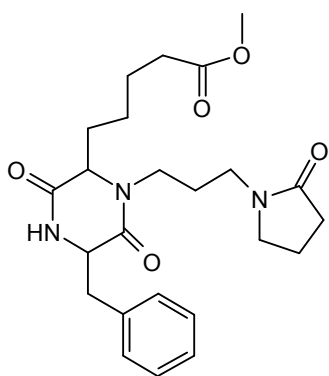


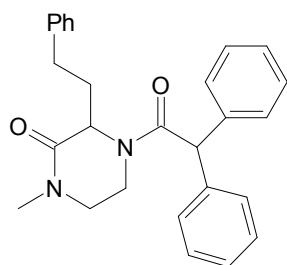
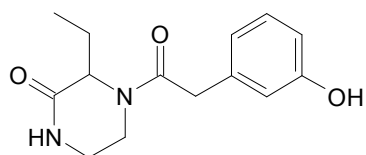
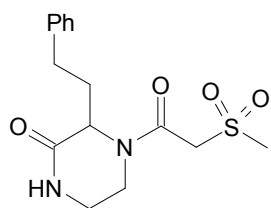
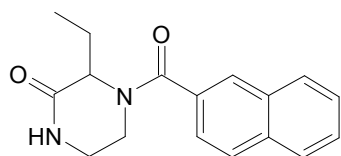
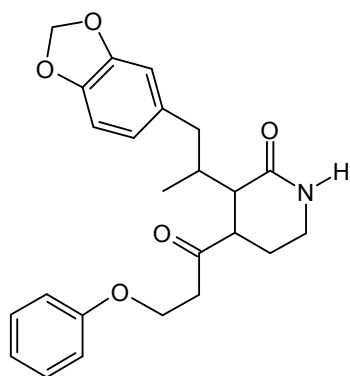
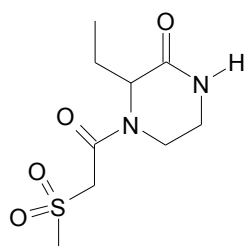
49. Спосіб за п. 48, де циклізований продукт являє собою сполуку формули

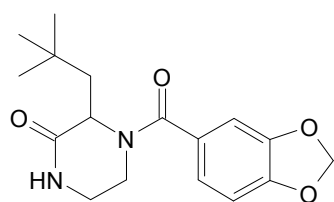
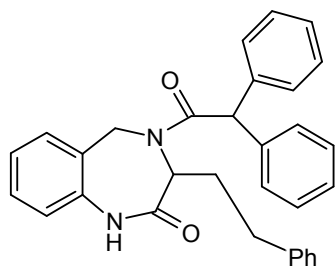
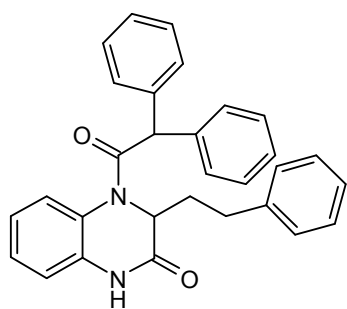
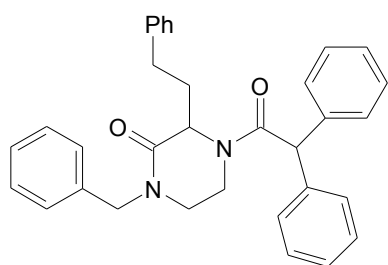
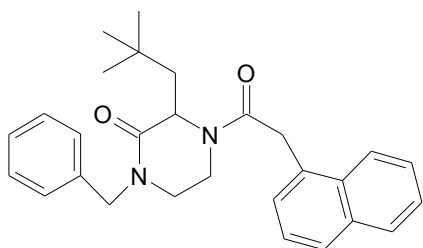
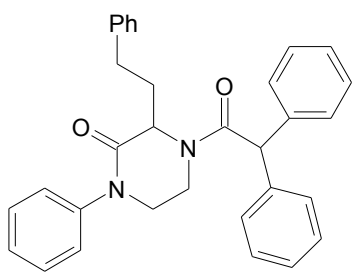


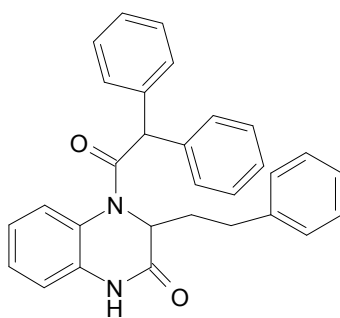
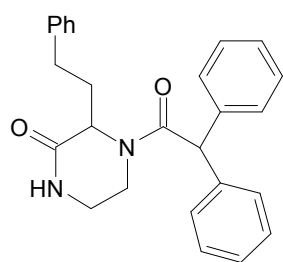
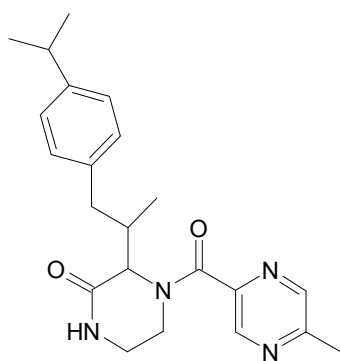
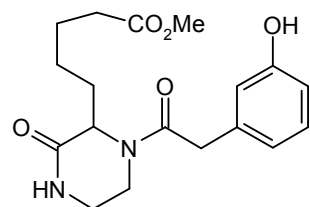
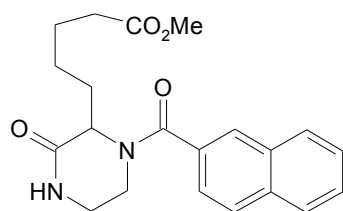
50. Спосіб за п. 1, де циклізований продукт вибирають з групи, що складається із сполук, представлених формулами:

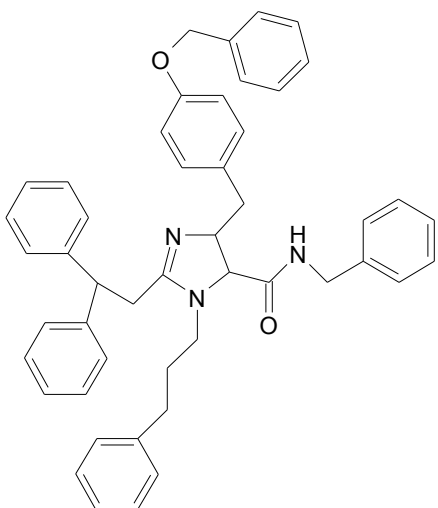
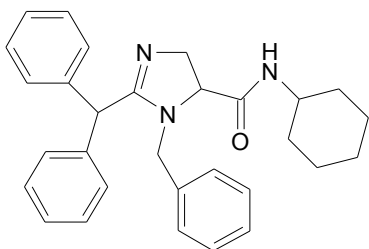
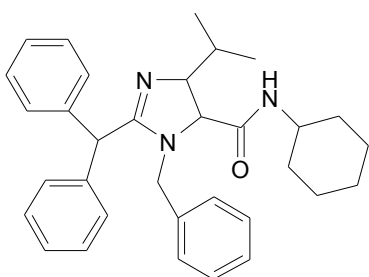
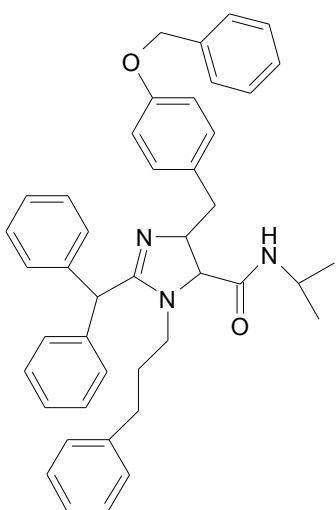


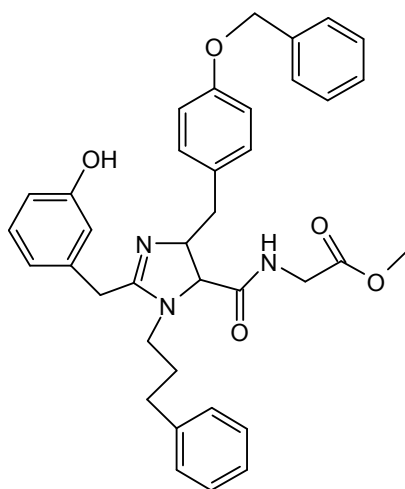
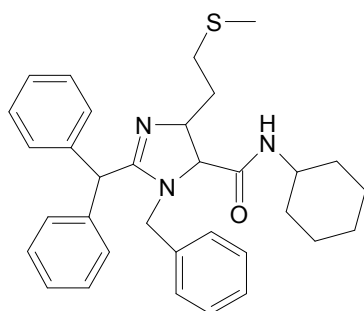
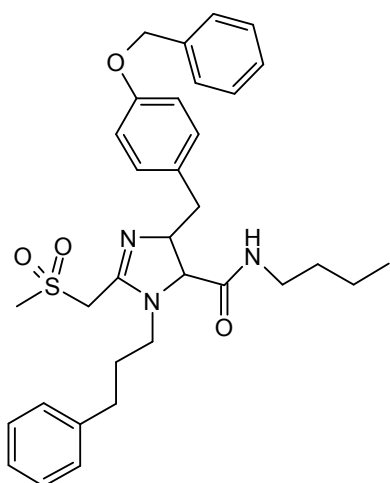


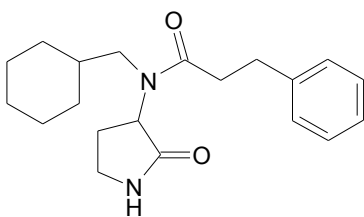
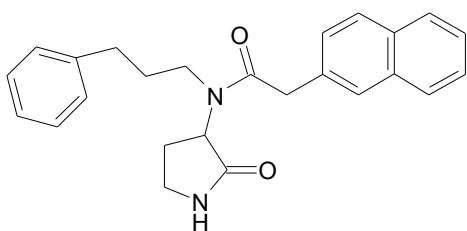
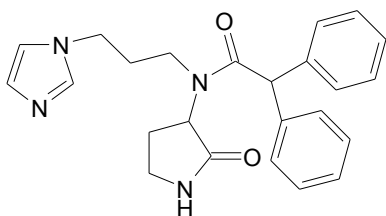
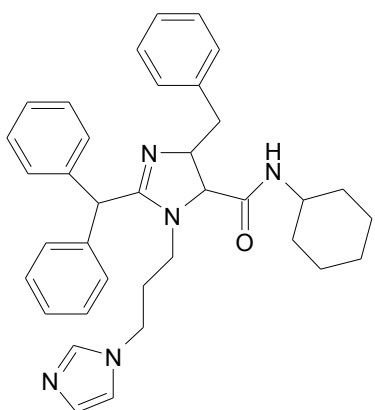
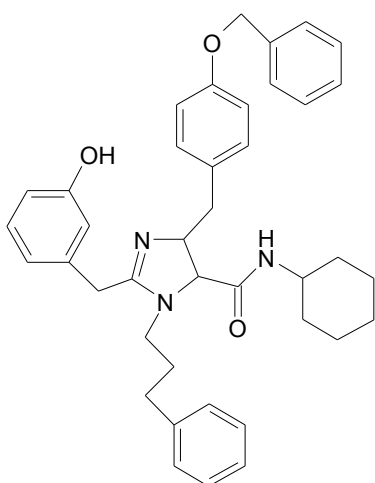


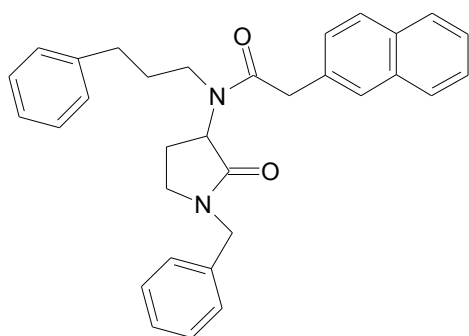
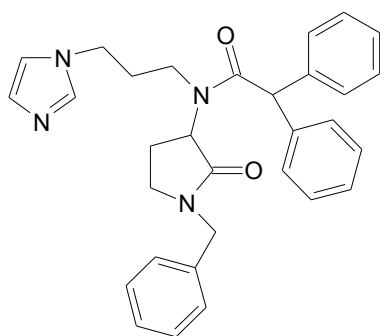
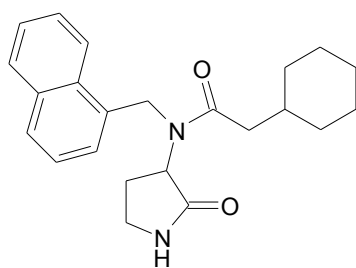
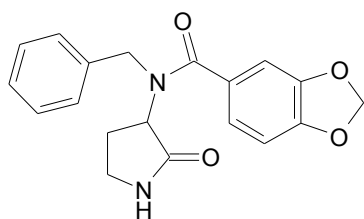
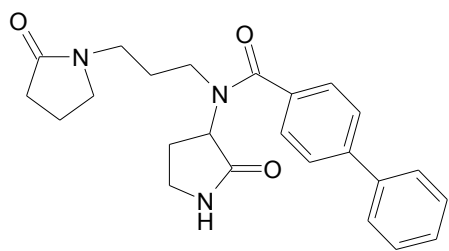


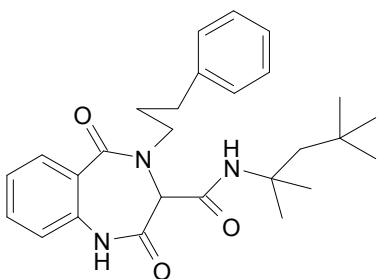
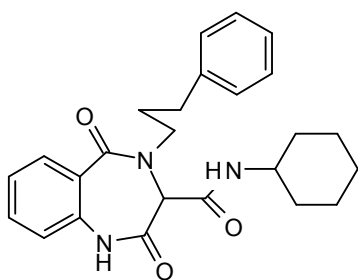
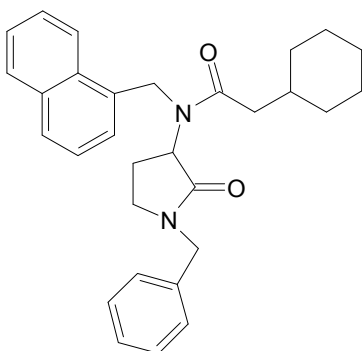
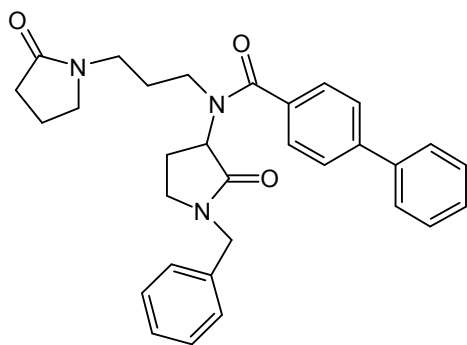
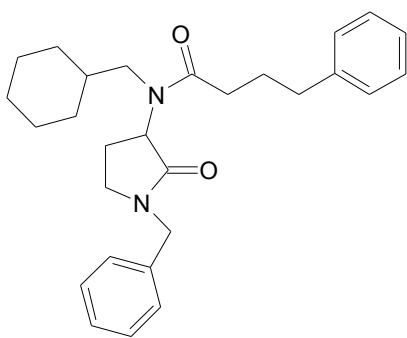


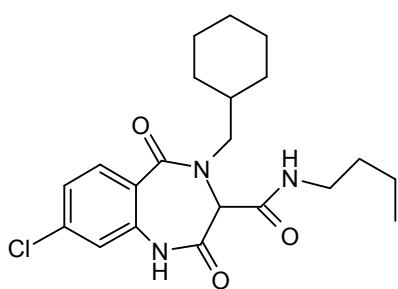
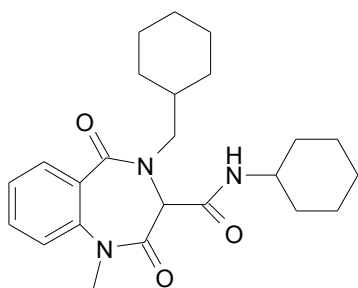
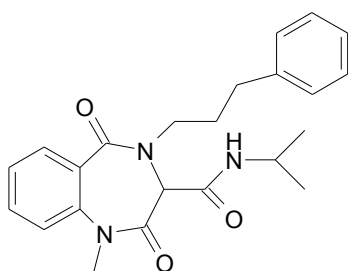
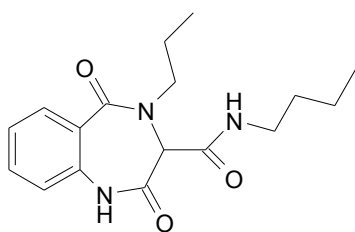
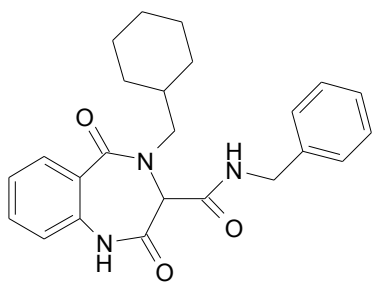
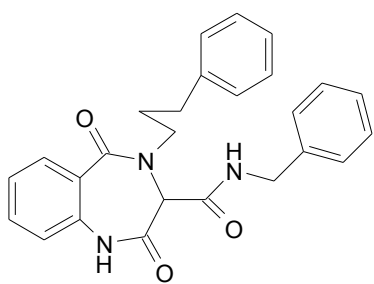


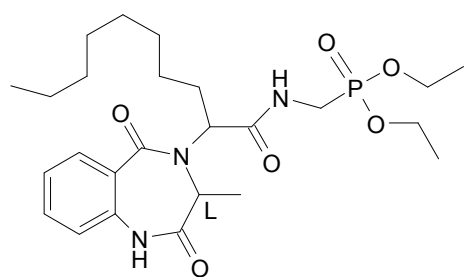
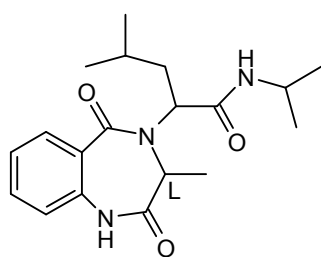
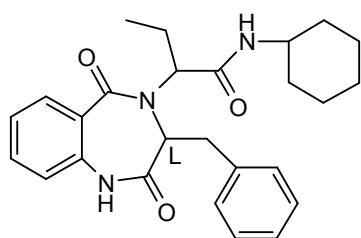
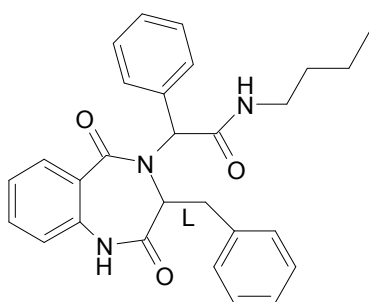
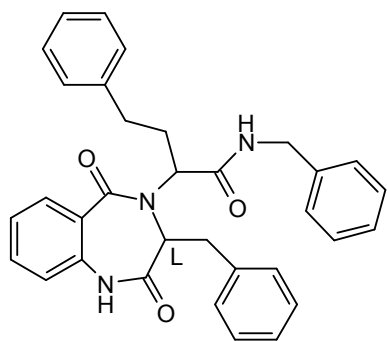
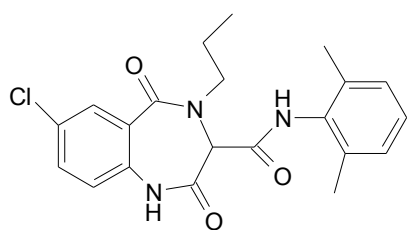


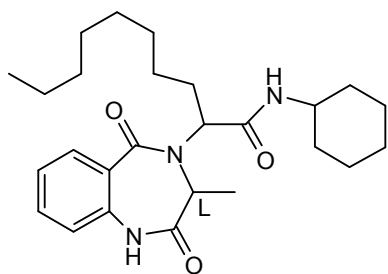
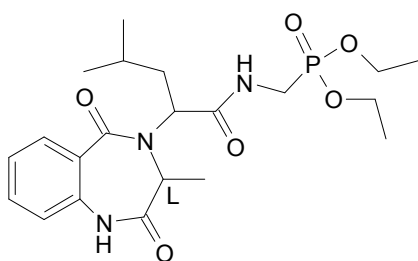
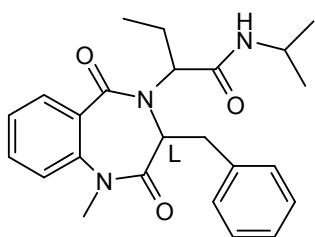
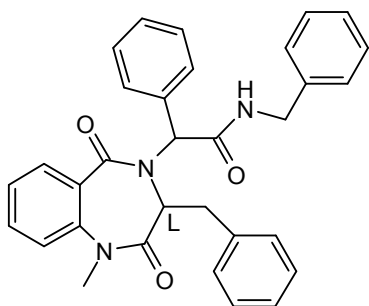
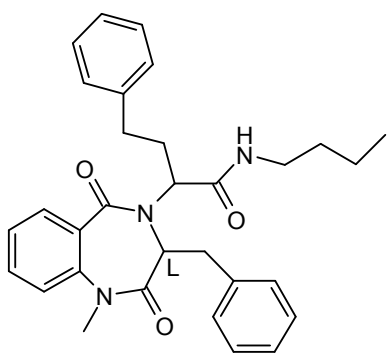


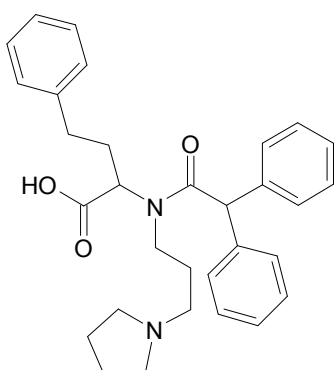
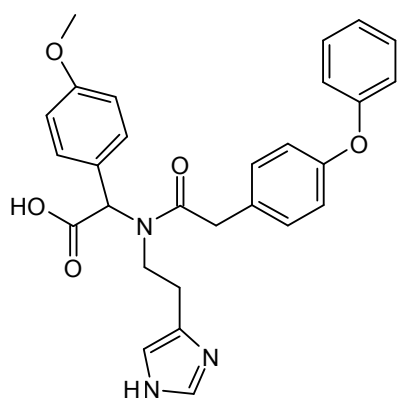
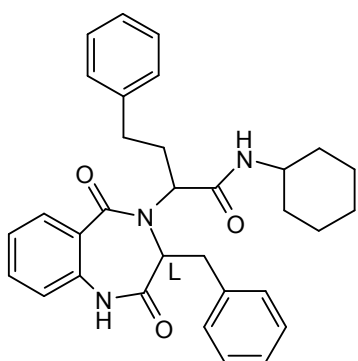
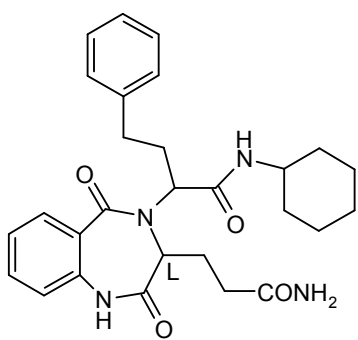


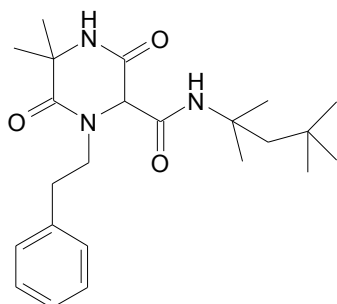
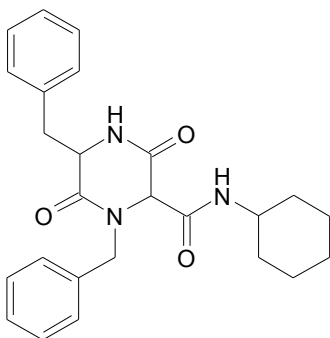
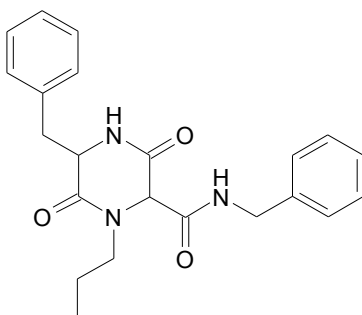
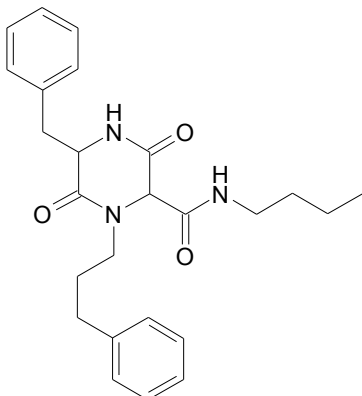
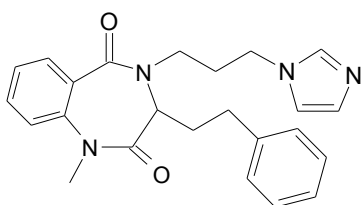


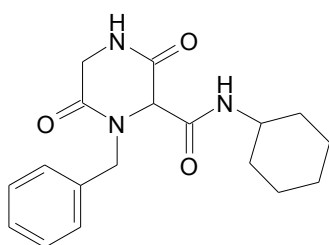
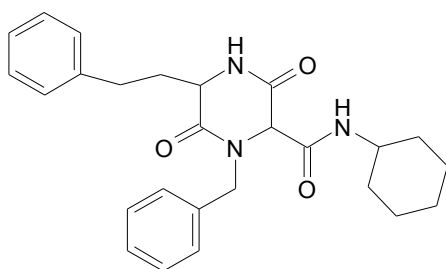
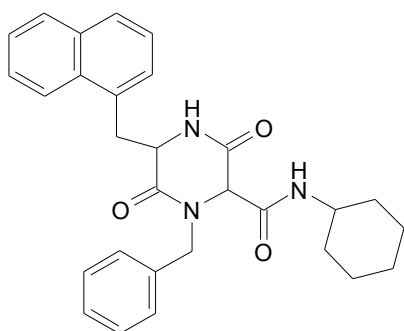
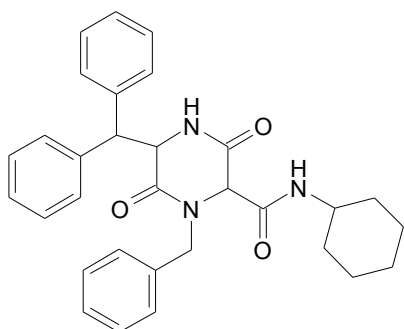
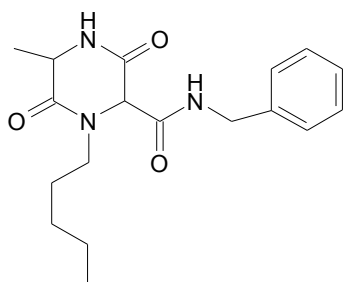


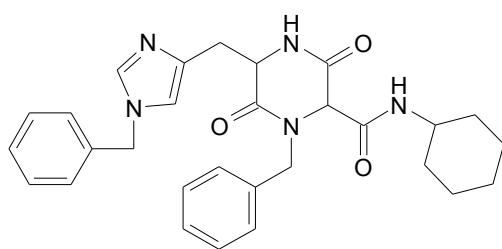
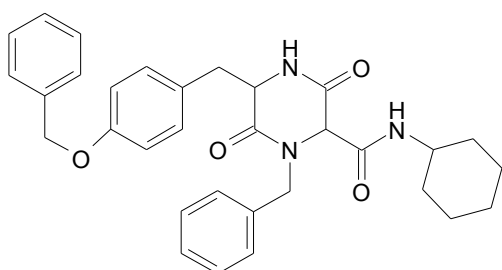
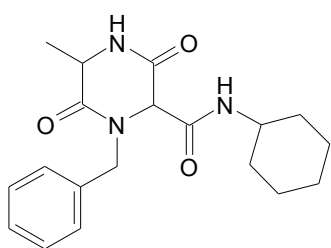
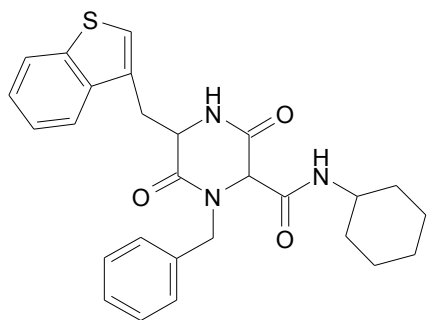
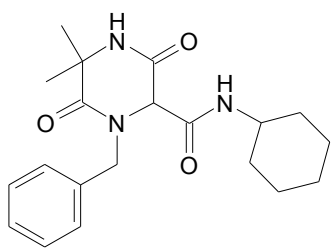


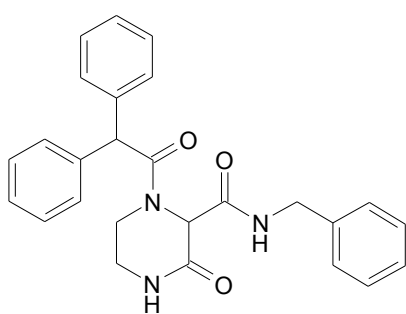
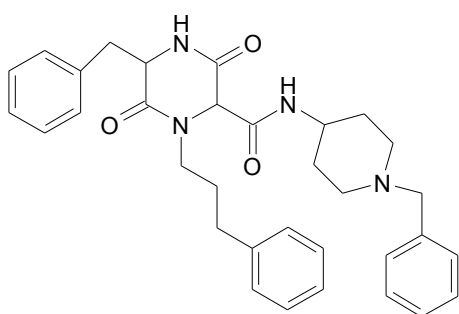
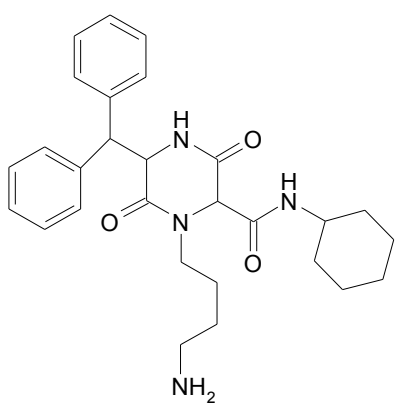
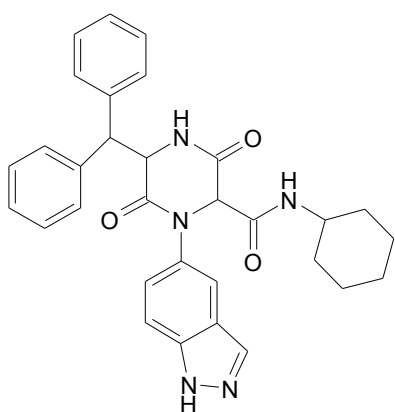


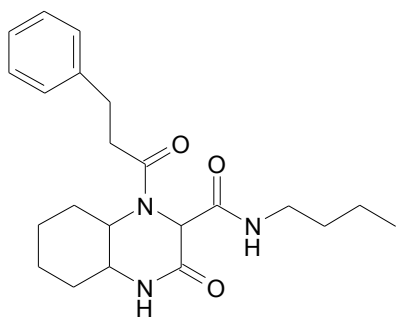
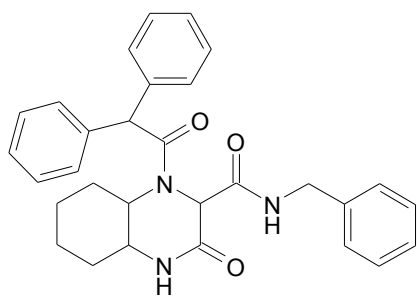
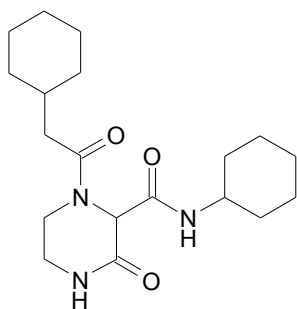
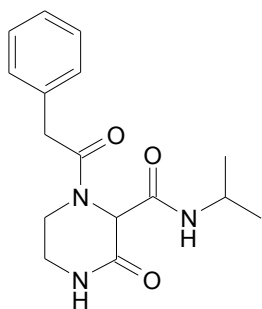
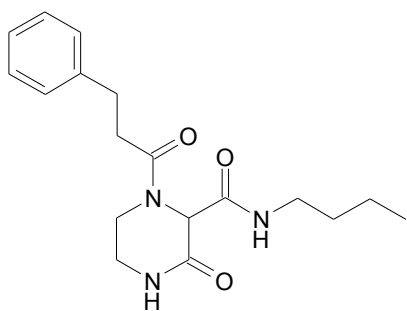


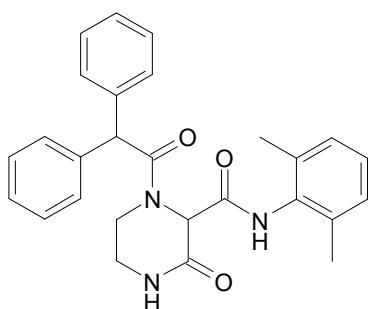
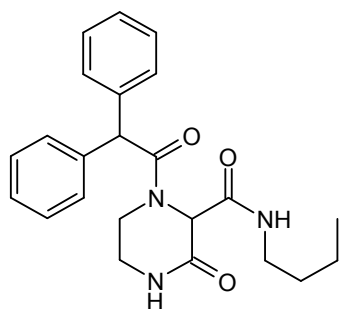
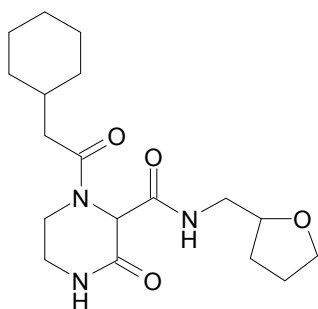
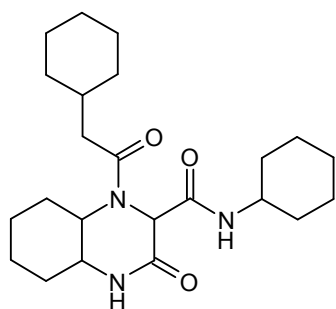
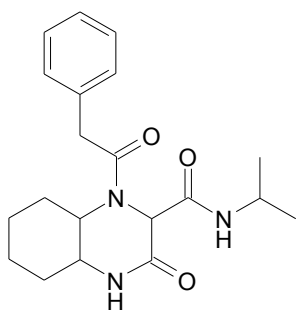


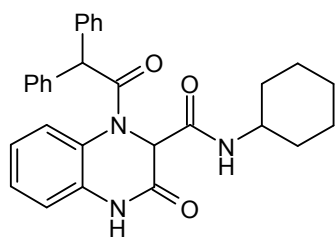
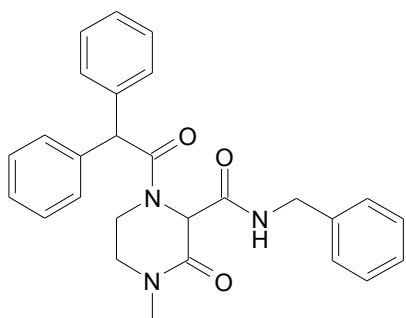
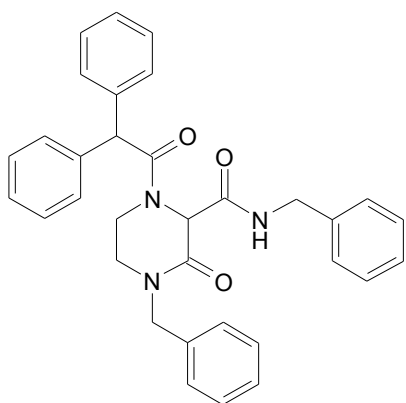
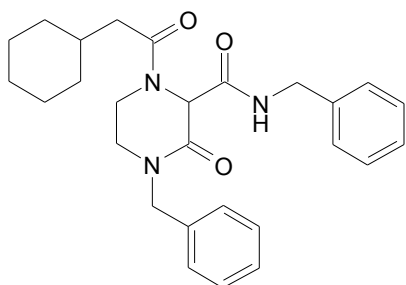
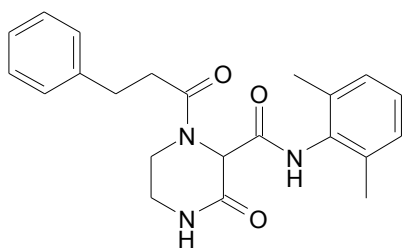


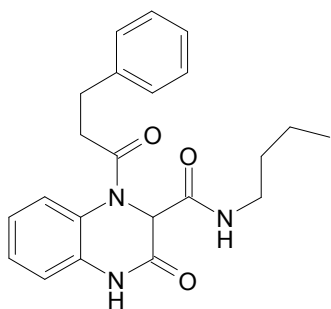
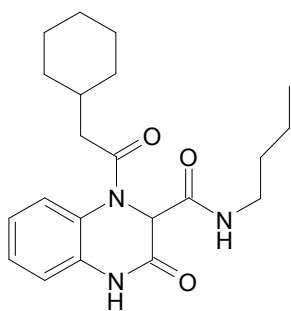
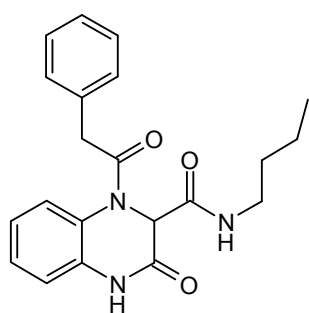
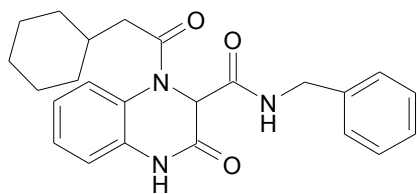
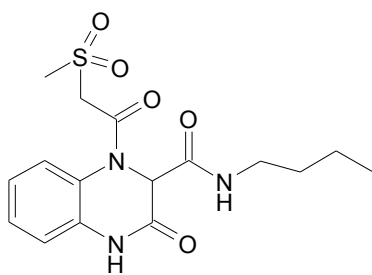


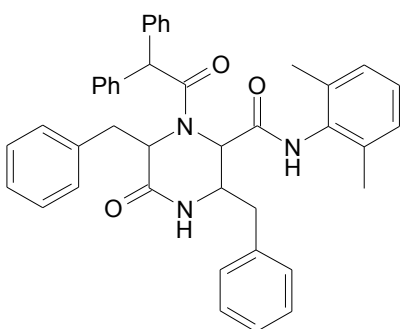
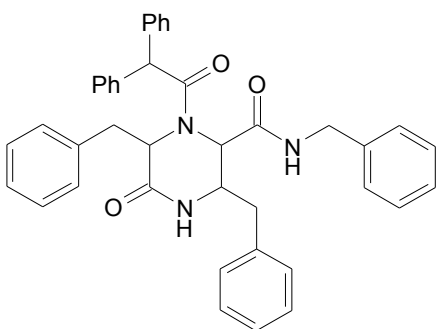
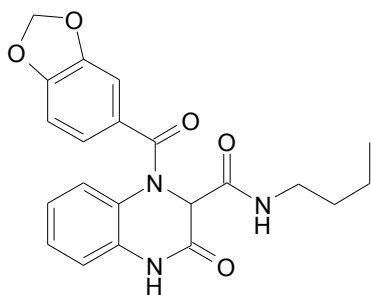
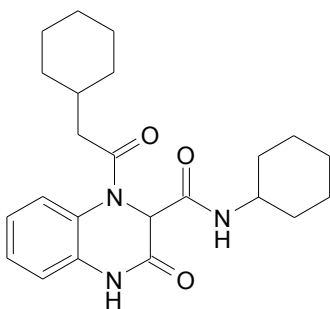
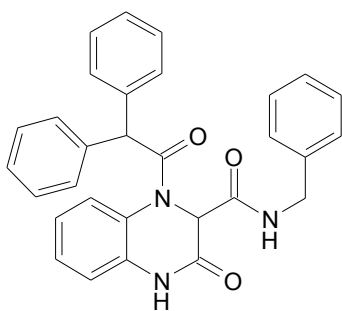


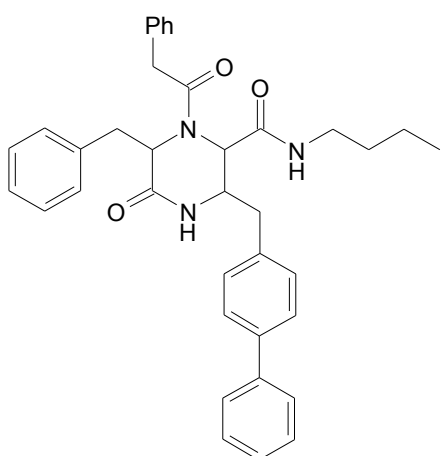
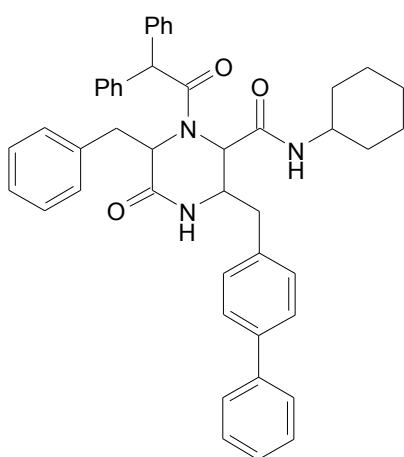
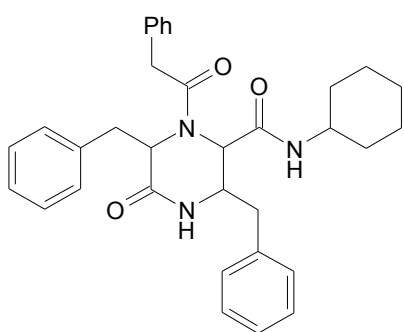
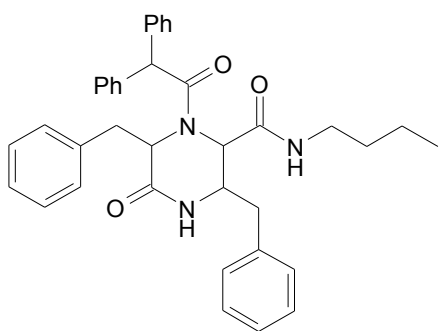


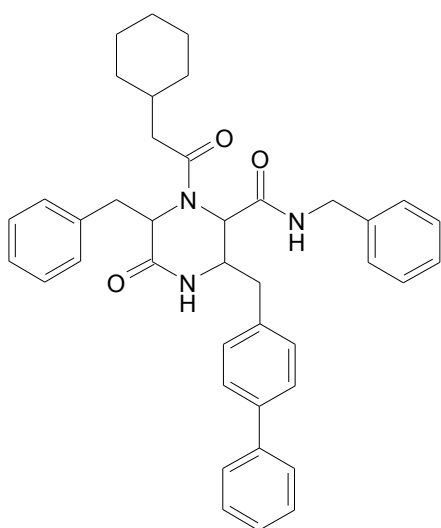




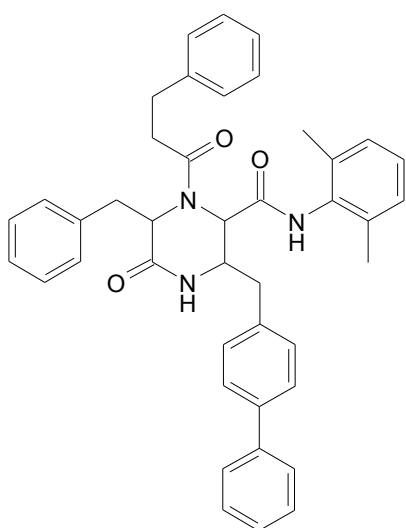




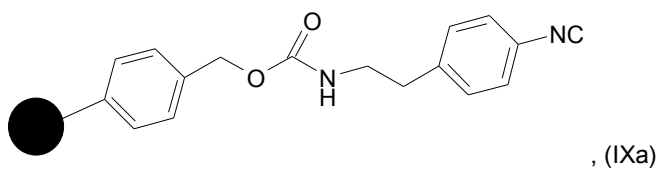





та



51. Ізонітрил, зв'язаний на смолі, що має формулу



де  являє собою тверду смолу-носії.