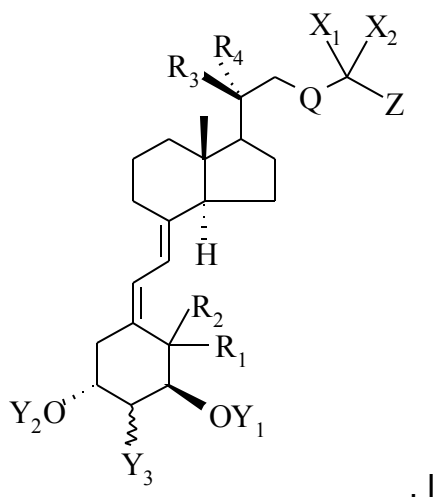


1. Похідні вітаміну D загальної формули I



у якій

Y_1 і Y_2 кожен незалежно один від одного означає атом водню або групу $-C(O)R_5$, а

Y_3 означає атом водню або гідроксигрупу, атом галогену, групу $-OC(O)R_5$ або групу $-OR_5$,

де

R^5 являє собою ароматичний радикал з 5-12 С-атомами або аліфатичний, прямоланцюговий або розгалужений, насичений або ненасичений C_1 - C_{12} алкільний радикал, необов'язково перерваний 1-2 атомами кисню, 1-2 атомами сірки і/або 1-2 NH-групами, і/або необов'язково заміщений 1-2 гідроксигрупами, 1-2 аміногрупами, 1-2 SH-групами, 1-2 COOH-групами і/або 1-2 фенільними групами,

і група Y_3 може бути представлена як у 2α -, так і в епімерній 2β -конфігурації,

R_1 і R_2 кожен означає атом водню або обидва разом являють собою екзоциклічну метиленову групу,

R_3 і R_4 кожен незалежно один від одного означає атом водню, атом фтору, хлору або броду, алкільну групу з 1-4 атомами вуглецю, обидва разом являють собою метиленову групу або разом із четвертинним атомом вуглецю 20 утворюють 3-7-членне, насичене або ненасичене карбоциклічне кільце,

Q означає прямоланцюгову алкіленову групу з 1-5 атомами вуглецю,

X_1 і X_2 разом означають кетокисневий атом із подвійним зв'язком або незалежно один від одного означають атом водню, гідроксигрупу, $-OC(O)R_5$ -групу, атом фтору, хлору або броду, при цьому X_1 і X_2 не повинні кожен одночасно означати гідроксигрупу або $-OC(O)R_5$ -групу,

Z означає карбоциклічне або гетероциклічне, необов'язково ароматичне або гетероароматичне кільце з 5 або 6 членами або конденсованою циклічною системою, що складається з 5- і 6-членного кільця або ж двох 6-членних кілець, які можуть бути

заміщені одним або декількома атомами фтору, хлору, бромю або йоду, однією або декількома гідроксигрупами, однією або декількома COOR₆-групами, однією або декількома C₁-C₅алкільними групами, які у свою чергу можуть бути заміщені одним або декількома атомами фтору, хлору, бромю або йоду, C₁-C₆алкоксигрупами і/або COOR₆-групами, при цьому

R₆ являє собою C₁-C₆алкільну групу, бензильну групу або фенільну групу, а саме,

(7E)-(1R,3R,24aR)-24a-(оксазол-4-іл)-24a-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,3,24a-тріол,

(7E)-(1R,3R,24aS)-24a-(оксазол-4-іл)-24a-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,3,24a-тріол,

(5Z,7E)-(1S,3R,24aR)-24a-(оксазол-4-іл)-24a-гомо-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-1,3,24a-тріол,

(5Z,7E)-(1S,3R,24aS)-24a-(оксазол-4-іл)-24a-гомо-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-1,3,24a-тріол,

(7E)-(1R,3R,24aR)-24a-(тіазол-2-іл)-24a-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,3,24a-тріол,

(7E)-(1R,3R,24aS)-24a-(тіазол-2-іл)-24a-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,3,24a-тріол,

(7E)-(1R,3R)-1,3-дигідрокси-24a-(тіазол-2-іл)-24a-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-24a-он,

(5Z,7E)-(1S,3R,24aR)-24a-(тіазол-2-іл)-24a-гомо-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-1,3,24a-тріол,

(5Z,7E)-(1S,3R,24aS)-24a-(тіазол-2-іл)-24a-гомо-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-1,3,24a-тріол,

(5Z,7E)-(1S,3R)-1,3-дигідрокси-24a-(тіазол-2-іл)-24a-гомо-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-24a-он,

(7E)-(1R,3R,24aR)-24a-(4-метилтіазол-2-іл)-24a-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,3,24a-тріол,

(7E)-(1R,3R,24aS)-24a-(4-метилтіазол-2-іл)-24a-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,3,24a-тріол,

(7E)-(1R,3R)-1,3-дигідрокси-24a-(4-метилтіазол-2-іл)-24a-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-24a-он,

(5Z,7E)-(1S,3R,24aR)-24a-(4-метилтіазол-2-іл)-24a-гомо-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-1,3,24a-тріол,

(5Z,7E)-(1S,3R,24aS)-24a-(4-метилтіазол-2-іл)-24a-гомо-9,10-секохола-5,7,10(19)-

триєн-1,3,24а-тріол,
(5Z,7E)-(1S,3R)-1,3-дигідрокси-24а-(4-метилпіазол-2-іл)-24а-гомо-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-24а-он,
(7E)-(1R,3R,24aR)-24а-(тієн-2-іл)-24а-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,3,24а-тріол,
(7E)-(1R,3R,24aS)-24а-(тієн-2-іл)-24а-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,3,24а-тріол,
(7E)-(1R,3R)-1,3-дигідрокси-24а-(тієн-2-іл)-24а-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-24а-он,
(5Z,7E)-(1S,3R,24aR)-24а-(тієн-2-іл)-24а-гомо-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-1,3,24а-тріол,
(5Z,7E)-(1S,3R,24aS)-24а-(тієн-2-іл)-24а-гомо-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-1,3,24а-тріол,
(7E)-(1R,2S,3R,24aR)-24а-(тієн-2-іл)-24а-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-триєн-1,2,3,24-тетрол,
(7E)-(1R,2S,3R,24aS)-24а-(тієн-2-іл)-24а-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,2,3,24-тетрол,
(7E)-(1R,2S,3R)-24а-(тієн-2-іл)-1,2,3-тригідрокси-24а-гомо-9,10-секохола-5,7-дієн-24а-он,
(7E)-(1R,3R,24aR)-24а-(4-метилтієн-2-іл)-24а-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,3,24а-тріол,
(7E)-(1R,3R,24aS)-24а-(4-метилтієн-2-іл)-24а-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,3,24а-тріол,
(7E)-(1R,3R)-1,3-дигідрокси-24а-(4-метилтієн-2-іл)-24а-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-24а-он,
(5Z,7E)-(1S,3R,24aR)-24а-(4-метилтієн-2-іл)-24а-гомо-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-1,3,24а-тріол,
(5Z,7E)-(1S,3R,24aS)-24а-(4-метилтієн-2-іл)-24а-гомо-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-1,3,24а-тріол,
(5Z,7E)-(1S,3R)-1,3-дигідрокси-24а-(4-метилтієн-2-іл)-24а-гомо-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-24а-он,
(7E)-(1R,2S,3R,24aR)-24а-(4-метилтієн-2-іл)-24а-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,2,3,24-тетрол,
(7E)-(1R,2S,3R,24aS)-24а-(4-метилтієн-2-іл)-24а-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,2,3,24-тетрол,

(7E)-(1R,2S,3R)-24a-(4-метилпієн-2-іл)-1,2,3-тригідрокси-24a-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-24a-он,
(7E)-(1R,3R,24aR)-24a-(5-етилпієн-2-іл)-24a-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,3,24a-тріол,
(7E)-(1R,3R,24aS)-24a-(5-етилпієн-2-іл)-24a-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,3,24a-тріол,
(7E)-(1R,3R,24aR)-24a-[5-(2-гідроксіетил)-4-метилпіазол-2-іл]-24a-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,3,24a-тріол,
(7E)-(1R,3R,24aS)-24a-[5-(2-гідроксіетил)-4-метилпіазол-2-іл]-24a-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,3,24a-тріол,
(7E)-(1R,3R)-1,3-дигідрокси-24a-[5-(2-гідроксіетил)-4-метилпіазол-2-іл]-24a-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-24a-он,
(7E)-(1R,3R,24aR)-24a-(бензотіазол-2-іл)-24a-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,3,24a-тріол,
(7E)-(1R,3R,24aS)-24a-(бензотіазол-2-іл)-24a-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,3,24a-тріол,
(7E)-(1R,3R)-24a-(бензотіазол-2-іл)-1,3-дигідрокси-24a-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-24a-он,
(7E)-(1R,3R,24aR)-24a-(бензофуран-2-іл)-24a-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,3,24a-тріол,
(7E)-(1R,3R,24aS)-24a-(бензофуран-2-іл)-24a-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,3,24a-тріол,
(7E)-(1R,3R)-24a-(бензофуран-2-іл)-1,3-дигідрокси-24a-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-24a-он,
(7E)-(1R,3R,24aR)-24a-(бензотіофен-2-іл)-24a-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,3,24a-тріол,
(7E)-(1R,3R,24aS)-24a-(бензотіофен-2-іл)-24a-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,3,24a-тріол,
(7E)-(1R,3R)-24a-(бензотіофен-2-іл)-1,3-дигідрокси-24a-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-24a-он,
(7E)-(1R,3R,24aR)-24a-(1-метилбензімідазол-2-іл)-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,3,24a-тріол,
(7E)-(1R,3R,24aS)-24a-(1-метилбензімідазол-2-іл)-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,3,24a-тріол,
(7E)-(1R,3R)-1,3-дигідрокси-24a-(1-метилбензімідазол-2-іл)-24a-гомо-19-нор-9,10-

секохола-5,7-дієн-24а-он,

етиловий ефір

(7E)-(1R,3R)-1-(1,3-дигідрокси-24а-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-24а-іл)-3-[(4-метоксифеніл)метокси]-1Н-піразол-4-карбонової кислоти,

етиловий ефір

(7E)-(1R,3R)-1-(1,3-дигідрокси-24а-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-24а-іл)-3-гідрокси-1Н-піразол-4-карбонової кислоти,

(7E)-(1R,3R,24aR)-24а-(4-метилфеніл)-24а-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,3,24а-тріол,

(7E)-(1R,3R,24aS)-24а-(4-метилфеніл)-24а-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,3,24а-тріол,

(7E)-(1R,3R)-1,3-дигідрокси-24а-(4-метилфеніл)-24а-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-24а-он,

(7E)-(1R,2R,3R,24aR)-24а-(4-метилфеніл)-24а-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,2,3,24а-тетрол,

(7E)-(1R,RS,3R,24aS)-24а-(4-метилфеніл)-24а-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,2,3,24а-тетрол,

(7E)-(1R,3R,24aR)-24а-(4-трифторметилфеніл)-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,3,24а-тріол,

(7E)-(1R,3R,24aS)-24а-(4-трифторметилфеніл)-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,3,24а-тріол,

(7E)-(1R,3R)-1,3-дигідрокси-24а-(4-трифторметилфеніл)-24а-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-24а-он,

(7E)-(1R,3R,24aR)-24а-(4-метоксифеніл)-24а-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,3,24а-тріол,

(7E)-(1R,3R,24aS)-24а-(4-метоксифеніл)-24а-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,3,24а-тріол,

(7E)-(1R,3R)-1,3-дигідрокси-24а-(4-метоксифеніл)-24а-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-24а-он,

(7E)-(1R,3R,20S,24aR)-24а-(тіазол-2-іл)-24а-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,3,24а-тріол,

(7E)-(1R,3R,20S,24aS)-24а-(тіазол-2-іл)-24а-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,3,24а-тріол,

(7E)-(1R,3R,20S)-1,3-дигідрокси-24а-(тіазол-2-іл)-24а-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-24а-он,

(5Z,7E)-(1S,3R,20S,24aS)-24a-(тіазол-2-іл)-24a-гомо-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-1,3,24a-тріол,
(5Z,7E)-(1S,3R,20S,24aR)-24a-(тіазол-2-іл)-24a-гомо-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-1,3,24a-тріол,
(5Z,7E)-(1S,3R,20S)-1,3-дигідрокси-24a-(тіазол-2-іл)-24a-гомо-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-24a-он,
(5Z,7E)-(1S,3R,24S)-24-(тіазол-2-іл)-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-1,3,24-тріол,
(5Z,7E)-(1S,3R,24R)-24-(тіазол-2-іл)-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-1,3,24-тріол,
(5Z,7E)-(1S,3R)-1,3-дигідрокси-24-(тіазол-2-іл)-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-24-он,
(7E)-(1R,3R,20S,24aR)-24a-(оксазол-4-іл)-24a-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,3,24a-тріол,
(7E)-(1R,3R,20S,24aS)-24a-(оксазол-4-іл)-24a-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,3,24a-тріол,
(7E)-(1R,3R,20S)-1,3-дигідрокси-24a-(оксазол-4-іл)-24a-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-24a-он,
(5Z,7E)-(1S,3R,20S,24aR)-24a-(оксазол-4-іл)-24a-гомо-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-1,3,24a-тріол,
(5Z,7E)-(1S,3R,20S,24aS)-24a-(оксазол-4-іл)-24a-гомо-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-1,3,24a-тріол,
(5Z,7E)-(1S,3R,20S)-1,3-дигідрокси-24a-(оксазол-4-іл)-24a-гомо-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-24a-он,
(5Z,7E)-(1S,3R,24R)-24a-(оксазол-4-іл)-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-1,3,24a-тріол,
(5Z,7E)-(1S,3R,24S)-24-(оксазол-4-іл)-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-1,3,24a-тріол,
(5Z,7E)-(1S,3R)-1,3-дигідрокси-24-(оксазол-4-іл)-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-24-он,
(7E)-(1R,3R,20S,24aR)-24a-(4-метилтіазол-2-іл)-24a-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,3,24a-тріол,
(7E)-(1R,3R,20S,24aS)-24a-(4-метилтіазол-2-іл)-24a-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,3,24a-тріол,
(7E)-(1R,3R,20S)-1,3-дигідрокси-24a-(4-метилтіазол-2-іл)-24a-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-24a-он,
(5Z,7E)-(1S,3R,20S,24aR)-24a-(4-метилтіазол-2-іл)-24a-гомо-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-1,3,24a-тріол,
(5Z,7E)-(1S,3R,20S,24aS)-24a-(4-метилтіазол-2-іл)-24a-гомо-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-1,3,24a-тріол,
(5Z,7E)-(1S,3R,20S)-1,3-дигідрокси-24a-(4-метилтіазол-2-іл)-24a-гомо-9,10-секохола-

5,7,10(19)-триєн-24а-он,
(5Z,7E)-(1S,3R,24R)-24-(4-метилтіазол-2-іл)-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-1,3,24а-тріол,
(5Z,7E)-(1S,3R,24S)-24-(4-метилтіазол-2-іл)-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-1,3,24а-тріол,
(5Z,7E)-(1S,3R)-1,3-дигідрокси-24-(4-метилтіазол-2-іл)-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-24а-он,
(7E)-(1R,3R,20S,24aR)-24а-(4-метилтієн-2-іл)-24а-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,3,24а-тріол,
(7E)-(1R,3R,20S,24aS)-24а-(4-метилтієн-2-іл)-24а-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,3,24а-тріол,
(7E)-(1R,3R,20S)-1,3-дигідрокси-24а-(4-метилтієн-2-іл)-24а-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-24а-он,
(5Z,7E)-(1S,3R,20S,24aR)-24а-(4-метилтієн-2-іл)-24а-гомо-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-1,3,24а-тріол,
(5Z,7E)-(1S,3R,20S,24aS)-24а-(4-метилтієн-2-іл)-24а-гомо-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-1,3,24а-тріол,
(5Z,7E)-(1S,3R,20S)-1,3-дигідрокси-24а-(4-метилтієн-2-іл)-24а-гомо-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-24а-он,
(5Z,7E)-(1S,3R,24R)-24-(4-метилтієн-2-іл)-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-1,3,24а-тріол,
(5Z,7E)-(1S,3R,24S)-24-(4-метилтієн-2-іл)-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-1,3,24а-тріол,
(5Z,7E)-(1S,3R)-1,3-дигідрокси-24-(4-метилтієн-2-іл)-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-24а-он,
(7E)-(1R,3R,20S,24aR)-24а-(тієн-2-іл)-24а-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,3,24а-тріол,
(7E)-(1R,3R,20S,24aS)-24а-(тієн-2-іл)-24а-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,3,24а-тріол,
(7E)-(1R,3R,20S)-1,3-дигідрокси-24а-(тієн-2-іл)-24а-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-24а-он,
(5Z,7E)-(1S,3R,20S,24aR)-24а-(тієн-2-іл)-24а-гомо-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-1,3,24а-тріол,
(5Z,7E)-(1S,3R,20S,24aS)-24а-(тієн-2-іл)-24а-гомо-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-1,3,24а-тріол,

(5Z,7E)-(1S,3R,20S)-1,3-дигідрокси-24a-(тієн-2-іл)-24a-гомо-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-24a-он,
(5Z,7E)-(1S,3R,24R)-24-(тієн-2-іл)-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-1,3,24a-тріол,
(5Z,7E)-(1S,3R,24S)-24-(тієн-2-іл)-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-1,3,24a-тріол,
(5Z,7E)-(1S,3R)-1,3-дигідрокси-24-(тієн-2-іл)-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-24-он,
(5Z,7E)-(1S,3R,24S)-24-(4-метилтіазол-2-іл)-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-1,3,24-тріол,
(5Z,7E)-(1S,3R,24R)-24-(4-метилтіазол-2-іл)-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-1,3,24-тріол,
(5Z,7E)-(1S,3R)-1,3-дигідрокси-24-(4-метилтіазол-2-іл)-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-24-он,
(5Z,7E)-(1S,3R,24S)-24-(тієн-2-іл)-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-1,3,24-тріол,
(5Z,7E)-(1S,3R,24R)-24-(тієн-2-іл)-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-1,3,24-тріол,
(5Z,7E)-(1S,3R)-1,3-дигідрокси-24-(тієн-2-іл)-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-24-он,
(5Z,7E)-(1S,3R,24S)-24-(4-метилтієн-2-іл)-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-1,3,24-тріол,
(5Z,7E)-(1S,3R,24R)-24-(4-метилтієн-2-іл)-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-1,3,24-тріол,
(5Z,7E)-(1S,3R)-1,3-дигідрокси-24-(4-метилтієн-2-іл)-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-24-он,
(7E)-(1R,3R,24aR)-24a-фтор-24a-(тіазол-2-іл)-24a-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,3-діол,
(7E)-(1R,3R,24aS)-24a-фтор-24a-(тіазол-2-іл)-24a-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,3-діол,
(5Z,7E)-(1S,3R,24aR)-24a-фтор-24a-(тіазол-2-іл)-24a-гомо-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-1,3-діол,
(5Z,7E)-(1S,3R,24aS)-24a-фтор-24a-(тіазол-2-іл)-24a-гомо-9,10-секохола-5,7,10(19)-триєн-1,3-діол,
(7E)-(1R,3R,24aR)-24a-(ацетилокси)-24a-(тіазол-2-іл)-24a-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,3,24a-тріол,
(7E)-(1R,3R,24aS)-24a-(ацетилокси)-24a-(тіазол-2-іл)-24a-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,3,24a-тріол,
(7E)-(1R,3R,24aR)-24a-(2,2-диметилпропаноїлокси)-24a-(тіазол-2-іл)-24a-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,3,24a-тріол,
(7E)-(1R,3R,24aS)-24a-(2,2-диметилпропаноїлокси)-24a-(тіазол-2-іл)-24a-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,3,24a-тріол,
(7E)-(1R,3R)-2-бром-24a-(тіазол-2-іл)-24a-гомо-19-нор-9,10-секохола-5,7-дієн-1,3,24a-

тріол,

а також усі можливі епімери або діастереомери та їхні суміші.

2. Похідні вітаміну D загальної формули I за п. 1, у якій

R_3 або R_4 означає водень,

X_1 і X_2 обидва разом означають карбонільну групу або X_1 означає гідроксильну групу або атом фтору, а X_2 означає атом водню, або X_1 означає атом водню, а X_2 означає гідроксильну групу або атом фтору, або X_1 означає $-\text{OC}(\text{O})\text{R}_5$ -групу, а X_2 означає атом водню, або X_1 означає атом водню, а X_2 означає $-\text{OC}(\text{O})\text{R}_5$ -групу і

Z являє собою ароматичну циклічну систему.

3. Похідні вітаміну D загальної формули I за п. 1, у якій

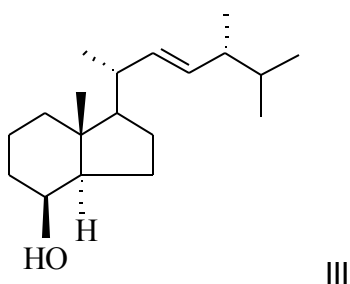
R_3 або R_4 означає водень,

X_1 і X_2 обидва разом означають карбонільну групу або X_1 означає гідроксильну групу або атом фтору, а X_2 означає атом водню, або X_1 означає атом водню, а X_2 означає гідроксильну групу або атом фтору, або X_1 означає $-\text{OC}(\text{O})\text{R}_5$ -групу, а X_2 означає атом водню, або X_1 означає атом водню, а X_2 означає $-\text{OC}(\text{O})\text{R}_5$ -групу і

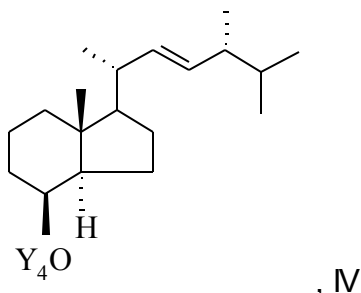
Z являє собою гетероароматичну циклічну систему.

4. Похідні вітаміну D загальної формули I за п. 1, де стереохімія в положенні 20 представлена в неприродній 20-епіконфігурації.

5. Спосіб одержання сполук загальної формули I за п. 1, де Q означає C_2 - C_5 алкіл, який **відрізняється** тим, що сполуку формули III



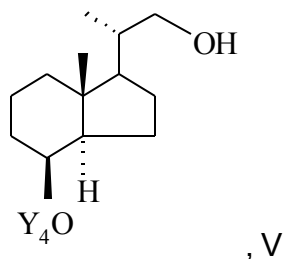
введенням захисної групи Y_4 переводять у сполуку формули IV



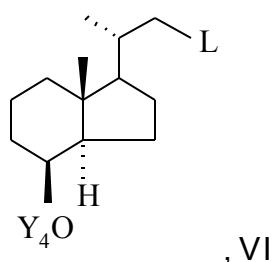
в якій Y_4 означає триалкілсилільну захисну групу, силільну захисну групу зі змішаним арилалкілним заміщенням, тетрагідропіранільну або тетрагідрофуранільну захисну

групу,

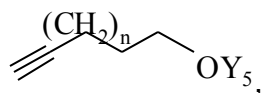
шляхом оксидативного розщеплення подвійного зв'язку переводять у сполуку загальної формули V



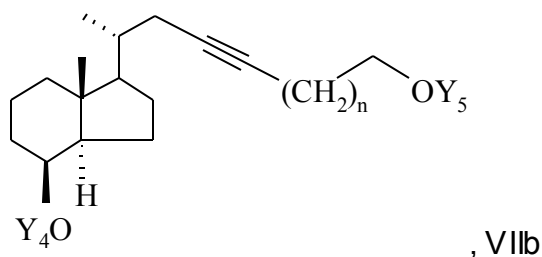
спирт за рахунок введення будь-якої відхідної групи L переводять у сполуку загальної формули VI



у якій L означає будь-яку відхідну групу, а Y_4 означає триалкілсилільну захисну групу, силільну захисну групу зі змішаним арилалкілним заміщенням, тетрагідропіранільну або тетрагідрофуранільну захисну групу, піддають взаємодії з алкінолом формули

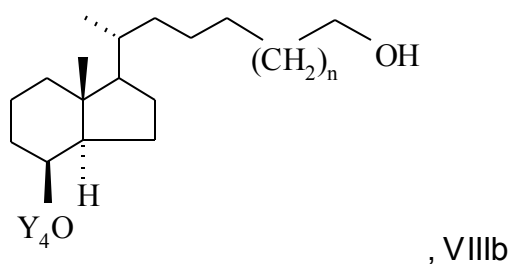


у якій Y_5 являє собою тетрагідропіранільну групу або бензильну групу, а n означає 0, 1, 2, 3, депротонуваним за допомогою відповідної основи, такої як гідрид натрію, гідрид калію, бутиллітій або амід натрію, з одержанням сполуки загальної формули VIIb

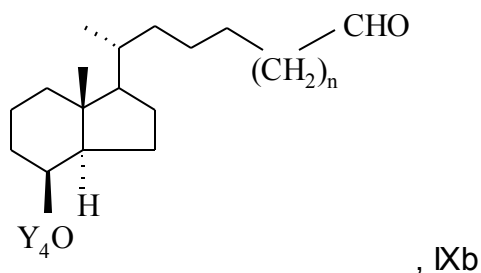


у якій Y_5 має зазначені вище значення,

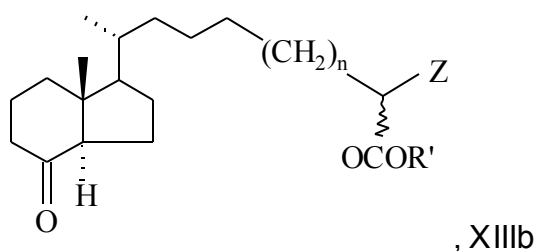
далі в будь-якій послідовності гідрують потрібний зв'язок, і необов'язково наявну ще захисну групу Y_5 звичайним шляхом відщеплюють з метою одержання сполуки загальної формули VIIIb



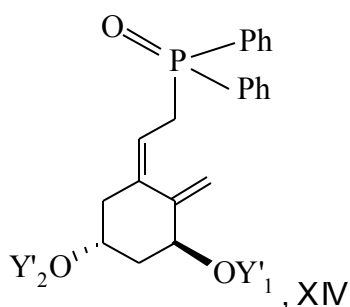
вільну гідроксигрупу якої за допомогою відповідних окислювачів, таких як хлорхромат піридинію, дихромат піридинію, окислюванням згідно зі Сверном або окислюванням згідно з Колінзом переводять потім в альдегід загальної формули IXb

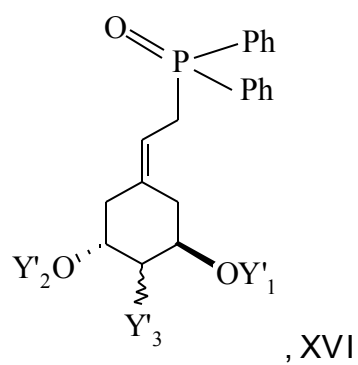
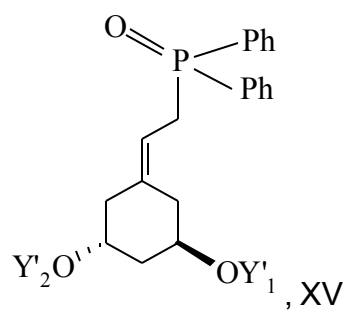


який взаємодією з нуклеофілом Z', що являє собою будь-яку нуклеофільну форму радикалів із числа зазначених для Z, переведенням вільної гідроксигрупи в групу OCOR', де R' означає C₁-C₅алкіл, відщипленням захисної групи Y₄ і окислюванням вільної гідроксигрупи переводять у кетон загальної формули XIIIb



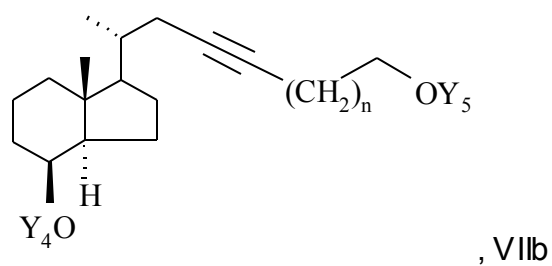
який потім звичайним шляхом за реакцією Віттіга з використанням одного з відомих фосфонатів формул XIV, XV або XVI



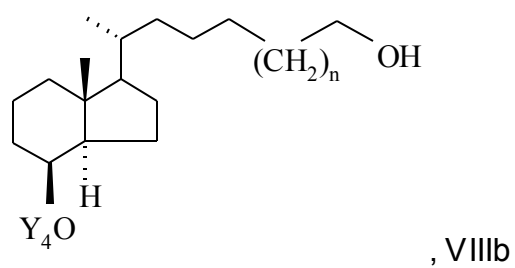


після відщиплення захисних груп переводять у сполуку загальної формули I.

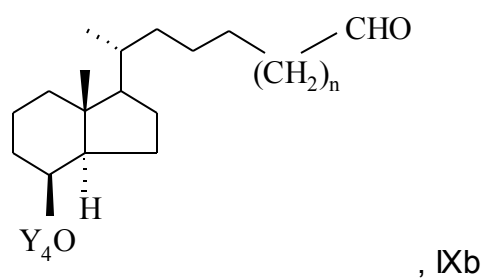
6. Проміжні продукти загальних формул VIIb



VIIIb



i IXb



відповідно до способу за п. 5, при цьому Y_4 , Y_5 і n мають значення, зазначені в п. 5.

7. Фармацевтичні препарати, які містять у своєму складі принаймні одну сполуку за п. 1 разом із фармацевтично прийнятними допоміжними речовинами й носіями.

8. Застосування похідних вітаміну D загальної формули I за п. 1 для одержання відповідних лікарських засобів.

9. Застосування за п. 8, яке **відрізняється** тим, що лікарський засіб призначений для лікування захворювань, які характеризуються гіперпроліферацією і відсутністю диференціювання клітин (наприклад, гіперпроліферативних захворювань шкіри: псоріазу, лишая Pitiriasis subia pilasis, вугрів та іхтіозу; шкірної сверблячки; пухлинних захворювань і передраку: пухлин шлунково-кишкового тракту, раку молочної залози, пухлин легенів, раку передміхурової залози, лейкозів, лімфоми Т-клітин, меланоми, бета-клітинного раку, лускатого раку, актинічного кератозу, шийної дисплазії, пухлин будь-якого типу, які дають метастази).

10. Застосування за п. 8, яке **відрізняється** тим, що лікарський засіб призначений для лікування й профілактики захворювань, які характеризуються порушенням рівноваги імунної системи (наприклад, екземи, atopічних захворювань і запальних захворювань: ревматоїдного артриту, захворювань дихальних шляхів, таких як астма, автоімунних захворювань, таких як розсіяний склероз, цукрового діабету типу I, важкої міастенії, червоного вовчаку, склеродермії, бульозних захворювань шкіри, таких як пемфігус, пемфігоїд, при реакціях відторгнення аутологічних, алогенних або гетерологічних трансплантатів, а також СНІДу).

11. Застосування за п. 9, яке **відрізняється** тим, що лікарський засіб включає і інші засоби, які мають імуносупресорну дію, такі як циклоспорин А, FK 506, рапаміцин і антитіла до CD4.

12. Застосування за п. 8, яке **відрізняється** тим, що лікарський засіб призначений для терапії вторинного гіперпаратиреозу і ниркової остеодистрофії, а також цукрового діабету типу II.

13. Застосування за п. 8, яке **відрізняється** тим, що лікарський засіб призначений для локального введення для прискореного загоєння ран, а також для лікування старіння шкіри або індукованої медикаментами атрофії шкіри.

14. Застосування за п. 8, яке **відрізняється** тим, що лікарський засіб призначений для лікування захворювань, які супроводжуються порушенням росту волосся, з метою сприяння фізіологічному процесу росту волосся.

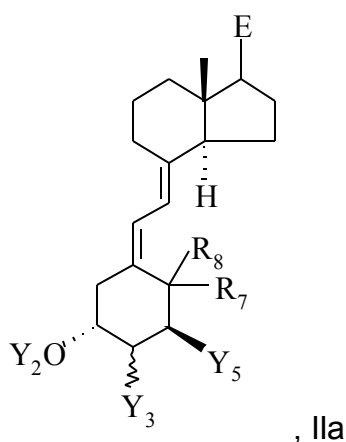
15. Застосування за п. 8, яке **відрізняється** тим, що лікарський засіб призначений

для терапії та профілактики старечого остеопорозу, клімактеричного остеопорозу, індукованого стероїдами остеопорозу і для прискореного загоєння артропластики.

16. Застосування за п. 8, яке **відрізняється** тим, що лікарський засіб призначений для лікування дегенеративних захворювань периферичної й центральної нервової системи.

17. Застосування за п. 8, яке **відрізняється** тим, що лікарський засіб призначений для терапії й профілактики артеріосклерозу, для терапії гіперкальціємії, для контролю фертильності, при СНІДі, як імуностимуляторів, при гірсутизмі і гранулематозних захворюваннях.

18. Спосіб одержання сполук загальної формули IIa



в якій E означає будь-який бічний ланцюг,

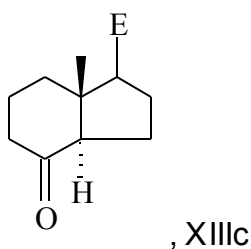
R₇ і R₈ кожен незалежно один від одного означає атом водню, метильну групу або обидва разом утворюють екзоциклічну метиленову групу або циклопропільне кільце, Y₂ означає атом водню або групу -(CO)R₅,

Y₃ означає атом водню, гідроксигрупу, атом галогену, групу -O(CO)R₅ або OR₅-групу, де

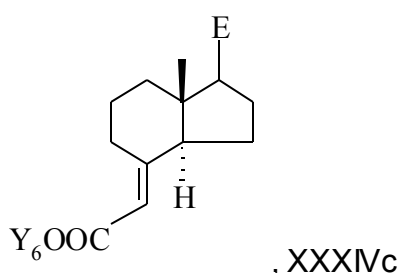
R₅ являє собою аліфатичний C₁-C₁₂алкільний радикал, необов'язково перерваний 1-2 атомами кисню, 1-2 атомами сірки і/або 1-2 NH-групами, і/або необов'язково заміщений 1-2 гідроксигрупами, 1-2 аміногрупами, 1-2 SH-групами, 1-2 COOH-групами і/або 1-2 фенільними групами, або являє собою ароматичний радикал з 5-12 C-атомами,

Y₅ означає атом фтору, (CH₂)_n-OH-групу або (CH₂)_n-O(CO)R₅-групу, де n означає 0-4,

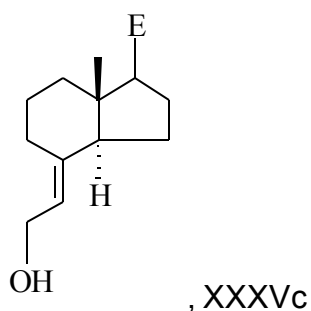
і необов'язково наявні гідроксигрупи, представлені при потребі в захищеній формі, який **відрізняється** тим, що кетон загальної формули XIIIc



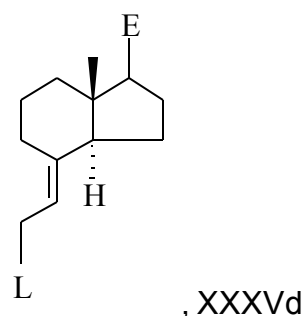
в якій E означає будь-який бічний ланцюг, а необов'язково наявні кетогрупи і/або гідроксигрупи представлені в захищеній формі, взаємодією з ефіром триметилсилілоцтової кислоти в присутності відповідної основи, наприклад, н-бутиллітію або алюмогідриду літію, або з відповідним реагентом Віттіга в апротонному розчинникові, такому як толуол, тетрагідрофуран, діетиловий ефір або діоксан, переводять у сполуку загальної формули XXXIVc



у якій Y₆ означає C₁-C₆алкільну групу, бензильну групу або фенільну групу, складноефірну групу за реакцією з відновником, таким як діізобутилалюмогідрид, алюмогідрид літію, диборан або червоний алюміній (RedAl), у гексані, толуолі, тетрагідрофурані, діетиловому ефірі або діоксані, переводять в аліловий спирт загальної формули XXXVc

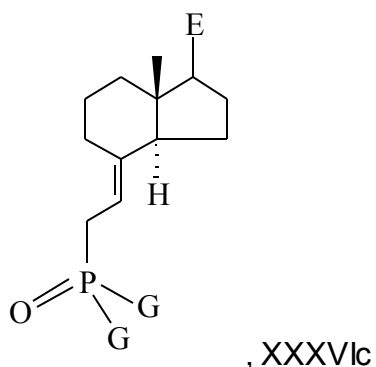


цей аліловий спирт відомим чином переводять у сполуку загальної формули XXXVd

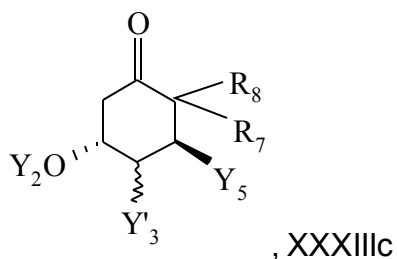


у якій L означає галоген, мезилат, тозилат, трифлат, нонафлат, зазначену сполуку

виділяють або, при потребі, утворюють *in situ* і далі відразу ж перетворюють на реагент Віттіга загальної формули XXXVIc



в якій G означає C₁-C₁₀алкільну групу, C₁-C₁₀алкоксигрупу, фенільну групу або феноксигрупу, потім зазначений реагент Віттіга при дотриманні відомих умов піддають взаємодії з кетоном загальної формули XXXIIIc



у який Y₃ означає атом водню, атом галогену або захищену гідроксигрупу, групу - O(CO)R₅ або OR₅-групу, а Y₅, R₇ і R₈ мають зазначені вище значення, і при потребі захисні групи відщеплюють.