



УКРАЇНА

(19) UA

(11) 85994

(13) C2

(51) МПК (2009)	C07C 255/58 (2006.01)	C07D 239/34 (2006.01)
C07D 295/16 (2006.01)	C07C 271/28 (2006.01)	C07D 239/48 (2006.01)
A61K 31/164	C07C 271/44 (2006.01)	C07D 241/08 (2006.01)
A61K 31/18	C07C 311/08 (2006.01)	C07D 241/24 (2006.01)
A61K 31/27 (2006.01)	C07C 311/16 (2006.01)	C07D 261/08 (2006.01)
A61K 31/336	C07C 311/17 (2006.01)	C07D 263/06 (2006.01)
A61K 31/341		C07D 263/34 (2006.01)
A61K 31/357	C07C 311/18 (2006.01)	C07D 263/56 (2006.01)
A61K 31/36 (2006.01)	C07C 311/19 (2006.01)	C07D 265/36 (2006.01)
A61K 31/381	C07C 311/20 (2006.01)	C07D 271/06 (2006.01)
A61K 31/39	C07C 311/21 (2006.01)	C07D 271/12 (2006.01)
A61K 31/40	C07C 311/29 (2006.01)	C07D 275/00
A61K 31/41	C07C 311/37 (2006.01)	C07D 277/20 (2006.01)
A61K 31/415	C07C 317/44 (2006.01)	C07D 277/30 (2006.01)
A61K 31/416	C07C 317/46 (2006.01)	C07D 277/56 (2006.01)
A61K 31/4164	C07C 317/50 (2006.01)	C07D 279/00
A61K 31/421	C07C 323/60 (2006.01)	C07D 285/06 (2006.01)
A61K 31/423	C07C 323/62 (2006.01)	C07D 295/155 (2006.01)
A61K 31/426	C07C 323/65 (2006.01)	C07D 295/185 (2006.01)
A61K 31/427	C07D 207/06 (2006.01)	C07D 295/192 (2006.01)
A61K 31/428	C07D 207/08 (2006.01)	C07D 295/22 (2006.01)
A61K 31/437 (2006.01)	C07D 207/14 (2006.01)	C07D 295/26 (2006.01)
A61K 31/439	C07D 207/26 (2006.01)	C07D 303/00
A61K 31/4402	C07D 207/267	C07D 307/20 (2006.01)
A61K 31/4409	(2006.01)	C07D 307/46 (2006.01)
A61K 31/4418	C07D 207/48 (2006.01)	C07D 307/52 (2006.01)
A61K 31/4439 (2006.01)	C07D 209/08 (2006.01)	C07D 309/12 (2006.01)
A61K 31/445	C07D 211/10 (2006.01)	C07D 311/58 (2006.01)
A61K 31/455	C07D 211/44 (2006.01)	C07D 317/68 (2006.01)
A61K 31/47	C07D 211/58 (2006.01)	C07D 319/00
A61K 31/495	C07D 211/60 (2006.01)	C07D 327/00
A61P 25/28 (2006.01)	C07D 211/96 (2006.01)	C07D 333/20 (2006.01)
A61P 43/00	C07D 213/36 (2006.01)	C07D 333/22 (2006.01)
C07C 217/58 (2006.01)	C07D 213/56 (2006.01)	C07D 333/32 (2006.01)
C07C 233/36 (2006.01)	C07D 213/64 (2006.01)	C07D 333/34 (2006.01)
C07C 233/40 (2006.01)	C07D 213/81 (2006.01)	C07D 333/58 (2006.01)
C07C 233/58 (2006.01)	C07D 213/82 (2006.01)	C07D 333/72 (2006.01)
C07C 233/78 (2006.01)	C07D 213/89 (2006.01)	C07D 335/00
C07C 235/20 (2006.01)	C07D 215/54 (2006.01)	C07D 403/04 (2006.01)
C07C 235/50 (2006.01)	C07D 217/08 (2006.01)	C07D 413/04 (2006.01)
C07C 235/74 (2006.01)	C07D 217/22 (2006.01)	C07D 413/06 (2006.01)
C07C 237/04 (2006.01)	C07D 223/00	C07D 413/12 (2006.01)
C07C 237/06 (2006.01)	C07D 231/14 (2006.01)	C07D 417/04 (2006.01)
C07C 237/08 (2006.01)	C07D 231/56 (2006.01)	C07D 417/12 (2006.01)
C07C 237/22 (2006.01)	C07D 233/64 (2006.01)	C07D 453/00
C07C 237/42 (2006.01)	C07D 233/84 (2006.01)	C07D 471/04 (2006.01)
C07C 251/38 (2006.01)	C07D 233/90 (2006.01)	C07D 495/04 (2006.01)

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ
І НАУКИ УКРАЇНИ

ДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ

ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВІНАХІД

(54) ПОХІДНІ N,N'-ЗАМІЩЕНОГО-1,3-ДІАМІНО-2-ГІДРОКСИПРОПАНУ

1

2

(21) 20040604411
(22) 08.11.2002
(24) 25.03.2009
(86) PCT/US02/36072, 08.11.2002

(31) 60/337,122
(32) 08.11.2001
(33) US
(31) 60/344,086

(19) UA
(11) 85994
(13) C2

(32) 28.12.2001

(33) US

(31) 60/345,635

(32) 03.01.2002

(33) US

(46) 25.03.2009, Бюл.№ 6, 2009 р.

(72) ДЖОН ВАРГЕС, МЕЙЛАРД МІШЕЛЬ, ЯГОДЗІНСКА БАРБАРА, БЕК ДЖЕЙМС П., ГЕЙЛУНАС АНДРЕА, ФЕНГ ЛАРРІ, СІЛІ ДЖЕННІФЕР, ТЕНБРИНК РУТ, IN/US, ФРЕСКОС ДЖОН, МІКЕЛЬСОН ДЖОН, САМАЛА ЛАКСМАН, IN/US, ХОМ РОЙ

(73) ЕЛАН ФАРМАСЬЮТИКАЛЗ, ІНК., ФАРМАЦІА ЕНД АПДЖОН КОМПАНІ

(56) WO 9833795; 06.08.1998

EP 0652009; 10.05.1995

Chevallier N. et al. Brain Research, Amsterdam, vol. 750, No. 1/2, 1997, pp. 11-19

WO 0202505; 10.01.2002

WO 0214264; 21.02.2002

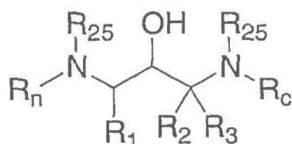
WO 0202520; 10.01.2002

WO 0202518; 10.01.2002

WO 0202512; 10.01.2002

(57)

1. Сполука формули

або її фармацевтично прийнятна сіль,
де R₁ означає:(I) C₁-C₆-алкіл, необов'язково заміщений одним, двома або трьома замісниками, вибраними з групи, що складається з C₁-C₃-алкілу, C₃-C₆-циклоалкілу (необов'язково заміщеного C₁-C₃-алкілом, C₁-C₃-алкокси), -F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, -C≡N, -CF₃, C₁-C₃-алкокси, NR_{1-a}R_{1-b} і -OC=O-NR_{1-a}R_{1-b}, де R_{1-a} і R_{1-b} у кожному випадку незалежно являють собою -H або C₁-C₆-алкіл,(II) -CH₂-S(O)₀₋₂-(C₁-C₆-алкіл),(III) -CH₂-CH₂-S(O)₀₋₂-(C₁-C₆-алкіл),(IV) C₂-C₆-алкеніл, що містить один або два подвійні зв'язки, необов'язково заміщений одним, двома або трьома замісниками, вибраними з групи, що складається з -F, -Cl, -OH, -SH, -C≡N, -CF₃, C₁-C₃-алкокси, NR_{1-a}R_{1-b}, де R_{1-a} і R_{1-b} означають -H або C₁-C₆-алкіл,(V) C₂-C₆-алкініл, що містить один або два потрійні зв'язки, необов'язково заміщений одним, двома або трьома замісниками, вибраними з групи, що складається з -F, -Cl, -OH, -SH, -C≡N, -CF₃, C₁-C₃-алкокси, NR_{1-a}R_{1-b}, де R_{1-a} і R_{1-b} означають -H або C₁-C₆-алкіл,(VI) -(CH₂)_{n1}-(R_{1-арил}), де n₁ дорівнює 0 або 1, а R_{1-арил} являє собою феніл, нафтил, інданіл, інденіл, дигідронафтаїл або тетралініл, кожен з яких необов'язково заміщений одним, двома, трьома, чотирма або п'ятьма такими замісниками:(A) C₁-C₆-алкілом, необов'язково заміщеним одним, двома або трьома замісниками, вибраними з групи, що складається з C₁-C₃-алкілу, -F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, NR_{1-a}R_{1-b}, -C≡N, -CF₃ і C₁-C₃-алкокси,(B) C₂-C₆-алкенілом, необов'язково заміщеним одним, двома або трьома замісниками, вибраними з групи, що складається з -F, -Cl, -OH, -SH, -C≡N, -CF₃, C₁-C₃-алкокси і NR_{1-a}R_{1-b},(C) C₂-C₆-алкінілом, необов'язково заміщеним одним, двома або трьома замісниками, вибраними з групи, що складається з -F, -Cl, -OH, -SH, -C≡N, -CF₃, C₁-C₃-алкокси і NR_{1-a}R_{1-b},

(D) -F, -Cl, -Br і -I,

(E) C₁-C₆-галогеналкокси,(F) C₁-C₆-алкокси,(G) NR_{n-2}R_{n-3},

(H) -OH

(I) -C≡N,

(J) C₃-C₇-циклоалкілом, необов'язково заміщеним одним, двома або трьома замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з -F, -Cl, -OH, -SH, -C≡N, -CF₃, C₁-C₃-алкокси і NR_{1-a}R_{1-b},(K) -CO-(C₁-C₄-алкілом),(L) -SO₂-NR_{1-a}R_{1-b},(M) -CO-NR_{1-a}R_{1-b},(N) -SO₂-(C₁-C₄-алкілом),де R₂ вибраний з групи, що складається з:

(I) -H,

(II) C₁-C₆-алкілу, необов'язково заміщеного одним, двома або трьома замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з C₁-C₃-алкілу, -F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, -C≡N, -CF₃, C₁-C₃-алкокси і NR_{1-a}R_{1-b},(IV) C₂-C₆-алкенілу, що містить один або два подвійні зв'язки, необов'язково заміщеного одним, двома або трьома замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з -F, -Cl, -OH, -SH, -C≡N, -CF₃, C₁-C₃-алкокси і NR_{1-a}R_{1-b},(V) C₂-C₆-алкінілу, необов'язково заміщеного одним, двома або трьома замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з -F, -Cl, -OH, -SH, -C≡N, -CF₃, C₁-C₃-алкокси і NR_{1-a}R_{1-b},де R₃ вибраний з групи, що складається з:

(I) -H,

(II) C₁-C₆-алкілу, необов'язково заміщеного одним, двома або трьома замісниками, вибраними з групи, що складається з C₁-C₃-алкілу, -F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, -C≡N, -CF₃, C₁-C₃-алкокси і NR_{1-a}R_{1-b},(IV) C₂-C₆-алкенілу,(V) C₂-C₆-алкінілу,або R₂ і R₃ разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, утворюють вуглецевий цикл з трьох, чотирьох, п'ятьох, шести або семи атомів вуглецю; R_n означає:(I) R_{n-1}-X_n, де X_n являє собою: -CO-,де R_{n-1} вибраний з групи, що складається з:(A) R_n-арил, де R_n-арил у кожному випадку незалежно являє собою феніл, нафтил, тетралініл, інданіл, інденіл, дигідронафтаїл або 6,7,8,9-тетрагідро-5H-бензо[а]циклопентил; кожен з яких необов'язково заміщений 1, 2 або 3 групами, що в кожному випадку незалежно являють собою:(1) C₁-C₆-алкіл, необов'язково заміщений одним, двома або трьома замісниками, вибраними з групи, що складається з C₁-C₃-алкілу, -F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, -C≡N, -CF₃, C₁-C₃-алкокси і NR_{1-a}R_{1-b}, де R_{1-a} і R_{1-b} у кожному випадку незалежно являють собою -H або C₁-C₆-алкіл,

(2) -OH,

(3) -NO₂,

(4) -F, -Cl, -Br, -I,

(5) -CO₂H,

(6) -C≡N,

(7) $-(CH_2)_{0-4}-CO-NR_{n-2}R_{n-3}$, де R_{n-2} і R_{n-3} в кожному випадку є однаковими або різними й вибрані з групи, що складається з:

- (a) -H,
- (b) -C₁-C₈-алкілу, необов'язково заміщеного одним замісником, вибраним з групи, що складається з:
 - (i) -OH,
 - (ii) -NR^{'''},
 - (iii) фенілу,
- (c) -C₁-C₈-алкілу, необов'язково заміщеного 1, 2 або 3 групами, що незалежно являють собою -F, -Cl, -Br або -I,
- (d) -C₃-C₈-циклоалкілу,
- (e) -(C₁-C₂-алкіл)-(C₃-C₈-циклоалкілу),
- (f) -(C₁-C₆-алкіл)-O-(C₁-C₃-алкілу),
- (g) -C₂-C₆-алкенілу,
- (h) -C₂-C₆-алкінілу,
- (i) -C₁-C₆-алкільного ланцюга, що містить один подвійний та один потрійний зв'язок,
- (j) -R₁-арилу,
- (8) $-(CR'R'')_{0-4}CO-OR'$, (C) $R_{n-арил}-W-R_{n-арилу}$, де W означає:

- (1) $-(CH_2)_{1-4}$,
- (2) -O-,
- (3) -S(O)₁₋₂,
- (4) -N(R_{n-5})-,
- (5) -CO-,
- (6) зв'язок;

де R_c означає:

- (I) C₁-C₁₀-алкіл, необов'язково заміщений одним, двома або трьома замісниками, вибраними з групи, що складається з C₁-C₃-алкілу, -F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, -C≡N, -CF₃, C₁-C₆-алкокси, -O-фенілу, -NR_{1-a}R_{1-b}, -OC=ONR_{1-a}R_{1-b}, -S(=O)₀₋₂-R_{1-a}, -NR_{1-a}=ONR_{1-a}R_{1-b}, -C=ONR_{1-a}R_{1-b} і -S(=O)₂NR_{1-a}R_{1-b},
- (II) $-(CH_2)_{0-3}-(C_3-C_8)$ циклоалкіл, де циклоалкіл може бути необов'язково заміщений одним, двома або трьома замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з C₁-C₃-алкілу, -F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, -C≡N, -CF₃, C₁-C₆-алкокси, -O-фенілу, -CO₂H, -CO₂-(C₁-C₄-алкілу) і -NR_{1-a}R_{1-b},
- (III) $-(CR_{c-x}R_{c-y})_{0-4}-R_{c-арил}$ у кожному випадку незалежно являє собою феніл, нафтил, тетралініл, інданіл, інденіл, дигідронафтил або 6,7,8,9-тетрагідро-5H-бензо[а]циклопентеніл; кожен з яких необов'язково заміщений 1, 2 або 3 групами, що в кожному випадку незалежно являють собою:

- (1) C₁-C₆-алкіл, необов'язково заміщений одним, двома або трьома замісниками, вибраними з групи, що складається з C₁-C₃-алкілу, -F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, -C≡N, -CF₃, C₁-C₃-алкокси і NR_{1-a}R_{1-b},
- (2) -OH,
- (3) -NO₂,
- (4) -F, -Cl, -Br, -I,
- (5) CO₂H,
- (6) -C≡N, і
- (7) $-(CH_2)_{0-4}-CO-NR_{n-2}R_{n-3}$,

де R_{c-x} і R_{c-y} незалежно являють собою

- H,
- C₁-C₄-алкіл, необов'язково заміщений однією або двома групами -OH,
- C₁-C₄-алкокси, необов'язково заміщений 1, 2 або 3 атомами -F,
- $-(CH_2)_{0-4}-C_3-C_8$ -циклоалкіл,
- C₂-C₆-алкеніл,
- C₂-C₆-алкініл і

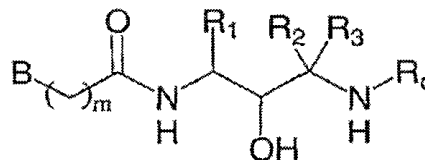
феніл,

або R_{c-x} і R_{c-y} разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, утворюють вуглецевий цикл з трьох, чотирьох, п'яти, шести або семи атомів вуглецю,

(V) $-(CR_{c-x}R_{c-y})_{0-4}-R_{c-арил}-R_{c-арил}$,

R₂₅ являє собою водень або C₁-C₆-алкіл.

2. Сполука за п. 1 формули



Z51

та її фармацевтично прийнятні солі, де

m дорівнює 0;

B означає арил, необов'язково заміщений однією або двома групами, незалежно вибраними з R₆, R'₆, R''₆, R'''₆, R і R', які незалежно являють собою -H, -(C₁-C₁₀)-алкіл, $-(CH_2)_{0-4}-R_{арил}$, або C₂-C₇-алкеніл або C₂-C₇-алкініл, кожен з яких необов'язково заміщений одним, двома або трьома замісниками, вибраними з групи, що складається з галогену, -OH, -SH, -C≡N, -CF₃, C₁-C₃-алкокси, аміногрупи, моно- або діалкіламіногрупи і C₁-C₆-алкілу, або

$-(CH_2)_{0-4}-C_3-C_7$ -циклоалкіл, необов'язково заміщений одним, двома або трьома замісниками, вибраними з групи, що складається з галогену, -OH, -SH, -C≡N, -CF₃, C₁-C₃-алкокси, аміногрупи, моно- або діалкіламіногрупи і C₁-C₆-алкілу;

бензил, у якому фенільне кільце необов'язково заміщено 1-3 групами, незалежно вибраними з галогену, -OH, -SH, -C≡N, моно- або діалкіламіногрупи, C₁-C₆-алкокси або трифторметилу;

R₆, R'₆, R''₆, R'''₆ незалежно один від одного означають -OR, -NO₂, галоген, -CO₂R, -C≡N, NRR', -SR, -SO₂R, -C(=O)R, -OCH₂, -CF₃, -CONRR', -SO₂NRR', -O-P(=O)(OR)(OR'), -N(R)(CH₂)', -N(R)(SO₂R'), $-(CH_2)_{0-4}-CO-NR_7R'_7$, $-(CH_2)_{0-4}-O-(CH_2)_{0-4}-CONRR'$, $-(CH_2)_{0-4}-CO-(C_1-C_{12}-алкіл)$, $-(CH_2)_{0-4}-CO-(C_2-C_{12}-алкеніл)$, $-(CH_2)_{0-4}-CO-(C_2-C_{12}-алкініл)$, $-(CH_2)_{0-4}-CO-(C_3-C_7-циклоалкіл)$, $-(CH_2)_{0-4}-R_{арил}$, $-(CH_2)_{0-4}-CO-R_{арил}$, $-(CH_2)_{0-4}-CO-O-R_{11}$, $-(CH_2)_{0-4}-SO_2-NR_7R'_7$, $-(CH_2)_{0-4}-SO-(C_1-C_8-алкіл)$, $-(CH_2)_{0-4}-SO_2-(C_1-C_{12}-алкіл)$, $-(CH_2)_{0-4}-SO_2-(C_3-C_7-циклоалкіл)$, $-(CH_2)_{0-4}-N(H \text{ або } R_{11})-CO-O-R_{11}$, $-(CH_2)_{0-4}-N(H \text{ або } R_{11})-CO-N(R_{11})_2$, $-(CH_2)_{0-4}-N(H \text{ або } R_{11})-CS-N(R_{11})_2$, $-(CH_2)_{0-4}-N(H \text{ або } R_{11})-CO-R_7$, $-(CH_2)_{0-4}-NR_7R'_7$, $-(CH_2)_{0-4}-O-CO-(C_1-C_6-алкіл)$, $-(CH_2)_{0-4}-O-P(O)-(O-R_{арил})_2$, $-(CH_2)_{0-4}-O-CO-N(R_{11})_2$, $-(CH_2)_{0-4}-O-CS-N(R_{11})_2$, $-(CH_2)_{0-4}-O-(R_{11})$, $-(CH_2)_{0-4}-O-(R_{11})-COOH$, $-(CH_2)_{0-4}-S-(R_{11})$, C₃-C₇-циклоалкіл, $-(CH_2)_{0-4}-N(H \text{ або } R_{11})-SO_2-R_7$ або $-(CH_2)_{0-4}-C_3-C_7-циклоалкіл$, або

C₁-C₈-алкіл, необов'язково заміщений однією, двома або трьома групами, незалежно вибраними з C₁-C₆-алкілу, -F, -Cl, -Br, -I, -OR, -NO₂, -F, -Cl, -Br, -I, -CO₂R, -C≡N, -NRR', -SR, -SO₂R, -C(=O)R, -OCF₃, -CF₃, -CONRR', SO₂NRR', -O-P(=O)(OR)(OR'), -N(R)(COR'), -N(R)(SO₂R'), $-(CH_2)_{0-4}-CO-NR_7R'_7$, $-(CH_2)_{0-4}-CO-(C_1-C_{12}-алкілу)$, $-(CH_2)_{0-4}-CO-(C_2-C_{12}-алкенілу)$, $-(CH_2)_{0-4}-CO-(C_2-C_{12}-алкінілу)$, $-(CH_2)_{0-4}-CO-(C_3-C_7-циклоалкілу)$, $-(CH_2)_{0-4}$

4-Рарилу, $-(CH_2)_{0-4}-CO-R_{арилу}$, $-(CH_2)_{0-4}-CO-O-R_{11}$, $-(CH_2)_{0-4}-SO_2-NR_7R'_7$, $-(CH_2)_{0-4}-SO-(C_1-C_8-алкілу)$, $-(CH_2)_{0-4}-SO_2-(C_1-C_{12}-алкілу)$, $-(CH_2)_{0-4}-SO_2-(C_3-C_7-циклоалкілу)$, $-(CH_2)_{0-4}-N(H \text{ або } R_{11})-CO-O-R_{11}$, $-(CH_2)_{0-4}-N(H \text{ або } R_{11})-CO-N(R_{11})_2$, $-(CH_2)_{0-4}-N(H \text{ або } R_{11})-CS-N(R_{11})_2$, $-(CH_2)_{0-4}-N(H \text{ або } R_{11})-CO-R_7$, $-(CH_2)_{0-4}-NR_7R'_7$, $-(CH_2)_{0-4}-O-CO-(C_1-C_6-алкілу)$, $-(CH_2)_{0-4}-O-P(O)-(O-R_{арилу})_2$, $-(CH_2)_{0-4}-O-CO-N(R_{11})_2$, $-(CH_2)_{0-4}-O-CS-N(R_{11})_2$, $-(CH_2)_{0-4}-O-(R_{11})$, $-(CH_2)_{0-4}-O-(R_{11})-COOH$, $-(CH_2)_{0-4}-S-(R_{11})$, $C_3-C_7-циклоалкілу$, $-(CH_2)_{0-4}-N(H \text{ або } R_{11})-SO_2-R_7$ або $-(CH_2)_{0-4}-C_3-C_7-циклоалкілу$, або

$C_2-C_7-алкеніл$ або $C_2-C_7-алкініл$, кожен з яких необов'язково містить один, два або три замісники, незалежно вибрані з галогену або $-OH$, або

$C_2-C_7-алкеніл$ або $C_2-C_7-алкініл$, кожен з яких необов'язково заміщений однією, двома або трьома групами, незалежно вибраними з галогену, $C_1-C_3-алкілу$, $-OH$, $-SH$, $-C\equiv N$, $-CF_3$, $C_1-C_3-алкокси$, аміно- і моно- або діалкіламіногрупи, або

$-(CH_2)_{0-4}-O-(C_1-C_6-алкіл)$, де алкіл необов'язково заміщений одним, двома, трьома, чотирма або п'ятьма атомами галогену,

R_7 і R'_7 є однаковими або різними і являють собою $-H$, $-C_3-C_7-циклоалкіл$, $-(C_1-C_2-алкіл)-(C_3-C_7-циклоалкіл)$, $-(C_1-C_6-алкіл)-O-(C_1-C_3-алкіл)$, $-C_2-C_6-алкеніл$, $-C_2-C_6-алкініл$, $-C_1-C_6-алкільний$ ланцюг з одним подвійним й одним потрійним зв'язком, або $-C_1-C_6-алкіл$, необов'язково заміщений $-OH$ або $-NH_2$; або

$-C_1-C_6-алкіл$, необов'язково заміщений однією, двома або трьома групами, незалежно вибраними з галогену; або

$C_1-C_6-алкіл$, необов'язково заміщений однією, двома або трьома групами, незалежно вибраними з $C_1-C_3-алкілу$, галогену, $-OH$, $-SH$, $-C\equiv N$, $-CF_3$, $C_1-C_3-алкокси$, аміно- і моно- або діалкіламіногрупи; або

$C_2-C_6-алкеніл$ або $C_2-C_6-алкініл$, кожен з яких необов'язково заміщений однією, двома або трьома групами, незалежно вибраними з $C_1-C_3-алкілу$, галогену, $-OH$, $-SH$, $-C\equiv N$, $-CF_3$, $C_1-C_3-алкокси$, аміно- і моно- або діалкіламіногрупи; або

$C_1-C_6-алкокси$, необов'язково заміщений одним, двома або трьома атомами галогену;

арил, необов'язково заміщений галогеном, аміно-, моно- або діалкіламіногрупою, $-OH$, $-C\equiv N$, $-SO_2-NH_2$, $-SO_2-NH-C_1-C_6-алкілом$, $-SO_2-N(C_1-C_6-алкіл)_2$, $SO_2-(C_1-C_4-алкілом)$, $-CO-NH_2$, $-CO-NH-C_1-C_6-алкілом$ і $-CO-N(C_1-C_6-алкіл)_2$; або

$C_1-C_6-алкіл$, необов'язково заміщений однією, двома або трьома групами, незалежно вибраними з $C_1-C_3-алкілу$, галогену, $-OH$, $-SH$, $-C\equiv N$, $-CF_3$, $C_1-C_3-алкокси$, аміно- і моно- або діалкіламіногрупи; або

$C_2-C_6-алкеніл$ або $C_2-C_6-алкініл$, кожен з яких необов'язково заміщений однією, двома або трьома групами, незалежно вибраними з $C_1-C_3-алкілу$, галогену, $-OH$, $-SH$, $-C\equiv N$, $-CF_3$, $C_1-C_3-алкокси$, аміно- і моно- або діалкіламіногрупи; або

$C_1-C_6-алкокси$, необов'язково заміщений одним, двома або трьома атомами галогену;

R_{11} означає $C_1-C_6-алкіл$, $C_2-C_6-алкеніл$, $C_2-C_6-алкініл$, $C_3-C_7-циклоалкіл$ або $-(CH_2)_{0-2}-R_{арил}$;

$R_{арил}$ означає феніл, необов'язково заміщений галогеном, аміно-, моно- або діалкіламіногрупою, -

OH , $-C\equiv N$, $-SO_2-NH_2$, $-SO_2-NH-C_1-C_6-алкілом$, $-SO_2-N(C_1-C_6-алкіл)_2$, $-SO_2-(C_1-C_4-алкілом)$, $-CO-NH_2$, $-CO-NH-C_1-C_6-алкілом$ або $-CO-N(C_1-C_6-алкіл)_2$; або $C_1-C_6-алкіл$, необов'язково заміщений однією, двома або трьома групами, незалежно вибраними з $C_1-C_3-алкілу$, галогену, $-OH$, $-SH$, $-C\equiv N$, $-CF_3$, $C_1-C_3-алкокси$, аміно- і моно- або діалкіламіногрупи; або

$C_2-C_6-алкеніл$ або $C_2-C_6-алкініл$, кожен з яких необов'язково заміщений однією, двома або трьома групами, незалежно вибраними з $C_1-C_3-алкілу$, галогену, $-OH$, $-SH$, $-C\equiv N$, $-CF_3$, $C_1-C_3-алкокси$, аміно- і моно- або діалкіламіногрупи; або

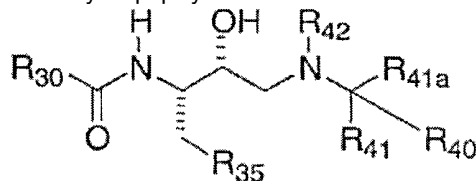
$C_1-C_6-алкокси$, необов'язково заміщений одним, двома або трьома атомами галогену;

R_2 і R_3 незалежно один від одного є $-H$ або $C_1-C_6-алкілом$; або

R_2 і R_3 разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, утворюють 3- або 4-членний цикл;

R_c являє собою феніл, необов'язково заміщений $C_1-C_3-алкілом$, $C_2-C_4-алкінілом$, трифторметилом або $C_1-C_2-алкокси$.

3. Сполука формули



або її фармацевтично прийнятна сіль, де

R_{30} вибраний з групи, що включає феніл, дигідро-нафталеноніл, дигідронафтил та тетрагідронафтил,

де кожен з перерахованих вище радикалів є незаміщеним або заміщений 1, 2, 3, 4 або 5 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з:

$C_1-C_{10}-алкілу$, необов'язково заміщеного 1 фенілом або 1 групою CN ; OH , гідроксі- $C_1-C_{10}-алкілу$, необов'язково заміщеного фенілом або $(C_1-C_4-алкіл)фенілом$, $C_1-C_6-алкокси$, необов'язково заміщеного 1 або 2 групами, що незалежно являють собою гідроксил або феніл; галогеналкілу, галогеналкокси, $(CH_2)_{0-4}C(O)NR_{31}R_{32}$, $-NR_{31}-SO_2-(C_1-C_6-алкілу)$, де алкільна група необов'язково заміщена 1, 2 або 3 групами, що незалежно являють собою галоген або R_{33} , $-SO_2-NH(C_1-C_6-алкілу)$, де алкільна група необов'язково заміщена 1 або 2 групами, що незалежно являють собою галоген, OH , алкокси або R_{33} ; $-(C_1-C_6-алкіл)-SO_2-(C_1-C_6-алкілу)$, де алкільна група необов'язково заміщена 1 або 2 групами, що незалежно являють собою галоген, OH , $C_1-C_4-алкокси$ або R_{33} ; $-SO_2-(C_1-C_6-алкілу)$, де алкільна група необов'язково заміщена 1 або 2 групами, що незалежно являють собою OH або $C_1-C_4-алкокси$; $-SO_2-N(C_1-C_6-алкіл)(C_1-C_6-алкілу)$, де кожна алкільна група необов'язково заміщена 1 або 2 групами, що незалежно являють собою галоген, OH або R_{33} ; $-SO_2-NH(C_1-C_6-алкіл)фенілу$, де феніл необов'язково заміщений 1 або 2 групами, що незалежно являють собою $C_1-C_4-алкокси$ або галоген, $-(C_1-C_6-алкіл)-O-фенілу$, $-(C_1-C_6-алкіл)-O-(C_1-C_6-алкіл)фенілу$, галогену, $-NHC(O)NH_2$, $-NHC(O)NH(C_1-C_6-алкілу)$, $-NHC(O)N(C_1-C_6-алкіл)(C_1-C_6-алкілу)$, $-N(C_1-C_6-алкіл)C(O)NH_2$, $-N(C_1-C_6-алкіл)C(O)NH(C_1-C_6-алкілу)$, $-N(C_1-C_6-$

алкіл)C(O)N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкіл), -S-(C₁-C₆-алкіл)фенілу, -SO₂NR₃₁R₃₂, C(O)-NR₃₁R₃₂, -NHC(S)NH₂, -NHC(S)NH(C₁-C₆-алкіл), -NHC(S)N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкіл), -CO₂(C₁-C₆-алкіл), фенілу, необов'язково заміщеного 1 або 2 групами, що незалежно являють собою F, Cl або Br; -C₂-C₄-алкінілфенілу, -O-C₃-C₈-циклоалкілу, -O-(C₁-C₆-алкіл)-R₃₃; -C(O)(C₁-C₁₀-алкіл), де алкільна група необов'язково заміщена NH₂, N(C₁-C₆-алкілом) або N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкілом); C(O)NH-фенілу, -C(O)N(C₁-C₆-алкіл)фенілу, -S-(C₁-C₆-алкіл), де алкільна група необов'язково заміщена 1 або 2 групами, що незалежно являють собою CN або OH; (C₁-C₆-тіоалкокси)-(C₁-C₆-алкіл), C₂-C₈-алкінілу, -(CH₂)_{0.4}-SO₂-(C₁-C₁₀-алкіл), де алкільна група необов'язково заміщена OH; -NHC(O)NH(C₃-C₈-циклоалкіл), -N(C₁-C₆-алкіл)C(O)NH(C₃-C₈-циклоалкіл), -N(C₁-C₆-алкіл)C(O)N(C₁-C₆-алкіл)(C₃-C₈-циклоалкіл), -NHC(O)N(C₁-C₆-алкіл)(C₃-C₈-циклоалкіл), -(C₁-C₆-алкокси)-(C₁-C₆-тіоалкокси); -CO₂-(C₁-C₆-алкіл), де алкільна група необов'язково заміщена фенілом; де R₃₁ і R₃₂ в кожному випадку незалежно вибрані з групи, що складається з водню, C₁-C₈-алкілу, C₂-C₈-алкенілу, гідроксі-C₁-C₆-алкілу, C₁-C₆-галогеналкілу, C₁-C₆-алкокси-C₁-C₆-алкілу, -(CH₂)_{0.4}-SO₂-(C₁-C₆-алкіл), де алкіл необов'язково заміщений 1, 2, 3 або 4 незалежно вибраними атомами галогену; -(C₁-C₆-алкіл)-C(O)NH₂, -(C₁-C₆-алкіл)-C(O)NH(C₁-C₆-алкіл), -(C₁-C₆-алкіл)-C(O)N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкіл), -(C₁-C₆-алкіл)-NH₂, -(C₁-C₆-алкіл)-NH(C₁-C₆-алкіл), -(C₁-C₆-алкіл)-N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкіл), -(C₁-C₆-алкіл)фенілу, циклопропілу, циклобутилу, циклопентилу, циклогексилу, -CO₂-(C₁-C₆-алкіл), -(C₁-C₆-тіоалкокси)-(C₁-C₆-алкіл), -C(O)-(C₁-C₆-алкіл), (C₁-C₆-алкокси), -(C₂-C₈-алкенілокси), -(C₁-C₆-алкіл)-CO₂-(C₁-C₆-алкіл); фенільні групи є незаміщеними або заміщені 1, 2, 3, 4 або 5 групами, що незалежно являють собою C₁-C₄-алкіл, гідроксильну групу, C₁-C₄-алкокси, галоген,

R₃₃ в кожному випадку незалежно являє собою H, NH₂, NH(C₁-C₆-алкіл), N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкіл), N(C₁-C₆-алкіл)феніл, N(C₁-C₆-алкіл)бензил;

R₃₅ означає феніл, C₃-C₈-циклоалкіл, -S-феніл, C₁-C₆-алкіл, кожний з яких є незаміщеним або заміщений 1, 2, 3, 4 або 5 групами, що незалежно являють собою C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-алкокси, OH, гідроксі-C₁-C₆-алкіл, галоген, галоген-C₁-C₆-алкіл, галоген-C₁-C₆-алкокси, -O-(C₁-C₆-алкіл)феніл, -CO₂-(C₁-C₆-алкіл), -(C₁-C₄-алкіл)-(C₅-C₆-циклоалкіл) або (CH₂)_{0.4}CN;

R₄₀ означає феніл, біфеніл, -(C₁-C₄-алкіл)-O-C(O)NH-феніл, де феніл необов'язково заміщений 1, 2 або 3 атомами галогену; -(C₁-C₄-алкіл)OC(O)N(C₁-C₆-алкіл)феніл, -(C₁-C₆-алкіл)феніл, -(C₁-C₄-алкіл)-SO₂NH₂, -(C₁-C₄-алкіл)-SO₂NH(C₁-C₆-алкіл), -(C₁-C₄-алкіл)-SO₂N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкіл), -SO₂NH₂, -SO₂NH(C₁-C₆-алкіл), -SO₂N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкіл), CN, -(CH₂)_{0.4}-(C₃-C₈-циклоалкіл), -(C₁-C₄-алкіл)C(O)O-(C₁-C₄-алкіл), -(C₁-C₄-алкіл)-R₃₃, C₁-C₁₀-алкіл, C₂-C₈-алкеніл, -(C₁-C₄-алкіл)-NHC(O)-(C₁-C₄-алкіл), -(CH₂)_{0.4}-C(O)NH₂, (CH₂)_{0.4}-C(O)NH(C₁-C₆-алкіл), -(CH₂)_{0.4}-C(O)N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкіл), нафтил, тетрагідронафтил, дигідронафтил, алкоксіалкіл, -фенілциклогексил, -

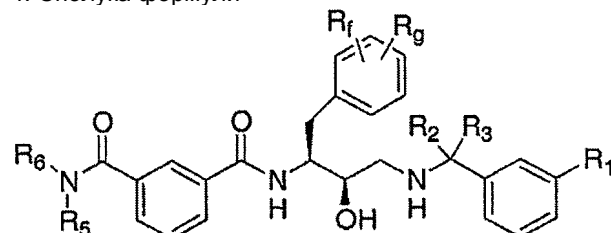
фенілциклопентил, -феніл-(C₁-C₆-алкіл)циклопентил, -феніл-(C₁-C₆-алкіл)циклогексил, 7-оксабіцикло[2.2.1]гептил; фенілбіцикло[2.2.1]гептил, біцикло[2.2.1]гептил, -феніл-C(O)феніл, -феніл-O-феніл, -феніл-O-бензил;

де кожна з перерахованих вище груп є незаміщеною або заміщена 1, 2, 3, 4 або 5 замісниками, що незалежно являють собою галоген, C₁-C₈-алкіл, необов'язково заміщений 1 або 2 групами, що незалежно являють собою CN або OH; C₁-C₆-алкокси, галоген-(C₁-C₈-алкіл), галоген-(C₁-C₄-алкокси), -O-(C₁-C₄-алкіл)феніл, де феніл необов'язково заміщений 1 або 2 атомами галогену, CN, -CHO, C₁-C₄-тіоалкокси, -NHCO₂-(C₁-C₆-алкіл), -N(C₁-C₄-алкіл)SO₂-(C₁-C₄-алкіл), де алкільні групи необов'язково заміщені 1, 2 або 3 атомами галогену; OH; -SO₂R₃₃; R₃₃; C₂-C₈-алкініл; C₂-C₈-алкеніл; тіоалкоксіалкіл; -SO₂-(C₁-C₁₀-алкіл); -NR₃₁R₃₂; -C(O)-NR₃₁R₃₂; -OC(O)R₃₃; C₁-C₈-алканойл; -(C₁-C₆-алкіл)-C(O)-(C₁-C₆-алкокси), -C(O)-(C₁-C₆-алкокси); -O-(C₁-C₆-алкіл)-C(O)NR₃₁R₃₂; -CO₂-(C₁-C₆-алкіл);

R_{41a} і R₄₁ незалежно являють собою H, циклогексил, феніл або C₁-C₆-алкіл, необов'язково заміщений 1 або 2 групами, що незалежно являють собою феніл, гідроксил, C₁-C₄-тіоалкокси, C₁-C₄-тіоалкокси-C₁-C₆-алкіл або -C₁-C₆-алкіл-SO₂-C₁-C₆-алкіл;

R₄₀, R₄₁ і атом, до якого вони приєднані, утворюють циклоалкільне кільце C₃-C₈, необов'язково заміщене C₁-C₄-алкілом, C₁-C₄-алкокси, галогеном, -CO₂NH₂, CO₂NH(C₁-C₆-алкілом) або -CO₂N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкілом); або феніл, необов'язково заміщений 1, 2 або 3 групами, що незалежно являють собою галоген або C₁-C₆-алкіл; і R₄₂ означає H.

4. Сполука формули



або її фармацевтично прийнятна сіль, де

R₁ означає C₂-C₃-алкіл;

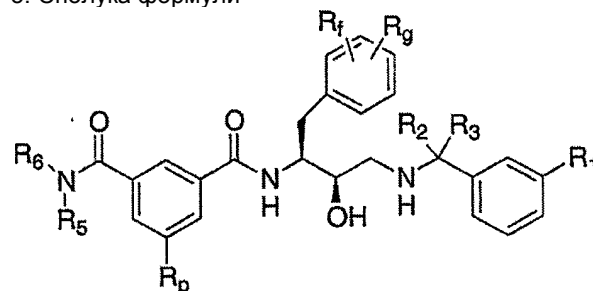
R₂ і R₃ обидва є воднем; або

R_f і R_g незалежно являють собою галоген;

R₅ означає C₂-C₃-алкілсульфоніл;

R₆ являє собою гідроксіетил або метоксіетил.

5. Сполука формули

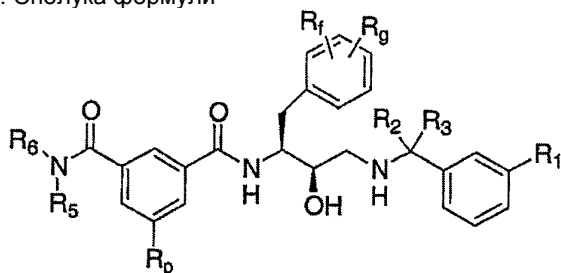


або її фармацевтично прийнятна сіль, де

R₁ означає C₂-C₃-алкіл, CF₃ або -NH(C₃-C₆-циклоалкіл);

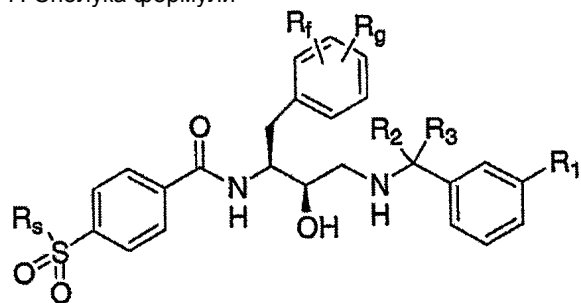
R_2 і R_3 обидва є воднем; або
 R_2 і R_3 разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, утворюють 3-членний цикл;
 R_p означає аміногрупу, аміно-(C₁-C₅)алкіл, моно-(C₁-C₂)алкіламіно-(C₁-C₅)алкіл, ді-(C₁-C₂)алкіламіно-(C₁-C₅)алкіл, моно-(C₁-C₃)алкіламіногрупу, ді-(C₁-C₃)алкіламіногрупу, аміно-(C₃-C₄)алкініл, моно-(C₁-C₂)алкіламіно-(C₃-C₄)алкініл, ді-(C₁-C₂)-алкіламіно-(C₃-C₅)алкініл, -N(C₁-C₂-алкіл)-SO₂(C₁-C₂-алкіл), -NH-SO₂(C₁-C₂-алкіл), -N(C₁-C₂-алкіл)-SO₂(C₁-C₂-галогеналкіл), ді-(C₁-C₂)алкіламіно-(C₃-C₄)алкініл або C₂-C₄-алкініл;
 R_f і R_g незалежно являють собою галоген;
 R_5 і R_6 незалежно означають C₃-C₄-алкіл.

6. Сполука формули



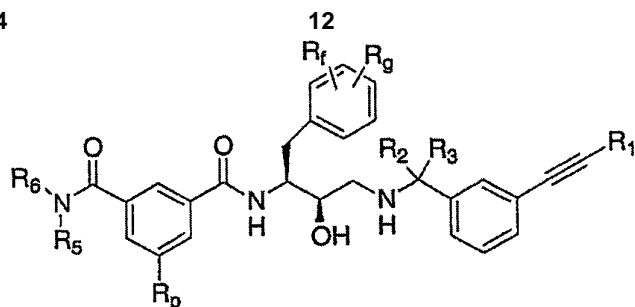
або її фармацевтично прийнятна сіль, де
 R_1 означає C₂-C₃-алкініл;
 R_2 і R_3 обидва є воднем;
 R_p являє собою C₁-C₃-алкіл;
 R_f і R_g незалежно являють собою галоген;
 R_5 і R_6 незалежно означають C₃-C₄-алкіл; або
один із замісників R_5 і R_6 є метилом, а інший являє собою C₃- або C₄-алкіл.

7. Сполука формули

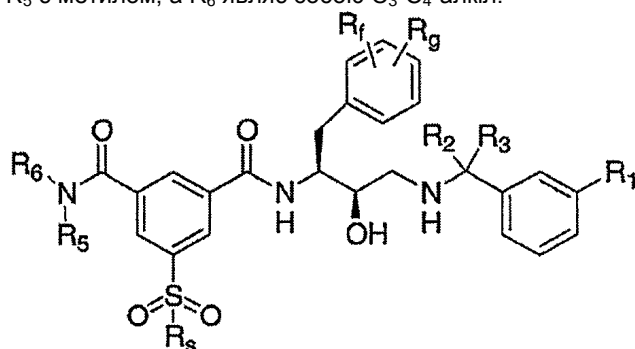


або її фармацевтично прийнятна сіль, де
 R_s являє собою NR_{s31}R_{s41}, де
 R_{s31} є C₁-C₂-алкілом; а
 R_{s41} означає C₁-C₆-алкіл, аліл, ціано-(C₁-C₃)алкіл, (C₄-C₇)циклоалкіл, феніл, феніл-(C₁-C₃)алкіл, аміно-(C₁-C₃)алкіл, моно-(C₁-C₃)алкіламіно-(C₁-C₂)алкіл або ді-(C₁-C₃)алкіламіно-(C₁-C₂)алкіл; або
 R_s являє собою CH₃, -N(C₁-C₂-алкіл)феніл або -N(C₂-C₃-алкіл)(C₃-C₄-алкіл);
 R_1 означає C₂-C₃-алкіл;
 R_2 і R_3 обидва є воднем; а
 R_f і R_g незалежно являють собою галоген.

8. Сполука формули



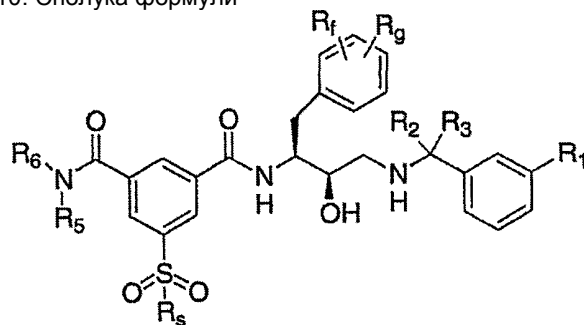
або її фармацевтично прийнятна сіль, де
 R_1 означає водень або метил;
 R_2 і R_3 обидва є воднем; або
 R_2 і R_3 разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, утворюють 3-членний цикл;
 R_p є C₂-C₃-алкінілом або C₁-C₃-алкілом;
 R_f і R_g незалежно являють собою галоген;
 R_5 і R_6 незалежно означають C₃-C₄-алкіл; або
 R_5 є метилом, а R_6 являє собою C₃-C₄-алкіл.



9. Сполука формули

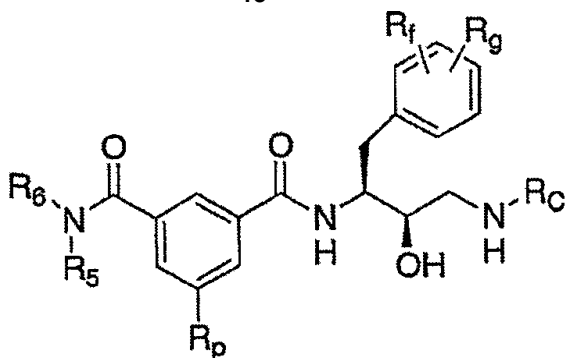
де
 R_1 означає C₂-C₃-алкіл;
 R_2 і R_3 обидва є метилом, або
 R_2 , R_3 і атом вуглецю, до якого вони приєднані, утворюють циклопропільне кільце;
 R_f і R_g незалежно являють собою галоген;
 R_5 і R_6 незалежно означають C₃-C₄-алкіл; і
 R_s являє собою -NH(C₁-C₄-гідроксіалкіл).

10. Сполука формули



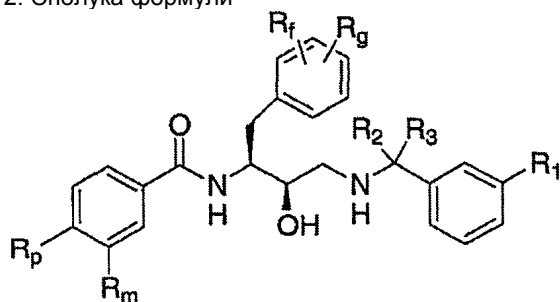
де
 R_1 означає C₂-C₃-алкініл;
 R_2 і R_3 обидва є воднем; або
 R_f і R_g незалежно являють собою галоген;
 R_5 і R_6 незалежно означають C₃-C₄-алкіл; і
 R_s являє собою -NH(C₂-C₄-гідроксіалкіл).

11. Сполука формули



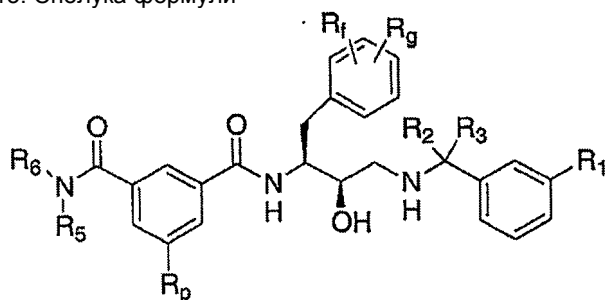
де
 R_c означає C_4 - C_5 -алкіл; циклопропіл; тетрагідро-
 нафтиленіл;
 $-CH(C_2$ -алкіл- $S-(C_1$ -
 $C_2)$ алкіл) $C(O)NH(C_4$ -алкіл) або $-CH(C_2$ -алкіл- SO_2 -
 $(C_1$ - $C_2)$ алкіл) $C(O)NH(C_4$ -алкіл);
 R_f і R_g незалежно являють собою галоген;
 R_p означає $-NHSO_2CF_3$, $-SO_2NH(C_3$ - C_4 -
 гідроксіалкіл), $-NHSO_2CH_3$; а
 R_5 і R_6 незалежно означають C_3 - C_4 -алкіл.

12. Сполука формули



де
 R_1 означає C_2 - C_3 -алкіл або галоген;
 R_2 і R_3 обидва є воднем;
 R_f і R_g незалежно являють собою галоген; і
 R_m означає $-NH-SO_2CF_3$, $-N(CH_3)SO_2CH_3$, $-N(C_3$ - C_4 -
 гідроксіалкіл) $SO_2(C_1$ - C_2 -алкіл), а R_p є H ; або
 R_m означає H , а R_p є $-NH-SO_2CF_3$, $-CH_2SO_2(C_1$ - C_2 -
 алкілом).

13. Сполука формули



де
 R_1 означає C_2 - C_5 -алкіл, C_3 - C_6 -ціаноалкіл, C_3 - C_6 -
 алкеніл, $-NHSO_2(C_1$ - C_2 -алкіл), C_4 - C_5 -галогеналкіл, $-$
 C_3 -алкіл- CO_2 -(C_1 - C_2 -алкіл), CN , $-N(C_1$ - C_2 -
 алкіл) $SO_2(C_1$ - C_2 -алкіл), $-SO_2(C_1$ - C_2 -алкіл), $-NH-(C_3$ -
 C_6 -циклоалкіл), $-OC(O)N(C_1$ - C_2 -алкіл)(C_1 - C_2 -алкіл);
 R_2 і R_3 обидва є воднем;
 R_f і R_g незалежно являють собою галоген;
 R_p є C_1 - C_2 -алкілом;
 R_5 і R_6 незалежно означають C_3 - C_5 -алкіл, C_1 - C_2 -
 алкокси- C_1 - C_2 ,3-алкіл, або
 R_5 є H , а R_6 являє собою $C_{4,5}$ - C_6 -алкіл або (C_1 - C_2 -
 алкокси)-(C_2 - C_3 -алкіл);

R_5 є етилом, а R_6 являє собою C_2 - C_3 -гідроксіалкіл
 або $-(C_1$ - C_2 -алкіл)- $N(C_1$ - C_2 -алкіл)(C_1 - C_2 -алкіл); або
 R_5 є CH_3 , а R_6 являє собою C_4 - C_5 -алкіл, циклогекс-
 сил, $-(C_1$ - C_2 -алкіл)феніл, або

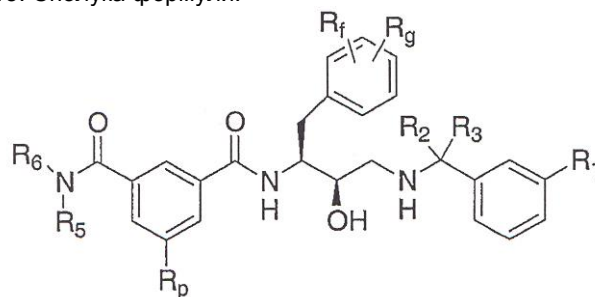
R_5 є метилом або етилом, а R_6 являє собою (C_1 -
 C_2 -алкокси)-(C_2 - C_3 -алкіл).

14. Сполука за п. 13, де

R_1 означає циклопентил, циклогексил, пропеніл,
 аліл або (C_3 - C_6 -алкіл)- CN , C_2 - C_5 -алкіл, 4-
 хлорбутил, метил-2-метилпропаноат, гекс-5-еніл,
 CN , $-N(CH_3)SO_2CH_3$, $-SO_2CH_2CH_3$, $-NH$ -
 циклопропіл, $NHSO_2CH_3$; а

R_p є метилом.

15. Сполука формули:



де

R_1 означає C_2 - C_3 -алкіл, галоген, $-NH$ (циклопропіл);
 R_f і R_g незалежно являють собою галоген;

R_p означає C_1 - C_2 -алкіл або C_2 - C_3 -алкініл;

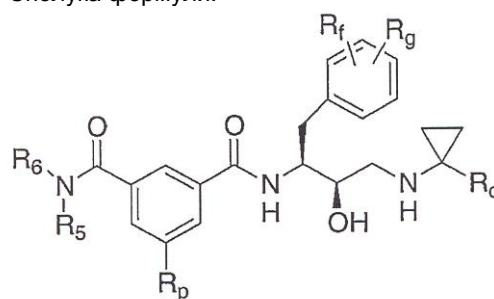
R_2 , R_3 і атом вуглецю, до якого вони приєднані,
 утворюють циклопропільне кільце; або

R_2 і R_3 обидва є метилом;

R_5 і R_6 незалежно означають C_3 - C_4 -алкіл; або

R_5 є метилом, а R_6 являє собою C_3 - C_5 -алкіл.

16. Сполука формули:



де

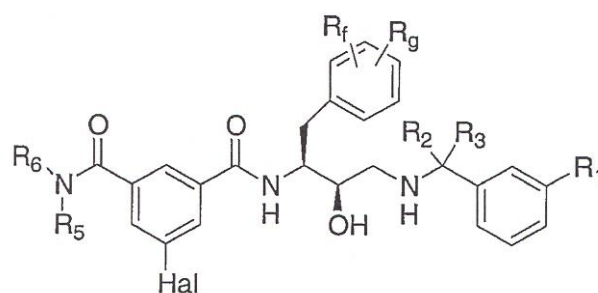
R_c означає $-C_1$ - C_3 -алкіл- $C(O)NH(C_1$ - C_3 -алкіл);

R_f і R_g незалежно являють собою галоген;

R_p означає C_1 - C_2 -алкіл або C_2 - C_4 -алкініл;

R_5 і R_6 незалежно означають C_3 - C_4 -алкіл.

17. Сполука формули:



де

Hal означає галоген;

R_1 є C_1 - C_2 -алкілом або галогеном;

R₂ і R₃ обидва є воднем;
 R_f і R_g незалежно являють собою галоген;
 R₅ і R₆ незалежно означають C₃-C₄-алкіл.
 18. Сполука, що являє собою:
 N-[1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(1-ізобутилкарбамоїл)-3-метилсульфанілпропіламіно]пропіл]-5-метил-N',N'-дипропілізофталамід;
 N⁴-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етилфеніл)циклопропіл]-аміно]-2-гідроксипропіл)-6-метил-N²-N²-дипропілпіридин-2,4-дикарбоксамід;
 N¹-бутил-N³-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N¹-метил-5-(1,3-тіазол-2-іл)ізофталамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N³-метил-N³-пропіл-5-(1,3-тіазол-2-іл)ізофталамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N³-метил-5-(1,3-оксазол-2-іл)-N³-пропілізофталамід;
 N¹-бутил-N³-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N¹-метил-5-(1,3-оксазол-2-іл)ізофталамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N³-етил-5-(1,3-оксазол-2-іл)-N³-пропілізофталамід;
 N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(1-етилкарбамоїлетиламіно)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N',N'-дипропілізофталамід;
 N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-N'-диметилкарбамоїлметил-5,N'-диметилізофталамід;
 N-[1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(1-метилкарбамоїл)-3-метилсульфанілпропіламіно]пропіл]-5-метил-N',N'-дипропілізофталамід;
 N-[3-(1-бензилкарбамоїлетиламіно)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N',N'-дипропілізофталамід;
 N-[[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропілкарбамоїл]-метил]-3-трифторметилбензамід;
 N-[[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропілкарбамоїл]-метил]-4-трифторметилбензамід;
 3,4-дихлор-N-[[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропілкарбамоїл]-метил]-бензамід;
 N-[3-(1-карбамоїл-3-метилбутиламіно)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N',N'-дипропілізофталамід;
 N-[[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропілкарбамоїл]-метил]-4-метоксибензамід;
 N-[[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропілкарбамоїл]-метил]-2,6-дифторбензамід;
 N-[3-(1-карбамоїлетиламіно)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N',N'-дипропілізофталамід;
 N-[[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропілкарбамоїл]-метил]-2,6-диметоксибензамід;
 2-[[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропілкарбамоїл]-метилсульфаніл]-N-(4-оксазол-5-ілфеніл)-ацетамід;

2-[[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропілкарбамоїл]-метилсульфаніл]-N-(5-метилізоксазол-3-іл)-ацетамід;
 N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-4-метансульфонілбензолсульфамід;
 2-ціано-N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-бензолсульфамід;
 2-хлор-N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-4-трифторметоксибензолсульфамід;
 2-хлор-N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-6-метилбензолсульфамід;
 5-хлор-N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-2-метоксибензолсульфамід;
 2-хлор-4-ціано-N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-бензолсульфамід;
 N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-2-трифторметилбензолсульфамід;
 4-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропілсульфаміоїл]-бензойна кислота;
 6-хлорпіридин-3-сульфонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-2,5-біс-(2,2,2-трифторетокси)-бензолсульфамід;
 піридин-3-сульфонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 N-(2-хлор-4-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропілсульфаміоїл]-феніл)-ацетамід;
 N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-2-трифторметоксибензолсульфамід;
 N-[5-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропілсульфаміоїл]-тіофен-2-ілметил]-бензамід;
 5-хлор-3-метилбензо[b]тіофен-2-сульфонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 N-[5-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропілсульфаміоїл]-4-метилтіазол-2-іл]-ацетамід;
 4-хлор-N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-бензолсульфамід;
 3-хлор-N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-бензолсульфамід;
 N-[1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(3-метоксибензиламіно)-пропіл]-2-трифторметилбензолсульфамід;
 6-хлорпіридин-3-сульфонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(3-метоксибензиламіно)-пропіл]-амід;
 піридин-3-сульфонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(3-метоксибензиламіно)-пропіл]-амід;
 N-[1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(3-метоксибензиламіно)-пропіл]-2-

метансульфонілбензолсульфамід;
 3,5-дихлор-N-[1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(3-метоксибензиламіно)-пропіл]-бензолсульфамід;
 1,2-диметил-1Н-імідазол-4-сульфонової кислоти
 [1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(3-метоксибензиламіно)-пропіл]-амід;
 N-[1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(3-метоксибензиламіно)-пропіл]-3,4-диметоксибензолсульфамід;
 2-(2,2,2-трифторацетил)-1,2,3,4-тетрагідроізохінолін-7-сульфонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(3-метоксибензиламіно)-пропіл]-амід;
 5-хлор-3-метилбензо[b]тіофен-2-сульфонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(3-метоксибензиламіно)-пропіл]-амід;
 3-[4-[1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(3-метоксибензиламіно)-пропілсульфаміон]-феніл]-пропіонової кислоти метиловий ефір;
 3-хлор-N-[1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(3-метоксибензиламіно)-пропіл]-бензолсульфамід;
 3-ціано-N-[1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(3-метоксибензиламіно)-пропіл]-бензолсульфамід;
 бутан-1-сульфонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(3-метоксибензиламіно)-пропіл]-амід;
 N-{1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(1-метансульфонілпіперидин-4-ілметил)-аміно]-пропіл}-5-метил-N',N'-дипропілізофталамід;
 N-[3-бензолсульфоніламіно-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N',N'-дипропілізофталамід;
 N-[1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(3-метоксибензиламіно)-пропіл]-5-метил-N',N'-дипропілізофталамід;
 4-(3,5-дифторфеніл)-3-(2,5-диметил-4-нітро-2Н-піразол-3-іламіно)-1-(3-метоксибензиламіно)-бутан-2-ол;
 3-(2-аміно-7Н-пурин-6-іламіно)-4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метоксибензиламіно)-бутан-2-ол;
 3-(4-хлорпіримідин-2-іламіно)-4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метоксибензиламіно)-бутан-2-ол;
 3-(2-аміно-6-метилпіримідин-4-іламіно)-4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метоксибензиламіно)-бутан-2-ол;
 3-(2-хлор-6-метилпіримідин-4-іламіно)-4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метоксибензиламіно)-бутан-2-ол;
 3-(2-аміно-6-хлорпіримідин-4-іламіно)-4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метоксибензиламіно)-бутан-2-ол;
 4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метоксибензиламіно)-3-(1-феніл-1Н-тетразол-5-іламіно)-бутан-2-ол;
 3-(2-хлор-7Н-пурин-6-іламіно)-4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метоксибензиламіно)-бутан-2-ол;
 4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метоксибензиламіно)-3-[9-(тетрагідропіран-2-іл)-9Н-пурин-6-іламіно]-бутан-2-ол;
 3-[1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(3-метоксибензиламіно)-пропіламіно]-піразин-2-кабонітрил;
 4-(3,5-дифторфеніл)-3-(4,6-диметокси-[1,3,5]тріазин-2-іламіно)-1-(3-

метоксибензиламіно)-бутан-2-ол;
 2-[1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(3-метоксибензиламіно)-пропіламіно]-нікотинонітрил;
 4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метоксибензиламіно)-3-(7Н-пурин-6-іламіно)-бутан-2-ол;
 3-(бензотіазол-2-іламіно)-4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метоксибензиламіно)-бутан-2-ол;
 4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метоксибензиламіно)-3-(2-фенілхінолін-4-іламіно)-бутан-2-ол;
 6-[1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(3-метоксибензиламіно)-пропіламіно]-нікотинонітрил;
 2-[1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(3-метоксибензиламіно)-пропіламіно]-нікотинової кислоти етиловий ефір;
 4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метоксибензиламіно)-3-(3-метил-5-нітро-3Н-імідазол-4-іламіно)-бутан-2-ол;
 3-(бензоксазол-2-іламіно)-4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метоксибензиламіно)-бутан-2-ол;
 4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метоксибензиламіно)-3-(хінолін-4-іламіно)-бутан-2-ол;
 4-(3,5-дифторфеніл)-3-(5-етилпіримідин-2-іламіно)-1-(3-метоксибензиламіно)-бутан-2-ол;
 4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метоксибензиламіно)-3-(4-трифторметилпіримідин-2-іламіно)-бутан-2-ол;
 3-(6-хлор-2-метилсульфаніл-5-фенілпіримідин-4-іламіно)-4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метоксибензиламіно)-бутан-2-ол;
 3-(3-хлорхіноксалін-2-іламіно)-4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метоксибензиламіно)-бутан-2-ол;
 4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метоксибензиламіно)-3-(8-трифторметилхінолін-4-іламіно)-бутан-2-ол;
 3-(6-хлор-2,5-дифенілпіримідин-4-іламіно)-4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метоксибензиламіно)-бутан-2-ол;
 3-(3-хлорпіразин-2-іламіно)-4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метоксибензиламіно)-бутан-2-ол;
 4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метоксибензиламіно)-3-(5-трифторметилпіридин-2-іламіно)-бутан-2-ол;
 4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метоксибензиламіно)-3-(хінолін-2-іламіно)-бутан-2-ол;
 3-(6-хлорпіразин-2-іламіно)-4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метоксибензиламіно)-бутан-2-ол;
 4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метоксибензиламіно)-3-(3-нітропіридин-2-іламіно)-бутан-2-ол;
 4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метоксибензиламіно)-3-(піримідин-2-іламіно)-бутан-2-ол;
 4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метоксибензиламіно)-3-(2-фенілхіназолін-4-іламіно)-бутан-2-ол;
 N-[3-(N'-ацетил-N-етилгідразино)-1-бензил-2-гідроксипропіл]-3-гідрокси-4-(піролідин-1-карбоніл)-бензамід;
 3-(4,6-діаміно-[1,3,5]тріазин-2-іламіно)-4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метоксибензиламіно)-бутан-2-ол;
 5-ацетиламіно-N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-2-гідроксибензамід;
 2-(2,5-диметилпірол-1-іл)-тіофен-3-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 N-{1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[3-(3-гідроксиметилпіперидин-1-карбоніл)-феніламіно]-пропіл}-5-метил-N',N'-дипропілізофталамід;
 4-феніл-[1,2,3]тіадіазол-5-карбонової кислоти [1-

(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 N-[3-(3-циклогексил-1-фенілпропіламіно)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N',N'-дипропілізофталамід;
 2-метансульфоніламінооксазол-4-карбонової кислоти {1-бензил-3-[N-етил-N'-(3-етилбензоїл)-гідразино]-2-гідроксипропіл]-амід;
 N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-2-(2,6-диметилфеноксипропіонамід;
 2-метансульфоніламінооксазол-4-карбонової кислоти {1-бензил-3-[N-етил-N'-(4-метилпентаноїл)-гідразино]-2-гідроксипропіл]-амід;
 4-ацетиламіно-1-метил-1H-пірол-2-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 2-етил-5-тіофен-2-іл-2H-піразол-3-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 2-метансульфоніламінооксазол-4-карбонової кислоти [3-(N'-ацетил-N-етилгідразино)-1-бензил-2-гідроксипропіл]-амід;
 2-метансульфоніламінооксазол-4-карбонової кислоти [3-(N'-бензоїл-N-етилгідразино)-1-бензил-2-гідроксипропіл]-амід;
 6-метил-4-оксо-1-феніл-1,4-дигідропіридазин-3-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 2-метансульфоніламінотіазол-4-карбонової кислоти {1-бензил-3-[N-етил-N'-(3-етилбензоїл)-гідразино]-2-гідроксипропіл]-амід;
 4-метил-2-фенілоксазол-5-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 2-метансульфоніламінотіазол-4-карбонової кислоти [3-(N'-ацетил-N-етилгідразино)-1-бензил-2-гідроксипропіл]-амід;
 N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-2-піридин-3-ілбензамід;
 2-л-толїлтіазол-4-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 N-{1-бензил-3-[N-етил-N'-(3-етилбензоїл)-гідразино]-2-гідроксипропіл]-2-[4-(2-оксопіролідін-1-іл)-феніл]-ацетамід;
 2-феноксиметилтіазол-4-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 N-{1-бензил-3-[N-етил-N'-(4-метилпентаноїл)-гідразино]-2-гідроксипропіл]-2-[4-(2-оксопіролідін-1-іл)-феніл]-ацетамід;
 [1,2,5]тіадіазол-3-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 N-[3-(N'-ацетил-N-етилгідразино)-1-бензил-2-гідроксипропіл]-2-[4-(2-оксопіролідін-1-іл)-феніл]-ацетамід;
 2-л-толїлтіазол-4-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 N-[3-(N'-бензоїл-N-етилгідразино)-1-бензил-2-гідроксипропіл]-2-[4-(2-оксопіролідін-1-іл)-феніл]-ацетамід;
 2-(2-хлорфеніл)-тіазол-4-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-

гідроксипропіл]-амід;
 N-{1-бензил-3-[N-етил-N'-(3-етилбензоїл)-гідразино]-2-гідроксипропіл]-3-гідрокси-4-(піролідін-1-карбоніл)-бензамід;
 N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-3-феніл-2-тетразол-1-ілпропіонамід;
 N-{1-бензил-3-[N-етил-N'-(4-метилпентаноїл)-гідразино]-2-гідроксипропіл]-3-гідрокси-4-(піролідін-1-карбоніл)-бензамід;
 4-хлор-7,7-диметил-7,8-дигідро-5H-пірано[4,3-b]піридин-2-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 2-пропілтетрагідропіран-4-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 5-л-толїл-3,4-дигідро-2H-піразол-3-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 2-ацетиламіно-5-хлортіофен-3-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 4-(4-метоксифеніл)-тіофен-2-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-N'-(2-фтор-5-метансульфонілфеніл)-сукцинамід;
 1-(4-фторфеніл)-5-метил-1H-[1,2,4]тріазол-3-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 N-(2-ацетилтіофен-3-іл)-N'-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-сукцинамід;
 6-хлор-4-трифторметилпіридин-2-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-2-(5,7-диметил-[1,2,4]тріазоло[1,5-a]піримідин-2-іл)-ацетамід;
 N-(1-циклопропілетил)-N'-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-N-фенілсукцинамід;
 N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-2-(3,4-диметоксифенілсульфаніл)-ацетамід;
 1-метил-5-оксо-2-піридин-3-ілпіролідін-3-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 4-метокситіофен-3-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 2,5-диметил-1-піридин-4-ілметил-1H-пірол-3-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 2-метил-5-тіофен-2-ілфуран-3-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 4-(4-бензил-[1,4]діазепан-1-іл)-N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-4-оксобоутирамід;
 2-(бензо[1,2,5]тіадіазол-4-ілокси)-N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-ацетамід;
 3-хлор-5-фенілізотіазол-4-карбонової кислоти [1-

(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-5-фенілетинілінікотинамід;
 4,7-диметоксибензофуран-5-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-3-морфолін-4-ілметилбензамід;
 2,2-диметил-4-оксохроман-6-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 [1,6]нафтиридин-2-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 8-ціано-4-гідроксигіолін-3-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 2-піридин-3-ілтiazол-4-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 5-хлорбензофуран-2-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 4-добензофуран-2-іл-N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-4-оксобутирамід;
 N-[[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропілкарбамоїл]-метил]-нікотинамід;
 4-трет-бутил-N-[[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропілкарбамоїл]-метил]-бензамід;
 4-хлор-N-[[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропілкарбамоїл]-метил]-бензамід;
 4-хлор-6-метилхінолін-2-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-2-(2,4-дигідрокситіазол-5-іл)-ацетамід;
 2-метилпіримідин-5-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-4-піперидин-1-ілбензамід;
 4-ацетиламіно-N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-бензамід;
 N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-4-метоксибензамід;
 4-метилоксазол-5-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 1H-індол-5-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 6-хлор-1H-індол-2-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 2-(4-хлор-2-оксобензотіазол-3-іл)-N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-ацетамід;
 тіофен-3-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 2-метилоксазол-4-карбонової кислоти [1-(3,5-

дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-2-(1-оксипіридин-3-іл)-ацетамід;
 N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-2-гідрокси-2-феніл-2-тіофен-2-ілацетамід;
 6-гідрокси-2-метилсульфаніліпіримідин-4-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 2,5-диметилфуран-3-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-нікотинамід;
 N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-4-(3-метоксифеніл)-4-оксобутирамід;
 4-ацетил-N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-бензамід;
 N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-4-гідрокси-3,5-диметоксибензамід;
 фуран-2-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-2-(1,3-диметил-2,6-діоксо-1,2,3,6-тетрагідропурин-7-іл)-ацетамід;
 4-ацетиламіно-N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-2,6-диметилбензамід;
 N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-2-тіофен-2-ілацетамід;
 N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-4-оксо-4-фенілбутирамід;
 1H-індол-3-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-3-(1,3-діоксо-1,3-дигідроізоіндол-2-іл)-пропіонамід;
 3-бензо[1,3]діоксол-5-іл-N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-пропіонамід;
 N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-4-морфолін-4-іл-4-оксобутирамід;
 [2,3]бітіофеніл-5-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 5-метокситіофен-2-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 4-фенілтіофен-2-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 2-(5-бензо[1,3]діоксол-5-ілтетразол-2-іл)-N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-ацетамід;
 2-(бензотіазол-2-ілметокси)-N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-ацетамід;
 піролідин-1,2-дикарбонової кислоти 1-[[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід] 2-феніламід;
 N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-3-(6-етокси-1H-бензоімідазол-2-іл)-

пропіонамід;
 N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-2-(3-метил-2-оксо-2,3-дигідробензоімідазол-1-іл)-ацетамід;
 2-оксо-2,3-дигідробензоксазол-6-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 тієно[3,2-с]піридин-2-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 1-метил-1H-індол-3-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 бензо[b]тіофен-3-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 4-окси-3-пропілпіразин-2-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 1,1,3-триоксо-2,3-дигідро-1H-116-бензо[d]ізотіазол-6-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-2-(7-гідрокси-5-метил-[1,2,4]триазоло[1,5-a]піримідин-2-ілсульфаніл)-ацетамід;
 2-гідрокси-6-метилхінолін-4-карбонової кислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-амід;
 N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-2-(2-метил-2,3-дигідробензофуран-5-іл)-пропіонамід;
 3-(бензоксазол-2-ілсульфаніл)-N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-пропіонамід;
 N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-2-(5-о-толїлтетразол-2-іл)-ацетамід;
 2-хлор-N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-4-тетразол-1-ілбензамід;
 N-(4-трет-бутилтіазол-2-іл)-N'-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-сукцинамід;
 N-(5-циклопропіл-[1,3,4]тіадіазол-2-іл)-N'-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-сукцинамід;
 2-(3-хлорфенокси)-N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-пропіонамід;
 N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-3-(піридин-4-ілметилсульфаніл)-бензамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-[(2-гідроксietил)аміно]сульфоніл]-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(2-ізобутил-1,3-тіазол-5-іл)метил]аміно]пропіл]-5-етиніл-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-ізопропілбензил)аміно]пропіл]-5-етиніл-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-ізопропілбензил)аміно]пропіл]-5-(1,3-оксазол-2-іл)-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-[(диметиламіно)сульфоніл]-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-(1,3-оксазол-2-іл)-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-формілтїєн-2-іл)бензил]аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 5-бром-N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-йодбензил)аміно]пропіл]-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-[(1R)-2-гідрокси-1-метилетил]аміно]сульфоніл]-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-ізобутилбензил)аміно]пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-трифторметил)бензил]аміно]пропіл]-5-етиніл-

етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-[(2-гідрокси-1,1-диметилетил)аміно]сульфоніл]-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-(4-метил-1,3-оксазол-2-іл)-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(2-ізобутил-1,3-тіазол-5-іл)метил]аміно]пропіл]-5-(1,3-оксазол-2-іл)-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-[(3-гідроксипропіл)аміно]сульфоніл]-N³,N³-дипропілізофталамід;
 метил-[3-[(2R,3S)-4-(3,5-дифторфеніл)-3-[(3-дипропіламіно)карбоніл]-5-метилбензоїл]аміно)-2-гідроксибутил]аміно]метилфеніл]метилкарбамат;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(4R)-2,2-діоксидо-3,4-дигідро-1H-2,1-бензотіазин-4-іл]аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил-N,N-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(4S)-2,2-діоксидо-3,4-дигідро-1H-2,1-бензотіазин-4-іл]аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил-N,N-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3,3-диметил-N²,N²-дипропілциклопропан-1,2-дикарбоксамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N²-(2,2-диметилпропаноїл)-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]-D-аланінамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N³,N³-дипропіл-5-піримідин-2-ілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-пропілбензил)аміно]пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етинілбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-етиніл-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-ізобутилїзоксазол-5-іл)метил]аміно]пропіл]-5-етиніл-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-[(диметиламіно)сульфоніл]-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-(1,3-оксазол-2-іл)-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-5-формілтїєн-2-іл)бензил]аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 5-бром-N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-йодбензил)аміно]пропіл]-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-[(1R)-2-гідрокси-1-метилетил]аміно]сульфоніл]-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-ізобутилбензил)аміно]пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-трифторметил)бензил]аміно]пропіл]-5-етиніл-

дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N³,N³-дипропілізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-[(1Z)-проп-1-еніл]бензил)аміно]пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N³,N³-дипропіл-5-(1H-піразол-4-іл)ізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(1-(3-етилфеніл)-1-метилетил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-етиніл-N³,N³-дипропілізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-3-[(3-алілбензил)аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(1-(3-етилфеніл)циклопропіл)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(1-(3-етилфеніл)-1-метилетил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-(1,3-оксазол-2-іл)-N³,N³-дипропілізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N³-етил-5-метил-N³-пропілізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-3-[(3-(циклопропіламіно)бензил)аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(1-(3-етинілфеніл)циклопропіл)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-етиніл-N³,N³-дипропілізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-[(1-(3-ізобутилізоксазол-5-іл)циклопропіл)аміно]пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-(5-форміл-4-метилтієн-2-іл)бензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-[(метилсульфоніл)аміно]бензил)аміно]пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-[(3-ізопентилбензил)аміно]пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-3-[(1,1'-дифеніл-3-ілметил)аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(1-(3-етинілфеніл)циклопропіл)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-[(2-(метиламіно)етил)аміно]сульфоніл)-N³,N³-дипропілізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-[(1-(3-ізобутилізоксазол-5-іл)циклопропіл)аміно]пропіл]-5-етиніл-N³,N³-дипропілізофталамід;
N¹,N¹-діаліл-N³-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метилізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-[(1-(2-ізобутил-1,3-тіазол-5-іл)циклопропіл)аміно]пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(1-(3-етинілфеніл)-1-метилетил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;

N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-[[2-гідроксіетил)аміно]сульфоніл]- N^3 -пропілізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]- N^3 ,5-диметил- N^3 -пропілізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]- N^2 -(фенілсульфоніл)-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]аланінамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]- N^3 , N^3 -діетил-5-(1,3-оксазол-2-іл)ізофталамід;
 N^2 -[(бензиламіно)карбоніл]- N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]аланінамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-піридин-3-ілбензил)аміно]пропіл]-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-(3-форміл-2-фурил)бензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-(1-метил-1H-імідазол-2-іл)- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)- N^3 , N^3 -діетил-5-метилізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-(етилсульфоніл)бензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
3-[[бутил(етил)аміно]сульфоніл]- N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)пропанамід;
 N^1 -((1S,2R)-3-[(3-ціанобензил)аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]пропанамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)- N^3 -ізобутил- N^3 ,5-диметилізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-піридин-2-ілбензил)аміно]пропіл]-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метил(метилсульфоніл)аміно)бензил)аміно]пропіл]-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)- N^2 -(3-фенілпропаноіл)-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]аланінамід трифторацетат;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-(етилсульфоніл)бензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^2 -[(5-хлортієн-2-іл)сульфоніл]- N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]аланінамід;
 N^1 -[(1S,2R)-3-[(3-(5-ацетилтієн-2-іл)бензил)аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-

N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -(втор-бутил)- N^3 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метилізофталамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-(1,3-оксазол-2-іл)бензамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)- N^3 ,5-диметил- N^3 -(2-фенілетил)ізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3,5-диметилізоксазол-4-іл)бензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)- N^3 ,5-диметил- N^3 -проп-2-інілізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)- N^3 -етил- N^3 ,5-диметилізофталамід;
3-(((2R,3S)-4-(3,5-дифторфеніл)-3-[(3-(дипропіламіно)карбоніл)-5-метилбензоіл]аміно)-2-гідроксибутил)аміно)метил)феніл диметилкарбамат;
 N^1 -бензил- N^3 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)- N^1 ,5-диметилізофталамід;
 N^1 -(втор-бутил)- N^3 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-метил- N^1 -пропілізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-(4-метилтієн-2-іл)бензил)аміно]пропіл)-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
метил-3-(((2R,3S)-4-(3,5-дифторфеніл)-3-[(3-(дипропіламіно)-карбоніл)-5-метилбензоіл]аміно)-2-гідроксибутил)аміно)метил)-феніл(метил)карбамат;
 N^1 -((1S,2R)-2-гідрокси-1-(2,3,5-трифторбензил)-3-[(3-(трифторметил)бензил)аміно]пропіл)-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)- N^3 , N^3 -діізобутил-5-метилізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)- N^3 ,5-диметил- N^3 -(2-піридин-2-ілетил)ізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3-фтор-5-гідроксибензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл)-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3-хлор-5-фторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл)- N^3 , N^3 -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-йодбензил)аміно]пропіл)-4-гідрокси-3-(піролідін-1-ілкарбоніл)бензамід;
5-оксо-D-пропіл- N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]аланінамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-[[[трифторметил)сульфоніл]аміно]бензамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-піридин-4-ілбензил)аміно]пропіл)-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-(диметиламіно)сульфоніл)-бензил)аміно]-2-

гідроксипропіл]-5-метил- N^3, N^3 -
дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(6-метокси-1,2,3,4-тетрагідронафтален-1-іл)аміно]пропіл]-5-метил- N^3, N^3 -
дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]- N^2 -
(фенілацетил)-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]аланінамід;
метил-3-[(2R,3S)-4-(3,5-дифторфеніл)-3-[(3-[(дипропіламіно)-карбоніл]-5-метилбензоїл)аміно]-2-гідроксибутил)аміно]метил-фенілкарбамат;
5-оксо-L-проліл- N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]-аланінамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]- N^3 -ізобутил-5-метилізофталамід;
4-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]аміно]-4-оксо-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]метил]масляної кислоти трифторацетат;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-
[метил(метилсульфоніл)аміно]бензамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]- N^3 -етил- N^3 -ізопропіл-5-метилізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]-1-(тієн-2-ілметил)пропіл]-5-метил- N^3, N^3 -
дипропілізофталамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-[(2-гідроксіетил)(пропіл)аміно]сульфоніл]пропанамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]- N^3 -ізопропіл- $N^3, 5$ -диметилізофталамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-
[(метилсульфоніл)аміно]-1,3-тіазол-4-карбоксамід;
 N^1 -аліл- N^1 -циклопентил- N^3 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метилізофталамід;
 N -3-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]аміно]-3-оксо-2-[(1-пропілбутил)сульфоніл]метил]пропіл)-
бензамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-
(ізопентилсульфоніл)пропанамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-5-метилтієн-2-іл)бензил]аміно]пропіл]-5-метил- N^3, N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(1-метилгексил)аміно]пропіл]-5-метил- N^3, N^3 -
дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-3-[(1-амінокарбоніл)циклогексил]аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3, N^3 -
дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(2E)-гекс-2-еніламіно]-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3, N^3 -
дипропілізофталамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-

гідроксіізоксазол-5-карбоксамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-[(1E)-гекс-1-еніл]бензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3, N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]- N^3 -ізопропіл-5-метилізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]-1-(тієн-2-ілметил)пропіл]- N^3, N^3 -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
2-[3-(2-аміно-2-оксоетокси)феніл]- N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-йодбензил)аміно]пропіл]ацетамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3-бромбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-5-метил- N^3, N^3 -
дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(2-етилгексил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3, N^3 -
дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-6-метоксипіридин-3-іл)бензил]аміно]пропіл]-5-метил- N^3, N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-(2,4-диметоксипіримідин-5-іл)бензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3, N^3 -
дипропілізофталамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-(2-етилбутаноїл)бензамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-[(4-гідроксіпіперидин-1-іл)карбоніл]-5-метилбензамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3-бромбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]- N^3, N^3 -
дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
4'-[4-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-йодбензил)аміно]пропіл]аміно]-4-оксобутаноїл]-1,1'-дифеніл-2-карбоксамід;
1-3-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]аміно]карбоніл]-5-метилбензоїл]-L-пролінамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-[(3-гідроксіпіперидин-1-іл)карбоніл]-5-метилбензамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-гідрокси-1-фенілпропіл)аміно]пропіл]-5-метил- N^3, N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]- N^3 -[2-(диметиламіно)етил]- N^3 -етил-5-метилізофталамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-метил-4Н,6Н-піроло[1,2-а][4,1]бензоксазепін-4-карбоксамід;
2-(5-ацетилтієн-2-іл)- N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]ацетамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]- N^3, N^3 -діізопропіл-5-метилізофталамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-
[(метилсульфоніл)аміно]бензамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-йодбензил)аміно]пропіл]-2-[4-(2-оксопіролідин-1-

іл)феніл]ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3-хлор-5-фторбензил)-2-гідрокси-3-
 [(3-метоксибензил)аміно]пропіл)-3-
 [(дипропіламіно)сульфоніл]пропанамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3-хлор-5-фторбензил)-2-гідрокси-3-
 (ізопентиламіно)пропіл]-N³,N³-дипропілбензол-
 1,3,5-трикарбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-
 етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[(1-метил-
 1Н-імідазол-4-іл)сульфоніл]аміно}бензамід три;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-
 (пентиламіно)пропіл]-5-метил-N³,N³-
 дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(4-фторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-
 метоксибензил)аміно]пропіл]-N³,N³-
 дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(3-хлор-5-
 фторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-
 дипропілізофталамід;
 N¹-циклогексил-N³-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-
 3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N¹-етил-
 5-метилізофталамід;
 2-[(2R,3S)-4-(3,5-дифторфеніл)-3-[(3-
 [(дипропіламіно)карбоніл]-5-метилбензоїл]аміно)-
 2-гідроксибутил]аміно}етил 2,4-
 дифторфенілкарбамат;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-
 етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[(23)-2-
 (метоксиметил)піролідин-1-іл]карбоніл)-5-
 метилбензамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3-бромбензил)-2-гідрокси-3-
 (ізопентиламіно)пропіл]-N³,N³-дипропілбензол-
 1,3,5-трикарбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-
 етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2,8-
 диметилхінолін-3-карбоксамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(6-
 гідроксигексил)аміно]пропіл]-5-метил-N³,N³-
 дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-
 [(2R)-2-гідроксипропіл]аміно}пропіл]-5-метил-
 N³,N³-дипропілізофталамід;
 N-((1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-
 метоксибензил)аміно]пропіл)-3-[(1-
 пропілбутил)сульфоніл]пропанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-
 етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[(2-
 гідрокси-1,1-
 диметилетил)аміно]сульфоніл}бензамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(4-
 фенілбутил)аміно]пропіл]-5-метил-N³,N³-
 дипропілізофталамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-
 йодбензил)аміно]пропіл)-7-(1Н-імідазол-1-іл)-5,6-
 дигідронафталін-2-карбоксамід;
 3-(ацетиламіно)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-
 3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-
 метилбензамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-[(2-(аміносульфоніл)етил)аміно]-1-
 (3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-
 N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(2-
 (етилтіо)етил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-метил-
 N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-бензил(ціанометил)аміно]-1-(3,5-
 дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-

дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(2-
 гідроксипропіл)аміно]пропіл]-5-метил-N³,N³-
 дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-[(3-бутоксипропіл)аміно]-1-(3,5-
 дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-
 дипропілізофталамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-
 етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[(2-(2-
 гідроксіетил)піперидин-1-іл)карбоніл]-5-
 метилбензамід;
 метил N-[(2R,3S)-4-(3,5-дифторфеніл)-3-[(3-
 [(дипропіламіно)карбоніл]-5-метилбензоїл]аміно)-
 2-гідроксибутил]-бета-аланінат;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-
 етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-(1-гідрокси-
 2-пропілпентил)бензамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(3-хлор-5-
 фторбензил)-2-гідроксипропіл]-N³,N³-
 дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-
 етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-
 [(метилсульфоніл)аміно]бутанамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-[(3-(1-бензотієн-2-іл)бензил)аміно]-1-
 (3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-
 N³,N³-дипропілізофталамід;
 3-(бензилокси)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-
 [(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)ізоксазол-
 5-карбоксамід;
 2-[(бензилокси)карбоніл]аміно}-7-
 [(циклопропілметил)аміно]-1,2,4,5,7-пентадеокси-
 5-(3,5-дифторбензил)-1-[(1-
 пропілбутил)сульфоніл]-D-трео-гепт-3-улозу три-
 фторацетат;
 1-{3-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-
 етилбензил)аміно]-2-
 гідроксипропіл]аміно}карбоніл]-5-метилбензоїл]-D-
 пролінамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-
 етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-(1Н-піразол-
 1-іл)пентанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-
 етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1-(2-
 фурилметил)-5-оксопіролідин-3-карбоксамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(5-
 гідроксипентил)аміно]пропіл]-5-метил-N³,N³-
 дипропілізофталамід;
 3-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(1-
 метил-1-фенілетил)аміно]пропіл]аміно}сульфоніл]-
 N,N-дипропілбензамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-
 метоксибензил)аміно]пропіл]-N³,N³-
 дипропілпіперидин-1,3-дикарбоксамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-
 метоксибензил)аміно]пропіл]-N³,N³-
 діетилпіперидин-1,3-дикарбоксамід;
 5-бром-N¹-[(1S,2R)-2-гідрокси-1-
 (пентафторбензил)-3-[(3-
 (трифторметил)бензил)аміно]пропіл]-N³,N³-
 дипропілізофталамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-
 етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-
 [(метилсульфоніл)аміно]бензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3-бромбензил)-2-гідрокси-3-[(3-
 метоксибензил)аміно]пропіл)-3-
 [(дипропіламіно)сульфоніл]пропанамід;

3-[(дипропіламіно)сульфоніл]-N-[(1S,2R)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]-1-(тієн-2-ілметил)пропіл]пропанамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етоксипропіл)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3, N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-2-гідрокси-1-(тієн-2-ілметил)пропіл]-5-метил- N^3, N^3 -дипропілізофталамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-гідрокси-4-(фенілсульфоніл)бутанамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дихлорбензил)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)пропіл]- N^3, N^3 -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3,3-диметилбутил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3, N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(3-бромбензил)-2-гідроксипропіл]- N^3, N^3 -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3-хлор-5-фторбензил)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)пропіл]-5-метил- N^3, N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(1,3-дифенілпропіл)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3, N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[[[(1S)-1-(гідроксиметил)пропіл]аміно]пропіл]- N^3, N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[[[(3S)-2-оксоазепан-3-іл]аміно]пропіл]-5-метил- N^3, N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -циклогексил- N^5 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]пентандіамід;
 N^1 -[(1S,2R)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]-1-(3-метилбензил)пропіл]- N^3, N^3 -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]- N^3 -[(2-пропілпентил)сульфоніл]-бета-аланінамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-(1,3-тіазол-2-іл)бензамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метил(феніл)аміно)пропіл]аміно]пропіл]-5-метил- N^3, N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]-1-(4-метилбензил)пропіл]- N^3, N^3 -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-оксо-1-(тієн-2-ілметил)піролідін-3-карбоксамід;
4-[(бутилтіо)метил]- N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил-2-фурамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-[(2-гідроксіетил)аміно]сульфонілбензамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метилциклогексил)аміно]пропіл]-5-метил- N^3, N^3 -дипропілізофталамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-(2-оксо-1,3-оксазолідін-3-іл)бензамід;

N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-(1H-пірол-1-іл)бензамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-1,3,4,5-тетрагідротіопірано[4,3-b]індол-8-карбоксамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]- N^4 -[2-(трифторметил)феніл]сукцинамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3-бромбензил)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)пропіл]-5-метил- N^3, N^3 -дипропілізофталамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4,5-диметил-2-(1H-пірол-1-іл)тіофен-3-карбоксамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(2,3-дигідроксипропіл)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3, N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[[[(2S)-2-гідроксипропіл]аміно]пропіл]-5-метил- N^3, N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[[[(1R)-1-метилпропіл]аміно]пропіл]-5-метил- N^3, N^3 -дипропілізофталамід;
2-хлор- N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-(метилсульфоніл)бензамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(2-гідроксіетил)аміно]пропіл]-5-метил- N^3, N^3 -дипропілізофталамід;
3-[(дипропіламіно)сульфоніл]- N -[(1S,2R)-2-гідрокси-1-(3-метоксибензил)-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]пропанамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-{метил[(трифторметил)сульфоніл]аміно}бензамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-гідрокси-6-(1-гідрокси-2,2-диметилпропіл)піридин-2-карбоксамід;
 N^1 -[(1S,2R)-3-[(1,3-дициклогексилпропіл)аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3, N^3 -дипропілізофталамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2,2'-бітіофен-5-карбоксамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-(1H-імідазол-1-іл)бутанамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2,3-дигідрокси- N^4 -(4-метоксифеніл)сукцинамід;
 N^1 -[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-2-гідрокси-1-(4-гідроксибензил)пропіл]-5-метил- N^3, N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]-1-[3-(трифторметил)бензил]пропіл]- N^3, N^3 -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N^1 -[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-2-гідрокси-1-(тієн-2-ілметил)пропіл]- N^3, N^3 -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N^1 -[(1S,2R)-3-[(2-(амінокарбоніл)-1H-індол-6-іл)аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3, N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(3-бромбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3, N^3 -

дипропілізофталамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(1-оксо-1,3-дигідро-2H-ізоіндол-2-іл)бутанамід;
 3-хлор-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(метилсульфоніл)тіофен-2-карбоксамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(1-етилпропіл)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-(((5R)-3-етил-2-оксо-1,3-оксазолідин-5-іл)метил)аміно)-2-гідроксипропіл)-5-метил-N³, N³-дипропілізофталамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-метил-7-(трифторметил)піразоло[1,5-a]піримідин-2-карбоксамід;
 N¹-((1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл)-N²-[(метилтіо)ацетил]-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]аланінамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(2,3-диметилциклогексил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4,5-диметокси-1-бензотіофен-2-карбоксамід;
 N¹-((1S,2R)-1-[3-фтор-5-(трифторметил)бензил]-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)пропіл)-N³,N³-дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-(((5S)-3-етил-2-оксо-1,3-оксазолідин-5-іл)метил)аміно)-2-гідроксипропіл)-5-метил-N³, N³-дипропілізофталамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(1,3-бензодіоксол-5-ілметил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл)-N³,N³-дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(3,5-діоксо-1,2,4-триазолідин-4-іл)бензамід;
 N-((1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл)-2-гідрокси-3-[(3-метоксифеніл)сульфоніл]пропанамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(2-метилциклогексил)аміно]пропіл)-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-(1S,2R)-3-[(2-{4-[(3-хлорбензил)оксибеніл]етил)аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл)-5-метил-N³, N³-дипропілізофталамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-гідрокси-4-оксо-4-тієн-3-ілбутанамід;
 N¹-((1S,2R)-1-[3-(бензилоксо)-5-фторбензил]-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл)-N³,N³-дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-гідрокси-4-оксо-4-[3-(трифторметил)феніл]бутанамід;
 N¹-((1S,2R)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)-1-[3-(трифторметоксибензил)пропіл]-N³,N³-дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[[1-(гідроксиметил)-3-(метилтіо)пропіл]аміно]пропіл)-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;

2-(1H-1,2,3-бензотриазол-1-іл)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)гексанамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3-фтор-4-метилбензил)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)пропіл]-N³,N³-дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-(4,4-диметил-2,5-діоксоімідазолідин-1-іл)-2-[[1-пропілбутил)сульфоніл]метил]пропанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-[[трифторметил)сульфоніл]аміно]бутанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(5-метил-1,3-діоксо-1,3-дигідро-2H-ізоіндол-2-іл)ацетамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[[1-(гідроксиметил)пропіл]аміно]пропіл)-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(3,5-дихлорбензил)-2-гідроксипропіл]-N³,N³-дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл)-3-[[2-гідроксіетил(пропіл)аміно]сульфоніл]пропанамід;
 5-(бензилтіо)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)нікотинамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1H-піразол-5-карбоксамід;
 6-хлор-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-метил-2-оксо-2,3-дигідро-1,3-бензоксазол-5-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1H-бензимидазол-2-карбоксамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(циклогексилметил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл)-N³,N³-дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-6-гідрокси-4,7-диметокси-1-бензофуран-5-карбоксамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(4-метилциклогексил)аміно]пропіл)-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)[1,2,4]триазоло[4,3-a]піридин-6-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-гідрокси-4-оксо-4-тієн-2-ілбутанамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(3,5-дихлорбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(2-гідрокси-5-метилфеніл)-4-оксобутанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-феноксibenзамід;
 4-[(амінокарбоніл)аміно]-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)бензамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-

{[(1S)-1-(гідроксиметил)-3-(метилтіо)пропіл]аміно}пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-7-гідроксі-4-оксохроман-2-карбоксамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(1S)-1-(гідроксиметил)-3-метилбутил]аміно}пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(1R)-1-(гідроксиметил)пропіл]аміно}пропіл]-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(1-метил-3-фенілпропіл)аміно]пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-(2,3-дигідро-1-бензофуран-5-іл)-1,3-тіазол-4-карбоксамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-[3-(бензилокси)бензил]-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N-[(1S,2R)-1-(4-хлорбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-3-[(дипропіламіно)сульфоніл]пропанамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N³-пентилмалонамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-(трифторметокси)бензамід;
 3-[(дипропіламіно)сульфоніл]-N-[(1S,2R)-1-(3-фтор-4-метилбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]пропанамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3-хлор-5-фторбензил)-2-гідроксі-3-(ізопентиламіно)пропіл]-3-[(дипропіламіно)сульфоніл]пропанамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-(4,4-диметил-2,5-діоксоімідазолідин-1-іл)-2-[(1-пропілбутил)сульфоніл]метилпропанамід;
 N¹-[4-(ацетиламіно)феніл]-N⁴-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]сукцинамід;
 3-(1-ціаноетил)-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]бензамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N⁴-(5-феніл-1,3,4-тіадіазол-2-іл)сукцинамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-2-гідрокси-1-[3-(трифторметокси)бензил]пропіл]-N³,N³-дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-[(2-оксо-2-піролідин-1-ілетокси)феніл]аміно}пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(4-хлорбензил)-2-гідроксі-3-(ізопентиламіно)пропіл]-N³,N³-дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-(1,1-діоксидотетрагідротієн-2-іл)ацетамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(4-хлорбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-

етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-гекс-1-инілнікотинамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3-бромбензил)-2-гідроксі-3-(ізопентиламіно)пропіл]-3-[(дипропіламіно)сульфоніл]пропанамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-метоксіізоксазол-5-карбоксамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2,3-диметил-1Н-індол-7-карбоксамід;
 4-(3-хлорфеніл)-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-гідроксі-4-оксобутанамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-(1-метил-1Н-індол-3-іл)-2-оксоацетамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3-фтор-4-метилбензил)-2-гідроксі-3-(ізопентиламіно)пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 3-[(дипропіламіно)сульфоніл]-N-[(1S,2R)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]-1-(4-метилбензил)пропіл]пропанамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(3-фтор-4-метилбензил)-2-гідроксипропіл]-N³,N³-дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-[5-(4-метилфеніл)-2Н-тетразол-2-іл]ацетамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дихлорбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-3-[(дипропіламіно)сульфоніл]пропанамід;
 N¹-[(1S,2R)-2-гідроксі-3-(ізопентиламіно)-1-(тієн-2-ілметил)пропіл]-N³,N³-дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил-3-фенілізоксазол-4-карбоксамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(4-фторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N²-[(метилсульфоніл)ацетил]-N²-пентилгліцинамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-(1Н-індол-3-іл)-4-оксобутанамід;
 N¹-(5-бензил-1,3,4-тіадіазол-2-іл)-N⁴-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]сукцинамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-(3-фтор-4-метоксифеніл)-4-оксобутанамід;
 етил-4-[(2R,3S)-4-(3,5-дифторфеніл)-3-[(дипропіламіно)карбоніл]-5-метилбензоіл]аміно)-2-гідроксибутил]аміно}піперидин-1-карбоксилат;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-(2-фторбензоіл)-1Н-пірол-2-карбоксамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(4-хлорбензил)-2-гідроксипропіл]-N³,N³-дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N¹-[(1S,2R)-2-гідроксі-3-(ізопентиламіно)-1-[3-(трифторметил)бензил]пропіл]-N³,N³-дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N¹-[(1S,2R)-2-гідрокси-1-(4-гідроксибензил)-3-

(ізопентиламіно)пропіл]-5-метил- N^3, N^3 -дипропілізофталамід;
 N -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-(4-морфолін-4-ілфеніл)ацетамід;
 3 -[(дипропіламіно)сульфоніл]- N -{(1S,2R)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]-1-[3-(трифторметокси)бензил]пропіл]пропанамід;
 N^1 -бензил- N^1 -(1-циклопропілетил)- N^4 -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]сукцинамід;
 N -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-3-(2,5-диметилбензоіл)-5-метилбензамід;
 N^1 -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]- N^4 -(2-метокси-5-метилфеніл)сукцинамід;
 N -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-(3-гідроксифеніл)ацетамід;
 N -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-3-[гідрокси(2-метилфеніл)метил]-5-метилбензамід;
 N -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-(етилтіо)нікотинамід;
 N -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-[4-(2-фурил)піперазин-1-іл]-4-оксобутанамід;
 N^1 -{(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(3-фтор-4-метилбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3, N^3 -дипропілізофталамід;
 N -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-оксоізоіндолін-1-карбоксамід;
 N -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-(етилтіо)бензамід;
 N -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]тієно[2,3- b]хінолін-2-карбоксамід;
 N -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-(4-метил-1,3-оксазол-2-іл)бензамід;
 N^1 -{(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(4-фторбензил)-2-гідроксипропіл]- N^3, N^3 -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N -{2-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]аміно)карбоніл]феніл}- N -метил-2-фурамід;
 N -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-гідрокси-4-(3-метоксифеніл)-4-оксобутанамід;
 N^1 -{(1S,2R)-3-(циклогептиламіно)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3, N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -{(1S,2R)-2-гідроксі-3-(ізопентиламіно)-1-(4-метилбензил)пропіл]- N^3, N^3 -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 1 3-[(дипропіламіно)сульфоніл]- N -{(1S,2R)-1-(3-фтор-5-гідроксибензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]пропанамід;
 3 -[(дипропіламіно)сульфоніл]- N -{(1S,2R)-1-(3-фтор-5-гідроксибензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]пропанамід;

N -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-гідроксі-1H-індол-2-карбоксамід;
 N -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2,2-диметилхроман-8-карбоксамід;
 6 -бензил- N -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]піразин-2-карбоксаміду 4-оксид;
 2 -{[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]аміно)карбоніл]аміно}- N, N -дипропілетансульфонамід;
 N^1 -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(1R)-1-(гідроксиметил)-2-метилпропіл]аміно]пропіл]-5-метил- N^3, N^3 -дипропілізофталамід;
 N -{(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(3-хлор-5-фторбензил)-2-гідроксипропіл]-3-[(дипропіламіно)сульфоніл]пропанамід;
 N -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-(4-метоксифеніл)-4-оксобутанамід;
 N^1 -{(1S,2R)-3-(бензиламіно)-2-гідрокси-1-(4-гідроксибензил)пропіл]- N^3, N^3 -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-метил-4-оксо-3,4-дигідрофалазин-1-карбоксамід;
 N -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3,4-дигідро-2H-1,5-бензодіоксепін-7-карбоксамід;
 N -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-[4-(2,5-діоксопіролідін-1-іл)феноксі]ацетамід;
 N -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил-4-оксо-3,4-дигідротієно[2,3- d]піримідін-6-карбоксамід;
 N^1 -{(1S,2R)-1-(1,3-бензодіоксол-5-ілметил)-2-гідроксі-3-(ізопентиламіно)пропіл]- N^3, N^3 -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N^1 -{(1S,2R)-1-(3-хлор-5-фторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]- N^5, N^5 -дипропілпентандіамід;
 N -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-6-фтор-2-гідроксхінолін-4-карбоксамід;
 N -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-оксо-4-тієн-2-ілбутанамід;
 N^3 -{[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]аміно)карбоніл]- N^1, N^1 -дипропіл-бета-аланінамід;
 N^1 -{(1R,2R)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]-1-[(фенілтіо)метил]пропіл]- N^3, N^3 -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N^1 -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(1R,2S)-1-(гідроксиметил)-2-метилбутил]аміно]пропіл]-5-метил- N^3, N^3 -дипропілізофталамід;
 N -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-(феноксиметил)бензамід;
 N^1 -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]- N^5 -(2,4-

дифторфеніл)пентандіамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)- N^5 -(4,6-диметилпіримідин-2-іл)пентандіамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл)-3-(3-метоксибензоїл)-5-метилбензамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-[3-(бензилокси)бензил]-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл)- N^3 , N^3 -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 4-(3,4-дихлорфеніл)- N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-оксобутанамід;
 метил-4-((2R,3R)-2-((3-[(дипропіламіно)карбоніл]-5-метилбензоїл)аміно)-3-гідрокси-4-[(3-метоксибензил)аміно]бутил)бензоат;
 N^1 -(4-ацетилфеніл)- N^5 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)пентандіамід;
 N^1 -((1R,2R)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]-1-[(фенілтіо)метил]пропіл)-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 2-[[3-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)аміно]-3-оксопропіл]тіо]- N -метилбензамід;
 N -((1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл)-3-[(1-пропілбутил)тіо]пропанамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)- N^4 -(4-етоксифеніл)сукцинамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-[3-(бензилокси)-5-фторбензил]-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)пропіл]- N^3 , N^3 -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 2-[(2R,3S)-4-(3,5-дифторфеніл)-3-[(3-[(дипропіламіно)карбоніл]-5-метилбензоїл)аміно]-2-гідроксибутил]аміно)етил 3-метоксифенілкарбамат;
 3-(бензилокси)- N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)бензамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[[1S)-2-гідрокси-1-метилетил]аміно]пропіл)-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-2-гідрокси-1-(пентафторбензил)-3-[(3-трифторметил)бензил]аміно)пропіл)-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(4-гідроксифеніл)-4-оксобутанамід;
 3-[(дипропіламіно)сульфоніл]- N -((1S,2R)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]-1-[3-(трифторметил)бензил]пропіл)пропанамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-(піперидин-3-ілсульфоніл)бензамід;
 6-хлор- N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-гідроксифеніл-2-карбоксамід;
 N^1 -[(1S,2R)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]-1-(тісн-2-ілметил)пропіл]- N^5 , N^5 -дипропілпентандіамід;
 N^1 -((1S)-1-((1R)-1-гідрокси-2-[(3-метоксибензил)аміно]етил)-3-метилбутил)-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(6-оксо-3-

фенілпіридазин-1(6H)-іл)ацетамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[(4-[(метилсульфоніл)аміно]феніл)пропанамід;
 N^1 -[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-2-гідрокси-1-(4-метилбензил)пропіл]-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 3-(2-хлорфенокси)- N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-йодбензил)аміно]пропіл)пропанамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(4-фторбензил)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)пропіл]- N^3 , N^3 -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 1N-((1S,2R)-1-[3-(бензилокси)-5-фторбензил]-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл)-3-[(дипропіламіно)сульфоніл]пропанамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(4-метилфеніл)-4-оксобутанамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]- N^4 -3-(трифторметил)феніл]сукцинамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(1,3-бензодіоксол-5-ілметил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(5-піридин-2-іл-2H-тетразол-2-іл)ацетамід;
 3-[(дипропіламіно)сульфоніл]- N -[(1S,2R)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]-1-(3-метилбензил)пропіл]пропанамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)ізоксазол-5-карбоксамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(3,5-диметоксифенокси)ацетамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(2,5-диметил-1H-пірол-1-іл)-3-гідроксибензамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3-бромбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]- N^5 , N^5 -дипропілпентандіамід;
 N^1 -[5-(циклопентилметил)-1,3,4-тіадіазол-2-іл]- N^4 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)сукцинамід;
 N^1 -[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-2-гідрокси-1-[3-(трифторметил)бензил]пропіл]- N^3 , N^3 -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(3-оксо-1,2-бензизотіазол-2(3H)-іл)ацетамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[[1-метил-5-(піролідін-1-ілкарбоніл)-1H-пірол-3-іл]аміно]пропіл)-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(3,4-дифторфеніл)-4-оксобутанамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(2-нафтил)-4-оксобутанамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4,6-діетоксипіридин-2-карбоксамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-

етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-(5-метил-1H-пірол-2-іл)-4-оксобутанамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-[(2-(метиламіно)етил)аміно]сульфоніл)бензамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-3-метил-5-(4-метилбензоїл)бензамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(1,3-бензодіоксол-5-ілметил)-3-(бензиламіно)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-(піперазин-1-ілсульфоніл)бензамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-[(2-[4-(аміносульфоніл)феніл]етил)аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(2-гідрокси-1-(гідроксиметил)етил)аміно]пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(4-фтор-3-метилбензил)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)пропіл]-N³,N³-дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-(3-оксо-2,1-бензотіазол-1(3H)-іл)пропанамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-(2,6-дигідроксипіримідин-4-іл)ацетамід;
 N¹-[(1S,2R)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]-1-[3-(трифторметил)бензил]пропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
 N-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-2-гідрокси-1-(4-гідроксибензил)пропіл]-3-[(дипропіламіно)сульфоніл]пропанамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-(3,4-дифторфеніл)-2-метил-4-оксобутанамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N⁵-(2-піридин-2-ілетил)пентандіамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-[2-(4-фторфеніл)-1,3-бензоксазол-5-іл]ацетамід;
 N²-(анілінокарбоніл)-N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]гліцинамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-(1,3-дитіан-2-іл)-3-фурамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-[2-оксо-2-(пропіламіно)етил]бензамід;
 N-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(3-бромбензил)-2-гідроксипропіл]-3-[(дипропіламіно)сульфоніл]пропанамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-йодбензил)аміно]пропіл]-3-(2-фторфеніл)пропанамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метилтіофен-2-карбоксамід;
 2-[4-(бензилокси)феніл]-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-йодбензил)аміно]пропіл]ацетамід;

N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-[(5,7-диметил[1,2,4]тріазоло[4,3-a]піримідин-3-іл)тіо]ацетамід;
 N¹-(1-ацетил-2,3-дигідро-1H-індол-7-іл)-N⁴-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]сукцинамід;
 N¹-(3-ацетилфеніл)-N⁵-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]пентандіамід;
 3-(4-хлорфенокси)-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-гідроксипропанамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(3-фтор-4-метоксибензил)-2-гідроксипропіл]-N³,N³-дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-2-гідрокси-1-(3-метилбензил)пропіл]-N³,N³-дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-1H-індол-7-карбоксамід;
 N¹-[(1S,2R)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)-1-(3-метилбензил)пропіл]-N³,N³-дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-(1,2,3-тіадіазол-4-іл)бензамід;
 N-[(1S,2R)-1-[3-(бензилокси)-5-фторбензил]-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-3-[(дипропіламіно)сульфоніл]пропанамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-(4,4-диметил-2,5-діоксоімідазолідин-1-іл)-2-[(1-пропілбутил)сульфоніл]метил]пропанамід;
 N¹-[(1S,2R)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)-1-(4-метилбензил)пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-[3-фтор-5-(трифторметил)бензил]-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-[1-метил-3-(метилтіо)-1H-індол-2-іл]ацетамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дихлорбензил)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-(2-фурил)-4-оксобутанамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-(3-піридин-2-іл-1,2,4-оксадіазол-5-іл)пропанамід;
 2-[2-(ацетиламіно)-1,3-тіазол-4-іл]-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]ацетамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-[(4-метил-4H-1,2,4-тріазол-3-іл)тіо]-2-фенілацетамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(4-хлорбензил)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 4-(1,3-бензотіазол-2-іл)-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]бутанамід;
 N¹-(3-хлор-4-фторфеніл)-N⁴-[(1S,2R)-1-(3,5-

дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]сукцинамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-[3-(бензилокси)-5-фторбензил]-2-гідроксі-3-(ізопентиламіно)пропіл]-5-метил- N^3, N^3 -дипропілізофталамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-[(2-оксо-2,3-дигідрохіназолін-4-іл)тіо]ацетамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-3-метил-5-(2-метилбензоіл)бензамід;
 N^1 -[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-2-гідрокси-1-(4-метилбензил)пропіл]- N^3, N^3 -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-пропоксибензамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-1-метил-1H-індол-2-карбоксамід;
5-хлор- N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-(3-метил-4H-1,2,4-триазол-4-іл)бензамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-(3,4-дифторфеніл)-2-метокси-4-оксобутанамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-(3-тієн-2-іл-1H-піразол-1-іл)ацетамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]- N^5 -фенілпентандіамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-(2-тіоксо-1,3-бензотіазол-3(2H)-іл)ацетамід;
 N^1 -[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(циклогексилметил)-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3, N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-2-гідрокси-1-(4-метоксибензил)-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]- N^3, N^3 -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-(3-гідрокси-4-метилфеніл)ацетамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-[3-фтор-5-(трифторметил)бензил]-2-гідроксі-3-(ізопентиламіно)пропіл]-5-метил- N^3, N^3 -дипропілізофталамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-7-фтор-4H-імідазо[5,1-с][1,4]бензоксазин-3-карбоксамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-(3,4-дигідро-2H-1,5-бензодіоксепін-7-іл)-4-оксобутанамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-1-бензофуран-3-карбоксамід;
 N^1 -(3,4-дихлорфеніл)- N^3 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]малонамід;
 N^1 -[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-[3-фтор-5-(трифторметил)бензил]-2-гідроксипропіл]- N^3, N^3 -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-[(1R)-2-гідрокси-1-метилетил]аміно]пропіл]-5-метил- N^3, N^3 -дипропілізофталамід;

N^1 -[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-2-гідрокси-1-(3-метилбензил)пропіл]-5-метил- N^3, N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]- N^5 -піридин-3-ілпентандіамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-метил-4-оксо-4H-хромен-6-карбоксамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-[(3-(1H-імідазол-1-іл)пропіл]аміно)пропіл]-5-метил- N^3, N^3 -дипропілізофталамід;
3-[(дипропіламіно)сульфоніл]- N -[(1S,2R)-1-[3-фтор-5-(трифторметил)бензил]-2-гідроксі-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]пропанамід;
3-[(дипропіламіно)сульфоніл]- N -[(1S,2R)-2-гідрокси-1-(4-гідроксибензил)-3-(ізопентиламіно)пропіл]пропанамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(1,3-бензодіоксол-5-ілметил)-2-гідроксі-3-(ізопентиламіно)пропіл]-5-метил- N^3, N^3 -дипропілізофталамід;
3-[(дипропіламіно)сульфоніл]- N -[(1S,2R)-2-гідроксі-3-(ізопентиламіно)-1-(тієн-2-ілметил)пропіл]пропанамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-[(2,2-диметилпропаноіл)аміно]-2-гідроксибензамід;
 N^1 -[(1S,2R)-2-гідроксі-3-(ізопентиламіно)-1-(3-метоксибензил)пропіл]-5-метил- N^3, N^3 -дипропілізофталамід;
 N -[(1S,2R)-1-(4-фторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-(трифторметил)бензил)аміно]пропіл]-3-[(3-метоксибензил)аміно]сульфоніл]бензамід;
 N^1 -[(1S,2R)-2-гідроксі-3-(ізопентиламіно)-1-[3-(трифторметил)бензил]пропіл]-5-метил- N^3, N^3 -дипропілізофталамід;
 N -[6-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]аміно]-6-оксогексил]-2-фурамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-[(1-феніл-4,5-дигідро-1H-тетразол-5-іл)тіо]ацетамід;
4-ацетил-4-аміно- N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]циклогекса-1,5-дієн-1-сульфонамід;
 N -[(1S,2S)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-(трифторметил)бензил)аміно]пропіл]-3-[(3-метоксибензил)аміно]сульфоніл]бензамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-(3,4-дигідро-2H-хромен-6-іл)-4-оксобутанамід;
 N^1 -[(1S,2R)-2-гідроксі-3-(ізопентиламіно)-1-(3-метоксибензил)пропіл]- N^3, N^3 -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3-фтор-4-метилбензил)-2-гідроксі-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]- N^5, N^5 -дипропілпентандіамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]індолізін-2-карбоксамід;
 N^1 -[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-2-гідрокси-1-[3-(трифторметокси)бензил]пропіл]-5-метил- N^3, N^3 -дипропілізофталамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]нікотинамід у 1-оксид;

N-[(1S,2R)-1-[3-(бензилокси)-5-фторбензил]-2-гідроксі-3-(ізопентиламіно)пропіл]-3-[(дипропіламіно)сульфоніл]пропанамід;
 2-[[[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-[(3-йодбензил)аміно]пропіл]аміно]-2-оксоетилкарбамат;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2,3-дигідро-1H-циклопента[b]хінолін-9-карбоксамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-метил-1H-піразол-5-карбоксамід;
 N-[5-[[[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]аміно]-5-оксопентил]бензамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-[(метоксиметил)тіо]бензамід;
 3-(1,3-бензотіазол-2-іл)-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-метоксипропанамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-[[[метиламіно]карбоніл]аміно]-3-тієн-3-ілпропанамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-піридин-2-ілтіофен-2-карбоксамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-[3-(бензилокси)-5-фторбензил]-2-гідроксипропіл]-N³,N³-дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-(5,6-диметил-2,4-діоксо-1,2,3,4-тетрагідропіридин-3-іл)ацетамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3-фтор-4-метоксибензил)-2-гідроксі-3-(ізопентиламіно)пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-ізобутил-1,3-діоксоізоіндолін-5-карбоксамід;
 3-[[[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]аміно]сульфоніл]бензойна кислота;
 5-(ацетиламіно)-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-фурамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N²-[(4-метоксифеніл)ацетил]гліцинамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]ізохінолін-4-карбоксамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-[3-(бензилокси)бензил]-2-гідроксі-3-(ізопентиламіно)пропіл]-N³,N³-дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-(4-гідроксі-3-метоксифеніл)ацетамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-[(4-феніл-4H-1,2,4-триазол-3-іл)тіо]ацетамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-(3,5-диметоксифеніл)ацетамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-2-гідрокси-1-(3-

метоксибензил)пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-(2-етил-4H-[1,2,4]триазоло[1,5-a]бензимидазол-4-іл)ацетамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(2-фурилметил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 7-хлор-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-1-бензофуран-2-карбоксамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-(1,3-діоксо-1,3-дигідро-2H-ізоіндол-2-іл)пропанамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-(2-оксо-2H-1,3-бензоксазин-3(4H)-іл)пропанамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-(піримідин-2-ілтіо)ацетамід;
 N¹-[3-(амінокарбоніл)-4,5,6,7-тетрагідро-1-бензотієн-2-іл]-N⁴-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]сукцинамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-[(5-феніл-1,3,4-оксадіазол-2-іл)тіо]ацетамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]хінолін-6-карбоксамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(2-фурилметил)-2-гідроксипропіл]-N³,N³-дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-(2,3-дигідро-1,4-бензодіоксин-6-іл)-4-оксобутанамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-(1H-індол-3-іл)-1H-піразол-5-карбоксамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-гідрокси-4-[[[метиламіно]карботіол]аміно]бензамід;
 6-хлор-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]нікотинамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-(3-гідроксифеніл)-4-оксобутанамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-(фталазин-1-ілтіо)ацетамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-[(1-оксидопіридин-2-іл)тіо]ацетамід;
 3-(ацетиламіно)-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-фтор-1H-індол-2-карбоксамід;
 N-[(1S,2S)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-трифторметил)бензил]аміно]пропіл]-3-[[[(3-хлорбензил)аміно]сульфоніл]бензамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(1,3-бензодіоксол-5-ілметил)-3-(бензиламіно)-2-гідроксипропіл]-N³,N³-дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 4-(3,4-дихлорфеніл)-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-гідрокси-3-метил-4-оксобутанамід;
 3-[(дипропіламіно)сульфоніл]-N-[(1S,2R)-2-гідроксі-

3-(ізопентиламіно)-1-[3-(трифторметокси)бензил]пропілпропанамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]- N^4 -(5-метил-1,3,4-тіадіазол-2-іл)сукцинамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-(2-етил-1H-бензимидазол-1-іл)ацетамід;
 N -[(1S,2R)-1-(1,3-бензодіоксол-5-ілметил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-3-[(дипропіламіно)сульфоніл]пропанамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-(2-оксо-1,3-бензоксазол-3(2H)-іл)пропанамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дихлорбензил)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)пропіл]-3-[(дипропіламіно)сульфоніл]пропанамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]- N^4 -(6-метилпіридин-2-іл)сукцинамід;
етил-(4R)-4-[[[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]аміно]карбоніл]-1,3-оксазолідин-3-карбоксилат;
 N -[(1R,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-3-гліцилбензамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-(1-метил-1H-імідазол-2-іл)бензамід;
4-(ацетиламіно)- N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]бутанаміду трифторацетат;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]- N^2 -[(3S)-тетрагідрофуран-3-ілокси]карбоніл]-D-лейцинамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-(піролідин-3-ілсульфоніл)бензамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-3-[(дипропіламіно)метил]бензамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[[[(1R)-1-(гідроксиметил)-3-метилбутил]аміно]пропіл]-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-3-[трет-бутил(циклогексил)аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[[[(1S)-1-(гідроксиметил)-2,2-диметилпропіл]аміно]пропіл]-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[[(2R)-1-етилпіролідин-2-іл]метил]аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-диметиламіно)-2,2-диметилпропіл]аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-3-[(1-бензилпіролідин-3-іл)аміно]-1-

(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-піролідин-1-ілпропіл)аміно]пропіл]-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-диметиламіно)пропіл]аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-3-[[2-(ацетиламіно)етил]аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[[2-(6-оксо-1,4,5,6-тетрагідропіридазин-3-іл)феніл]аміно]пропіл]-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-3-[7-хлор-1-(2-гідрокси-3-метоксифеніл)-3,4-дигідроізохінолін-2(1H)-іл]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-3-[[4-(1-ціаноциклопентил)феніл]аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-3-[[4-(4-(ацетиламіно)фенокси]феніл)аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-3-[[4-бензоіл-2,3-диметилфеніл]аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-3-[[2-аміно-2-оксо-1-фенілетил]аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-{4-[(1-метил-1H-імідазол-2-іл)метил]піперазин-1-іл}пропіл]-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-[3,5-біс(трифторметил)бензил]-2-гідрокси-3-[[3-(трифторметил)бензил]аміно]пропіл]-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
(1S,2R)- N^1 -[2-(трет-бутилтіо)етил]- N^2 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]циклопропан-1,2-дикарбоксамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4,5-дигідронафто[2,1-d]ізоксазол-3-карбоксамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-1-метил-1H-бензо[g]індазол-3-карбоксамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-метил-1,3-тіазол-4-карбоксамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-метокси-1H-пірол-3-карбоксамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-9-оксо-1,2,3,9-тетрагідроциклопента[b]хромен-7-карбоксамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-(2-оксо-2,3-дигідро-1H-бензимидазол-5-іл)ацетамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-(2-оксо-2,3-дигідро-1,3-бензоксазол-5-іл)ацетамід;
2-[2-(1,3-бензоксазол-2-іл)фенокси]- N -[(1S,2R)-1-

(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]ацетамід;
 5-хлор-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-морфолін-4-ілбензамід;
 3-(3-хлорізоксазол-5-іл)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)пропанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(6-метокси-1,1'-дифеніл)-4-оксобутанамід;
 4-(1-бензофуран-2-іл)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-оксобутанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-оксо-1,2,3,4-тетрагідрохінолін-3-карбоксамід;
 2-(1-бензофуран-2-іл)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-метилпропанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-6-метокси-1-бензофуран-2-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-[4-(1H-пірол-1-іл)феніл]пропанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1H-імідазо[1,2-b]піразол-6-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-[4-(метил-1,3-тіазол-2-іл)тіо]ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-метокси-4-(метилтіо)бензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-гідрокси-4-(пропіоніламіно)бензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-6-[[4-(метилфеніл)сульфоніл]аміно]-4-оксогексанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1H-бензимидазол-5-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-метил-2-(1-оксо-1,3-дигідро-2H-ізоіндол-2-іл)пропанамід;
 7-(ацетиламіно)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-метилхінолін-5-карбоксамід;
 N³-(трет-бутоксикарбоніл)-N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-b-аланінамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-гідрокси-3-пропілгексанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-феніл-2-(1H-пірол-1-іл)ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1-метил-5-феніл-1H-піразол-3-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(3-оксо-2,3-дигідро-1H-ізоіндол-1-іл)ацетамід;
 4-[2-(ацетиламіно)-4,5-диметилфеніл]-N-((1S,2R)-

1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-оксобутанамід;
 6-хлор-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)піразин-2-карбоксамід 4-оксид;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-6-метоксипіразин-2-карбоксамід 4-оксид;
 2-(1H,1'H-2,2'-діімідазол-1-іл)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)ацетамід;
 5-хлор-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2,3-дигідро-1-бензофуран-7-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-[[1,2,4]триазоло[4,3-b]піридазин-6-ілітіо]ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-метил-1-піридин-4-іл-1H-1,2,3-триазол-4-карбоксамід;
 2-бутил-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-оксо-3,4-дигідрохіназолін-6-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(7-метокси-1-бензофуран-2-іл)-4-оксобутанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-[(2-етил-1-оксо-2,3-дигідро-1H-ізоіндол-5-іл)окси]пропанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)піразин-2-карбоксамід 4-оксид;
 7-хлор-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)хінолін-2-карбоксамід;
 2-ціано-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-(3,4-диметоксифеніл)-2-метилпропанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-гідрокси-5-(пропіоніламіно)бензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[2-оксо-5-(трифторметил)піридин-1(2H)-іл]пропанамід;
 5-(4-хлорфеніл)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-фурамід;
 4-ціано-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-(1H-пірол-1-іл)тіофен-2-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3,5-біс(метилтіо)ізотіазол-4-карбоксамід;
 2-хлор-4-ціано-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)бензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[(метоксіацетил)аміно]-3-фенілпропанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-фтор-4-морфолін-4-ілбензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(1-оксидотіоморфолін-4-іл)бутанамід;
 4-хлор-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1,3-диметил-

1H-піразоло[3,4-b]піридин-5-карбоксамід;
 N-{2-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]аміно}карбонілфеніл}-5-метил-2-фурамід;
 1-(ціанометил)-N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-1H-пірол-2-карбоксамід;
 N¹-(2-хлорпіридин-3-іл)-N⁴-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}сукцинамід;
 3-(циклопентилокси)-N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-4-метоксибензамід;
 N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-2-(5-піролідин-1-іл)-2H-тетразол-2-іл)ацетамід;
 N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-2,5-диметил-1-феніл-1H-пірол-3-карбоксамід;
 1-(4-ацетилфеніл)-N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}піперидин-4-карбоксамід;
 N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-2-метил-2-(1H-1,2,4-триазол-1-іл)пропанамід;
 N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-5-(піперидин-1-ілметил)-2-фурамід;
 N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-2-метил-2,3-дигідро-1-бензотіофен-2-карбоксаміду 1,1-діоксид;
 2-(2,1,3-бензоксадіазол-5-іл)-N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-1,3-тіазол-4-карбоксамід;
 N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-4,5-дигідрофуру[2,3-g][2,1]бензизоксазол-8-карбоксамід;
 N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-2-[(4-метил-1,2,3-тіадіазол-5-іл)тіо]ацетамід;
 N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-1-(2-фуроіл)-4-гідроксипролінамід;
 N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-4-оксо-4,5,6,7-тетрагідро-1-бензофуран-3-карбоксамід;
 4,5-дихлор-N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}ізотіазол-3-карбоксамід;
 N¹-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-N⁵-(1,3-тіазол-2-іл)пентандіамід;
 N-ацетил-4-хлор-N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}феніланінамід;
 8-хлор-N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-4-гідроксицінолін-3-карбоксамід;
 N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-2,6-діоксогексагідропіримідин-4-карбоксамід;
 N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-4-(5-метил-4-феніл-1,3-оксазол-2-іл)бензамід;

N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-2-фенілімідазо[1,2-a]піридин-6-карбоксамід;
 N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-3-[(4-метоксифеніл)-1,2,4-оксадіазол-5-іл]пропанамід;
 N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-2-(4-метил-1,2,3-тіадіазол-5-іл)-1,3-тіазол-4-карбоксамід;
 N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-5-метил-2-феніл-2H-1,2,3-триазол-4-карбоксамід;
 N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-4-(3-піридин-2-іл-1,2,4-оксадіазол-5-іл)бутанамід;
 N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-1,3-диметил-1H-тієно[2,3-с]піразол-5-карбоксамід;
 4-(1,3-бензодіоксол-5-іл)-N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}бутанамід;
 N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-3-метил-5-(4-метил-1,2,3-тіадіазол-5-іл)ізоксазол-4-карбоксамід;
 N¹-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[2-(диметиламіно)-1-метилетил]аміно]-2-гідроксипропіл}-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(2-метилморфолін-4-іл)пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[2-гідрокси(феніл)метил]-4-метилпіперазин-1-іл]пропіл}-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(2R)-2-метилбутил]аміно]пропіл}-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-[[4-(діетиламіно)-1-метилбутил]аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(2-гідрокси-1,1-диметилетил)аміно]пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-(2-метилпіперидин-1-іл)пропіл]аміно]пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[[5-(трифторметил)-1,3,4-тіадіазол-2-іл]аміно]пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метил-4,5,6,7-тетрагідро-3H-3,4-[1,3]тіазоло[5,4-с]піридин-2-іл)аміно]пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідрокси-1-(1H-піразол-1-ілметил)пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 3,5-біс(ацетиламіно)-N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}бензамід;
 N¹-[4-(аміносультфоніл)феніл]-N⁴-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}сукцинамід;
 N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-4-[метил(метилсульфоніл)аміно]бензамід;

1-ацетил-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)піперидин-4-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-(4-метоксифенокси)пропанамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-N⁴-метилсукцинамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-N⁴-(2,6-диметилфеніл)сукцинамід;
 N-ацетил-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-D-фенілаланінамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-[(4-метилфеніл)сульфоніл]ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-[[етиламіно]карбоніл]аміно]бензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1-феніл-1,4,5,6-тетрагідроциклопента[с]піразол-3-карбоксамід;
 4-(циклопентилокси)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)бензамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-N⁴-піридин-3-ілсукцинамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-N⁴-фенілсукцинамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3,4-дигідроксибензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-(1H-1,2,4-триазол-1-іл)пентанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-феніл-1,3-оксазол-4-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-7-метокси-4-оксо-1,2,3,4-тетрагідронафтален-2-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-{4-[(метилсульфоніл)аміно]феніл}-4-оксобутанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-гідрокси-7-метокси-1-бензофуран-5-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-гідрокси-7-метокси-1-бензотіофен-5-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3,6,6-триметил-4-оксо-4,5,6,7-тетрагідро-1-бензофуран-2-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5,6-дигідро-4H-циклопента[б]тіофен-2-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1,3-тіазол-4-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-

етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(2-піридин-2-іл-1,3-тіазол-4-іл)ацетамід;
 N¹-[5-(аміносальфоніл)-1,3,4-тіадіазол-2-іл]-N⁴-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]сукцинамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-гідрокси-6-неопентилпіридин-2-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1-(4-фторфеніл)-1,4,5,6-тетрагідроциклопента[с]піразол-3-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-метил-5,6,7,8-тетрагідро-4H-піразоло[1,5-а]азепін-3-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-метил-3-фурамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-фурамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(2-гідроксіетокси)бензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)тіофен-2-карбоксамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-N²,N²-диметилфталамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-метил-2-феніл-1,3-оксазол-4-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(1,3-діоксо-1,3-дигідро-2H-ізоіндол-2-іл)-2-гідроксибутанамід;
 2-(2H-1,2,3-бензотриазол-2-іл)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)бутанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1H-індазол-3-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-гідроксифінокалін-2-карбоксамід;
 2-(ацетиламіно)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4,5-диметилтіофен-3-карбоксамід;
 N¹-(2-ціанофеніл)-N⁴-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)сукцинамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1-етил-1H-індол-2-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1-бензофуран-2-карбоксамід;
 1-бензил-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3,5-диметил-1H-піразол-4-карбоксамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-N²-[(4-метилфеніл)сульфоніл]гліцинамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4,8-дигідроксифінолін-2-карбоксамід;

N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(1,1-діоксидотетрагідротієн-3-іл)ацетамід;
 метил-5-[[[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]аміно]карбоніл]-1H-бензимидазол-2-ілкарбамат;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(2-метил-1,3-бензоксазол-5-іл)ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-[етил(метил)аміно]-4-гідроксипіримідин-5-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(2-піридин-4-іл-1,3-бензоксазол-5-іл)ацетамід;
 4-[2-(діетиламіно)етокси]-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)бензамід;
 3-(аміносультфоніл)-4-хлор-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)бензамід;
 2-(діетиламіно)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-гідроксипіримідин-5-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5,6,7,8-тетрагідро-4H-циклопента[с]ізоксазол-3-карбоксамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-N⁴,N⁴-дифенілсукцинамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-6-гідрокси-4-метилпіридин-2-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-фенілімідазо[1,2-а]піридин-7-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)хінолін-4-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(1,3-диметил-2,6-діоксо-1,2,3,6-тетрагідро-9H-пурин-9-іл)ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-метокси-1H-індол-2-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(3,5-диметил-1H-піразол-1-іл)бензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-метилізоксазол-3-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-метилізоксазол-5-карбоксамід;
 2-(1-бензотієн-4-іл)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-метил-4-оксо-4,5,6,7-тетрагідро-1H-індол-2-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1-

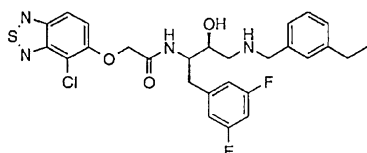
бензотіофен-2-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-6-гідроксинікотинамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-N³-[(4-метилфеніл)сульфоніл]-бета-аланінамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-гідроксихінолін-4-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(5-феніл-1H-тетразол-1-іл)ацетамід;
 4-[[циклобутилкарбоніл]аміно]метил-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)бензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(2-оксо-1,3-бензоксазол-3(2H)-іл)бутанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(1,3-діоксооктагідро-2H-ізоіндол-2-іл)бутанамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-N²-(тетрагідрофуран-2-ілметил)фталамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(2,3-дигідро-1H-індол-1-іл)-4-оксобутанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)тієно[3,2-b]піридин-6-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-[(6-метокси-1H-бензимидазол-2-іл)тіо]ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)тієно[2,3-с]піридин-2-карбоксамід;
 2-(1H-бензимидазол-2-ілтіо)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)пропанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[(2,4-дифторбензил)окси]пропанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5,6-диметил-4-оксо-3,4-дигідротієно[2,3-d]піримідин-2-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1-(2-фторфеніл)-5-оксопіролідін-3-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(5-метил-1H-тетразол-1-іл)бензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(4,4-диметил-4,5-дигідро-1,3-оксазол-2-іл)тіофен-3-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-(трифторметокси)-1H-індол-2-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1-феніл-5-пропіл-1H-піразол-4-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-[(піридин-2-ілтіо)метил]-2-фурамід;

5-хлор-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-морфолін-4-ілпіримідин-4-карбоксамід;
 5-хлор-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-метил-1-феніл-1H-піразол-4-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-метил-1,2,3-тіадіазол-5-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2,1,3-бензоксадіазол-5-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-[[імідазо[1,2-а]піридин-2-ілметил]тіо]ацетамід;
 2-(ацетиламіно)-N-((1R,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-йодбензил)аміно]пропіл)-1,3-оксазол-4-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-[3-(циклогексилметил)бензил]-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл)ацетамід;
 12-[[[(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]аміно]карбоніл]аміно]-N,N-дипропілетансульфонамід;
 2-(3-азабіцикло[3.2.2]нон-3-іл)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-йодбензил)аміно]пропіл)ацетамід;
 2-(4-бензоілфенокси)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-йодбензил)аміно]пропіл)пропанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-йодбензил)аміно]пропіл)-4-(7-метокси-2,3-дигідро-1-бензофуран-4-іл)-4-оксобутанамід;
 N-((1S,2R)-1-[3-(циклогексилметил)бензил]-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл)-3-[[[трифторметил]сульфоніл]аміно]бензамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-[3-(циклогексилметил)бензил]-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 3-хлор-N-((1S,2R)-1-(4-фторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-трифторметил)бензил]аміно]пропіл)бензамід;
 3-хлор-N-((1S,2R)-1-(4-фторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл)бензамід;
 3-хлор-N-((1S,2R)-1-(циклогексилметил)-2-гідрокси-3-[(3-трифторметил)бензил]аміно]пропіл)бензамід;
 3-хлор-N-((1S,2R)-1-(циклогексилметил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл)бензамід;
 N-((1S,2S)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-трифторметил)бензил]аміно]пропіл)-3-хлорбензамід;
 N-((1S,2S)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл)-3-хлорбензамід;
 3-[[[(3-хлорбензил)аміно]сульфоніл]-N-((1S,2R)-1-(4-фторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-трифторметил)бензил]аміно]пропіл)бензамід;
 3-[[[(3-хлорбензил)аміно]сульфоніл]-N-((1S,2R)-1-(4-фторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл)бензамід;
 3-[[[(3-хлорбензил)аміно]сульфоніл]-N-((1S,2R)-1-(циклогексилметил)-2-гідрокси-3-[(3-трифторметил)бензил]аміно]пропіл)бензамід;
 3-[[[(3-хлорбензил)аміно]сульфоніл]-N-((1S,2R)-1-(циклогексилметил)-2-гідрокси-3-[(3-

метоксибензил)аміно]пропіл)бензамід;
 N-((1S,2S)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл)-3-[[[(3-хлорбензил)аміно]сульфоніл]бензамід;
 N-((1S,2R)-1-(4-фторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл)-3-[[[(3-метоксибензил)аміно]сульфоніл]бензамід;
 N-((1S,2R)-1-(циклогексилметил)-2-гідрокси-3-[(3-трифторметил)бензил]аміно]пропіл)-3-[[[(3-метоксибензил)аміно]сульфоніл]бензамід;
 N-((1S,2R)-1-(циклогексилметил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл)-3-[[[(3-метоксибензил)аміно]сульфоніл]бензамід;
 N-((1S,2S)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл)-3-[[[(3-метоксибензил)аміно]сульфоніл]бензамід;
 N¹-[(1R,2S)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]-1-(4-метилбензил)пропіл]-N³,N³-дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N¹-[(1R,2S)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)-1-(4-метилбензил)пропіл]-N³,N³-дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N¹-[(1R,2S)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]-1-(4-метилбензил)пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1R,2S)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)-1-(4-метилбензил)пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1R,2S)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]-1-(4-метилбензил)пропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
 N¹-[(1R,2S)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)-1-(4-метилбензил)пропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
 3-[[[дипропіламіно]сульфоніл]-N-((1R,2S)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]-1-(4-метилбензил)пропіл)пропанамід;
 3-[[[дипропіламіно]сульфоніл]-N-((1R,2S)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)-1-(4-метилбензил)пропіл)пропанамід;
 N¹-[(1S,2R)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]-1-(4-метилбензил)пропіл]пропанамід;
 N¹-[(1S,2R)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]-1-(4-метилбензил)пропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
 N¹-[(1S,2R)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]-1-(4-метилбензил)пропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
 N-((1S,2R)-3-(бензиламіно)-2-гідрокси-1-(4-метилбензил)пропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
 N¹-[(1S,2R)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)-1-(4-метилбензил)пропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
 N-((1S,2R)-3-(бензиламіно)-2-гідрокси-1-(4-метилбензил)пропіл)-3-[[[дипропіламіно]сульфоніл]пропанамід;
 3-[[[дипропіламіно]сульфоніл]-N-((1S,2R)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)-1-(4-метилбензил)пропіл)пропанамід;
 N-((1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл)-3-(4,5-диметил-2-фуроіл)-5-метилбензамід;
 N-((1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл)-2-гідрокси-3-(ізопентилсульфоніл)пропанамід;
 N-((1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл)-3-[[[2-метоксіетил](пропіл)аміно]сульфоніл]пропанамід;
 N¹-[(1R,2R)-3-(бензиламіно)-2-гідрокси-1-[(фенілтіо)метил]пропіл]-N³,N³-дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N¹-[(1R,2R)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)-1-[(фенілтіо)метил]пропіл]-N³,N³-дипропілбензол-

дипропілізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-1-(2-фурилметил)-2-гідроксі-3-(ізопентиламіно)пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-[3-(бензилокси)бензил]-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-1-[3-(бензилокси)бензил]-2-гідроксі-3-(ізопентиламіно)пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-1-(4-фторбензил)-2-гідроксі-3-(ізопентиламіно)пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-2-гідроксі-3-(ізопентиламіно)-1-(тіен-2-ілметил)пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
N¹-[(1S)-1-[(1R)-1-гідрокси-2-[(3-метоксибензил)аміно]етил]бут-3-ініл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
N¹-[(1S)-1-[(1R)-2-(бензиламіно)-1-гідроксіетил]бут-3-ініл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
N¹-[(1S)-1-[(1R)-1-гідроксі-2-(ізопентиламіно)етил]бут-3-ініл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-1-(циклогексилметил)-2-гідроксі-3-(ізопентиламіно)пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
N¹-[(1S)-1-[(1R)-1-гідроксі-2-(ізопентиламіно)етил]-3-метилбутил]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
N¹-[(1R,2R)-2-гідроксі-3-[(3-метоксибензил)аміно]-1-[(фенілтіо)метил]пропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
N¹-[(1R,2R)-3-(бензиламіно)-2-гідрокси-1-[(фенілтіо)метил]пропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
N¹-[(1R,2R)-2-гідроксі-3-(ізопентиламіно)-1-[(фенілтіо)метил]пропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
N¹-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-[4-(бензилокси)бензил]-2-гідроксипропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
N¹-[(1S,2R)-1-[4-(бензилокси)бензил]-2-гідроксі-3-(ізопентиламіно)пропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
N¹-[(1S,2R)-2-гідроксі-3-[(3-метоксибензил)аміно]-1-(1-нафтилметил)пропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
N¹-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-2-гідрокси-1-(1-нафтилметил)пропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
N¹-[(1S,2R)-2-гідроксі-3-(ізопентиламіно)-1-(1-нафтилметил)пропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
N¹-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(2-фурилметил)-2-гідроксипропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
N¹-[(1S,2R)-1-(2-фурилметил)-2-гідроксі-3-(ізопентиламіно)пропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
N¹-[(1S,2R)-1-[3-(бензилокси)бензил]-2-гідроксі-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
N¹-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-[3-(бензилокси)бензил]-2-гідроксипропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
N¹-[(1S,2R)-1-[3-(бензилокси)бензил]-2-гідроксі-3-(ізопентиламіно)пропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;

3-(ізопентиламіно)-1-(1-нафтилметил)пропілпропанамід;
 3-[(дипропіламіно)сульфоніл]-N-[(1S,2R)-1-(3-фтор-4-метоксибензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]пропанамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(4-хлорбензил)-2-гідроксипропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
 N-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(2-фурилметил)-2-гідроксипропіл]-3-[(дипропіламіно)сульфоніл]пропанамід;
 N-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(3-фтор-4-метоксибензил)-2-гідроксипропіл]-3-[(дипропіламіно)сульфоніл]пропанамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(4-хлорбензил)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)пропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
 3-[(дипропіламіно)сульфоніл]-N-[(1S,2R)-1-(2-фурилметил)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)пропіл]пропанамід;
 3-[(дипропіламіно)сульфоніл]-N-[(1S,2R)-1-(3-фтор-4-метоксибензил)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)пропіл]пропанамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(1,3-бензодіоксол-5-ілметил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-феніл-2-(4H-1,2,4-триазол-3-ілтіо)ацетамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(1,3-бензодіоксол-5-ілметил)-3-(бензиламіно)-2-гідроксипропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
 1-ацетил-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-фенілпропінамід;
 N-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-[3-(бензилокси)бензил]-2-гідроксипропіл]-3-[(дипропіламіно)сульфоніл]пропанамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(1,3-бензодіоксол-5-ілметил)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)пропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;



N-[(1S,2R)-1-[3-(бензилокси)бензил]-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)пропіл]-3-[(дипропіламіно)сульфоніл]пропанамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(4-фтор-3-метилбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
 N-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(4-фторбензил)-2-гідроксипропіл]-3-[(дипропіламіно)сульфоніл]пропанамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(4-фтор-3-метилбензил)-2-гідроксипропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
 3-[(дипропіламіно)сульфоніл]-N-[(1S,2R)-1-(4-фторбензил)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)пропіл]пропанамід;
 N'-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3R,4S)-3-(гідроксиметил)-6-ізопропіл-2,2-діоксидо-3,4-дигідро-1H-ізотіохромен-4-іл]аміно}пропіл]-5-метил-N,N-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(4-фтор-3-метилбензил)-2-гідрокси-3-

(ізопентиламіно)пропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
 N'-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3R,4S)-6-ізопропіл-3-метил-2,2-діоксидо-3,4-дигідро-1H-ізотіохромен-4-іл]аміно}пропіл]-5-метил-N,N-дипропілізофталамід;
 N-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-2-гідрокси-1-(тієн-2-ілметил)пропіл]-3-[(дипропіламіно)сульфоніл]пропанамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-2-гідрокси-1-[3-(трифторметил)бензил]пропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
 3-[(дипропіламіно)сульфоніл]-N-[(1S)-1-[(1R)-1-гідрокси-2-[(3-метоксибензил)аміно]етил]бут-3-иніл]пропанамід;
 N'-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3R,4S)-6-ізопропіл-2,2-діоксидо-3-пропіл-3,4-дигідро-1H-ізотіохромен-4-іл]аміно}пропіл]-5-метил-N,N-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)-1-[3-(трифторметил)бензил]пропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
 N-[(1S)-1-[(1R)-2-(бензиламіно)-1-гідроксіетил]бут-3-иніл]-3-[(дипропіламіно)сульфоніл]пропанамід;
 N¹-[(1S,2R)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]-1-(3-метилбензил)пропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
 3-[(дипропіламіно)сульфоніл]-N-[(1S)-1-[(1R)-1-гідрокси-2-(ізопентиламіно)етил]бут-3-иніл]пропанамід;
 N'-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3S,4R)-3-(гідроксиметил)-6-ізопропіл-2,2-діоксидо-3,4-дигідро-1H-ізотіохромен-4-іл]аміно}пропіл]-5-метил-N,N-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-2-гідрокси-1-(3-метилбензил)пропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3S,4R)-3-(2-гідроксіетил)-6-ізопропіл-2,2-діоксидо-3,4-дигідро-1H-ізотіохромен-4-іл]аміно}пропіл]-5-метил-N,N-дипропілізофталамід;
 N-[(1S,2R)-1-(циклогексилметил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-3-[(дипропіламіно)сульфоніл]пропанамід;
 N¹-[(1S,2R)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)-1-(3-метилбензил)пропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
 N-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(циклогексилметил)-2-гідроксипропіл]-3-[(дипропіламіно)сульфоніл]пропанамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-[3-(бензилокси)-5-фторбензил]-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
 N'-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3S,4S)-6-ізопропіл-2,2-діоксидо-3-пропіл-3,4-дигідро-1H-ізотіохромен-4-іл]аміно}пропіл]-5-метил-N,N-дипропілізофталамід;
 N-[(1S,2R)-1-(циклогексилметил)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)пропіл]-3-[(дипропіламіно)сульфоніл]пропанамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-[3-(бензилокси)-5-фторбензил]-2-гідроксипропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
 3-[(дипропіламіно)сульфоніл]-N-[(1S)-1-[(1R)-1-гідрокси-2-[(3-метоксибензил)аміно]етил]-3-метилбутил]пропанамід;
 N'-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3S,4S)-6-ізопропіл-3-метил-2,2-діоксидо-3,4-

дигідро-1H-ізотіохромен-4-іл]аміно}пропіл)-5-метил-N,N-дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-[3-(бензилокси)-5-фторбензил]-2-гідроксі-3-(ізопентиламіно)пропіл]- N^5 , N^5 -дипропілпентандіамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-[(4R)-6-ізопропіл-2,2-діоксидо-3,4-дигідро-1H-ізотіохромен-4-іл]аміно}пропіл)-5-метил-N,N-дипропілізофталамід;
 N -[(1S)-1-[(1R)-2-(бензиламіно)-1-гідроксіетил]-3-метилбутил]-3-[(дипропіламіно)сульфоніл]пропанамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3-фтор-4-метоксибензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]- N^5 , N^5 -дипропілпентандіамід;
3-[(дипропіламіно)сульфоніл]- N -[(1S)-1-[(1R)-1-гідроксі-2-(ізопентиламіно)етил]-3-метилбутил]пропанамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-[(3-метоксипропіл)(метилсульфоніл)аміно]бензамід;
 N^1 -[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(3-фтор-4-метоксибензил)-2-гідроксипропіл]- N^5 , N^5 -дипропілпентандіамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-[(3-метоксипропіл)(метилсульфоніл)аміно]бензамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-1-метил-1,3-дигідро-2,1-бензизотіазол-5-карбоксаміду 2,2-діоксид;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3-фтор-4-метоксибензил)-2-гідроксі-3-(ізопентиламіно)пропіл]- N^5 , N^5 -дипропілпентандіамід;
 N^1 -[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-2-гідрокси-1-(3-метоксибензил)пропіл]- N^3 , N^3 -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-[(2-метоксіетил)(метилсульфоніл)аміно]бензамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2,2-диметилхроман-6-карбоксамід;
 N^1 -[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(3-бромбензил)-2-гідроксипропіл]- N^5 , N^5 -дипропілпентандіамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-6-[(2-метоксіетил)(метилсульфоніл)аміно]нікотинамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2,2-диметилхроман-7-карбоксамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3-бромбензил)-2-гідроксі-3-(ізопентиламіно)пропіл]- N^5 , N^5 -дипропілпентандіамід;
 N^1 -[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-2-гідроксі-1-(4-ізопропілбензил)пропіл]- N^3 , N^3 -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
бензил-(3R)-4-[(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]аміно)-2,2,3-триметил-4-оксобутаноат;
 N -[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-2-гідрокси-1-(3-метоксибензил)пропіл]-3-[(дипропіламіно)сульфоніл]пропанамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-6-[(3-гідроксіпро-

піл)(метилсульфоніл)аміно]нікотинамід;
 N^1 -[(1S,2R)-2-гідроксі-3-(ізопентиламіно)-1-(4-ізопропілбензил)пропіл]- N^3 , N^3 -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
3-[(дипропіламіно)сульфоніл]- N -[(1S,2R)-2-гідроксі-3-(ізопентиламіно)-1-(3-метоксибензил)пропіл]пропанамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-6-[(2-гідроксіетил)(метилсульфоніл)аміно]нікотинамід;
 N -[(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-4-(фенілсульфоніл)бутанамід;
(3S)-тетрагідрофуран-3-іл(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропілкарбамат;
 N -[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(3,5-дихлорбензил)-2-гідроксипропіл]-3-[(дипропіламіно)сульфоніл]пропанамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-6-[(2-метоксіетил)(метилсульфоніл)аміно]нікотинамід;
 N^1 -[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-2-гідрокси-1-(4-метоксибензил)пропіл]- N^3 , N^3 -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
3-[(дипропіламіно)сульфоніл]- N -[(1S,2R)-2-гідроксі-1-(4-ізопропілбензил)-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]пропанамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-[(2-метоксіетил)(метилсульфоніл)аміно]ізонікотинамід;
 N^1 -[(1S,2R)-2-гідроксі-3-(ізопентиламіно)-1-(4-метоксибензил)пропіл]- N^3 , N^3 -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]- N^3 -(фенілсульфоніл)-бета-аланінамід;
 N -[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-2-гідроксі-1-(4-ізопропілбензил)пропіл]-3-[(дипропіламіно)сульфоніл]пропанамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-[(2-метоксіетил)(метилсульфоніл)аміно]нікотинамід;
 N^1 -[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(4-фтор-3-метилбензил)-2-гідроксипропіл]- N^3 , N^3 -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]- N^3 -(4-метилфеніл)сульфоніл]-бета-аланінамід;
3-[(дипропіламіно)сульфоніл]- N -[(1S,2R)-2-гідроксі-3-(ізопентиламіно)-1-(4-ізопропілбензил)пропіл]пропанамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-[(3-гідроксіпропіл)(метилсульфоніл)аміно]ізонікотинамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3-фтор-4-метоксибензил)-2-гідроксі-3-(ізопентиламіно)пропіл]- N^3 , N^3 -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]- N^3 -(4-фторфеніл)сульфоніл]-бета-аланінамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-[(2-гідроксіе-

(метилсульфоніл)-1Н-індол-5-карбоксамід;
N¹-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(4-фтор-3-метилбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-N²-(бензилсульфоніл)гліцинамід;
N-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-2-гідрокси-1-(4-метоксибензил)пропіл]-3-[(дипропіламіно)сульфоніл]пропанамід;
N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-1-(метилсульфоніл)індолін-5-карбоксамід;
N-[(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-3-[(4-фторфеніл)сульфоніл]пропанамід;
N¹-[(1S,2R)-1-(4-фтор-3-метилбензил)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
3-[(дипропіламіно)сульфоніл]-N-[(1S,2R)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)-1-(4-метоксибензил)пропіл]пропанамід;
N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-1-(метилсульфоніл)індолін-4-карбоксамід;
N¹-[(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-N³-(4-хлорфеніл)сульфоніл]-бета-аланінамід;
N¹-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-2-гідрокси-1-[3-(трифторметил)бензил]пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
N-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(4-хлорбензил)-2-гідроксипропіл]-3-[(дипропіламіно)сульфоніл]пропанамід;
N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-1-(метилсульфоніл)індолін-6-карбоксамід;
N¹-[(1S,2R)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)-1-(3-метилбензил)пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-N³-(бензилсульфоніл)-бета-аланінамід;
N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-1-(метилсульфоніл)-1Н-індол-4-карбоксамід;
N-[(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-3-[(4-метоксибензил)сульфоніл]пропанамід;
N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-[1-метил-1-(метилсульфоніл)етил]бензамід;
N-[(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-3-[(4-метилфеніл)сульфоніл]пропанамід;
N¹-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(3-фтор-4-метоксибензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-[1-метил-1-(метилсульфоніл)етил]бензамід;
N¹-[(1S,2R)-2-гідрокси-1-(3-метоксибензил)-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
N¹-[(1S,2R)-N⁴-(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-2,2-

диметилсукцинамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(етилсульфоніл)бензамід;
 N-((1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл)-3-(1,1-діоксидо-3-оксо-1,2-бензизотіазол-2(3H)-іл)пропанамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-2-гідрокси-1-(3-метоксибензил)пропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(пропілсульфоніл)бензамід;
 N-((1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл)-3-(1,3-діоксо-1,3-дигідро-2H-ізоіндол-2-іл)пропанамід;
 N¹-[(1S,2R)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)-1-(3-метоксибензил)пропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
 (2R)-N-((1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл)-2-метил-3-(фенілсульфоніл)пропанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(пентилсульфоніл)бензамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(3-хлор-5-фторбензил)-2-гідроксипропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
 (2S)-N-((1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл)-2-метил-3-(фенілсульфоніл)пропанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-[(2-гідроксіетил)сульфоніл]бензамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3-хлор-5-фторбензил)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)пропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-[(2-метоксіетил)сульфоніл]бензамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дихлорбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
 N¹-бензил-N⁵-[(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]пентандіамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-[(2-етоксіетил)сульфоніл]бензамід;
 N-((1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл)-2-[(фенілсульфоніл)метил]акриламід;
 N¹-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(3,5-дихлорбензил)-2-гідроксипропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-[(3-гідроксипропіл)сульфоніл]бензамід;
 N-((1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл)-2-[(ізопентилсульфоніл)метил]акриламід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дихлорбензил)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)пропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2,3-дигідро-1-бензотіофен-5-карбоксаміду 1,1-діоксид;
 N¹-[(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-

метоксибензил)аміно]пропіл]-N³-[(дипропіламіно)карбоніл]-бета-аланінамід;
 N¹-[(1S,2R)-2-гідрокси-1-(4-ізопропілбензил)-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1-бензотіофен-5-карбоксаміду 1,1-діоксид;
 N¹-[(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-N²-[(дипропіламіно)карбоніл]гліцинамід;
 бензил-(4R)-4-[[[(1S,2R)-1-бензил-3-[(3-диметиламіно)-2,2-диметилпропіл]аміно]-2-гідроксипропіл]аміно]карбоніл]-1,3-оксазолідин-3-карбоксилатна сполука з метил-гідропероксидом (1:2);
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2,3-дигідро-1-бензотіофен-6-карбоксаміду 1,1-діоксид;
 трет-бутил-(2R,3S)-2-гідрокси-3-[(2-гідрокси-3-[(3-метоксифеніл)сульфоніл]пропаноїл]аміно)-4-фенілбутил(3-метоксибензил)карбамат;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1-бензотіофен-6-карбоксаміду 1,1-діоксид;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-метил-2,3-дигідро-1,2-бензизотіазол-6-карбоксаміду 1,1-діоксид;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-метил-2,3-дигідро-1,2-бензизотіазол-5-карбоксаміду 1,1-діоксид;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1-метил-1,3-дигідро-2,1-бензизотіазол-6-карбоксаміду 2,2-діоксид;
 N¹-[(1S,2R)-1-[3-(бензилокси)-5-фторбензил]-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-[3-(бензилокси)-5-фторбензил]-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-[3-(бензилокси)-5-фторбензил]-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)пропіл]-N³,N³-дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-[3-(бензилокси)бензил]-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл)-3-[(дипропіламіно)сульфоніл]пропанамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(циклогексилметил)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-[4-(бензилокси)бензил]-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(циклогексилметил)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)пропіл]-N³,N³-дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(циклогексилметил)-2-гідроксипропіл]-N³,N³-дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-[3-(бензилокси)бензил]-2-гідроксипропіл]-N³,N³-дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-[4-(бензилокси)бензил]-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)пропіл]-N³,N³-дипропілбензол-

1,3,5-трикарбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл)-3-гідрокси(2-метилфеніл)метил-5-метилбензамід;
 N¹-[(1R,2S)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)-1-(4-метилбензил)пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1R,2S)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]-1-(4-метилбензил)пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1R,2S)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)-1-(4-метилбензил)пропіл]-N³,N³-дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N¹-[(1R,2S)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]-1-(4-метилбензил)пропіл]-N³,N³-дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 3-хлор-N-((1S,2R)-1-(циклогексилметил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл)бензамід;
 3-хлор-N-((1S,2R)-1-(циклогексилметил)-2-гідрокси-3-[(3-(трифторметил)бензил)аміно]пропіл)бензамід;
 бензил-(2R,3S)-4-(3,5-дифторфеніл)-3-[(3-(4,4-диметил-2,5-діоксоімідазолідин-1-іл)-2-[(1-пропілбутил)сульфоніл]метил)-пропаноїл]аміно]-2-гідроксибутил(3-етилбензил)карбамат;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-йодбензил)аміно]пропіл)-7-(1H-імідазол-1-іл)-5,6-дигідронафтален-2-карбоксамід;
 2-[[[(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)-аміно]пропіл]аміно]карбоніл]аміно]-N,N-дипропілетансульфонамід;
 бензил-(2R,3S)-4-(3,5-дифторфеніл)-2-гідрокси-3-[(N-(3-фенілпропаноїл)-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]аланіл)аміно]бутил(3-етилбензил)карбамат;
 N¹-[(1S,2R)-3-[(бензилокси)карбоніл](3-етилбензил)аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-N²-[[[(3S)-тетрагідрофуран-3-ілокси]карбоніл]-D-лейцинамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-[(1,3)оксазол[4,5-b]піридин-2-ілтіо)ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-[(імідазо[1,2-a]піридин-2-ілметил)тіо]ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-[(5,7-диметил[1,2,4]триазол[4,3-a]піримідин-3-іл)тіо]ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2,3-дигідро-1H-циклопента[b]хінолін-9-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-гідрокси-6-оксо-1-феніл-1,6-дигідропіридазин-3-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1,3-діоксоізоіндолін-5-карбоксамід;
 1-бензил-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1H-імідазол-2-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(4,4-диметил-4,5-дигідро-1,3-оксазол-2-іл)тіофен-3-

карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-ізобутил-1,3-діоксоізоіндолін-5-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-оксо-2-фенілпіразолідин-3-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5,6-диметил-4-оксо-3,4-дигідротієно[2,3-d]піримідин-2-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[(2,4-дифторбензил)окси]пропанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)тієно[2,3-c]піридин-2-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(2-метил-1H-бензимидазол-1-іл)-4-оксобутанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-(2,5-діоксопіролідин-1-іл)-4-метилбензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)тієно[3,2-b]піридин-6-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(2,3-дигідро-1H-індол-1-іл)-4-оксобутанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(1,3-діоксооктагідро-2H-ізоіндол-2-іл)бутанамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N³-[(4-метилфеніл)сульфоніл]-бета-аланінамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(1H-індол-3-іл)-4-оксобутанамід;
 N²-(анілінокарботіоїл)-N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]гліцинамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-метил-4-оксо-4,5,6,7-тетрагідро-1H-індол-2-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5,6,7,8-тетрагідро-4H-циклопента[c]ізоксазол-3-карбоксамід;
 4-[2-(діетиламіно)етокси]-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)бензамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N²-[(4-метилфеніл)сульфоніл]гліцинамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(3,5-діоксо-1,2,4-триазолідин-4-іл)бензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(2-гідроксіетокси)бензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(1,3-дитіан-2-іл)-3-фурамід;
 4-(3-хлорфеніл)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-гідрокси-4-оксобутанамід або 2479;

N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-метил-5,6,7,8-тетрагідро-4Н-піразоло[1,5-а]азепін-3-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1-(4-фторфеніл)-1,4,5,6-тетрагідроциклопента[с]піразол-3-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5,6-дигідро-4Н-циклопента[б]тіофен-2-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3,6,6-триметил-4-оксо-4,5,6,7-тетрагідро-1-бензофуран-2-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-7-метокси-4-оксо-1,2,3,4-тетрагідронафтален-2-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2,3-діоксо-1,2,3,4-тетрагідрокінокалін-6-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4,5,6,7-тетрагідро-2Н-індазол-3-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-метил-4-оксо-3,4-дигідротієно[2,3-с]піримідин-6-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-7-фтор-4Н-імідазо[5,1-с][1,4]бензоксазин-3-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(3-фтор-4-метоксифеніл)-4-оксобутанамід;
 метил-4-(((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)аміно)-4-оксобутил-(дитіокарбамат);
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)[1,2,4]триазоло[4,3-а]піридин-6-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1-феніл-1,4,5,6-тетрагідроциклопента[с]піразол-3-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-[(4-метилфеніл)сульфоніл]ацетамід;
 3-(2-хлорфеніл)-2-ціано-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)пропанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(4-метилфеніл)-4-оксобутанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(2-гідрокси-5-метилфеніл)-4-оксобутанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-(2,5-діоксо-2,5-дигідро-1Н-пірол-1-іл)бензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-оксо-4-тієн-2-ілбутанамід або 2379;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(2,5-діоксо-2,5-дигідро-1Н-пірол-1-іл)-2-гідроксибензамід;

N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(2,5-діоксопіролідін-1-іл)бензамід;
 4-[(амінокарбоніл)аміно]-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)бензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-[(трифторацетил)аміно]бутанамід;
 5-бром-N¹-((1S,2R)-2-гідрокси-1-(пентафторбензил)-3-[(3-трифторметил)бензил)аміно]пропіл)-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-[(1-гідроксициклопентил)тіо]ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-(2-оксоциклогексил)пропанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(2-нафтил)-4-оксобутанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-оксо-2,3-дигідро-1Н-індазол-4-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1,3-диметил-1Н-тієно[2,3-с]піразол-5-карбоксамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-N²-[(диметиламіно)сульфоніл]валінамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(2-фурил)-4-оксобутанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(5-метил-4-феніл-1,3-оксазол-2-іл)бензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2,6-діоксогексагідропіримідин-4-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5,7-диметокси-1-оксоіндан-2-карбоксамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-N⁵-(2-піридин-2-ілетил)пентандіамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-[4-(2-фурил)піперазин-1-іл]-4-оксобутанамід;
 N'-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-(1Z)-проп-1-ен-1-іл)бензил)аміно]пропіл)-5-метил-N,N-дипропілізофталамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-оксо-4,5,6,7-тетрагідро-1-бензофуран-3-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-оксо-1-(тієн-2-ілметил)піролідін-3-карбоксамід;
 2-[(ціанометил)тіо]-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)нікотинамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1-(2-фурил)-4-гідроксипролінамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4,5-

дигідрофуру[2,3-g][2,1]бензизоксазол-8-карбоксамід;
метил-3-[[[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]аміно]карбоніл]-5-метилтіофен-2-сульфенат;
2-(ацетиламіно)-2-(1H-1,2,3-бензотриазол-1-іл)-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]ацетамід;
1-[[[(циклогексиламіно)карбоніл]аміно]-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]циклопропанкарбоксамід;
N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-(2-етил-4H-[1,2,4]триазоло[1,5-a]бензимидазол-4-іл)ацетамід;
(2E)-N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N⁴-[4-(1,3-оксазол-5-іл)феніл]бут-2-ендіамід;
N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-1,3,4,5-тетрагідротіопірано[4,3-b]індол-8-карбоксамід;
4-хлор-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-1,3-диметил-1H-піразоло[3,4-b]піридин-5-карбоксамід;
N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-(3,4-дигідро-2H-1,5-бензодіоксепін-7-іл)-4-оксобутанамід;
N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-(1-оксидотіоморфолін-4-іл)бутанамід;
N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-оксо-4-(2-тіоксо-1,3-бензотіазол-3(2H)-іл)бутанамід;
N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-8H-тієно[2,3-b]індол-2-карбоксамід;
N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3,4-дигідро-2H-1,5-бензодіоксепін-7-карбоксамід;
N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4H-хромено[3,4-d]ізоксазол-4-карбоксамід;
4-(3,4-дихлорфеніл)-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-оксобутанамід;
N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-(3,4-дифторфеніл)-4-оксобутанамід;
N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-(3,4-дифторфеніл)-2-метил-4-оксобутанамід;
N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-(3,4-дифторфеніл)-2-метокси-4-оксобутанамід;
N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-гідроксі-4-оксо-4-тієн-2-ілбутанамід;
4-(3,4-дихлорфеніл)-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-гідроксі-3-метил-4-оксобутанамід;
N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-

етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-[(2-етил-1-оксо-2,3-дигідро-1H-ізоіндол-5-іл)окси]пропанамід;
N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-оксоізоіндолін-1-карбоксамід;
N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-(7-метокси-1-бензофуран-2-іл)-4-оксобутанамід;
N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4H-хромено[3,4-d]ізоксазол-8-карбоксамід;
N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-метил-4-оксо-4H-хромен-6-карбоксамід;
N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-[(1,2,4]триазоло[4,3-b]піридазин-6-ілтіо)ацетамід;
N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-(1,1-діоксидотетрагідротієн-2-іл)ацетамід;
N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-(3,4-дигідро-2H-хромен-6-іл)-4-оксобутанамід;
N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-етил-3-оксоізоіндолін-1-карбоксамід;
4-[2-(ацетиламіно)-4,5-диметилфеніл]-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-оксобутанамід;
N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-(4-гідроксифеніл)-4-оксобутанамід;
2-[(6-хлор[1,2,4]триазоло[4,3-b]піридазин-3-іл)окси]-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]ацетамід;
N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-гідрокси-4-(3-метоксифеніл)-4-оксобутанамід;
N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-гідроксі-4-оксо-4-тієн-3-ілбутанамід;
3-хлорфеніл-4-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]аміно)-4-оксобутаноат;
4-(4-хлор-2-гідроксифеніл)-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-оксобутанамід;
N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-6-[(4-метилфеніл)сульфоніл]аміно)-4-оксогексанамід;
N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-(6-гідроксі-3-оксо-2,3-дигідроімідазо[2,1-b][1,3]тіазол-2-іл)ацетамід;
N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-(4,5-дигідро-1,3-тіазол-2-ілтіо)ацетамід;
N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-1H-імідазо[1,2-b]піразол-6-карбоксамід;
4-(1-бензофуран-2-іл)-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-оксобутанамід;
N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-(6-метокси-1,1'-дифеніл-3-іл)-4-оксобутанамід;

N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(4-метоксифеніл)-4-оксобутанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(2,3-дигідро-1,4-бензодіоксин-6-іл)-4-оксобутанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(2-оксо-2,3-дигідро-1,3-бензоксазол-5-іл)ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(2-оксо-2,3-дигідро-1H-бензimidазол-5-іл)ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-9-оксо-1,2,3,9-тетрагідроциклопента[b]хромен-7-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1-метил-1H-бензо[g]індазол-3-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4,5-дигідронафто[2,1-d]ізоксазол-3-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(тетразоло[1,5-b]піридазин-6-ілтіо)ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(5-метил-1H-пірол-2-іл)-4-оксобутанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-[[[трифторметил]сульфоніл]аміно]бутанамід;
 N-[(1S,2R)-3-(2-ацетил-1-етилгідазино)-1-бензил-2-гідроксипропіл]-2-[(метилсульфоніл)аміно]-1,3-тіазол-4-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-(1-гідрокси-2-пропілпентил)бензамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-[(2-(4-[(3-хлорбензил)окси]феніл)етил)аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-морфолін-4-ілпропіл)аміно]пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 етил-4-[(2R,3S)-4-(3,5-дифторфеніл)-3-[(3-дипропіламіно)карбоніл]-5-метилбензоіл)аміно]-2-гідроксибутил)аміно]піперидин-1-карбоксилат;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N²-[(метилсульфоніл)ацетил]-N²-пентилгліцинамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[(2R)-2-(метоксиметил)піролідин-1-іл]сульфонілпропанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[(2S)-2-(метоксиметил)піролідин-1-іл]сульфонілпропанамід;
 етил-4-[(2R,3S)-3-[(3-дипропіламіно)карбоніл]бензоіл)аміно]-2-гідрокси-4-фенілбутил)аміно]піперидин-1-карбоксилат;
 N¹-[(1S,2R)-1-бензил-3-[(3R)-1-бензилпіролідин-3-іл)аміно]-2-гідроксипропіл)-N³,N³-дипропілізофталамід;
 метил-(2E)-2-[2-((1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-

метоксibenзил)аміно]пропіл)аміно]-2-оксоетил]-4-метилпент-2-еноат;
 N¹-[(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксibenзил)аміно]пропіл]-N⁴-(4-метоксibenзил)сукцинамід;
 N-((1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксibenзил)аміно]пропіл)-3-[(4-фторфеніл)сульфоніл]аміно]-3-метилбутанамід;
 N-((1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксibenзил)аміно]пропіл)-9,10-діоксо-9,10-дигідроантрацен-2-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксibenзил)аміно]пропіл)-4-(бензилокси)бензамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксibenзил)аміно]пропіл]-N-метил-N-фенілсечовина;
 N¹-[(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксibenзил)аміно]пропіл]-N,N-діізопропілсечовина;
 N¹-[(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксibenзил)аміно]пропіл]-N,N-дифенілсечовина;
 N¹-[(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксibenзил)аміно]пропіл]-N,N-диметилсечовина;
 метил-2-[[[(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксibenзил)аміно]пропіл)аміно]карбоніл]аміно]бензоат;
 феніл-(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксibenзил)аміно]пропілкарбамат;
 2-метоксіетил-(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксibenзил)аміно]пропілкарбамат;
 2-(бензилокси)етил-(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксibenзил)аміно]пропілкарбамат;
 проп-2-ініл-(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксibenзил)аміно]пропілкарбамат;
 (1R,2S,5R)-2-ізопропіл-5-метилциклогексил-(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксibenзил)аміно]пропілкарбамат;
 пентил-(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксibenзил)аміно]пропілкарбамат;
 неопентил-(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксibenзил)аміно]пропілкарбамат;
 N¹-[(1S,2R)-3-[(6-хлорімідазо[2,1-b][1,3]тіазол-5-іл)метил]аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(4-оксо-4H-хромен-3-іл)метил]аміно]пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(1,7,7-триметилбіцикло[2.2.1]гепт-2-іл)аміно]пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-йодбензил)аміно]пропіл)-4-(3-метил-5-оксо-4,5-дигідро-1H-піразол-1-іл)бензамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-[(1-ацетилпіперидин-3-іл)аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N³-етокси-5-метилізофталамід;
 N¹-(аліокси)-N³-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-

метилізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)- N^3 -ізобутоксид-5-метилізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-метил- N^3 -(2,2,3,3,3-пентафторпропіл)ізофталамід;
 етил-4-((3-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)аміно)карбоніл)-5-метилбензоїл)аміно)бутаноат;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-метил- N^3 , N^3 -біс(2,2,2-трифторетил)ізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)- N^3 -етил- N^3 -[(1-етилпіперидин-4-іл)карбоніл]-5-метилізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)- N^3 -(2,2,3,3,4,4,4-гептафторбутил)-5-метилізофталамід;
 N^1 -(1-бензилпіролідин-3-іл)- N^3 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)- N^1 -етил-5-метилізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-метил- N^3 -(тетрагідрофуран-2-ілметил)ізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-[(3R)-2-оксоазепан-3-іл]аміно)пропіл)-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(1,1-діоксидо-3,4-дигідро-2H-1,2-бензотіазин-4-іл)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-[2-(4-метилпентаноїл)гідразино]пропіл)-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[(3-етилфеніл)сульфоніл]пропанамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2,2,3,3,4,4-гексафтор- N^5 , N^5 -дипропілпентандіамід;
 N^5 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-феніл- N^1 , N^1 -дипропілпентандіамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[(3-гідроксипропіл)(метилсульфоніл)аміно]бензамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-[(2-гідроксіетил)(метилсульфоніл)аміно]бензамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-[(2R)-2-(метоксиметил)піролідин-1-іл]сульфоніл)- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-[(3-гідроксипропіл)(метилсульфоніл)аміно]бензамід;
 5-бром- N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-[(3-йодбензил)аміно]пропіл)- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[(трифторметил)сульфоніл]аміно)бензамід;

N^1 -[(1S,2R)-2-гідроксі-3-[(3-метоксибензил)аміно]-1-(тієн-2-ілметил)пропіл]- N^3 , N^3 -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-(4-метил-1,3-оксазол-2-іл)- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)- N^3 , N^3 -дипропіл-5-(1,3-тіазол-2-іл)ізофталамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[(метилсульфоніл)аміно]бензамід;
 4-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)аміно)-4-оксо-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]метил)масляної кислоти трифторацетат;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-(ізопентиламіно)пропіл]-5-[(метилсульфоніл)аміно]- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-(1,3-оксазол-2-іл)- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]пропанамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл)-5-(1,3-оксазол-2-іл)- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-[(3-йодбензил)аміно]пропіл)-2-[(метилсульфоніл)аміно]-1,3-тіазол-4-карбоксамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-(ізопентиламіно)пропіл]- N^3 , N^3 -дипропіл-5-[(трифторметил)сульфоніл]аміно)ізофталамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-(ізопентилсульфоніл)пропанамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[(1-метил-1H-імідазол-4-іл)сульфоніл]аміно)бензамід три;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-[(трифторметил)сульфоніл]аміно)бензамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[(2-гідроксіетил)(пропіл)аміно]сульфоніл]пропанамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-(1,3-оксазол-2-іл)бензамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-[(2-гідроксі-1,1-диметилетил)аміно]сульфоніл)- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[(2-гідроксі-1,1-диметилетил)аміно]сульфоніл]бензамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-[(3-гідроксипропіл)аміно]сульфоніл)- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-[(метилсульфоніл)аміно]-1,3-тіазол-4-карбоксамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-

етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N²-
(фенілацетил)-3-[(1-
пропілбутил)сульфоніл]аланінамід;
N¹-[(1R,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-
етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N²-
бензилоксикарбоніл-3-[(1-
пропілбутил)сульфоніл]аланінамід трифтораце-
тат;
N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-
етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-(3-
метилізоксазол-4-іл)-N³,N³-дипропілізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-
етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-[(2-
(метиламін)етил)аміно]сульфоніл)-N³,N³-
дипропілізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-
етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-[(2-
гідроксіетил)аміно]сульфоніл)-N³,N³-
дипропілізофталамід;
N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-
етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-
[(метилсульфоніл)аміно]бутанамід;
N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-
етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-(піперазин-
1-ілсульфоніл)-N³,N³-дипропілізофталамід;
N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-
етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-
[метил(метилсульфоніл)аміно]бензамід;
5-[[bис(2-гідроксіетил)аміно]сульфоніл]-N¹-[(1S,2R)-
1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-
гідроксипропіл]-N³,N³-дипропілізофталамід;
N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-
етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2,8-
диметилхінолін-3-карбоксамід;
2-[(2R,3S)-4-(3,5-дифторфеніл)-3-[(3-
[(дипропіламіно)карбоніл]-5-метилбензоїл)аміно]-
2-гідроксибутил)аміно]етил-2,4-
дифторфенілкарбамат;
5-(аміноссульфоніл)-N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-
дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-
гідроксипропіл]-N³,N³-дипропілізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-
етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N³,N³-
дипропіл-5-(1H-піразол-4-іл)ізофталамід;
N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-
етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-
гідроксіізоксазол-5-карбоксамід;
N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-
етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-(1-метил-
1H-імідазол-2-іл)-N³,N³-дипропілізофталамід;
N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-
етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-[(2R)-2-
(метоксиметил)піролідін-1-іл]карбоніл]-5-
метилбензамід;
N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-
етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-[(2-
гідроксіетил)аміно]сульфоніл)-N³-
пропілізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-
етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-[(1S)-2-
гідрокси-1-метилетил)аміно]сульфоніл)-N³,N³-
дипропілізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-
етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N³,N³-діетил-
5-(1,3-оксазол-2-іл)ізофталамід;
N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-

етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-[(2S)-2-
(метоксиметил)піролідін-1-іл]карбоніл]-5-
метилбензамід;
N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-
етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-[(2S)-2-
(гідроксиметил)піролідін-1-іл]сульфоніл)-N³,N³-
дипропілізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-
етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-[(1R)-2-
гідрокси-1-метилетил)аміно]сульфоніл)-N³,N³-
дипропілізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-2-гідрокси-1-(2,3,5-трифторбензил)-3-
[(3-(трифторметил)бензил)аміно]пропіл]-5-метил-
N³,N³-дипропілізофталамід;
N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-
етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-(2-етил-1-
гідроксибутил)бензамід;
N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-
етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-
[(диметиламін)сульфоніл)-N³,N³-
дипропілізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-3-[(1-
(амінокарбоніл)циклогексил)аміно]-1-(3,5-
дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-
дипропілізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-3-[(2-(аміноссульфоніл)етил)аміно]-1-
(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-
N³,N³-дипропілізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(1-
метилгексил)аміно]пропіл]-5-метил-N³,N³-
дипропілізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(2-
гідроксіпропіл)аміно]пропіл]-5-метил-N³,N³-
дипропілізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(2-
етилгексил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-
дипропілізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(4-
фенілбутил)аміно]пропіл]-5-метил-N³,N³-
дипропілізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-
(пентиламіно)пропіл]-5-метил-N³,N³-
дипропілізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(5-
гідроксіпентил)аміно]пропіл]-5-метил-N³,N³-
дипропілізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(6-
гідроксигексил)аміно]пропіл]-5-метил-N³,N³-
дипропілізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-3-[(3-бутоксипропіл)аміно]-1-(3,5-
дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-
дипропілізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-
[(2R)-2-гідроксипропіл)аміно]пропіл]-5-метил-
N³,N³-дипропілізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-
етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N³-етил-N³-
метил-5-(1,3-оксазол-2-іл)ізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-
етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N³-метил-5-
(1,3-оксазол-2-іл)-N³-пропілізофталамід;
N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-
етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N³,NA-
дипропіл-5-(піролідін-1-ілсульфоніл)ізофталамід
гідрохлорид;
N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-

(ізопентиламіно)пропіл]-5-[[2-гідрокси-1,1-диметилетил)аміно]сульфоніл]-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-(1,3-оксазол-5-іл)-N³,N³-дипропілізофталаміду гідрохлорид;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етинілбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-(1,3-оксазол-2-іл)-N³,N³-дипропілізофталаміду гідрохлорид;
 N¹-бутил-N³-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N¹-метил-5-(1,3-оксазол-2-іл)ізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N³,N³-диметил-5-(1,3-оксазол-2-іл)ізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N³-етил-5-(1,3-оксазол-2-іл)-N³-пропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етинілбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N³,N³-дипропіл-5-(1,3-тіазол-2-іл)ізофталаміду гідрохлорид;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-[(1-пропілбутил)аміно]сульфоніл]пропанамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-[(2R)-2-(гідроксиметил)піролідин-1-іл]сульфоніл]-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етинілбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-[(2-гідрокси-1,1-диметилетил)аміно]сульфоніл]-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(ізобутиламіно)пропіл]-5-(1,3-оксазол-2-іл)-N³,N³-дипропілізофталаміду гідрохлорид;
 5-бром-N¹-[(1S,2R)-1-[3-фтор-4-(трифторметил)бензил]-2-гідрокси-3-[(3-трифторметил)бензил]аміно]пропіл]-N³,N³-дипропілізофталамід;
 5-бром-N¹-[(1S,2R)-2-гідрокси-1-(2,3,4-трифторбензил)-3-[(3-трифторметил)бензил]аміно]пропіл]-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-(2-етилбутаноіл)-5-метилбензаміду гідрохлорид;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-метил-5-[(2-пропілпіперидин-1-іл)карбоніл]бензаміду гідрохлорид;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-метил-5-[(2-метилпіролідин-1-іл)карбоніл]бензаміду гідрохлорид;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-[(2,6-диметилпіперидин-1-іл)карбоніл]-5-метилбензаміду гідрохлорид;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-[(2-метоксіетил)аміно]сульфоніл]-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-

(трифторметил)бензил]аміно]пропіл]-N³,N³-дипропіл-5-(1,3-тіазол-2-іл)ізофталаміду дигідрохлорид;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етинілбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-[(2-гідроксіетил)аміно]сульфоніл]-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-метил-5-(2-пропілпентаноіл)бензаміду гідрохлорид;
 N¹-(втор-бутил)-N³-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил-N¹-пропілізофталамід;
 N¹-бутил-N³-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил-N¹-пропілізофталамід;
 N¹-аліл-N¹-циклопентил-N³-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метилізофталамід;
 N¹,N¹-дибутил-N³-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метилізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N³,N³-діізобутил-5-метилізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-[(1Z)-проп-1-еніл]бензил)аміно]пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилсульфоніл)бензил]аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(1-(3-йодфеніл)циклопропіл]аміно]пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-(1-(3,5-дифторбензил)-3-[[2-(етиламіно)-1-метил-2-оксоетил]аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил-N,N-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-[(1,1'-дифеніл-3-ілметил)аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-гідрокси-1-фенілпропіл)аміно]пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-циклогексил-N³-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N¹,5-диметилізофталамід;
 N¹-циклогексил-N³-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N¹-етил-5-метилізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-[(3-(1-бензотієн-2-іл)бензил)аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-трифторметил)бензил]аміно]пропіл]-5-етиніл-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-тієн-3-ілбензил)аміно]пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-(5-метилтієн-2-іл)бензил)аміно]пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-піридин-4-ілбензил)аміно]пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-(4-метилтієн-2-іл)бензил)аміно]пропіл]-5-метил-

N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[[1-(3-ізобутилізоксазол-5-іл)циклопропіл]аміно]пропіл)-5-метил- N^3,N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етинілбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-(1,3-оксазол-2-іл)- N^3,N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[[3-(трифторметил)бензил]аміно]пропіл]-5-(1,3-оксазол-2-іл)- N^3,N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-3-[(3-ціанобензил)аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3,N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[[1(1S)-1-[[ізобутиламіно](оксо)метил]-3-(метилтіо)пропіл]аміно]пропіл]-5-метил-N,N-дипропілізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етинілфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл]-5-(1,3-оксазол-2-іл)- N^3,N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-((3-[(1E)-гекс-1-еніл]бензил)аміно)-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3,N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-3-[[3-(5-ацетилтієн-2-іл)бензил]аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3,N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-3-[(3-алілбензил)аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3,N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-{3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[[3-(6-метоксипіридин-3-іл)бензил]аміно]пропіл]-5-метил- N^3,N^3 -дипропілізофталамід;
 N -[(1S,2R)-3-[[2-трет-бутилпіримідин-4-л)метил]аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3,N^3 -дипропілізофталамід;
 N^4 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[[3-ізопропілбензил)аміно]пропіл]-6-метил- N^2,N^2 -дипропілпіридин-2,4-дикарбоксамід;
 N^1 -[(1S,2R)-3-[(3-бутилбензил)аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3,N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[[3-пентилбензил)аміно]пропіл]-5-метил- N^3,N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[[3-пент-4-енілбензил)аміно]пропіл]-5-метил- N^3,N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-3-[(3-циклопентилбензил)аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3,N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-3-[(3-циклогексилбензил)аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3,N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-3-[[3-(циклогексилметил)бензил]аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3,N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[3-гекс-5-енілбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3,N^3 -дипропілізофталамід;
метил-(2S)-3-[3-(((2R,3S)-4-(3,5-дифторфеніл)-3-((3-[[дипропіламіно]карбоніл]-5-метилбензоіл)аміно)-2-гідроксибутил]аміно)метил]феніл]-2-метилпропаннат;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[[3-

етоксіетил)-5-метилізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(2-нафтилметил)аміно]пропіл)-5-(1,3-оксазол-2-іл)- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -бутил- N^3 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етилфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл)- N^1 ,5-диметилізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етилфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл)-5-[[2-гідрокси-1,1-диметилетил]аміно]сульфоніл)- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(1S)-1,2,3,4-тетрагідронафтален-1-іламіно]пропіл)-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[[2S]-тетрагідрофуран-2-ілметил]аміно]пропіл)-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-[(3-гідроксипропіл)сульфоніл]- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-(1H-імідазол-4-іл)- N^3 , N^3 -дипропілізофталаміду три-фторацетат;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-ізоксазол-3-іл- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[[2R]-2-(метоксиметил)піролідін-1-іл]карбоніл)-5-(1,3-оксазол-2-іл)бензамід;
 N^4 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-6-метил- N^2 , N^2 -дипропілпіридин-2,4-дикарбоксамід;
 N^4 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[[3-(трифторметил)бензил]аміно]пропіл)-6-метил- N^2 , N^2 -дипропілпіридин-2,4-дикарбоксамід;
 N^4 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етилфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл)-6-метил- N^2 , N^2 -дипропілпіридин-2,4-дикарбоксамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етилфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл)- N^3 , N^3 -дипропіл-5-(1,3-тіазол-2-іл)ізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-[метил(тієн-2-ілсульфоніл)аміно]- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-[[2R]-2-гідроксипропіл]аміно]сульфоніл)- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[[1-(2-ізобутил-1,3-тіазол-5-іл)циклопропіл]аміно]пропіл)-5-(1,3-оксазол-2-іл)- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-гідрокси- N^5 , N^5 -дипропілпентандіамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(2-дипропіламіно-2-оксоетокси)ацетамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-[(2-дипропіламіно-2-оксоетил)тіо]ацетамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[[2-

(ізобутиламіно)-1,1-диметил-2-оксоетил]аміно]пропіл)-5-(1,3-оксазол-2-іл)-N,N-дипропілізофталамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-[(метилсульфоніл)метил]бензамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-метил-5-(2-метилпентаноіл)бензаміду гідрохлорид;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-[(метилсульфоніл)аміно]- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]-D-аланінаміду дигідрохлорид;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)- N^2 -пропіоніл-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]-D-аланінамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[[1S]-2-(ізобутиламіно)-1-метил-2-оксоетил]аміно]пропіл)-N,N-дипропіл-5-(1,3-тіазол-2-іл)ізофталамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[[1S]-2-(ізобутиламіно)-1-метил-2-оксоетил]аміно]пропіл)-N-метил-N-пропіл-5-(1,3-тіазол-2-іл)ізофталамід;
 N^1 -бутил- N^3 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)- N^1 -метил-5-(1,3-тіазол-2-іл)ізофталамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[(3-гідроксипропіл)(метилсульфоніл)аміно]бензамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(метилсульфоніл)бензамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)- N^2 -(1-оксобутил)-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]-D-аланінаміду гідрохлорид;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)- N^3 , N^3 -дипропіл-5-піримідін-2-ілїзофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-[[2S]-2-гідроксипропіл]аміно]сульфоніл)- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)- N^3 -метил- N^3 -пропіл-5-(1,3-тіазол-2-іл)ізофталамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-(2-метилпентаноіл)-5-(1,3-оксазол-2-іл)бензамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[[3-[(метилсульфоніл)аміно]бензил]аміно]пропіл]-5-(1,3-оксазол-2-іл)- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)- N^2 -(2,2-диметилпропаноіл)-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]-D-аланінаміду гідрохлорид;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-[[2R]-2-(метоксиметил)піролідін-1-іл]сульфоніл)- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-

етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-[(3-гідроксипропіл)(метилсульфоніл)аміно]бензамід;
 N^2 -ацетил- N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]-D-аланінамід; гідрохлорид;
 2-[аліл(метилсульфоніл)аміно]-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-1,3-тіазол-5-карбоксамід;
 3-(бутилсульфоніл)- N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-D-аланінамід; бис(трифторацетат);
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(1-(3-етилбензил)циклопропіл)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]-D-аланінамід, бис(трифторацетат);
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]- N^2 -ізобутирил-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]-D-аланінамід; гідрохлорид;
 N-[(1S,2R)-3-(бутиламіно)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-4-(етилтіо)бензамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-1-(2-фторфеніл)-5-оксопіролідін-3-карбоксамід;
 N^1 -(4-трет-бутил-1,3-тіазол-2-іл)- N^4 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]сукцинамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-гідрокси-6-(1-гідрокси-2,2-диметилпропіл)піридин-2-карбоксамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-[[етиламіно]карбоніл]аміно]бензамід;
 3-(1-ціаноетил)-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]бензамід;
 1-(ціанометил)-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-1H-пірол-2-карбоксамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-(1H-імідазол-1-іл)пропіл)аміно]пропіл]-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(2R)-1-етилпіролідін-2-іл]метил]аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 3-ацетил-N-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]бензамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(7-метокси-1,2,3,4-тетрагідронафтален-1-іл)аміно]пропіл]-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(2E)-гекс-2-еніламіно]-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(5R)-3-етил-2-оксо-1,3-оксазолідін-5-іл]метил]аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(5S)-3-етил-2-оксо-1,3-оксазолідін-5-іл]метил]аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(2,2-діоксидо-3,4-дигідро-1,2-бензоксантин-4-іл)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3 , N^3 -

дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(1,1-діоксидо-3,4-дигідро-2H-1,2-бензотіазин-4-іл)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^5 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-феніл- N^1 , N^1 -дипропілпентандіамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-[[5-(ціанометил)-1H-імідазол-1-іл]метил]-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]- N^3 , N^3 -дипропіл-5-піримідін-2-ілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(2-етилпіримідін-4-іл)метил]аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]- N^2 -(2,2-диметилпропаноіл)-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]-D-аланінамід; гідрохлорид;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-[[етил(метил)аміно]сульфоніл]- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-[(2-гідроксietил)(метилсульфоніл)аміно]бензамід;
 5-бром- N^1 -[(1S,2R)-1-(2,4-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-[(2-метоксietил)(метилсульфоніл)аміно]бензамід; гідрохлорид;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-[(метилсульфоніл)метил]бензамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-[(4-гідроксибутил)сульфоніл]- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід; гідрохлорид;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-1-(дипропіламіно)ізохінолін-7-карбоксамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-[[2-гідроксietил)(метил)аміно]сульфоніл]- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-[[етиламіно]сульфоніл]- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-(5-метил-1,2,4-оксадіазол-3-іл)- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід; гідрохлорид;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-[метил(метилсульфоніл)аміно]-1,3-оксазол-4-карбоксамід;
 3-(бутилсульфоніл)-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]пропанамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-

етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N³,N³-дипропілмалонамід;
 N²-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N³,N³-дипропілбіцикло[2.2.1]гепт-5-ен-2,3-дикарбоксамід;
 N¹-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N³,N³-дипропілциклопентан-1,3-дикарбоксамід;
 N²-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3,4-диметил-N⁵,N⁵-дипропілтієно[2,3-b]тіофен-2,5-дикарбоксамід;
 N¹-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-феніл-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
 N²-бензил-N¹-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N²-[2-(дипропіламіно)-2-оксоетил]гліцинамід;
 3-[4-хлорфеніл]-N¹-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
 (2E)-N⁵-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-(метоксііміно)-N¹,N¹-дипропілпентандіамід;
 N¹-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N²-[2-(дипропіламіно)-2-оксоетил]-N²-фенілгліцинамід;
 N¹-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N²,N²-дипропілциклогексан-1,2-дикарбоксамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-[(бензилокси)аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-(1,3-оксазол-2-іл)-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-фенілпропанамід;
 N¹-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(1,1-діоксидо-3,4-дигідро-2H-1,2-бензотіазин-4-іл)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-(1H-імідазол-2-іл)-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-(1-гідрокси-2-пропілпентил)бензамід;
 N-{(1R,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-ізобутирилбензамід, гідрохлорид;
 N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-(2-пропілпентаноіл)бензамід;
 N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-(2-етилбутаноіл)бензаміду гідрохлорид;
 N³-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(1,2,3,4-тетрагідронафтален-1-іламіно)пропіл]-N⁵,N⁵-діізопропілпіридин-3,5-дикарбоксамід;
 N¹-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(1S)-2-(етиламіно)-1-метил-2-оксоетил]аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил-N,N-дипропілізофталамід;
 N¹-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-гідрокси-1-фенілпропіл)аміно]пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-[(1S)-2-(бензиламіно)-1-метил-2-оксоетил]аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-

гідроксипропіл]-5-метил-N,N-дипропілізофталамід;
 N¹-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3,3-диметил-N²,N²-дипропілциклопропан-1,2-дикарбоксамід;
 N¹-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3,3-диметил-N²,N²-дипропілциклопропан-1,2-дикарбоксамід;
 N¹-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-метил-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
 N¹-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3,3-диметил-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
 N¹-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-етил-3-метил-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
 N¹-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-гідрокси-3-метил-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
 2-[аліл(метилсульфоніл)аміно]-N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-1,3-оксазол-4-карбоксамід;
 N¹-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(2-(диметиламіно)етил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-[(2-[біс(2-гідроксіетил)аміно]етил)аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-(циклопропіламіно)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]-D-аланінамиду дигідрохлорид;
 N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-[4-(гідроксиметил)-1,3-оксазол-2-іл]бензаміду гідрохлорид;
 її фармацевтично прийнятна соль.
 19. Сполука, яка являє собою:
 N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-[(2-гідроксіетил)(метилсульфоніл)аміно]бензамід;
 5-бром-N¹-{(1S,2R)-1-(2,4-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-[(метилсульфоніл)метил]бензамід;
 N¹-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-[(4-гідроксибутил)сульфоніл]-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-1-(дипропіламіно)ізохінолін-7-карбоксамід;
 N¹-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-[(2-гідроксіетил)(метил)аміно]сульфоніл]-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-[(етиламіно)сульфоніл]-N³,N³-дипропілізофталамід;

N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-(5-метил-1,2,4-оксадіазол-3-іл)- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-[метил(метилсульфоніл)аміно]-1,3-оксазол-4-карбоксамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]- N^3 , N^3 -дипропілмалонамід;
 N^2 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]- N^3 , N^3 -дипропілбіцикло[2.2.1]гепт-5-ен-2,3-дикарбоксамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]- N^3 , N^3 -дипропілциклопентан-1,3-дикарбоксамід;
 N^2 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3,4-диметил- N^5 , N^5 -дипропілтієно[2,3-b]тіофен-2,5-дикарбоксамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-феніл- N^5 , N^5 -дипропілпентандіамід;
 N^2 -бензил- N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)- N^2 -[2-(дипропіламіно)-2-оксоетил]глїцинамід;
3-(4-хлорфеніл)- N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)- N^5 , N^5 -дипропілпентандіамід;
(2E)- N^5 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-(метоксііміно)- N^1 , N^1 -дипропілпентандіамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)- N^2 -[2-(дипропіламіно)-2-оксоетил]- N^2 -фенілглїцинамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)- N^2 , N^2 -дипропілциклогексан-1,2-дикарбоксамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-фенілпропанамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(2,2-діоксидо-3,4-дигідро-1,2-бензоксантин-4-іл)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(2,2-діоксидо-3,4-дигідро-1,2-бензоксантин-4-іл)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(7-метокси-1,2,3,4-тетрагідронафтален-1-іл)аміно]пропіл]-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(7-метокси-1,2,3,4-тетрагідронафтален-1-іл)аміно]пропіл]-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-(1H-імідазол-2-іл)- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-пропіл-1,3-бензоксазол-6-карбоксамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-метил-1,3-бензоксазол-6-карбоксамід;

5-((трет-бутиламіно)сульфоніл)-N¹-{1(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N³,N³-дипропілізофталамід; N¹-{1(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-5-(1,3-оксазол-2-іл)-N³,N³-дипропілізофталамід; N⁴-{1(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етилфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл}-6-метил-N²,N²-дипропілпіридин-2,4-дикарбоксамід; N⁴-{1(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етинілфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл}-6-метил-N²,N²-дипропілпіридин-2,4-дикарбоксамід; N¹-{1(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-5-етиніл-N³,N³-дипропілізофталамід; N¹-{1(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етинілбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-5-етиніл-N³,N³-дипропілізофталамід; N¹-{1(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етинілфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл}-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід; N¹-{1(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-N³,N³-дипропіл-5-(1,3-тіазол-2-іл)ізофталамід; N¹-бутил-N³-{1(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-N¹-метил-5-(1,3-тіазол-2-іл)ізофталамід; N¹-{1(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-N³-метил-N³-пропіл-5-(1,3-тіазол-2-іл)ізофталамід; N¹-{1(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-5-(4-метил-1,3-оксазол-2-іл)-N³,N³-дипропілізофталамід; N¹-{1(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-N³-метил-5-(1,3-оксазол-2-іл)-N³-пропілізофталамід; N¹-бутил-N³-{1(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-N¹-метил-5-(1,3-оксазол-2-іл)ізофталамід; N¹-{1(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-N³-етил-5-(1,3-оксазол-2-іл)-N³-пропілізофталамід; N¹-{1(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[3-(триформетил)бензил]аміно]пропіл]-N³,N³-дипропіл-5-(1,3-тіазол-2-іл)ізофталамід; N¹-{1(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етилфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл}-5-(1,3-оксазол-2-іл)-N³,N³-дипропілізофталамід; N¹-{1(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етинілфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл}-5-(1,3-оксазол-2-іл)-N³,N³-дипропілізофталамід; 5-[[трет-бутил(метил)аміно]сульфоніл]-N¹-{1(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-N³,N³-дипропілізофталамід; N-{1(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-2-ізопропіл-1,3-бензоксазол-6-карбоксамід; (2S)-N-{1(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-2-гідрокси-2-(1-нафтил)етанамід; (2R)-N-{1(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-2-гідрокси-2-(1-нафтил)етанамід; N-{1(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}ізонікотинамід;

N^1 -((1S,2R)-1-бензил-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)- N^3 -метил-5-(1,3-оксазол-2-іл)- N^3 -пропілізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-[1-(етоксиметил)-1H-імідазол-2-іл]- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-пропіл-1,3-бензоксазол-5-карбоксамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-ізопропіл-1,3-бензоксазол-5-карбоксамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[[етил(метил)аміно]сульфоніл]бензамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-метил-1,3-бензоксазол-5-карбоксамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-(метилсульфоніл)- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-(метилсульфоніл)- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-метил-1,3-бензоксазол-7-карбоксамід;
метил-3-[[((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)аміно]карбоніл]бензоат;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(5-метокси-1,2,3,4-тетрагідронафтален-1-іл)аміно]пропіл)-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(5-метокси-1,2,3,4-тетрагідронафтален-1-іл)аміно]пропіл)-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(1S)-2,3-дигідро-1H-інден-1-іламіно]-2-гідроксипропіл)-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)- N^2 , N^2 -дипропілциклогексан-1,2-дикарбоксамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[(2R)-2-(метоксиметил)піролідін-1-іл]сульфоніл]бензамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-[[етил(метил)аміно]сульфоніл]бензамід;
сполука мурашиної кислоти з N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-[[етил(метил)аміно]сульфоніл]бензамідом (1:1);
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3,5-диметилбензамід;
 N^1 -бутил- N^3 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етинілфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл)- N^1 -метил-5-(1,3-тіазол-2-іл)ізофталамід;
 N^1 -бутил- N^5 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)- N^1 -метилпентандіамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-

етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)- N^5 , N^5 -дипропілпентандіамід;
(2R)- N^5 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-метил- N^1 , N^1 -дипропілпентандіамід;
(2S)- N^5 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-метил- N^1 , N^1 -дипропілпентандіамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)- N^4 , N^4 -дипропілсукцинамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)- N^2 -[2-(дипропіламіно)-2-оксоетил]- N^2 -метилгліцинамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)- N^2 -[2-(дипропіламіно)-2-оксоетил]гліцинамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-[2-(метоксиметил)піролідін-1-іл]-5-оксопентанамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)- N^5 -(2-фурилметил)- N^5 -метилпентандіамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[4-етилпіридин-2-іл)метил]аміно]-2-гідроксипропіл)-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^4 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етинілфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл)-6-метил- N^2 , N^2 -дипропілпіридин-2,4-дикарбоксамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2,2-диметилхроман-7-карбоксамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2,2-диметилхроман-6-карбоксамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-метил-1,3-бензоксазол-4-карбоксамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-пропіл-1,3-бензоксазол-4-карбоксамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-[[((2R)-2-(метоксиметил)піролідін-1-іл)сульфоніл]бензамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[(2R)-2-(метоксиметил)піролідін-1-іл]сульфоніл]бензамід;
1-бутил- N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1H-індол-6-карбоксамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1-пропіл-1H-індол-6-карбоксамід;
1-бутил- N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1H-індол-5-карбоксамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[4-(2-гідроксіетил)-1,3-оксазол-2-іл]бензамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-ізопропілбензил)аміно]пропіл)- N^3 , N^3 -дипропіл-5-(1,3-тіазол-2-іл)ізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-ізопропілбензил)аміно]пропіл)- N^3 , N^3 -дипропіл-5-(1,3-тіазол-2-іл)ізофталамід;

N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-((4-етилпіридин-2-іл)метил)аміно)-2-гідроксипропіл)-5-(1,3-оксазол-2-іл)- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-((1-(3-етинілфеніл)циклопропіл)аміно)-2-гідроксипропіл)-4-(етоксиметил)бензамід;
 1-бутил- N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-((3-етилбензил)аміно)-2-гідроксипропіл)індолін-6-карбоксамід;
 3-((трет-бутиламіно)сульфоніл)- N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-((3-етилбензил)аміно)-2-гідроксипропіл)бензамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-((3-етилбензил)аміно)-2-гідроксипропіл)-2,3-дигідро-1,4-бензодіоксин-6-карбоксамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-((3-етилбензил)аміно)-2-гідроксипропіл)-3-((2R)-2-(гідроксиметил)піролідін-1-іл)сульфоніл)бензамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-((3-етилбензил)аміно)-2-гідроксипропіл)- N^3 , N^3 -дипропіл-5-піридин-4-ілізофталамід;
 N^1 -бутил- N^3 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-((3-етинілбензил)аміно)-2-гідроксипропіл)- N^1 ,5-диметилізофталамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-((3-ізопропілбензил)аміно)пропіл)-3-((2R)-2-(метоксиметил)піролідін-1-іл)карбоніл)-5-метилбензамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-((3-етинілбензил)аміно)-2-гідроксипропіл)-3-((2R)-2-(метоксиметил)піролідін-1-іл)карбоніл)-5-метилбензамід;
 3-(1-бутил-1H-піразол-4-іл)- N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-((3-етилбензил)аміно)-2-гідроксипропіл)пропанамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-((1-(3-етилфеніл)циклопропіл)аміно)-2-гідроксипропіл)-3-((2R)-2-(метоксиметил)піролідін-1-іл)карбоніл)-5-метилбензамід;
 1-бутил- N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-((3-етилбензил)аміно)-2-гідроксипропіл)-1H-індазол-6-карбоксамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-((3-етилбензил)аміно)-2-гідроксипропіл)-2-тієн-2-іл-1,3-тіазол-4-карбоксамід;
 5-(аміноссульфоніл)- N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-((3-етилбензил)аміно)-2-гідроксипропіл)-1-метил-1H-пірол-2-карбоксамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-((3-етилбензил)аміно)-2-гідроксипропіл)-2-((2-фурилметил)сульфоніл)метил)-1,3-тіазол-4-карбоксамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-((3-етилбензил)аміно)-2-гідроксипропіл)-2-((4-фторбензил)сульфоніл)метил)-1,3-тіазол-4-карбоксамід;
 1-бутил- N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-((3-етилбензил)аміно)-2-гідроксипропіл)-4-[метил(метилсульфоніл)аміно]-1H-індол-6-карбоксамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-((1-(3-етинілфеніл)циклопропіл)аміно)-2-гідроксипропіл)-4-(2-метоксіетил)бензамід;
 N^1 -бутил- N^3 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-((1-фенілциклопропіл)аміно)пропіл)- N^1 -метил-5-(1,3-тіазол-2-іл)ізофталамід;

N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-((1-фенілциклопропіл)аміно)пропіл)-5-(1,3-оксазол-2-іл)- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-((3-етилбензил)аміно)-2-гідроксипропіл)-4-((етиламіно)сульфоніл)бензамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-((3-етилбензил)аміно)-2-гідроксипропіл)-4-((метиламіно)сульфоніл)бензамід;
 (2E)-3-(1-бутил-1H-піразол-4-іл)- N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-((3-етилбензил)аміно)-2-гідроксипропіл)проп-2-енамід або (2E)-3-(1-бутил-1H-піразол-4-іл)- N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-((3-етилбензил)аміно)-2-гідроксипропіл)проп-2-енамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-((3-етилбензил)аміно)-2-гідроксипропіл)ізохінолін-7-карбоксамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-((3-етилбензил)аміно)-2-гідроксипропіл)-1-(пропіламіно)ізохінолін-7-карбоксамід або N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-((3-етилбензил)аміно)-2-гідроксипропіл)-1-(пропіламіно)ізохінолін-7-карбоксамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-((3-ізопропілбензил)аміно)пропіл)-5-((2-гідрокси-1,1-диметилетил)аміно)сульфоніл)- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 метил-3-(2-3-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-((3-етилбензил)аміно)-2-гідроксипропіл)аміно)карбоніл)феніл)-1,3-оксазол-5-іл)пропаноат;
 3-(2-3-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-((3-етилбензил)аміно)-2-гідроксипропіл)аміно)карбоніл)феніл)-1,3-оксазол-5-іл)пропанова кислота;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-((3-етилбензил)аміно)-2-гідроксипропіл)-1-(3-гідроксипропіл)-1H-індол-6-карбоксамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-((3-етилбензил)аміно)-2-гідроксипропіл)-3-етоксибензамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-((3-етилбензил)аміно)-2-гідроксипропіл)-2-метил-6-(піролідін-1-ілкарбоніл)ізонікотинамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-((6-етилпіридин-2-іл)метил)аміно)-2-гідроксипропіл)-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-((3-етилбензил)аміно)-2-гідроксипропіл)-3-((дипропіламіно)сульфоніл)бензамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-((6-етилпіридин-2-іл)метил)аміно)-2-гідроксипропіл)-5-(1,3-оксазол-2-іл)- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 трет-бутил-(1R)-1-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-((3-етилбензил)аміно)-2-гідроксипропіл)аміно)карбоніл)-3-(метилсульфініл)пропілкарбамат;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-((3-етилбензил)аміно)-2-гідроксипропіл)-2-(дипропіламіно)ізонікотинамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-((3-етилбензил)аміно)-2-гідроксипропіл)-2-(дипропіламіно)ізонікотинамід;
 (2R)-2-аміно- N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-((3-етилбензил)аміно)-2-гідроксипропіл)-4-

(метилсульфоніл)бутанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[[етил(метил)аміно]сульфоніл]-5-[[{(2S)-2-(метоксиметил)піролідин-1-іл]карбоніл]бензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1-[метил(пропіл)аміно]ізохінолін-7-карбоксамід або
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1-[метил(пропіл)аміно]ізохінолін-7-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(1,3-оксазол-2-іл)бензамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-[[1-(3-бромфеніл)циклопропіл]аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-(1,3-оксазол-2-іл)-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-[[1-(3-бромфеніл)циклопропіл]аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-(1,3-оксазол-2-іл)-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N⁵-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N³,N³-дипропіл-1H-піразол-3,5-дикарбоксамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N²,N²-дипропілциклобутан-1,2-дикарбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[[дипропіламіно]карботіол]бензамід;
 3-[(E)-(ціаноіміно)(дипропіламіно)метил]-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)бензамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-[(6-ізопропіл-2,2-діоксидо-3,4-дигідро-1H-ізотіохромен-4-іл)аміно]пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-(1-пропілбутоксид)бензамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[5-етилпіридин-3-іл)метил]аміно]-2-гідроксипропіл]-5-(1,3-оксазол-2-іл)-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-[(6-ізопропіл-2,2-діоксидо-3,4-дигідро-1H-ізотіохромен-4-іл)аміно]пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1-(2-метоксіетил)-1H-індол-6-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[[{(2S)-2-(метоксиметил)піролідин-1-іл]карбоніл]-5-[[{(2R)-2-(метоксиметил)піролідин-1-іл]сульфоніл]бензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(1,3-тіазол-2-іл)бензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4,8-діетоксигінолін-2-карбоксамід;
 2-(4-бутил-3-оксопіперазин-1-іл)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)ацетамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-

етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N³-[2-(диметиламіно)етил]-N³,5-диметилізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-[(3-метилбутаноіл)аміно]пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-[(4-метилпентаноіл)аміно]пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 ізобутил-(2R,3S)-4-(3,5-дифторфеніл)-3-[(3-[[дипропіламіно]карбоніл]-5-метилбензоіл]аміно)-2-гідроксибутилкарбамат;
 етил-(2R,3S)-4-(3,5-дифторфеніл)-3-[(3-[[дипропіламіно]карбоніл]-5-метилбензоіл]аміно)-2-гідроксибутилкарбамат;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-(піримідин-2-іламіно)пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³-[(1S)-1-метилпропіл]ізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³-[(1R)-1-метилпропіл]ізофталамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(дипропіламіно)-6-метилпіримідин-4-карбоксамід;
 1-[бутил(метил)аміно]-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)ізохінолін-7-карбоксамід або 1-[бутил(метил)аміно]-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)ізохінолін-7-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1,3-дигідро-2-бензотіофен-5-карбоксамід 2,2-діоксид;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етинілфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[[{(2R)-2-(метоксиметил)піролідин-1-іл]карбоніл]-5-метилбензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етинілфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[[{(2R)-2-(метоксиметил)піролідин-1-іл]карбоніл]-5-метилбензаміду трифторацетат;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1-ізобутил-1H-індол-6-карбоксамід;
 1-бутил-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(2,5-диметил-1H-пірол-1-іл)-1H-індол-6-карбоксамід;
 1-бутил-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-метил-1H-індол-6-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-оксо-2-пропіл-2,3-дигідро-1,2-бензизотіазол-6-карбоксамід 1,1-діоксид;
 1-бутил-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(1,3-оксазол-2-іл)-1H-індол-6-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(дипропіламіно)-6-метилізонікотинамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-[(метилсульфоніл)метил]-1,3-тіазол-4-карбоксамід;
 4-аміно-1-бутил-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-

3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-1Н-індол-6-карбоксамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-етил-3-оксо-2,3-дигідро-1,2-бензизотіазол-6-карбоксаміду 1,1-діоксид;
 3-[(трет-бутиламіно)сульфоніл]-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-[(2S)-2-(метоксиметил)піролідин-1-іл]карбоніл]бензамід;
 3-[(2S)-2-бутилпіролідин-1-іл]карбоніл]-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метилбензамід;
 4-бутил-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3,4-дигідро-2Н-1,4-бензоксазин-6-карбоксамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-метил-5-[(2R)-2-(пропоксиметил)піролідин-1-іл]карбоніл]бензамід;
 2-(1-бутил-2-оксопіперидин-4-іл)-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]ацетамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-пентилбензамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-(2-етилгексил)бензамід;
 3-етил-5-{3-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]аміно}карбоніл]феніл]-2-фураат;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-1,1'-дифеніл-3-карбоксамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2'-(метилтіо)-1,1'-дифеніл-3-карбоксамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-(2-фторбензил)бензамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-(4-фторбензил)бензамід;
 3-етил-3'-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]аміно]карбоніл]-1,1'-дифеніл-2-карбоксилат;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-5-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3',5'-дифтор-1,1'-дифеніл-3-карбоксамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-фенілацетамід;
 трет-бутил-4-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]аміно]карбоніл]бензилкарбамат;
 (2R)-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-гідрокси-2-фенілетанамід;
 (2S)-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-гідрокси-2-фенілетанамід;
 3-(5-хлорпентил)-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]бензамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-

етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-(1-фенілетил)бензаміду трифторацетат;
 3-(циклогексилметил)-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]бензамід;
 3-циклопентил-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]бензамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-гекс-5-енілбензамід;
 3-(6-ціаногексил)-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]бензамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-(2-формілтїєн-3-іл)бензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-(5-формілтїєн-3-іл)бензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-(6-метоксипіридин-2-іл)бензил)аміно]пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-[(3-(5-ціанопіридин-3-іл)бензил)аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-(6-фторпіридин-3-іл)бензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-піримідин-4-ілбензил)аміно]пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-(5-етилпіримідин-2-іл)бензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-піримідин-2-ілбензил)аміно]пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 метил-2-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]аміно]карбоніл]-6-метилізонікотинат;
 N⁴-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-6-метил-N²,N²-дипропілпіридин-2,4-дикарбоксаміду 1-оксид;
 1-бутил-4-ціано-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-1Н-індол-6-карбоксамід;
 1-бутил-4-ціано-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-1Н-індол-6-карбоксамід;
 5-(діетиламіно)-N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-[(3-(діетиламіно)бензил)аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-(1,3-оксазол-2-іл)-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-(диметиламіно)-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(2-етилпіридин-4-іл)метил]аміно]-2-гідроксипропіл]-5-(1,3-оксазол-2-іл)-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N²-(трет-бутоксикарбоніл)-N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-

гідроксипропіл}-L-норлейцинамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[(3H-[1,2,3]триазоло[4,5-b]піридин-3-ілокси)метил]бензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-йодбензил)аміно]пропіл)-3-[(2-гідроксіетил)(пропіл)аміно]метил]-5-метилбензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-йодбензил)аміно]пропіл)-3-[[етил(пропіл)аміно]метил]-5-метилбензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1-метил-1,3-дигідро-2,1-бензизотіазол-5-карбоксаміду 2,2-діоксид;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-L-норлейцинамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-(диметиламіно)бензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-(1,3-оксазол-2-іл)-N³,N³-дипропілізофталамід;
 2-хлор-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-6-метилізонікотинамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-йодбензил)аміно]пропіл)-3-[(2-гідроксіетил)(пропіл)аміно]метил]бензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(3-фтор-4-пропоксибеніл)ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(3-метокси-4-пропоксибеніл)ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-йодбензил)аміно]пропіл)-3-метил-5-[[метил(пропіл)аміно]метил]бензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-йодбензил)аміно]пропіл)-3-[(дипропіламіно)метил]-5-метилбензамід;
 3-[[бутил(метил)аміно]метил]-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-йодбензил)аміно]пропіл)-5-метилбензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(піперидин-1-ілсульфоніл)бензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-[(6-ізопропіл-2,2-діоксидо-3,4-дигідро-1H-ізотіохромен-4-іл)аміно]пропіл)-3-метилбензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етинілфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(3-метоксипропіл)бензамід;
 5-аміно-N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-(диметиламіно)метил]бензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-(1,3-оксазол-2-іл)-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N-(трет-бутоксикарбоніл)-3-бутил-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-L-гістидинамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1-ізопентил-1H-індол-6-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-

етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-пропіл-2,3-дигідро-1,2-бензизотіазол-6-карбоксаміду 1,1-діоксид;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-етил-2,3-дигідро-1,2-бензизотіазол-6-карбоксаміду 1,1-діоксид;
 6-бром-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2,2-диметилхроман-8-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-[(метилсульфоніл)метил]циклогексанкарбоксамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-піперидин-4-іл-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-метил-5-(1,3-оксазол-2-іл)бензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-[(метилсульфоніл)метил]тіофен-2-карбоксамід;
 3-[(циклогексиламіно)метил]-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-йодбензил)аміно]пропіл)-5-метилбензамід;
 2-(2-хлорфенокси)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)піразин-2-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-(фенілсульфоніл)пропанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-[(2S)-2-(метоксиметил)піролідин-1-іл]-6-метилізонікотинамід;
 3-[[[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]аміно]карбоніл]-5-метилбензойна кислота;
 6-ціано-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2,2-диметилхроман-8-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-метил-5-(1,3-тіазол-2-іл)бензамід;
 сполука мурашиної кислоти з N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(4-етоксибеніл)ацетамідом (1:1);
 сполука мурашиної кислоти з N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-метил-5-[[2S]-2-пропілпіролідин-1-іл]карбоніл]бензамідом (1:1);
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[(2R)-2-(2-метоксіетил)піролідин-1-іл]карбоніл]-5-метилбензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-[(метилсульфоніл)метил]циклогексанкарбоксамід;
 3-бутил-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1-метил-1H-індол-5-карбоксамід;
 сполука мурашиної кислоти з 2-(1-бутил-2-оксо-

1,2-дигідропіридин-4-іл)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)ацетамідом (1:1);
 3-бутил-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-L-гістидинамід;
 5-[(діетиламіно)метил]-N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-[(диметиламіно)метил]-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N-((1S,2R)-3-[(3-етилбензил)аміно]-1-[3-(гексилокси)бензил]-2-гідроксипропіл)-3-(1,3-оксазол-2-іл)бензамід;
 сполука мурашиної кислоти з N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(3-гідрокси-4-метоксифеніл)ацетамідом (1:1);
 сполука мурашиної кислоти з N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(1,3-тіазолідин-3-ілсульфоніл)бензамідом (1:1);
 сполука мурашиної кислоти з N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(3,4-дигідроізохінолін-2(1H)-ілсульфоніл)бензамідом (1:1);
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-[(4-фенілпіперазин-1-іл)сульфоніл]бензамід;
 3-бутил-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1H-індол-5-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-3-[(3-етилбензил)аміно]-1-[3-(гексилокси)бензил]-2-гідроксипропіл)ацетамід;
 1-бутил-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етинілфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл)-1H-бензимидазол-6-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-[3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-[(метилсульфоніл)метил]нікотинамід;
 N¹-[(1S,2R)-3-[(3-[(діетиламіно)метил]бензил)аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-(1,3-оксазол-2-іл)-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-[1-метил-5-(4-метилбензоіл)-1H-пірол-2-іл]ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(дипропіламіно)-6-(1,3-оксазол-2-іл)ізонікотинамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-метил-6-(1,3-оксазол-2-іл)ізонікотинамід;
 1-бутил-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етинілфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл)-1H-бензимидазол-5-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-[(6-ізопропіл-2,2-діоксидо-3,4-дигідро-1H-ізотіохромен-4-іл)аміно]пропіл)-3-метилбензамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-піперидин-3-іл-N³,N³-дипропілізофталамід;
 3-[[бензил(метил)аміно]метил]-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-[(3-йодбензил)аміно]пропіл)-5-метилбензамід;

сполука мурашиної кислоти з N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-[[4-(4-фторфеніл)піперазин-1-іл]сульфоніл]бензамідом (2:1);
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(піролідін-1-ілсульфоніл)бензамід;
 сполука мурашиної кислоти з N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(піролідін-1-ілсульфоніл)бензамідом (1:1);
 сполука мурашиної кислоти з N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-((4-[3-(трифторметил)феніл]піперазин-1-іл)сульфоніл)бензамідом (2:1);
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-[(диметиламіно)сульфоніл]бензамід;
 сполука мурашиної кислоти з N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-[(диметиламіно)сульфоніл]бензамідом (1:1);
 N-((1S,2R)-3-[(3-етилбензил)аміно]-1-[3-(гексилокси)бензил]-2-гідроксипропіл)-2-[(метилсульфоніл)аміно]-1,3-оксазол-4-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-6-[(метилсульфоніл)метил]нікотинамід;
 N-((1S,2R)-3-[(3-бромбензил)аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл)-4-метилпентанамід;
 1-бутил-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-метил-1H-пірол-2-карбоксамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-[(1H-пірол-2-ілметил)аміно]пропіл)-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-піперазин-1-іл-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N-((1S,2R)-3-[(3-бромбензил)аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл)ацетамід;
 N²-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-6-метил-N⁴,N⁴-дипропілпіридин-2,4-дикарбоксамід;
 N²-(трет-бутоксикарбоніл)-N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-D-норлейцинамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-D-норлейцинамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-[[4R]-6-ізопропіл-2,2-діоксидо-3,4-дигідро-1H-ізотіохромен-4-іл]аміно]пропіл)ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-[[4S]-6-ізопропіл-2,2-діоксидо-3,4-дигідро-1H-ізотіохромен-4-іл]аміно]пропіл)ацетамід;
 сполука мурашиної кислоти з 4-[[4-хлорфеніл](метил)аміно]сульфоніл)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)бензамідом (1:1);
 сполука мурашиної кислоти з 4-[[бензил(феніл)аміно]сульфоніл)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-

гідроксипропіл}бензамідом (1:1);
 сполука мурашиної кислоти з N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(морфолін-4-ілсульфоніл)бензамідом (1:1);
 N-[(1S,2R)-3-[(3-бромбензил)аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]пропанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(3-оксо-4-пропілциклогексил)ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(3-оксоциклогексил)ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1,1-дипропіл-3,4-дигідро-1H-ізохромен-7-карбоксамід;
 сполука мурашиної кислоти з 4-[(2-ціаноетил)(метил)аміно]сульфоніл}-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}бензамідом (1:1);
 сполука мурашиної кислоти з 4-[[циклогексил(метил)аміно]сульфоніл}-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}бензамідом (1:1);
 сполука мурашиної кислоти з N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-[[метил(2-піридин-2-ілетил)аміно]сульфоніл}бензамідом (2:1);
 сполука мурашиної кислоти з N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-[[метил(феніл)аміно]сульфоніл}бензамідом (1:1);
 сполука мурашиної кислоти з 4-[[бензил(метил)аміно]сульфоніл}-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}бензамідом (1:1);
 сполука мурашиної кислоти з N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-[[метил(2-фенілетил)аміно]сульфоніл}бензамідом (1:1);
 сполука мурашиної кислоти з 4-[[аліл(метил)аміно]сульфоніл}-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}бензамідом (1:1);
 сполука мурашиної кислоти з 4-[[[2-(діетиламіно)етил](метил)аміно]сульфоніл}-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}бензамідом (2:1);
 сполука мурашиної кислоти з N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-[[метил(пропіл)аміно]сульфоніл}бензамідом (1:1);
 сполука мурашиної кислоти з 4-[[бутил(метил)аміно]сульфоніл}-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}бензамідом (1:1);
 сполука мурашиної кислоти з N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-[[метил(пентил)аміно]сульфоніл}бензамідом (1:1);
 сполука мурашиної кислоти з N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-[[ізопентил(метил)аміно]сульфоніл}бензамідом (1:1);

2-бутил-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1,2,3,4-тетрагідроізохінолін-7-карбоксамід;
 сполука мурашиної кислоти з N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-[[метил(1-метилпіролідін-3-іл)аміно]сульфоніл}бензамідом (2:1);
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(4-етилпіридин-2-іл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл)-5-(1,3-оксазол-2-іл)-N³,N³-дипропілізофаламід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етинілфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл)-3-(2-метоксіетил)бензамід;
 1-бутил-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етинілфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(2-метоксіетил)-1H-бензимидазол-6-карбоксамід;
 L-альфа-глутаміл-L-валіл-N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-L-метіонінамід;
 3-[[циклогексил(метил)аміно]метил]-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-йодбензил)аміно]пропіл)-5-метилбензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3-бутоксibenзил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)ацетамід;
 сполука мурашиної кислоти з 2-(4-бутил-2,5-діоксопіперазин-1-іл)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)ацетамідом (1:1);
 3-біцикло[2.2.1]гепт-2-ил-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}бензамід;
 3-(бутиламіно)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етинілфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(2-метоксіетил)бензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етинілфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(дипропіламіно)-6-(1,3-оксазол-2-іл)ізонікотинамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(1S)-1,2,3,4-тетрагідронафтален-1-іламіно]пропіл)-3-метилбензамід;
 сполука мурашиної кислоти з N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-[[дипропіламіно]сульфоніл}бензамідом (1:1);
 сполука мурашиної кислоти з 4-[[діетиламіно]сульфоніл}-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}бензамідом (1:1);
 4-бутил-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1-(метилсульфоніл)-1,2,3,4-тетрагідроксінкалін-6-карбоксамід;
 1-бутил-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)ізохінолін-7-карбоксамід;
 5-[[бутил(метил)аміно]метил]-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)тіофен-2-карбоксамід;
 3-[[бутил(метил)аміно]метил]-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етинілфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл)-5-метилбензамід;
 3-[[бутил(метил)аміно]метил]-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[[3-

(трифторметил)бензил]аміно}пропіл)-5-метилбензамід;
 3-бром-5-[[бутил(метил)аміно]метил]-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етинілфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл)бензамід;
 3-[[бутил(метил)аміно]метил]-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етинілфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл)-5-метилбензамід;
 (2R)-2-(4-бутил-3-оксопіперазин-1-іл)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[3-етилбензил]аміно]-2-гідроксипропіл)пропанамід;
 3-[[бутил(метил)аміно]метил]-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[3-етилбензил]аміно]-2-гідроксипропіл)-5-метилбензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[3-етилбензил]аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(дипропіламіно)-6-(1,3-тіазол-2-іл)ізонікотинамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[[3-йодбензил]аміно]пропіл)-3-[[ізопентил(метил)аміно]метил]-5-метилбензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3-бутоксibenзил)-3-[[3-етилбензил]аміно]-2-гідроксипропіл)-2-[[метилсульфоніл]аміно]-1,3-оксазол-4-карбоксамід;
 3-бутил-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[3-етилбензил]аміно]-2-гідроксипропіл)імідазо[1,2-а]піридин-6-карбоксамід;
 2-[[бутил(метил)аміно]N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[3-етилбензил]аміно]-2-гідроксипропіл)-6-(1,3-оксазол-2-іл)ізонікотинамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[3-етилбензил]аміно]-2-гідроксипропіл)-1,3-бензодіоксол-5-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[6-етил-2,2-діоксидо-3,4-дигідро-1H-ізотіохромен-4-іл]аміно]-2-гідроксипропіл)ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[6-етил-2,2-діоксидо-3,4-дигідро-1H-ізотіохромен-4-іл]аміно]-2-гідроксипропіл)ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[3-етилбензил]аміно]-2-гідроксипропіл)-2-[[метил(пропіл)аміно]-6-(1,3-оксазол-2-іл)ізонікотинамід;
 3-[[бутил(метил)аміно]метил]-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[[1-фенілциклопропіл]аміно]пропіл)-5-метилбензамід;
 3-[[бутил(метил)аміно]метил]-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[[3-ізопропілбензил]аміно]пропіл)-5-метилбензамід;
 N-[[1S,2R)-3-[[1-(3-бромфеніл)циклопропіл]аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]ацетамід;
 3-[[бутил(метил)аміно]метил]-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етинілфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл)-5-(1,3-оксазол-2-іл)бензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[[2-(метилсульфоніл)-1-фенілетил]аміно]пропіл)ацетамід;
 3-[[бутил(метил)аміно]метил]-5-ціано-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етинілфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл)бензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[3-етилбензил]аміно]-2-гідроксипропіл]ацетамід;

N-[[1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[[2-[[метилсульфо-ніл]метил]бензил]аміно]пропіл]ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[3-етилбензил]аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[[2-фурилметил](метил)аміно]метил]-5-метилбензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[3-етилбензил]аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[[2-метоксіетил](метил)аміно]метил]-5-метилбензамід;
 3-[[[2-(діетиламіно)етил](метил)аміно]метил]-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[3-етилбензил]аміно]-2-гідроксипропіл)-5-метилбензамід;
 N-[[1S,2R)-3-[[3-бромбензил]аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-2-метоксіацетамід;
 сполука мурашиної кислоти з N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[3-етилбензил]аміно]-2-гідроксипропіл)-2-[4-(етоксиметил)піперидин-1-іл]пентанамідом (2:1);
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[3-етилбензил]аміно]-2-гідроксипропіл)-3-оксоіндан-5-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[3-етилбензил]аміно]-2-гідроксипропіл)-3-гідроксііндан-5-карбоксамід;
 сполука мурашиної кислоти з N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[3-етилбензил]аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(4-пропоксипіперидин-1-іл)ацетамідом (2:1);
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[3-етилбензил]аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[[ізобутил(метил)аміно]метил]-5-метилбензамід;
 сполука мурашиної кислоти з 2-(1-бутил-2-оксопіперидин-4-іл)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[3-етилбензил]аміно]-2-гідроксипропіл)ацетамідом (1:1);
 сполука мурашиної кислоти з 2-(4-бутилпіперазин-1-іл)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[3-етилбензил]аміно]-2-гідроксипропіл)ацетамідом (3:1);
 4-бутил-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[3-етилбензил]аміно]-2-гідроксипропіл)-3,4-дигідро-2H-1,4-бензотіазин-6-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[[1R,2S)-2-гідрокси-2,3-дигідро-1H-інден-1-іл]аміно]пропіл)ацетамід;
 2-[[2S)-4-бутил-2-метил-3-оксопіперазин-1-іл]-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[3-етилбензил]аміно]-2-гідроксипропіл)ацетамід;
 2-[[2R)-4-бутил-2-метил-3-оксопіперазин-1-іл]-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[3-етилбензил]аміно]-2-гідроксипропіл)ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[3-етилбензил]аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(2,3-діоксо-4-пропілпіперазин-1-іл)ацетамід;
 4-бутил-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[3-етилбензил]аміно]-2-гідроксипропіл)-1,2,3,4-тетрагідрокіналінін-6-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[3-етилбензил]аміно]-2-гідроксипропіл)-3-метил-5-[[метил(пентил)аміно]метил]бензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[3-етилбензил]аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[[2R)-2-

(метоксиметил)піролідин-1-іл]метил}-5-метилбензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(1-(3-етинілфеніл)циклопропіл]аміно)-2-гідроксипропіл)-2-(дипропіламіно)ізонікотинамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(1-(4-[(диметиламіно)метил]піридин-2-іл)циклопропіл]аміно)-2-гідроксипропіл]-5-(1,3-оксазол-2-іл)-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(дипропіламіно)-4-метил-1,3-тіазол-5-карбоксамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(2-[(4-етилбензил)сульфоніл]етил]аміно)-2-гідроксипропіл]ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1-метил-3-феніл-1H-тієно[2,3-с]піразол-5-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(4R)-6-етил-2,2-діоксидо-3,4-дигідро-1H-ізотіохромен-4-іл]аміно)-2-гідроксипропіл)-3,5-диметилбензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(1S)-1,2,3,4-тетрагідронафтален-1-іламіно]пропіл]ацетамід;
 3-бром-5-[[бутил(метил)аміно]метил]-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]бензамід;
 1-бутил-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(1-(3-етинілфеніл)циклопропіл]аміно)-2-гідроксипропіл)-1H-індол-6-карбоксамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(4-[(диметиламіно)метил]піридин-2-іл]метил)аміно)-2-гідроксипропіл]-5-(1,3-оксазол-2-іл)-N³,N³-дипропілізофталамід;
 3-[(бутиламіно)метил]-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-метилбензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[(2S)-2-(метоксиметил)піролідин-1-іл]метил}-5-метилбензамід;
 сполука мурашиної кислоти з N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-[4-(2-метоксіетил)піперидин-1-іл]ацетамідом (2:1);
 1-бутил-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1,2,3,4-тетрагідроізохінолін-7-карбоксамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-N¹,5-диметил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-[3-(диметиламіно)проп-1-ініл]-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(2-феноксифеніл)ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(2,5-диметилфеніл)ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-[2-(трифторметокси)феніл]ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(2-

етоксифеніл)ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-[2-(трифторметил)феніл]ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(2-метоксифеніл)ацетамід;
 2-[2-(бензилокси)феніл]-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-фенілбутанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-мезитилацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(2,4-диметоксифеніл)ацетамід;
 2-(2-хлорфеніл)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]ацетамід;
 2-циклогексил-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]ацетамід;
 2-циклопент-2-ен-1-іл-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(1-метил-5-оксо-2-тіоксоімідазолідин-4-іл)ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(2-фторфеніл)ацетамід;
 2-циклопропіл-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]ацетамід;
 2-циклогекс-1-ен-1-іл-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]ацетамід;
 2-(1-адамантил)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]ацетамід;
 (2S)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-фенілпропанамід;
 (2R)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-фенілпропанамід;
 2-(2,4-дихлорфеніл)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(2,3-диметоксифеніл)ацетамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-[3-(диметиламіно)пропіл]-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(2,2-діоксидо-3,4-дигідро-1H-ізотіохромен-4-іл)аміно]-2-гідроксипропіл]ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(2,2-діоксидо-3,4-дигідро-1H-ізотіохромен-4-іл)аміно]-2-гідроксипропіл]ацетамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(1-(4-етинілпіридин-2-іл)циклопропіл]аміно)-2-гідроксипропіл)-5-(1,3-оксазол-2-іл)-N³,N³-дипропілізофталамід;
 4-бутил-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3,4-дигідро-

2H-1,4-бензотіазин-6-карбоксаміду 1-оксид;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1-гептил-4-гідрокси-1-пролінамід;
 2-[бутил(метил)аміно]-6-хлор-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)ізонікотинамід;
 2-[бутил(метил)аміно]-6-ціано-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)ізонікотинамід;
 N'-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(2-[(диметиламіно)метил]піридин-4-іл)метил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-(1,3-оксазол-2-іл)-N,N-дипропілізофталамід;
 4-бутил-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-8-(1,3-оксазол-2-іл)-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-карбоксамід або 4-бутил-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-8-(1,3-оксазол-2-іл)-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-(4-етил-1,3-оксазол-2-іл)-5-(1,3-оксазол-2-іл)бензамід;
 3-бензил-4-(4-бутилфеніл)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-оксобутанамід;
 2-(4-бутил-2-оксопіперазин-1-іл)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-[4-(етоксиметил)піперидин-1-іл]ацетамід;
 2-(4-бутил-2,3-діоксопіперазин-1-іл)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)гексанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-йодбензил)аміно]пропіл)ацетамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(4-етинілпіридин-2-іл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл)-5-(1,3-оксазол-2-іл)-N³,N³-дипропілізофталамід;
 5-[[1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етилфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл]аміно]-5-оксвалеріанова кислота;
 1-бутил-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1,2,3,4-тетрагідрохінолін-7-карбоксамід або 1-бутил-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1,2,3,4-тетрагідрохінолін-7-карбоксамід;
 4-[[1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етилфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл]аміно]-4-оксомасляна кислота;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-пропіл-1,2-бензизоксазол-5-карбоксамід;
 2-[аліл(метил)аміно]-N-((1S,2R)-1-[3-(алілокси)-5-фторбензил]-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)ізонікотинамід;
 1-аліл-N-((1S,2R)-1-[4-(алілокси)-3-фторбензил]-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1H-індол-6-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етинілфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл)-4-феніл-2-(1H-пірол-1-іл)-1,3-тіазол-5-карбоксамід;

N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етинілфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(дипропіламіно)-4-(трифторметил)-1,3-тіазол-5-карбоксамід;
 (2S)-2-[[2-(2R,3R)-3-(ацетиламіно)-4-(3,5-дифторфеніл)-2-гідроксибутил]аміно]-N-ізобутил-4-(метилсульфоніл)бутанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-гідроксипропіл)-1-ініл]бензил)аміно}пропіл)ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етинілфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл)-2,6-диморфолін-4-іпіримідин-4-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[(2S)-2-етилпіролідін-1-іл]карбоніл)-5-метилбензамід;
 (2S)-2-(4-бутил-3-оксопіперазин-1-іл)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)пропанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(4R)-6-етил-2,2-діоксидо-3,4-дигідро-1H-ізотіохромен-4-іл]аміно)-2-гідроксипропіл)тетрагідрофуран-3-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(4R)-6-етил-2,2-діоксидо-3,4-дигідро-1H-ізотіохромен-4-іл]аміно)-2-гідроксипропіл)пропанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(4R)-6-етил-2,2-діоксидо-3,4-дигідро-1H-ізотіохромен-4-іл]аміно)-2-гідроксипропіл)-2-(1H-імідазол-4-іл)ацетамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(4R)-6-етил-2,2-діоксидо-3,4-дигідро-1H-ізотіохромен-4-іл]аміно)-2-гідроксипропіл)-N²,2'-диметилаланінамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(4R)-6-етил-2,2-діоксидо-3,4-дигідро-1H-ізотіохромен-4-іл]аміно)-2-гідроксипропіл)циклопентанкарбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(4R)-6-етил-2,2-діоксидо-3,4-дигідро-1H-ізотіохромен-4-іл]аміно)-2-гідроксипропіл)циклопропанкарбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(4R)-6-етил-2,2-діоксидо-3,4-дигідро-1H-ізотіохромен-4-іл]аміно)-2-гідроксипропіл)-2-фенілацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(4R)-6-етил-2,2-діоксидо-3,4-дигідро-1H-ізотіохромен-4-іл]аміно)-2-гідроксипропіл)тетрагідрофуран-2-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(4R)-6-етил-2,2-діоксидо-3,4-дигідро-1H-ізотіохромен-4-іл]аміно)-2-гідроксипропіл)-1,3-тіазолідін-4-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(4R)-6-етил-2,2-діоксидо-3,4-дигідро-1H-ізотіохромен-4-іл]аміно)-2-гідроксипропіл)-3-гідроксибутанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(4R)-6-етил-2,2-діоксидо-3,4-дигідро-1H-ізотіохромен-4-іл]аміно)-2-гідроксипропіл)-3-гідроксипропанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(4R)-6-етил-2,2-діоксидо-3,4-дигідро-1H-ізотіохромен-4-іл]аміно)-2-гідроксипропіл)-3-гідрокси-2,2'-диметилпропанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(4R)-6-етил-2,2-діоксидо-3,4-дигідро-1H-ізотіохромен-4-іл]аміно)-2-гідроксипропіл)-3-метилбутанамід;

N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-((4R)-6-етил-2,2-діоксидо-3,4-дигідро-1H-ізотіохромен-4-іл)аміно)-2-гідроксипропіл)гліцинамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-((4R)-6-етил-2,2-діоксидо-3,4-дигідро-1H-ізотіохромен-4-іл)аміно)-2-гідроксипропіл)- N^2 -метилгліцинамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-((1-(3-етинілфеніл)циклопропіл)аміно)-2-гідроксипропіл)-1-метил-3-(трифторметил)-1H-тієно[2,3-с]піразол-5-карбоксамід;
2-[аліл(метил)аміно]- N -((1S,2R)-1-[4-(алілокси)-3-фторбензил]-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)ізонікотинамід;
3-бутил- N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1,2-бензизоксазол-5-карбоксамід;
5-(3-амінопропіл)- N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-[3-(метиламіно)пропіл]- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-[3-(метиламіно)проп-1-ініл]- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
5-(3-амінопроп-1-ініл)- N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етинілфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл)-5-піролідін-1-ілпіразин-2-карбоксамід;
4-бутоксид- N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)хінолін-2-карбоксамід;
2-ціано- N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-6-[метил(пропіл)аміно]ізонікотинамід;
3-ацетил-1-бутил- N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1H-індол-6-карбоксамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксид-3-[(1H-індол-6-ілметил)аміно]пропіл)-5-метил- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-ізобутил-1,2-бензизоксазол-5-карбоксамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-[(2S)-піролідін-2-іл]ацетамід;
2-[2-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)аміно]-2-оксоетил)- N -(6-метоксипіридин-3-іл)бензамід;
2-[2-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)аміно]-2-оксоетил)- N -(2,4-дифторфеніл)бензамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-піридин-3-ілацетамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(1H-імідазол-5-іл)ацетамід;
2-циклопентил- N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)ацетамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(2-

гідроксифеніл)ацетамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(2-метилфеніл)ацетамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(2-йодфеніл)ацетамід;
1-(4-хлорфеніл)- N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-оксопіролідін-3-карбоксамід;
4-(2,4-дихлорфенокси)- N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)бутанамід;
4,5-дибром- N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)тіофен-2-карбоксамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(5-метил-2-феніл-1,3-оксазол-4-іл)ацетамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етинілфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл)-2,6-біс(диметиламіно)піримідін-4-карбоксамід;
4-бутил-8-ціано- N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3,4-дигідро-2H-1,4-бензоксазин-6-карбоксамід;
3-(алілсульфоніл)- N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етилфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл)бензамід;
3-(алілтіо)- N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етилфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл)бензамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксид-3-[(7-метокси-1,2,3,4-тетрагідронафтален-1-іл)аміно]пропіл)ацетамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксид-3-[(7-метокси-1,2,3,4-тетрагідронафтален-1-іл)аміно]пропіл)ацетамід;
сполука мурашиної кислоти з N^1 -[(3S)-1-азабіцикло[2.2.2]окт-3-ил]- N^5 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етилфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл)пентандіамідом (1:1);
сполука мурашиної кислоти з N^1 -[(3R)-1-азабіцикло[2.2.2]окт-3-ил]- N^5 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етилфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл)пентандіамідом (1:1);
сполука мурашиної кислоти з N^1 -[(33)-1-азабіцикло[2.2.2]окт-3-ил]- N^4 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етилфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл)сукцинамідом (1:1);
сполука мурашиної кислоти з N^1 -[(3R)-1-азабіцикло[2.2.2]окт-3-ил]- N^4 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етилфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл)сукцинамідом (1:1);
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-((4R)-6-етил-2,2-діоксидо-3,4-дигідро-1H-ізотіохромен-4-іл)аміно)-2-гідроксипропіл)пентанамід;
 N -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[4R)-6-етил-2,2-діоксидо-3,4-дигідро-1H-ізотіохромен-4-іл]аміно]-2-гідроксипропіл)-3-фенілпропанамід;
 N^1 -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-[4-

(диметиламіно)бут-1-ініл]-N³,N³-дипропілізофталамід;
 1-бутил-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-(трифторацетил)-1H-індол-6-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(1-(3-етинілфеніл)циклопропіл)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[[ізопентил(метил)аміно]метил]-5-метилбензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(1-(3-етилфеніл)циклопропіл)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[[ізопентил(метил)аміно]метил]-5-метилбензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(1-(3-етинілфеніл)циклопропіл)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(дипропіламіно)-1-метил-1H-пірол-2-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(4R)-6-етил-2,2-діоксидо-3,4-дигідро-1H-ізотіохромен-4-іл]аміно)-2-гідроксипропіл)-4-(2-метоксіетил)бензамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-[4-(диметиламіно)бутил]-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[6-етил-2-(метилсульфоніл)-1,2,3,4-тетрагідроізохінолін-4-іл]аміно]-2-гідроксипропіл)ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[6-етил-2-(метилсульфоніл)-1,2,3,4-тетрагідроізохінолін-4-іл]аміно]-2-гідроксипропіл)ацетамід;
 2,6-дихлор-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(1-(3-етинілфеніл)циклопропіл)аміно]-2-гідроксипропіл)піримідин-4-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(1S)-7-етил-1,2,3,4-тетрагідронафтален-1-іл]аміно)-2-гідроксипропіл)ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(1R)-7-етил-1,2,3,4-тетрагідронафтален-1-іл]аміно)-2-гідроксипропіл)ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(1-(3-етинілфеніл)циклопропіл)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-морфолін-4-іл-4-(трифторметил)-1,3-тіазол-5-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-бензил-3-[(6-етил-2,2-діоксидо-3,4-дигідро-1H-ізотіохромен-4-іл)аміно]-2-гідроксипропіл)ацетамід;
 N-[(1S,2R)-3-[(1-(3-бромфеніл)циклопропіл)аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]ацетамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(1-(3-етилфеніл)-1H-тетразол-5-іл]метил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
 3-(алілсульфініл)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(1-(3-етилфеніл)циклопропіл)аміно]-2-гідроксипропіл)бензамід;
 метил-3-[3'-(ацетиламіно)-1,1'-дифеніл-3-іл]-3-[[2(2R,3S)-3-(ацетиламіно)-4-(3,5-дифторфеніл)-2-гідроксибутил]аміно]пропаноат;
 метил-3-[[2(2R,3S)-3-(ацетиламіно)-4-(3,5-дифторфеніл)-2-гідроксибутил]аміно]-3-[3-(5-формілітєн-2-іл)феніл]пропаноат;
 метил-3-[[2(2R,3S)-3-(ацетиламіно)-4-(3,5-дифторфеніл)-2-гідроксибутил]аміно]-3-(2'-ацетил-1,1'-дифеніл-3-іл)пропаноат;
 метил-3-[[2(2R,3S)-3-(ацетиламіно)-4-(3,5-дифторфеніл)-2-гідроксибутил]аміно]-3-[3'-(гідроксиметил)-1,1'-дифеніл-3-іл]пропаноат;

N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(1-(3'-метокси-1,1'-дифеніл-3-іл)циклопропіл)аміно]пропіл)ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(1-(3'-гідроксиметил)-1,1'-дифеніл-3-іл)циклопропіл)аміно]пропіл)ацетамід;
 N-[(1S,2R)-3-[(1-(2'-ацетил-1,1'-дифеніл-3-іл)циклопропіл)аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]ацетамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(1-[3-(5-формілітєн-2-іл)феніл]циклопропіл)аміно]-2-гідроксипропіл]ацетамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-(9H-флуорен-9-іламіно)-2-гідроксипропіл]ацетамід;
 метил-3-[[2(2R,3S)-3-(ацетиламіно)-4-(3,5-дифторфеніл)-2-гідроксибутил]аміно]-3-[3-(трифторметил)феніл]пропаноат;
 метил-3-[[2(2R,3S)-3-(ацетиламіно)-4-(3,5-дифторфеніл)-2-гідроксибутил]аміно]-3-(3-ціанофеніл)пропаноат;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-[3-(диметиламіно)пропіл]-N³,N³-дипропілізофталамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3'-(гідроксиметил)-5-(1,3-тіазол-2-іл)-1,1'-дифеніл-3-карбоксамід;
 3'-ціано-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-(1,3-тіазол-2-іл)-1,1'-дифеніл-3-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2'-етокси-5-(1,3-тіазол-2-іл)-1,1'-дифеніл-3-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-(1,3-тіазол-2-іл)-3-(трифторметокси)-1,1'-дифеніл-3-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4'-пропокси-5-(1,3-тіазол-2-іл)-1,1'-дифеніл-3-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4'-(диметиламіно)-5-(1,3-тіазол-2-іл)-1,1'-дифеніл-3-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3'-етокси-5-(1,3-тіазол-2-іл)-1,1'-дифеніл-3-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4'-етокси-5-(1,3-тіазол-2-іл)-1,1'-дифеніл-3-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4'-ізопропокси-5-(1,3-тіазол-2-іл)-1,1'-дифеніл-3-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4'-(гідроксиметил)-5-(1,3-тіазол-2-іл)-1,1'-дифеніл-3-карбоксамід;
 4'-бутоксі-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-(1,3-тіазол-

2-іл)-1,1'-дифеніл-3-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4'-метокси-5-(1,3-тіазол-2-іл)-1,1'-дифеніл-3-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-(1,3-тіазол-2-іл)-4-(трифторметокси)-1,1'-дифеніл-3-карбоксамід;
 4'-бутил-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-(1,3-тіазол-2-іл)-1,1'-дифеніл-3-карбоксамід;
 3'-бутоксид-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-(1,3-тіазол-2-іл)-1,1'-дифеніл-3-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3'-ізопропіл-5-(1,3-тіазол-2-іл)-1,1'-дифеніл-3-карбоксамід;
 3'-(ацетиламіно)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-(1,3-тіазол-2-іл)-1,1'-дифеніл-3-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2'-метил-5-(1,3-тіазол-2-іл)-1,1'-дифеніл-3-карбоксамід;
 2'-ацетил-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-(1,3-тіазол-2-іл)-1,1'-дифеніл-3-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4'-гідрокси-5-(1,3-тіазол-2-іл)-1,1'-дифеніл-3-карбоксамід;
 4'-(ацетиламіно)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-(1,3-тіазол-2-іл)-1,1'-дифеніл-3-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-(1H-пірол-2-іл)-5-(1,3-тіазол-2-іл)бензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[(E)-2-(4-фторфеніл)етеніл]-5-(1,3-тіазол-2-іл)бензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етинілфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл)піримідин-4-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етилфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл)ацетамід;
 метил-3-[[2R,3S]-3-(ацетиламіно)-4-(3,5-дифторфеніл)-2-гідроксибутил]аміно]-3-(3-бромфеніл)пропаноат;
 2-хлор-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етинілфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл)-6-морфолін-4-ілпіримідин-4-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етинілфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(дипропіламіно)-6-морфолін-4-ілпіримідин-4-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етинілфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл)-2,6-біс(дипропіламіно)піримідин-4-карбоксамід;
 метил-3-[[2R,3S]-3-(ацетиламіно)-4-(3,5-дифторфеніл)-2-гідроксибутил]аміно]-3-(3-бромфеніл)пропаноат;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етинілфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл)ацетамід;
 або її фармацевтично прийнятні солі.
 20. Сполука, що являє собою:
 N'-((1S,2S)-3-(бензиламіно)-1-(3,5-дифторбензил)-

2-гідроксипропіл]-5-метил-N,N-дипропілізофталамід;
 N'-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-етиніл-N,N-дипропілізофталамід;
 N-(1-циклопропілетил)-N'-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-N-фенілсукцинамід;
 N'-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-[(1E)-проп-1-ен-1-іл]бензил)аміно]пропіл)-5-метил-N,N-дипропілізофталамід;
 N'-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-ізопропілбензил)аміно]пропіл)-5-(1,3-оксазол-2-іл)-N,N-дипропілізофталамід;
 метил-3-[[2R,3S]-4-(3,5-дифторфеніл)-3-[(3-дипропіламіно)карбоніл]-5-(1,3-оксазол-2-іл)бензоіл]аміно]-2-гідроксибутил]аміно]метил]феніл]метилкарбамат;
 N'-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-[(метилсульфоніл)аміно]бензил)аміно]пропіл)-5-(1,3-оксазол-2-іл)-N,N-дипропілізофталамід;
 N'-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-ізопропілбензил)аміно]пропіл)-N,N-дипропілпіридин-3,5-дикарбоксамід;
 N'-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-N,N-дипропілпіридин-3,5-дикарбоксамід 1-оксид;
 N'-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етинілбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-етиніл-N,N-дипропілізофталамід;
 N⁴-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-ізопропілбензил)аміно]пропіл)-6-метил-N²,N²-дипропілпіридин-2,4-дикарбоксамід;
 N'-((1S,2R)-3-[(2-трет-бутилпіримідин-4-іл)метил]аміно)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N,N-дипропілізофталамід;
 N'-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(2-етилпіримідин-4-іл)метил]аміно)-2-гідроксипропіл)-5-метил-N,N-дипропілізофталамід;
 N'-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(1S)-1-[(ізобутиламіно)карбоніл]-3-(метилсульфоніл)пропіл]аміно]пропіл)-5-метил-N,N-дипропілізофталамід;
 N'-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-гідрокси-1-фенілпропіл)аміно]пропіл)-5-метил-N,N-дипропілізофталамід;
 N'-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(6,7,8,9-тетрагідро-5H-бензо[7]анулен-5-іламіно)пропіл)-5-метил-N,N-дипропілізофталамід;
 N'-((1S,2S)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(1R)-6-метокси-1,2,3,4-тетрагідронафтален-1-іл]аміно]пропіл)-5-метил-N,N-дипропілізофталамід;
 N'-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(1R)-6-метокси-1,2,3,4-тетрагідронафтален-1-іл]аміно]пропіл)-5-метил-N,N-дипропілізофталамід;
 N'-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(1S)-2-оксо-1-метил-2-(метиламіно)етил]аміно]пропіл)-5-метил-N,N-дипропілізофталамід;
 N'-((1S,2R)-3-[(1S)-1-бензил-2-оксо-2-(метиламіно)етил]аміно)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N,N-дипропілізофталамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-N²-[оксо[3-(трифторметил)феніл]метил]гліцинамід;
 2-[[2-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-

етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)аміно]-2-оксоетил]тіо]-N-(5-метилізоксазол-3-іл)ацетамід;
 N'-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-[[[(1S)-1-[оксо(метиламіно)метил]-3-(метилтіо)пропіл]аміно]пропіл]-5-метил-N,N-дипропілізофталамід;
 N'-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-[[[(1R)-1-(гідроксиметил)-2-оксо-2-(метиламіно)етил]аміно]пропіл]-5-метил-N,N-дипропілізофталамід;
 N'-[[[(1S,2R)-3-[[[(1S)-1-[аміно(оксо)метил]-3-метилбутил]аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N,N-дипропілізофталамід;
 N'-[[[(1S,2R)-3-[[[(2-аміно-2-оксо-1-метилетил)аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N,N-дипропілізофталамід;
 трет-бутил-(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропілкарбамат;
 трет-бутил-(1S,2R)-3-(циклопропіламіно)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропілкарбамат;
 трет-бутил-(1S,2R)-3-[(циклопропілметил)аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропілкарбамат;
 трет-бутил-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-[[2-оксо-2-(ізобутиламіно)-1-метилетил]аміно]пропіл)карбамат;
 бензил-(1S,2R)-1-бензил-3-[[3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропілкарбамат;
 (2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-1-[[1-(3-етинілфеніл)циклопропіл]аміно]бутан-2-ол;
 трет-бутил-[[[(1S,2R)-3-[[[(1S)-2-(бензиламіно)-2-оксо-1-метилетил]аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]карбамат;
 N'-[[2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-2-гідроксибутил]-N¹-бензил-1-аланінамід у біс(трифторацетат) (сіль);
 трет-бутил-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-[[1-(2-ізобутил-1,3-тіазол-5-іл)циклопропіл]аміно]пропіл)карбамат;
 (2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-1-[[1-(2-ізобутил-1,3-тіазол-5-іл)циклопропіл]аміно]бутан-2-ол у біс(трифторацетат) (сіль);
 трет-бутил-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-[[1-(3-ізобутилізоксазол-5-іл)циклопропіл]аміно]пропіл)карбамат;
 (2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-1-[[1-(3-ізобутилізоксазол-5-іл)циклопропіл]аміно]бутан-2-ол у біс(трифторацетат) (сіль);
 трет-бутил-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[2-етилпіримідин-4-іл)метил]аміно]-2-гідроксипропіл)карбамат;
 (2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-1-[[2-етилпіримідин-4-іл)метил]аміно]бутан-2-ол у біс(трифторацетат) (сіль);
 трет-бутил-[[[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-[[7-метоки-1,2,3,4-тетрагідронафтален-1-іл)аміно]пропіл]карбамат;
 трет-бутил-[[[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-[[6,7,8,9-тетрагідро-5H-бензо[7]анулен-5-іламіно]пропіл]карбамат;
 трет-бутил-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-[[3-гідроксі-1-фенілпропіл]аміно]пропіл)карбамат;
 трет-бутил-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-[[[(1S)-1-[оксо(ізобутиламіно)метил]-3-(метилтіо)пропіл]аміно]пропіл]карбамат;
 трет-бутил-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-

гідроксі-3-[[[(1S)-1-[(ізобутиламіно)карбоніл]-3-(метилсульфоніл)пропіл]аміно]пропіл]карбамат;
 трет-бутил-[[[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[2,2-діоксидо-3,4-дигідро-1,2-бензоксантин-4-іл)аміно]-2-гідроксипропіл]карбамат;
 трет-бутил-[[[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[2,2-діоксидо-3,4-дигідро-1H-2,1-бензотіазин-4-іл)аміно]-2-гідроксипропіл]карбамат;
 трет-бутил-[[[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етилфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл]карбамат;
 трет-бутил-[[[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етинілфеніл)циклопропіл]аміно]-2-гідроксипропіл]карбамат;
 трет-бутил-[[[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-[[1-(3-метилфеніл)циклопропіл]аміно]пропіл]карбамат;
 трет-бутил-[[[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-[[1-(3-йодфеніл)циклопропіл]аміно]пропіл]карбамат;
 трет-бутил-[[[(1S,2R)-3-[[3-(циклопропіламіно)бензил]аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]карбамат;
 метил-3-[[[(2R,3S)-3-[[трет-бутоксикарбоніл]аміно]-4-(3,5-дифторфеніл)-2-гідроксибутил]аміно]метил]бензоат;
 метил-3-[[[(2R,3S)-3-[[трет-бутоксикарбоніл]аміно]-4-(3,5-дифторфеніл)-2-гідроксибутил]аміно]метил]феніл]карбамат;
 метил-3-[[[(2R,3S)-3-[[трет-бутоксикарбоніл]аміно]-4-(3,5-дифторфеніл)-2-гідроксибутил]аміно]метил]феніл]метилкарбамат;
 трет-бутил-[[[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[3-(диметиламіно)сульфоніл]бензил]аміно]-2-гідроксипропіл]карбамат;
 трет-бутил-[[[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-[[3-(метилсульфо-ніл)аміно]бензил]аміно]пропіл]карбамат;
 трет-бутил-[[[(1S,2R)-3-[[3-ціанобензил]аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]карбамат;
 3-[[[(2R,3S)-3-[[трет-бутоксикарбоніл]аміно]-4-(3,5-дифторфеніл)-2-гідроксибутил]аміно]метил]феніл-диметилкарбамат;
 трет-бутил-[[[(2R,3S)-4-(3,5-дифторфеніл)-3-[[3-[[дипропіламіно]карбоніл]-5-метилбензоїл]аміно]-2-гідроксибутил]3-(етилтіо)бензил]карбамат;
 трет-бутил-[[[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1R)-2,3-дигідро-1H-інден-1-іламіно]-2-гідроксипропіл]карбамат;
 трет-бутил-[[[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1S)-2,3-дигідро-1H-інден-1-іламіно]-2-гідроксипропіл]карбамат;
 трет-бутил-[[[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-[[[(1S,2R)-2-гідроксі-2,3-дигідро-1H-інден-1-іл]аміно]пропіл]карбамат;
 трет-бутил-[[[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-[[[(1R,2S)-2-гідроксі-2,3-дигідро-1H-інден-1-іл]аміно]пропіл]карбамат;
 трет-бутил-[[[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-[[[(3S)-2-оксоазепан-3-іл]аміно]пропіл]карбамат;
 трет-бутил-[[[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксі-3-[[[(3R)-2-оксоазепан-3-іл]аміно]пропіл]карбамат;
 трет-бутил-[[[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[[(5S)-

3-етил-2-оксо-1,3-оксазолідин-5-іл]метил}аміно)-2-гідроксипропіл]карбамат;
трет-бутил-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-(((5R)-3-етил-2-оксо-1,3-оксазолідин-5-іл]метил}аміно)-2-гідроксипропіл]карбамат;
трет-бутил-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[1-(3-етилфеніл)-1-метилетил]аміно]-2-гідроксипропіл]карбамат;
трет-бутил-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(2-нафтилметил)аміно]пропіл]карбамат;
трет-бутил-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[[2-оксо-2-(ізобутиламіно)-1,1-диметилетил]аміно]пропіл]карбамат;
трет-бутил-[(1S,2R)-3-[(бензилокси)аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]карбамат;
трет-бутил-4-[[((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]карбоніл]піперидин-1-карбоксилату трифторацетат;
N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-фтор-1-нафтамід;
N-[(1S,2R)-1-бензил-3-(2-бутирил-1-етилгідазино)-2-гідроксипропіл]-2-(3-метилізоксазол-5-іл)ацетамід;
N'-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-N-гексил-N,5-диметилізофталамід;
N'-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензоїл)аміно]пропіл]-5-метил-N,N-дипропілізофталамід;
N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-1-метил-1H-імідазол-2-карбоксамід;
N'-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3,3-диметил-N²,N²-дипропілциклопропан-1,2-дикарбоксамід;
трет-бутил-2-[[((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]карбоніл)-1-метил-1H-імідазол-4-іл]карбамат;
N⁵-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2,2-диметил-N¹,N¹-дипропілпентандіамід;
N-((1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(2-морфолін-4-ілетил)аміно]пропіл]-2-(4-хлорфенокси)-2-метилпропанамідна сполука з метилгідропероксидом (1:2);
N-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-4-фтор-1-нафтамід;
3-[(дипропіламіно)сульфоніл]-N-[(1S,2R)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)-1-(4-ізопропілбензил)пропіл]пропанамід;
3-[(дипропіламіно)сульфоніл]-N-[(1S,2R)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)-1-(3-метоксибензил)пропіл]пропанамід;
N'-[(1S,2R)-1-(3,5-дихлорбензил)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)пропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
N'-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-2-гідрокси-1-(4-метоксибензил)пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
N'-[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-2-гідрокси-1-(4-метоксибензил)пропіл]-N³,N³-дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;

N'-[(1S,2R)-2-гідрокси-1-(4-ізопропілбензил)-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-N³,N³-дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
3-[(дипропіламіно)сульфоніл]-N-((1S)-1-((1R)-1-гідрокси-2-[(3-метоксибензил)аміно]етил)бут-3-иніл)пропанамід;
N'-[(1S,2R)-1-(2-фурилметил)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)пропіл]-N⁵,N⁵-дипропілпентандіамід;
N'-[(1S,2R)-1-(2-фурилметил)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
N'-[(1S,2R)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]-1-(1-нафтилметил)пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід;
N'-((1S)-1-((1R)-1-гідрокси-2-[(3-метоксибензил)аміно]етил)-3-метилбутил)-N³,N³-дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
N'-[(1S,2R)-1-(2-фурилметил)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)пропіл]-N³,N³-дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
N'-[(1S,2R)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]-1-(1-нафтилметил)пропіл]-N³,N³-дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід;
N-((1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-3-[(2-метоксіетил)(пропіл)аміно]сульфоніл]пропанамід;
N-((1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-3-(4,5-диметил-2-фурил)-5-метилбензамід;
3-[(дипропіламіно)сульфоніл]-N-[(1S,2R)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)-1-(4-метилбензил)пропіл]пропанамід;
1 3-[(дипропіламіно)сульфоніл]-N-((1S,2R)-1-(3-фтор-5-гідроксибензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]пропанамід;
N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-йодбензил)аміно]пропіл]-1,3-бензотіазол-2-карбоксамід;
N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-йодбензил)аміно]пропіл]-5-(2,5-диметилфенокси)-2,2-диметилпентанамід;
N-[(1S,2R)-3-аміно-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-3-(ізопентилсульфоніл)пропанаміду трифторацетат;
N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-2-гідрокси-5-метилбензамід;
4-аміно-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]бутанаміду біс(трифторацетат);
N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-[(піридин-4-ілметил)тіо]бензамід;
N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2,1,3-бензоксадіазол-5-карбоксамід;
N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-метил-1,2,3-тіадіазол-5-карбоксамід;
N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-[(піридин-2-ілтіо)метил]-2-фурамід;
N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-1-феніл-5-пропіл-1H-піразол-4-карбоксамід;

N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-гідроксихінолін-4-карбоксамід;
N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-6-гідроксинікотинамід;
N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1-бензотіофен-2-карбоксамід;
7-хлор-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-гідроксихінолін-3-карбоксамід;
N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-метилізоксазол-5-карбоксамід;
N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-метилізоксазол-3-карбоксамід;
N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(3,5-диметил-1Н-піразол-1-іл)бензамід;
N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-метокси-1Н-індол-2-карбоксамід;
N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2,5-диметил-3-фурамід;
N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-6-гідрокси-2-(метилтіо)піримідин-4-карбоксамід;
N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-метил-1,3-оксазол-4-карбоксамід;
N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-метил-1Н-піразол-5-карбоксамід;
N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)тіофен-3-карбоксамід;
6-хлор-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1Н-індол-2-карбоксамід;
N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1Н-індол-5-карбоксамід;
N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-метил-1,3-оксазол-5-карбоксамід;
N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-метоксибензамід;
4-(ацетиламіно)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)бензамід;
N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-піперидин-1-ілбензамід;
N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-фенілімідазол[1,2-а]піридин-7-карбоксамід;
N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-

етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-6-гідрокси-4-метилпіридин-2-карбоксамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]- N^4 , N^4 -дифенілсукцинамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-[етил(метил)аміно]-4-гідроксипіримідин-5-карбоксамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4,8-дигідроксінолін-2-карбоксамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-1-бензофуран-2-карбоксамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-1-етил-1H-індол-2-карбоксамід;
2-(ацетиламіно)- N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4,5-диметилтіофен-3-карбоксамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-гідроксініоксалин-2-карбоксамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-1H-індазол-3-карбоксамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил-2-феніл-1,3-оксазол-4-карбоксамід;
4-хлор- N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-6-метилхінолін-2-карбоксамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]- N^2 , N^2 -диметилфталамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]тіофен-2-карбоксамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-фурамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-метил-3-фурамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-гідрокси-6-неопентилпіридин-2-карбоксамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-1,3-тіазол-4-карбоксамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-гідрокси-7-метокси-1-бензотіофен-5-карбоксамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-гідрокси-7-метокси-1-бензофуран-5-карбоксамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-феніл-1,3-оксазол-4-карбоксамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3,4-дигідроксibenзамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]- N^4 -фенілсукцинамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-

етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]- N^4 -піридин-3-ілсукцинамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]- N^4 -(2,6-диметилфеніл)сукцинамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]- N^4 -метилсукцинамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-(4-метоксифенокси)пропанамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-гідрокси-7-метоксініолін-3-карбоксамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-[метил(метилсульфоніл)аміно]бензамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-(піролідин-3-ілсульфоніл)бензамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-метил-5-(4-метил-1,2,3-тіадіазол-5-іл)ізоксазол-4-карбоксамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил-2-феніл-2H-1,2,3-тіазол-4-карбоксамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-(4-метил-1,2,3-тіадіазол-5-іл)-1,3-тіазол-4-карбоксамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-фенілімідазо[1,2-а]піридин-6-карбоксамід;
 N^1 -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]- N^5 -(1,3-тіазол-2-іл)пентандіамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-[(4-метил-1,2,3-тіадіазол-5-іл)тіо]ацетамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-(піперидин-1-ілметил)-2-фурамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2,5-диметил-1-феніл-1H-пірол-3-карбоксамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил-1-феніл-1H-піразол-3-карбоксамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-фтор-4-морфолін-4-ілбензамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3,5-біс(метилтіо)ізотіазол-4-карбоксамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-метил-5-(трифторметил)ізоксазол-4-карбоксамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-гідрокси-5-(пропіоніламіно)бензамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-1-феніл-1H-пірол-2-карбоксамід;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]піразин-2-карбоксаміду 4-оксид;
 N -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-

етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил-1-піридин-4-іл-1Н-1,2,3-триазол-4-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-6-метоксипіразин-2-карбоксаміду 4-оксид;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-1-метил-5-феніл-1Н-піразол-3-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-гідрокси-3-пропілгексанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-1Н-бензимидазол-5-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-гідрокси-4-(пропіоніламіно)бензамід;
 5-хлор-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1-бензофуран-2-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-піридин-3-іл-1,3-тіазол-4-карбоксамід;
 8-ціано-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-гідроксигінолін-3-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-1,6-нафтиридин-2-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2,2-диметил-4-оксохроман-6-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-(морфолін-4-ілметил)бензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4,7-диметокси-1-бензофуран-5-карбоксамід;
 3-хлор-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-фенілізотіазол-4-карбоксамід;
 2-(2,1,3-бензотіадіазол-4-ілокси)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-метокси-4-(метилтіо)бензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-[(4-метил-1,3-тіазол-2-іл)тіо]ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-6-метокси-1-бензофуран-2-карбоксамід;
 5-хлор-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-морфолін-4-ілбензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-метокси-1Н-пірол-3-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-метил-1,3-тіазол-4-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-метил-5-(2-тієніл)-3-фурамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-

етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-метокситіофен-3-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N'-(3,5-диметилпіразин-2-іл)сукцинамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-[(3,4-диметоксифеніл)тіо]ацетамід;
 6-хлор-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-(трифторметил)піридин-2-карбоксамід;
 N-(2-ацетил-3-тієніл)-N'-(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]сукцинамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-1-(4-фторфеніл)-5-метил-1Н-1,2,4-триазол-3-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N'-[2-фтор-5-(метилсульфоніл)феніл]сукцинамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-(4-метоксифеніл)тіофен-2-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-[5-(метилсульфініл)-2,3-дигідро-1Н-індол-1-іл]-4-оксобутанамід;
 2-(ацетиламіно)-5-хлор-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)тіофен-3-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-пропілтетрагідро-2Н-піран-4-карбоксамід;
 4-хлор-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-7,7-диметил-7,8-дигідро-5Н-пірано[4,3-b]піридин-2-карбоксамід;
 2-(2-хлорфеніл)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1,3-тіазол-4-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-(3-метилфеніл)-1,3-тіазол-4-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1,2,5-тіадіазол-3-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-(феноксиметил)-1,3-тіазол-4-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-(4-метилфеніл)-1,3-тіазол-4-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-піридин-3-ілбензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-метил-2-феніл-1,3-оксазол-5-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1-етил-3-(2-тієніл)-1Н-піразол-5-карбоксамід;
 4-(ацетиламіно)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1-метил-1Н-пірол-2-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(2,6-

диметилфенокси)пропанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-феніл-1,2,3-тіадіазол-5-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(2,5-диметил-1H-пірол-1-іл)тіофен-3-карбоксамід;
 5-(ацетиламіно)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-гідроксибензамід;
 4-(ацетиламіно)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)бутанаміду трифторацетат;
 N-((1S,2R)-1-бензил-3-[1-етил-2-(4-метилпентаноіл)гідразино]-2-гідроксипропіл)-2-[(метилсульфоніл)аміно]-1,3-оксазол-4-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-(1-метил-1H-імідазол-2-іл)бензамід;
 N'-((1S,2R)-3-[(1R)-3-циклогексил-1-фенілпропіл]аміно)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N,N-дипропілізофталамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-N³,N³-дипропіл-5-піридин-3-ілізофталамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-фтор-1-нафтамід;
 N-циклогексил-N'-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-N,5-диметилізофталамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1-метил-1H-імідазол-2-карбоксамід;
 N¹-((1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл)-N³-[оксо(феніл)метил]-β-аланінамід;
 N¹-((1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл)-N²-[іміно(феніл)метил]глїцинамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-N³-(2-пропілпентанімідоіл)-β-аланінамід;
 6-(4-бензилпіперазин-1-іл)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-йодбензил)аміно]пропіл)нікотинамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[(3-метоксифеніл)сульфоніл]пропанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-метил-7-(трифторметил)піразоло[1,5-а]піримідин-2-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-N'-(5-феніл-1,3,4-тіадіазол-2-іл)сукцинамід;
 N-(5-циклопропіл-1,3,4-тіадіазол-2-іл)-N'-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)сукцинамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-(3-метил-5-оксо-4,5-дигідро-1H-піразол-1-іл)бензамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)тієно[2,3-*b*]хінолін-2-карбоксамід;

N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1-метил-5-оксо-2-фенілпролінамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-метил-4H,6H-піроло[1,2-*a*][4,1]бензоксазепін-4-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-[(7-гідрокси-5-метил[1,2,4]триазоло[1,5-*a*]піримідин-2-іл)тіо]ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-оксо-2,3-дигідро-1,2-бензизотіазол-6-карбоксаміду 1,1-діоксид;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)тієно[3,2-*c*]піридин-2-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-оксо-2,3-дигідро-1,3-бензоксазол-6-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-1-[оксо(фенокси)метил]пролінамід;
 6-хлор-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-метил-2-оксо-2,3-дигідро-1,3-бензоксазол-5-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-[4-(2,5-діоксопіролідін-1-іл)феноксі]ацетамід;
 N²-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-N¹-фенілпіролідін-1,2-дикарбоксамід;
 2-(1,3-бензотіазол-2-ілметокси)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-метил-4-оксо-3,4-дигідрофалазин-1-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)індолізін-2-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-оксо-4-фенілбутанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-2-(1,3-диметил-2,6-діоксо-1,2,3,6-тетрагідро-7H-пурин-7-іл)ацетамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(3-гідроксифеніл)-4-оксобутанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-4-(3-метоксифеніл)-4-оксобутанамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3',4'-дигідро-1'H-спіро[1,3-діоксолан-2,2'-нафтален]-8'-карбоксамід;
 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3',4'-дигідро-1'H-спіро[1,3-діоксолан-2,2'-нафтален]-7'-карбоксамід;
 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-N²-[меркапто(метилтіо)метил]-D-аланінамід;

N²-[(4-хлорфеніл)(оксо)метил]-N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]гліцинамід;
 N²-[(4-трет-бутилфеніл)(оксо)метил]-N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]гліцинамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N²-[оксо(піридин-3-іл)метил]гліцинамід;
 2-[[2-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]аміно]-2-оксоетил]тіо]-N-[4-(1,3-оксазол-5-іл)феніл]ацетамід;
 N²-[(4-хлорфеніл)(оксо)метил]-N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-D-аланінамід;
 N²-[(3,4-дихлорфеніл)(оксо)метил]-N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]гліцинамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-(5a,9a-дигідродибензо[b,d]фуран-2-іл)-4-оксобутанамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N²-[оксо[4-(трифторметил)феніл]метил]гліцинамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N²-[(2,6-дифторфеніл)(оксо)метил]гліцинамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N²-[оксо(4-метоксифеніл)метил]гліцинамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-(2-оксо-1,3-оксазолідин-3-іл)бензамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-(фенілетиніл)нікотинамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N³-[оксо(1H-1,2,4-триазол-5-іл)метил]-β-аланінамід;
 2-[[2-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]аміно]-2-оксоетил]тіо]-N-(піридин-4-ілметил)ацетамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-[(метоксиметил)тіо]бензамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-(1,5-диметил-3-оксо-2-феніл-2,3-дигідро-1H-піразол-4-іл)-4-оксобутанамід;
 4-(4-бензил-1,4-діазепан-1-іл)-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-оксобутанамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2,5-диметил-1-(піридин-4-ілметил)-1H-пірол-3-карбоксамід;
 N-[(диметиламіно)сульфоніл]гліцил-N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]гліцинамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-гідрокси-1-[(1R,2R)-2-гідроксициклогексил]пролінамід;
 (2S,3S)-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-1-метил-5-оксо-2-піридин-3-ілпіролідин-3-карбоксамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-

етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-(2,5-діоксопіролідин-1-іл)бензамід;
 N-(2-ціано-4,5,6,7-тетрагідро-1-бензотієн-3-іл)-N'-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]сукцинамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-(2,5-діоксоімідазолідин-4-іл)ацетамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-(5,7-диметил[1,2,4]триазоло[1,5-a]піримідин-2-іл)ацетамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-1-(2-фурилметил)-5-оксопіролідин-3-карбоксамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-оксо-4-(5-оксо-1,4-діазепан-1-іл)бутанамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-(4-метилфеніл)-4,5-дигідро-1H-піразол-5-карбоксамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2,1,3-бензоксадіазол-5-карбоксаміду 1-оксид;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-(2-піридин-3-ілпіперидин-1-іл)пропанамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-оксо-4-(2-пропіл-1H-імідазол-1-іл)бутанамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4a,9a-дигідро-9H-карбазол-9-карбоксамід;
 N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-6-метил-4-оксо-1-феніл-1,4-дигідропіридазин-3-карбоксамід;
 N'-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[[1-метил-5-(піролідин-1-ілкарбоніл)-1H-пірол-3-іл]аміно]пропіл]-5-метил-N,N-дипропілізофталамід;
 N'-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[[2-(2-оксо-2-піролідин-1-ілетокси)феніл]аміно]пропіл]-5-метил-N,N-дипропілізофталамід;
 N'-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[[3-(гідроксиметил)піперидин-1-іл]карбоніл]феніл]аміно]пропіл]-5-метил-N,N-дипропілізофталамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N²-[3-(метилтіо)-1-оксопропіл]-N²-пентилгліцинамід;
 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N²-[3-(метилсульфоніл)-1-оксопропіл]-N²-пентилгліцинамід;
 N-[(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-3-(фенілсульфоніл)пропанамід;
 N'-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[[7-оксабіцикло[2.2.1]гепт-2-илметил]аміно]пропіл]-5-метил-N,N-дипропілізофталамід;
 N'-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[[3R)-2-оксо-1-пропілазепан-3-іл]аміно]пропіл]-5-метил-N,N-дипропілізофталамід;
 N'-[(1S,2R)-3-[(1-ацетилпіперидин-4-іл)аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N,N-дипропілізофталамід;

аланінаміду трифторацетат;
 N^2 -[(бензилокси)карбоніл]- N^1 -{[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-метилбутил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]-D,L-аланінамід;
 N^2 -[(бензилокси)карбоніл]- N^1 -{[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(циклопропіламіно)-2-гідроксипропіл]-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]-D,L-аланінаміду трифторацетат;
 N^2 -[(бензилокси)карбоніл]- N^1 -{[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(циклопропілметил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]-D,L-аланінаміду трифторацетат;
 N^1 -{[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]- N^2 -{[(3S)-тетрагідрофуран-3-ілокси]карбоніл]-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]-L-аланінаміду трифторацетат;
 N^1 -{[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]- N^2 -{[(3S)-тетрагідрофуран-3-ілокси]карбоніл]-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]-D-аланінаміду трифторацетат;
 N^1 -{[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]- N^2 -{[(3S)-тетрагідрофуран-3-ілокси]карбоніл]-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]-D,L-аланінаміду трифторацетат;
 N^1 -{[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]- N^2 -{[(3R)-тетрагідрофуран-3-ілокси]карбоніл]-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]-D,L-аланінаміду трифторацетат;
 N^1 -{[(1S,2R)-1-бензил-3-[(3-метоксибензил)аміно]-2-гідроксипропіл]- N^2 -{[(3S)-тетрагідрофуран-3-ілокси]карбоніл]-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]-D,L-аланінамід;
 N^1 -{[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]- N^2 -{[(3S)-1,1-діоксидотетрагідротієн-3-ілокси]карбоніл]-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]-D,L-аланінаміду трифторацетат;
 N^1 -{[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]- N^2 -{[(3S)-тетрагідротіофен-3-ілокси]карбоніл]-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]-D,L-аланінаміду трифторацетат;
 N^1 -{[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]- N^2 -{[(3S)-1,1-діоксидотетрагідротієн-4-ілокси]карбоніл]-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]-D,L-аланінаміду трифторацетат;
 N^1 -{[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]- N^2 -{[(3R)-1,1-діоксидотетрагідротієн-4-ілокси]карбоніл]-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]-D,L-аланінаміду трифторацетат;
 N^2 -{[(1-ацетилпіперидин-4-ілокси]карбоніл]- N^1 -{[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]-D,L-аланінаміду трифторацетат;
 N^1 -{[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]- N^2 -{[(3R)-5-оксепіролідин-3-іл]метил]карбоніл]-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]-D,L-аланінаміду трифторацетат;

аланінамід;
N²(бензоіл)-N¹-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-
[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-3-[(1-
пропілбутил)сульфоніл]-D,L-аланінамід;
N¹-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-
етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-N²-
(фенілацетил)-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]-D,L-
аланінамід;
N¹-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-
етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-N²-(3-
фенілпропаноіл)-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]-D,L-
аланінаміду трифторацетат;
N¹-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-
метоксибензил)аміно]пропіл}-N²-
(циклопропілацетил)-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]-
D,L-аланінамід;
N¹-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-
метоксибензил)аміно]пропіл}-N²-
[(метилсульфоніл)ацетил]-3-[(1-
пропілбутил)сульфоніл]-D,L-аланінаміду трифто-
рацетат;
N¹-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-
метоксибензил)аміно]пропіл}-N²-
[(метилтіо)ацетил]-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]-
D,L-аланінамід;
N¹-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-
метоксибензил)аміно]пропіл}-N²-(4-гідрокси-4-
оксобутаноіл)-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]-D,L-
аланінамід;
N¹-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-
метоксибензил)аміно]пропіл}-N²-[4-(метиламіно)-4-
оксобутаноіл]-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]-D,L-
аланінамід;
N¹-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-
метоксибензил)аміно]пропіл}-N²-(4-метокси-4-
оксобутаноіл)-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]-D,L-
аланінамід;
N-(метилсульфоніл)гліцил-N¹-{(1S,2R)-1-бензил-2-
гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл}-3-[(1-
пропілбутил)сульфоніл]-D,L-аланінамід;
N²-ацетил-N¹-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-
метоксибензил)аміно]пропіл}-3-(фенілсульфоніл)-
D,L-аланінамід;
(2S)-2-(4-метокси-4-оксобутаноіл)аміно-N-{(1S,2R)-
1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-
метоксибензил)аміно]пропіл}-5-оксо-5-піперидин-
1-ілпентанамід;
(2R)-2-[(бензилокси)карбоніл]аміно-N-{(1S,2R)-1-
бензил-2-гідрокси-3-[(3-
метоксибензил)аміно]пропіл}-5-оксо-5-піперидин-
1-ілпентанамід;
(2R)-2-(3-етокси-3-оксопропаноіл)аміно-N-{(1S,2R)-
1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-
метоксибензил)аміно]пропіл}-5-оксо-5-піперидин-
1-ілпентанамід;
N¹-{(1S,2R)-1-бензил-3-[(3-метоксибензил)аміно]-2-
гідроксипропіл}-N²-(4-метокси-4-оксобутаноіл)-
N³,N⁵-дипропіл-D-глутамамід;
(2R)-2-(4-метокси-4-оксобутаноіл)аміно-N-{(1S,2R)-
1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-
метоксибензил)аміно]пропіл}-5-оксо-5-піперидин-
1-ілпентанамід;
(2R)-2-(5-метокси-5-оксопентаноіл)аміно-N-
{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-
метоксибензил)аміно]пропіл}-5-оксо-5-піперидин-
1-ілпентанамід;

N²-[(5-хлортієн-2-іл)сульфоніл]-N¹-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]-D,L-аланінамід;
 N¹-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-N²-(фенілсульфоніл)-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]-D,L-аланінамід;
 N²-[(бензиламіно)карбоніл]-N¹-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]-D,L-аланінамід;
 4-{{{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл}аміно)-3-[(ізопентилсульфоніл)метил]-4-оксомасляна кислота;
 метил-4-{{{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл}аміно)-3-[(ізопентилсульфоніл)метил]-4-оксобутаноат;
 N¹-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл}-2-[(ізопентилсульфоніл)метил]сукцинамід;
 N¹-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл}-2-[(ізопентилсульфоніл)метил]-N⁴-метилсукцинамід;
 N¹-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл}-2-[(ізопентилсульфоніл)метил]-N⁴,N⁴-диметилсукцинамід;
 N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-3-(4,4-диметил-2,5-діоксоімідазолідин-1-іл)-2-[(1-пропілбутил)сульфоніл]метилпропанамід;
 N-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл}-3-(етилсульфоніл)-2-[[[ізобутилсульфоніл)аміно]метил]пропанамід;
 N-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл}-3-(етилтіо)-2-[[[ізобутилсульфоніл)аміно]метил]пропанамід;
 (2S)-N-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл}-2-[(ізопентилсульфоніл)аміно]-4-(метилсульфоніл)бутанамід;
 N¹-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл}-N²-(ізопентилсульфоніл)-L-метіонінамід;
 S-3-{{{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл}аміно)-2-[(ізопентилсульфоніл)метил]-3-оксопропіл}етантіоат;
 N-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл}-2-гідрокси-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]пропанамід;
 N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-2-гідрокси-4-(фенілсульфоніл)бутанамід;
 N-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл}-2-гідрокси-4-(ізопентилсульфоніл)бутанамід;
 N-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-

метоксибензил)аміно]пропіл}-4-(ізопентилсульфоніл)-2-феноксипутанамід;
 N-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл}-4-(ізопентилсульфоніл)-2-(3-метоксифенокси)бутанамід;
 3-[1-[[[(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]аміно]карбоніл]-3-(ізопентилсульфоніл)пропокси]бензойної кислоти трифторацетат;
 метил-3-[1-[[[(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]аміно]карбоніл]-3-(ізопентилсульфоніл)пропокси]бензоат;
 N-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл}-2-гідрокси-4-(фенілсульфоніл)бутанамід;
 N-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл}-2-гідрокси-4-(фенілтіо)бутанамід;
 N-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл}-2-метокси-4-(фенілсульфоніл)бутанамід;
 N-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл}-2-метокси-4-(фенілтіо)бутанамід;
 N-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл}-4-(фенілсульфоніл)-2-пропоксибутанамід;
 N-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл}-2-(бензилокси)-4-(фенілсульфоніл)бутанамід;
 N-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл}-N²-[(бензилокси)карбоніл]-D,L-метіонінамід;
 (2S)-2-аміно-N-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл}-5-оксо-5-піперидин-1-ілпентанамід;
 (2S)-2-(2-етоксі-2-оксоетаніл)аміно-N-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл}-5-оксо-5-піперидин-1-ілпентанамід;
 (2R)-2-аміно-N-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл}-5-оксо-5-піперидин-1-ілпентанамід;
 (2R)-2-(2-етоксі-2-оксоетаніл)аміно-N-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл}-5-оксо-5-піперидин-1-ілпентанамід;
 (2R)-2-(4-етокси-4-оксобутаніл)аміно-N-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл}-5-оксо-5-піперидин-1-ілпентанаміду дитрифторацетат;
 N¹-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл}-N²-[(бензилокси)карбоніл]-L-аспартамід;
 N¹-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл}-N²-[(трет-бутилокси)карбоніл]-L-аспартамід;
 або її фармацевтично прийнятна сіль.

Винахід відноситься до сполук, що можуть бути використані для лікування хвороби Альцгеймера й аналогічних захворювань.

Хвороба Альцгеймера (ХА) являє собою прогресуюче дегенеративне захворювання головного мозку, яке головним чином обумовлене старечим

віком. Клінічна картина при ХА характеризується втратою пам'яті, порушенням когнітивних функцій, логічного мислення, розсудливості й орієнтування. В процесі розвитку захворювання також зачіпаються рухові, сенсорні і лінгвістичні здібності аж до повного порушення численних когнітивних функцій. Ця втрата когнітивних функцій протікає поступово, але звичайно призводить до різкого погіршення і, у кінцевому рахунку до смерті, протягом від чотирьох до дванадцяти років.

Хвороба Альцгеймера характеризується двома основними патологічними змінами в головному мозку: наявністю нейрофібрилярних сплетень і бета-амілоїдних (чи невротичних) бляшок, що переважно включають у себе агрегат пептидного фрагмента, відомий як А-бета. Для осіб з ХА характерна наявність бета-амілоїдних відкладень у головному мозку (бета-амілоїдні бляшки) і в церебральних кровоносних судинах (бета-амілоїдна ангіопатія), а також нейрофібрилярних сплетень. Нейрофібрилярні сплетіння не є специфічними для хвороби Альцгеймера, вони присутні також при інших захворюваннях, що призводять до деменції. Значне число таких патологічних змін звичайно виявляється при розкритті в зонах головного мозку людини, що відповідальні за пам'ять і когнітивні функції.

Менше число подібних патологічних змін при більш обмеженій анатомічній локалізації виявлені в головному мозку більшості людей похилого віку без клінічної ХА. Наявність амілоїдогенних бляшок і судинної амілоїдної ангіопатії головного мозку також характерно при трисомії 21 (синдромі Дауна), уродженому внутрішньомозковому крововиливі з голандським амілоїдозом (HCHWA-D) і інших нейродегенеративних захворюваннях. В даний час існує припущення, що бета-амілоїд, який являється характерною ознакою ХА, виступає причиною чи фактором розвитку захворювання. Основним фактором розвитку ХА є відкладення А-бета в зонах головного мозку, відповідальних за когнітивну активність. Бета-амілоїдні бляшки складаються переважно з амілоїдного бета-пептиду (А-бета, що позначається також іноді як бета-А4). Бета-пептид утворюється в результаті протеолізу білка-попередника амілоїда (APP) і складається з 39-42 амінокислот. У процесінгу APP беруть участь особливі протеази, що називаються секретазами.

Розщеплення APP по N-термінальному залишку А-бета-пептиду під дією бета-секретази і по 3-термінальному залишку під дією однієї чи більше гама-секретаз складає бета-амілоїдогенез, тобто шлях утворення А-бета. Розщеплення APP альфа-секретазою продукує альфа-sAPP, форму APP, що секретується, не утворюючи бета-амілоїдних бляшок. Цей альтернативний шлях перешкоджає утворенню А-бета-пептиду.

Аспарагіл-протеаза ідентифікована як фермент, що відповідає за процесінг APP на сайті розщеплення бета-секретази. Фермент бета-секретаза розкритий за допомогою різних найменувань, включаючи BACE, Asp і Метарсин.

Ряд доказів свідчать про те, що прогресуюче церебральне відкладення амілоїдного бета-пептиду (А-бета) відіграє основну роль у патогенезі ХА і може передувати когнітивним симптомам

протягом декількох років чи десятиліть. Продемонстровано вивільнення А-бета з нервових клітин, вирощених на культурі, і присутність А-бета в спинномозковій рідині (СМР) як здорових людей, так і пацієнтів з ХА.

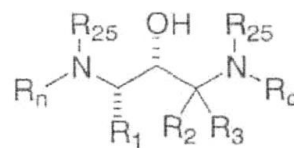
Існує припущення, що А-бета-пептид накопичується в результаті процесінга APP під дією бета-секретази, отже, для лікування ХА важливо інгібування саме цієї ферментної активності. Передбачається, що процесінг APP на сайті розщеплення бета-секретази в експериментах *in vivo* є стадією продукування, що лімітує, А-бета, і, таким чином, служить терапевтичною мішенню для лікування ХА.

BACE1 миші, що знаходяться в несвідомому стані, не продукують А-бета і являють собою нормальний фенотип. При схрещуванні з трансгенними мишами, які надлишково експресують APP, потомство показує знижений вміст А-бета в екстрактах головного мозку в порівнянні з контрольними тваринами (Luo et al., 2001 Nature Neuroscience 4: 231-232). Це ще раз підтверджує припущення про те, що терапевтичний підхід до лікування ХА й інших бета-амілоїдних розладів полягає в інгібуванні активності бета-секретази і скороченні А-бета в головному мозку.

В даний час не існує ефективних способів зупинки чи запобігання реверсії розвитку хвороби Альцгеймера. Тому виникає наполеглива потреба у фармацевтичних агентах, здатних сповільнювати розвиток хвороби Альцгеймера і/чи попереджати її на початковому етапі.

Для лікування і попередження захворювання, що характеризується бета-амілоїдними відкладеннями чи бляшками, такого як ХА, необхідні сполуки, що є ефективними інгібіторами бета-секретази та інгібують опосередковане бета-секретазою розщеплення APP; що є ефективними інгібіторами продукування А-бета і/чи скорочують бета-амілоїдні відкладення чи бляшки.

У широкому аспекті винахід представляє сполуки формули X:



і їх фармацевтично прийнятні солі, де

R₁ означає -(CH₂)₁₋₂-S(O)₀₋₂-(C₁-C₆-алкіл), чи

C₁-C₁₀-алкіл, необов'язково заміщений 1, 2 чи 3 групами, незалежно обраними з галогену, -OH, =O, -SH, -C≡N, -CF₃, -C₁-C₃-алкокси, аміногрупи, моно- чи діалкіламіногрупи, -N(R)C(O)R', -OC(=O)-аміногрупи і -OC(=O)-моно- чи діалкіламіногрупи, чи

C₂-C₆-алкеніл чи C₂-C₆-алкініл, кожний з яких необов'язково заміщений 1, 2 чи 3 групами, незалежно обраними з галогену, -OH, -SH, -C≡N, -CF₃, C₁-C₃-алкокси, аміногрупи, моно- чи діалкіламіногрупи, чи арил, гетероарил, гетероцикліл, -C₁-C₆-алкіларил, -C₁-C₆-алкілгетероарил чи -C₁-C₆-алкілгетероцикліл, де кожен циклічний фрагмент необов'язково заміщений 1, 2, 3 чи 4 групами, незалежно обраними з галогену, -OH, -SH, -C≡N, -NR₁₀₅R'₁₀₅, -CO₂R, -N(R)COR', чи -N(R)SO₂R', -

C(O)(C₁-C₄)алкіли, -SO₂-аміногрупи, -SO₂-моно- чи діалкіламіногрупи, -C(=O)аміногрупи, -C(=O)-моно- чи діалкіламіногрупи, -SO₂-(C₁-C₄)алкіли, чи

C₁-C₆-алкокси, необов'язково заміщеного 1, 2 чи 3 групами, незалежно обраними з галогену, чи

C₃-C₇-циклоалкіла, необов'язково заміщеного 1, 2 чи 3 групами, незалежно обраними з галогену, -OH, -SH, -C≡N, -CF₃, C₁-C₃-алкокси, аміногрупи, -C₁-C₆-алкілу і моно- чи діалкіламіногрупи, чи

C₁-C₁₀-алкілу, необов'язково заміщеного 1, 2 чи 3 групами, незалежно обраними з галогену, -OH, -SH, -C≡N, -CF₃, -C₁-C₃-алкокси, аміно-, моно- чи діалкіламіногрупи і -C₁-C₃-алкілу, чи

C₂-C₁₀-алкеніла чи C₂-C₁₀-алкініла, кожний з яких необов'язково заміщений 1, 2 чи 3 групами, незалежно обраними з галогену, -OH, -SH, -C≡N, -CF₃, C₁-C₃-алкокси, аміногрупи, C₁-C₆-алкіли і моно- чи діалкіламіногрупи; а гетероциклічна група необов'язково додатково заміщена оксогрупою;

де R і R' незалежно являють собою водень, -C₁-C₁₀-алкіл, C₁-C₁₀-алкіларил чи C₁-C₁₀-алкіл гетероарил;

R₂ являє собою водень, C₁-C₆-алкіл, необов'язково заміщений однією, двома чи трьома групами, незалежно обраними з C₁-C₃-алкілу, галогену, гідроксильної групи, -SH, ціаногрупи, -CF₃, C₁-C₃-алкокси, аміно-, моно(C₁-C₆)алкіламіно- чи ди(C₁-C₆)алкіламіногрупи;

R₃ обраний із групи, що складається з водню, C₁-C₆-алкілу, необов'язково заміщеного одним, двома чи трьома замісниками, незалежно обраними з групи, що складає з C₁-C₃-алкілу, галогену, гідроксильної групи, -SH, ціаногрупи, -CF₃, C₁-C₃-алкокси, аміно-, моно(C₁-C₆)алкіламіно- чи ді(C₁-C₆)алкіламіногрупи; чи

R₂ і R₃ разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, утворюють 3- чи 4-членний вуглецевий цикл;

кожен замісник R₂₅ незалежно обраний із групи, що складається з водню чи C₁-C₆-алкілу;

R₅ являє собою водень, -(CR₂₄₅R₂₅₀)₀₋₄-арил, -(CR₂₄₅R₂₅₀)₀₋₄-гетероарил, -(CR₂₄₅R₂₅₀)₀₋₄-гетероцикліл, -(CR₂₄₅R₂₅₀)₀₋₄-арилгетероарил, -(CR₂₄₅R₂₅₀)₀₋₄-арилгетероцикліл, -(CR₂₄₅R₂₅₀)₀₋₄-ариларил, -(CR₂₄₅R₂₅₀)₀₋₄-гетероариларил, -(CR₂₄₅R₂₅₀)₀₋₄-гетероарилгетероцикліл, -(CR₂₄₅R₂₅₀)₀₋₄-гетероарилгетероарил, -(CR₂₄₅R₂₅₀)₀₋₄-гетероциклілгетероарил, -(CR₂₄₅R₂₅₀)₀₋₄-гетероциклілгетероцикліл, -(CR₂₄₅R₂₅₀)₀₋₄-гетероцикліларил, -[C(R₂₅₅)(R₂₆₀)]₁₋₃-CO-N-(R₂₅₅)₂, -CH(арил)₂, -CH(гетероарил)₂, -CH(гетероцикліл)₂, -CH(арил)(гетероарил), -(CH₂)₀₋₁-CH((CH₂)₀₋₆-OH)-(CH₂)₀₋₁-арил, -(CH₂)₀₋₁-CH((CH₂)₀₋₆-OH)-(CH₂)₀₋₁-гетероарил, -CH(арил чи -гетероарил)-CO-O(C₁-C₄-алкіл), -CH(-CH₂-OH)-CH(OH)-феніл-NO₂, (C₁-C₆-алкіл)-O-(C₁-C₆-алкіл)-OH; -CH₂-NH-CH₂-CH(-O-CH₂-CH₃)₂, -(CH₂)₀₋₆-C(=NR₂₃₅)(NR₂₃₅R₂₄₀), чи C₁-C₁₀-алкіл, необов'язково заміщений 1, 2 чи 3 групами, незалежно обраними з групи, що складається з R₂₀₅, -OC=ONR₂₃₅R₂₄₀, -S(=O)₀₋₂(C₁-C₆-алкілу), -SH, -NR₂₃₅C=ONR₂₃₅R₂₄₀, -C=ONR₂₃₅R₂₄₀ і -S(=O)₂NR₂₃₅R₂₄₀, чи -(CH₂)₀₋₃-(C₃-C₈-циклоалкіл, де циклоалкіл необов'язково заміщений 1, 2 чи 3 замісниками, незалежно обраними з групи, що складається з R₂₀₅, -CO₂H і -CO₂-(C₁-C₄-алкіли), чи циклопентильне, циклогексильне чи циклогептильне

кільце, що сконденсоване з арилом, гетероарилом чи гетероциклілом, де один, два чи три атоми вуглецю циклопентила, циклогексила чи циклогептила необов'язково замінені на гетероатом, незалежно обраний з NH, NR₂₁₅, O чи S(=O)₀₋₂, і де циклопентильна, циклогексильна чи циклогептильна група може бути необов'язково заміщена однією чи двома групами, що незалежно представляють собою R₂₀₅, =O, -C

O-NR₂₃₅R₂₄₀ чи -SO₂-(C₁-C₄-алкіл), чи

C₂-C₁₀-алкеніл чи C₂-C₁₀-алкініл, кожний з яких необов'язково заміщений 1, 2 чи 3 групами R₂₀₅, де кожен арил і гетероарил необов'язково заміщений 1, 2 чи 3 групами R₂₀₀ і де кожен гетероцикліл необов'язково заміщений 1, 2, 3 чи 4 групами R₂₁₀;

R₂₀₀ у кожному випадку незалежно обраний з -OH, -NO₂, галогену, -CO₂H, -C≡N, -(CH₂)₀₋₄-CO-NR₂₂₀R₂₂₅, -(CH₂)₀₋₄-CO-(C₁-C₁₂-алкіли), -(CH₂)₀₋₄-CO-(C₂-C₁₂-алкеніла), -(CH₂)₀₋₄-CO-(C₂-C₁₂-алкініла), -(CH₂)₀₋₄-CO-(C₃-C₇-циклоалкіла), -(CH₂)₀₋₄-CO-арила, -(CH₂)₀₋₄-CO-гетероарила, -(CH₂)₀₋₄-CO-гетероцикліла, -(CH₂)₀₋₄-CO-O-R₂₁₅, -(CH₂)₀₋₄-SO₂-NR₂₂₀R₂₂₅, -(CH₂)₀₋₄-SO-(C₁-C₈-алкіли), -(CH₂)₀₋₄-SO₂-(C₁-C₁₂-алкіли), -(CH₂)₀₋₄-SO₂-(C₃-C₇-циклоалкіла), -(CH₂)₀₋₄-N(H чи R₂₁₅)-CO-O-R₂₁₅, -(CH₂)₀₋₄-N(H чи R₂₁₅)-CO-N(R₂₁₅)₂, -(CH₂)₀₋₄-N-CS-N(R₂₁₅)₂, -(CH₂)₀₋₄-N(H чи R₂₁₅)-CO-R₂₂₀, -(CH₂)₀₋₄-NR₂₂₀R₂₂₅, -(CH₂)₀₋₄-O-CO-(C₁-C₆-алкіли), -(CH₂)₀₋₄-O-P(O)-(OR₂₄₀)₂, -(CH₂)₀₋₄-O-CO-N(R₂₁₅)₂, -(CH₂)₀₋₄-O-CS-N(R₂₁₅)₂, -(CH₂)₀₋₄-O-(R₂₁₅), -(CH₂)₀₋₄-O-(R₂₁₅)-COOH, -(CH₂)₀₋₄-S-(R₂₁₅), -(CH₂)₀₋₄-O-(C₁-C₆-алкіли, необов'язково заміщеного 1, 2, 3 чи 5 атомами F), C₃-C₇-циклоалкіла, -(CH₂)₀₋₄-N(H чи R₂₁₅)-SO₂-R₂₂₀, -(CH₂)₀₋₄-C₃-C₇-циклоалкіла, чи

C₁-C₁₀-алкілу₅ необов'язково заміщеного 1, 2 чи 3 групами R₂₀₅,

чи C₂-C₁₀-алкеніла чи C₂-C₁₀-алкініла, кожний з яких необов'язково заміщений 1 чи 2 групами R₂₀₅, де арильні і гетероарильні групи в кожному випадку необов'язково заміщені 1, 2 чи 3 групами, що незалежно представляють собою R₂₀₅, R₂₁₀, чи C₁-C₆-алкілом, заміщеним 1, 2 чи 3 групами, що незалежно представляють собою R₂₀₅ чи R₂₁₀, і де гетероцикліл у кожному випадку необов'язково заміщений 1, 2 чи 3 групами, що незалежно представляють собою R₂₁₀;

R₂₀₅ у кожному випадку незалежно обраний з C₁-C₆-алкілу, галогену, -OH, -O-фенілу, -SH, -C≡N, -CF₃, C₁-C₆-алкокси, NH₂, NH(C₁-C₆-алкіли) чи N-(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкілу);

R₂₁₀ у кожному випадку незалежно обраний з галогену, C₁-C₆-алкокси, C₁-C₆-галогеналкокси, -NR₂₂₀R₂₂₅, OH, -C≡N, -CO-(C₁-C₄-алкілу), -SO₂-NR₂₃₅R₂₄₀, -CO-NR₂₃₅R₂₄₀, -SO₂-(C₁-C₄-алкілу), =O чи C₁-C₆-алкілу, C₂-C₆-алкеніла, C₂-C₆-алкініла чи C₃-C₇-циклоалкіла, кожний з яких необов'язково заміщений 1, 2 чи 3 групами R₂₀₅;

R₂₁₅ у кожному випадку незалежно обраний з C₁-C₆-алкілу, -(CH₂)₀₋₂-(арила), C₂-C₆-алкеніла, C₂-C₆-алкініла, C₃-C₇-циклоалкіла, а також -(CH₂)₀₋₂-(гетероарила), -(CH₂)₀₋₂-(гетероцикліла), де арильна група в кожному випадку необов'язково заміщена 1, 2 чи 3 групами, що незалежно представляють собою R₂₀₅ чи R₂₁₀, і де гетероциклільна і гетероарильна групи в кожному випадку необов'язково

зково заміщені 1, 2 чи 3 групами R_{210} ;

R_{220} і R_{225} у кожному випадку незалежно обрані з -H, -C₃-C₇-циклоалкіла, -(C₁-C₂-алкіл)-(C₃-C₇-циклоалкіла), -(C₁-C₆-алкіл)-O-(C₁-C₃-алкілу), -C₂-C₆-алкеніла, -C₂-C₆-алкініла, -C₁-C₆-алкільного ланцюга з одним подвійним й одним потрійним зв'язком, -арила, -гетероарила і -гетероцикліла, чи

-C₁-C₁₀-алкілу, необов'язково заміщеного -OH, -NH₂ чи галогеном, де арил, гетероцикліл і гетероарил у кожному випадку необов'язково заміщені 1, 2 чи 3 групами R_{270} ,

R_{235} і R_{240} у кожному випадку незалежно являють собою -H чи C₁-C₆-алкіл;

R_{245} і R_{250} у кожному випадку незалежно обрані з -H, C₁-C₄-алкілу, C₁-C₄-алкіларила, C₁-C₄-алкілгетероарила, C₁-C₄-гідроксиалкіла, C₁-C₆-алкокси, C₁-C₄-галогеналкокси, -(CH₂)₀₋₄-C₃-C₇-циклоалкіла, C₂-C₆-алкеніла, C₂-C₆-алкініла і феніла; чи

R_{245} і R_{250} разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, утворюють вуглецевий цикл, що складається з 3, 4, 5, 6 чи 7 атомів вуглецю, у якому один з атомів вуглецю необов'язково заміщений на гетероатом, обраний з -O-, -S-, -SO₂- і -NR₂₂₀-;

R_{255} і R_{260} у кожному випадку незалежно обрані з -H, -(CH₂)₁₋₂-S(O)₀₋₂-(C₁-C₆-алкіли), -(C₁-C₄-алкіл)-арила, -(C₁-C₄-алкіл)-гетероарила, -(C₁-C₄-алкіл)-гетероцикліла, -арила-гетероарила, -гетероцикліла, -(CH₂)₁₋₄-R₂₆₅-(CH₂)₀₋₄-арила, -(CH₂)₁₋₄-R₂₆₅-(CH₂)₀₋₄-гетероарила, (CH₂)₁₋₄-R₂₆₅-(CH₂)₀₋₄-гетероцикліла, чи C₁-C₆-алкілу, C₂-C₆-алкеніла, C₂-C₆-алкініла чи -(CH₂)₀₋₄-C₃-C₇-циклоалкіла, кожний з яких необов'язково заміщений 1, 2 чи 3 групами R_{205} , де кожен арил чи феніл необов'язково заміщений 1, 2 чи 3 групами, що незалежно представляють собою R_{205} , R_{210} , чи C₁-C₆-алкілом, заміщеним 1, 2 чи 3 групами, що незалежно являють собою R_{205} чи R_{210} , і де кожен гетероцикліл необов'язково заміщений 1, 2, 3 чи 4 групами R_{210} ;

R_{265} у кожному випадку незалежно являє собою -O-, -S- чи -N(C₁-C₆-алкіл)-;

R_{270} у кожному випадку незалежно являє собою R_{205} , галоген, C₁-C₆-алкокси, C₁-C₆-галогеналкокси, NR₂₃₅R₂₄₀, -OH, -C≡N, -CO-(C₁-C₄-алкіл), -SO₂-NR₂₃₅R₂₄₀, -CO-NR₂₃₅R₂₄₀, -SO₂-(C₁-C₄-алкіл), =O, чи C₁-C₆-алкіл, C₂-C₆-алкеніл, C₂-C₆-алкініл чи -(CH₂)₀₋₄-C₃-C₇-циклоалкіл, кожний з яких необов'язково заміщений 1, 2 чи 3 групами R_{205} ;

R_N являє собою R'₁₀₀, -SO₂R₁₀₀, (CRR')₁₋₆R₁₀₀, -C(=O)-(CRR')₀₋₆R₁₀₀, -C(=O)-(CRR')₁₋₆-O-R₁₀₀, -C(=O)-(CRR')₁₋₆-S-R'₁₀₀, -C(=O)-(CRR')₁₋₆-3(=O)-R₁₀₀, -C(=O)-(CRR')₁₋₆-SO₂-R₁₀₀ чи -C(=O)-(CRR')₁₋₆-NR₁₀₀-R'₁₀₀;

R_{100} і R'₁₀₀ незалежно являють собою арил, гетероарил, -арил-W-арил, -арил-W-гетероарил, -арил-W-гетероцикліл, -гетероарил-W-арил, -гетероарил-W-гетероарил, -гетероарил-W-гетероцикліл, -гетероцикліл-W-арил, -гетероцикліл-W-гетероарил, -гетероцикліл-W-гетероцикліл, -CH[(CH₂)O₂-O-R₁₅₀](CH₂)₀₋₂-арил, -CH[(CH₂)O₂-O-R₁₅₀](CH₂)₀₋₂-гетероарил чи -CH[(CH₂)O₂-O-R₁₅₀](CH₂)₀₋₂-гетероцикліл, де циклічні фрагменти кожного замісника необов'язково заміщені 1, 2 чи 3 групами, незалежно обраними з

-OR, -NO₂, галогену, -C≡N, -OCF₃, -CF₃, -(CH₂)₀₋₄-O-P(=O)(OR)(OR'), -(CH₂)₀₋₄-CO-NR₁₀₅R'₁₀₅, -(CH₂)₀₋₄-O-(CH₂)₀₋₄-CONR₁₀₂R'₁₀₂, -(CH₂)₀₋₄-CO-(C₁-C₁₂-алкіли), -(CH₂)₀₋₄-CO-(C₂-C₁₂-алкеніла), -(CH₂)₀₋₄-CO-(C₂-C₁₂-алкініла), -(CH₂)₀₋₄-CO-(C₃-C₇-циклоалкіла), -(CH₂)₀₋₄-R₁₁₀, -(CH₂)₀₋₄-R₁₂₀, -(CH₂)₀₋₄-R₁₃₀, -(CH₂)₀₋₄-CO-R₁₁₀, -(CH₂)₀₋₄-CO-R₁₂₀, -(CH₂)₀₋₄-CO-Ri₃₀, -(CH₂)₀₋₄-CO-R₁₄₀, -(CH₂)₀₋₄-CO-O-R₁₅₀, -(CH₂)₀₋₄-SO₂-NR₁₀₅R₁₀₅, -(CH₂)₀₋₄-SO-(C₁-C₈-алкіли), -(CH₂)₀₋₄-SO₂-(C₁-C₁₂-алкіли), -(CH₂)₀₋₄-SO₂-(CH₂)₀₋₄-(C₃-C₇-циклоалкіла), -(CH₂)₀₋₄-N(R₁₅₀)-CO-O-R₁₅₀, -(CH₂)₀₋₄-N(R₁₅₀)-CO-N(R₁₅₀)₂, -(CH₂)₀₋₄-N(R₁₅₀)-CS-N(R₁₅₀)₂, -(CH₂)₀₋₄-R₁₅-O-CO-R₁₀₅, -(CH₂)₀₋₄-NR₁₀₅R'₁₀₅, -(CH₂)₀₋₄-R₁₄₀, -(CH₂)₀₋₄-O-CO-(C₁-C₆-алкіл), -(CH₂)₀₋₄-O-P(O)-(O-R₁₁₀)₂, -(CH₂)₀₋₄-O-CO-N(R₁₅₀)₂, -(CH₂)₀₋₄-O-CS-N(R₁₅₀), -(CH₂)₀₋₄-O-(R₁₅₀), -(CH₂)₀₋₄-O-(R'₁₅₀)-COOH, -(CH₂)₀₋₄-S-(R₁₅₀), -(CH₂)₀₋₄-N(R₁₅₀)-SO₂-R₁₀₅, -(CH₂)₀₋₄-C₃-C₇-циклоалкіла, (C₂-C₁₀)алкеніла чи (C₂-C₇)алкініла, чи

R_{100} означає C₁-C₁₀алкіл, необов'язково заміщений 1, 2 чи 3 групами R₁₁₅, чи

R_{100} означає (C₁-C₆-алкіл)-O-(C₁-C₆-алкіл) чи (C₁-C₆-алкіл)-S-(C₁-C₆-алкіл), кожний з яких необов'язково заміщений 1, 2 чи 3 групами R₁₁₅, чи

R_{100} означає C₃-C₈-циклоалкіл, необов'язково заміщений 1, 2 чи 3 групами R₁₁₅;

W являє собою -(CH₂)₀₋₄-, -O-, -S(O)₀₋₂-, -N(R₁₃₅)-, -CR(OH)- чи -C(O)-;

R_{102} і R'₁₀₂ незалежно являють собою чи водень C₁-C₁₀-алкіл, необов'язково заміщений 1, 2 чи 3 групами, що незалежно представляють собою галоген, арил чи -R₁₁₀;

R_{105} і R'₁₀₅ незалежно означають -H, -R₁₁₀, -R₁₂₀, C₃-C₇-циклоалкіл, -(C₁-C₂-алкіл)-(C₃-C₇-циклоалкіл), -(C₁-C₆-алкіл)-O-(C₁-C₃-алкіл), C₂-C₆-алкеніл, C₂-C₆-алкініл чи C₁-C₆-алкільний ланцюг, що містить один подвійний й один потрійний зв'язок, чи C₁-C₆-алкіл, необов'язково заміщений -OH чи -NH₂; чи

C₁-C₆-алкіл, необов'язково заміщений 1, 2 чи 3 групами, незалежно обраними з галогену, чи

R_{105} і R'₁₀₅ разом з атомом, до якого вони приєднані, утворюють 3-7-членний вуглецевий цикл, один з атомів якого необов'язково є гетероатомом, обраним з -O-, -S(O)₀₋₂-, -N(R₁₃₅)-, а сам цикл необов'язково заміщений 1, 2 чи 3 групами R₁₄₀;

R_{115} у кожному випадку незалежно являє собою водень, -OH, -CO₂R₁₀₅, -C₁-C₆-тіоалкокси, CO₂-феніл, NR₁₀₅R'₁₃₅, -SO₂-(C₁-C₈-алкіл), -C(=O)R₁₈₀, R₁₈₀, -CONR₁₀₅R'₁₀₅, -NH-C(=O)-(C₁-C₆-алкіл), -NH-C(=O)-OH, -NH-C(=O)-OR, -NH-C(=O)-O-феніл, -O-C(=O)-(C₁-C₆-алкіл), -O-C(=O)-аміногрупу, -O-C(=O)-моно- чи -диалкіламіногрупу, -O-C(=O)-феніл, -O-(C₁-C₆-алкіл)-CO₂H, -NH-SO₂(C₁-C₆-алкіл), C₁-C₆-алкокси чи C₁-C₆-галогеналкокси;

R_{135} означає C₁-C₆-алкіл, C₂-C₆-алкеніл, C₂-C₆-алкініл, C₃-C₇-циклоалкіл, -(CH₂)₀₋₂-арил, -(CH₂)₀₋₄-гетероарил чи -(CH₂)₀₋₄-гетероцикліл;

R_{140} являє собою гетероцикліл, необов'язково заміщений 1, 2, 3 чи 4 групами, незалежно обраними з C₁-C₆-алкілу, C₁-C₆-алкокси, галогену, гідроксилу, ціаногрупи, нітрогрупи, аміногрупи, моно(C₁-C₆)алкіламіногрупи, ди(C₁-C₆)алкіламіногрупи, C₂-C₆-алкеніла, C₂-C₆-алкініла, C₁-C₆-галогеналкіла, C₁-C₆-галогеналкокси, аміно-(C₁-C₆)алкілу, моно(C₁-C₆)алкіламіно(C₁-C₆)алкілу,

ди(C₁-C₆)алкіламіно(C₁-C₆)алкілу i=0;

R₁₅₀ означає водень, C₃-C₇-циклоалкіл, -(C₁-C₂-алкіл)-(C₃-C₇-циклоалкіл), C₂-C₆-алкеніл, C₂-C₆-алкініл, C₁-C₆-алкіл, що містить один подвійний й один потрійний зв'язок, -R₁₁₀, -R₁₂₀, чи C₁-C₆-алкіл, необов'язково заміщений 1, 2, 3 чи 4 групами, незалежно обраними з -ОН, -NH₂, C₁-C₃-алкокси, R₁₁₀ і галогени;

R₁₅₀ означає C₃-C₇-циклоалкіл, -(C₁-C₃-алкіл)-(C₃-C₇-циклоалкіл), C₂-C₆-алкеніл, C₂-C₆-алкініл, C₁-C₆-алкіл, що містить один подвійний й один потрійний зв'язок, -R₁₁₀, -R₁₂₀, чи C₁-C₆-алкіл, необов'язково заміщений 1, 2, 3 чи 4 групами, незалежно обраними з -ОН, -NH₂, C₁-C₃-алкокси, R₁₁₀ і галогени;

R₁₅₀ обраний з морфолініла, тіоморфолініла, піперазиніла, піперидиніла, гомоморфолініла, гомотіоморфолініла, гомотіоморфолініла S-оксиду, гомотіоморфолініла S,S-діоксида, піролініла і піролідиніла, кожний з яких необов'язково заміщений 1, 2, 3 чи 4 групами, незалежно обраними з C₁-C₆-алкілу, C₁-C₆-алкокси, галогену, гідроксилу, ціаногрупи, нітрогрупи, аміногрупи, моно(C₁-C₆)алкіламіно групи, ди(C₁-C₆)алкіламіногрупи, C₂-C₆-алкеніла, C₂-C₆-алкініла, C₁-C₆-галогеналкіла, C₁-C₆-галогеналкокси, аміно-(C₁-C₆)алкілу, моно(C₁-C₆)алкіламіно-(C₁-C₆)алкілу, ди(C₁-C₆)алкіламіно-(C₁-C₆)алкілу i=0;

R₁₁₀ являє собою арил, необов'язково заміщений 1 чи 2 групами R₁₂₅;

R₁₂₅ у кожному випадку незалежно являє собою галоген, аміногрупу, моно- чи діалкіламіногрупу, -ОН, -C≡N, -SO₂NH₂, -SO₂NH-C₁-C₆-алкіл, -SO₂N(C₁-C₆-алкіл)₂, -SO₂N(C₁-C₆-алкіл), -CO-NH₂, -CO-NH-C₁-C₆-алкіл чи -CO-N(C₁-C₆-алкіл)₂, чи

C₁-C₆-алкіл, C₂-C₆-алкеніл чи C₂-C₆-алкініл, кожний з яких необов'язково заміщений 1, 2 чи 3 групами, незалежно обраними з C₁-C₃-алкілу, галогену, -ОН, -SH, -C≡N, -CF₃, C₁-C₃-алкокси, аміногрупи, моно- чи діалкіламіногрупи, чи C₁-C₆-алкокси, необов'язково заміщений 1, 2 чи 3 атомами галогену;

R₁₂₀ означає гетероарил, необов'язково заміщений 1 чи 2 групами R₁₂₅; і

R₁₃₀ являє собою гетероциклі, необов'язково заміщений 1 іл 2 групами R₁₂₅.

Відповідно до іншого широкого аспекту, винахід представляє сполуки формули X, де

R₁ означає:

(I) C₁-C₆-алкіл, необов'язково заміщений одним, двома чи трьома замісниками, обраними з групи, що складається з C₁-C₃-алкілу, C₁-C₇-алкілу (необов'язково заміщеного C₁-C₃-алкілом і C₁-C₃-алкокси), -F, -Cl, -Br, -I, -ОН, -SH, -C≡N, -CF₃, C₁-C₃-алкокси, NR_{1-a}R_{1-b} і -OC=O-NR_{1-a}R_{1-b}, де R_{1-a} і R_{1-b} у кожному випадку незалежно являють собою -H чи C₁-C₆-алкіл,

(II) -CH₂-S(O)₀₋₂-(C₁-C₆-алкіл),

(III) -CH₂-CH₂-S(O)₀₋₂-(C₁-C₆-алкіл),

(IV) C₂-C₆-алкеніл, що містить один чи два подвійні зв'язки, необов'язково заміщені одним, двома чи трьома замісниками, обраними з групи, що складається з -F, -Cl, -ОН, -SH, -C≡N, -CF₃, C₁-C₃-алкокси, NR_{1-a}R_{1-b}, де R_{1-a} і R_{1-b} означають -H чи C₁-C₆-алкіл,

(V) C₂-C₆-алкініл, що містить один чи два

потрійні зв'язки, необов'язково заміщений одним, двома чи трьома замісниками, обраними з групи, що складає з -F, -Cl, -ОН, -SH, -C≡N, -CF₃, C₁-C₃-алкокси, NR_{1-a}R_{1-b}, де R_{1-a} і R_{1-b} означають -H чи C₁-C₆-алкіл,

(VI) -(CH₂)_{n1}-(R₁-арил), де n₁ дорівнює 0 чи 1, а R₁-арил являє собою феніл, нафтил, інданіл, інденіл, дигідронафтаїл чи тетралініл, кожний з яких необов'язково заміщений по ароматичному кільцю одним, двома, трьома, чотирма чи п'ятьма наступними замісниками:

(A) C₁-C₆-алкілом, необов'язково заміщеним одним, двома чи трьома замісниками, обраними з групи, що складається з C₁-C₃-алкілу, -F, -Cl, -Br, -I, -ОН, -SH, NR_{1-a}R_{1-b}, -C≡N, -CF₃ і C₁-C₃-алкокси,

(B) C₂-C₆-алкенілом, необов'язково заміщеним одним, двома чи трьома замісниками, обраними з групи, що складається з -F, -Cl, -ОН, -SH, -C≡N, -CF₃, C₁-C₃-алкокси і NR_{1-a}R_{1-b},

(C) C₂-C₆-алкінілом, необов'язково заміщеним одним, двома чи трьома замісниками, обраними з групи, що складається з -F, -Cl, -ОН, -SH, -C≡N, -CF₃, C₁-C₃-алкокси і NR_{1-a}R_{1-b},

(D) -F, -Cl, -Br і -I,

(E) C₁-C₆-галогеналкокси,

(F) C₁-C₆-алкокси,

(G) NR_{N-2}R_{N-3},

(H) -ОН

(I) -C≡N,

(J) C₃-C₇-циклоалкілом, необов'язково заміщеним одним, двома чи трьома замісниками, незалежно обраними з групи, що складається з -F, -Cl, -ОН, -SH, -C≡N, -CF₃, C₁-C₃-алкокси і NR_{1-a}R_{1-b},

(K) -CO-(C₁-C₄-алкілом),

(L) -SO₂-NR_{1-a}R_{1-b},

(M) -CO-NR_{1-a}R_{1-b},

(N) -SO₂-(C₁-C₄-алкілом),

(VII) (CH₂)_{n1}-(R₁-гетероарил), де R₁-гетероарил обраний із групи, що складається з піридиніла, піримідиніла, хінолініла, бензотієніла, індоліла, індолініла, піридазиніла, піразиніла, ізоіндоліла, ізохіноліла, хіназолініла, хіноксалініла, фталазиніла, імідазоліла, ізоксазоліла, піразоліла, оксазоліла, тiazоліла, ііндолізініла, індазоліла, бензотіазоліла, бензімідазоліла, бензофураніла, фураніла, тієніла, піроліла, оксадіазоліла, тіадіазоліла, триазоліла, тетразоліла, оксазоліпіридиніла, імідазоліпіридиніла, ізотіазоліла, нафтиридиніла, цінолініла, кархазоліла, бета-карболініла, ізохроманіла, хроманіла, тетрагідроізохінолініла, ізоіндолініла, ізобензотетрагідрофураніла, ізобензотетрагідротієніла, ізобензотієніла, бензоксазоліла, піридопіридиніла, бензотетрагідрофураніла, бензотетрагідротієніла, пуриніла, бензодіоксоліла, триазиніла, феноксазиніла, фенотіазиніла, птеридиніла, бензотіазоліла, імідазопіридиніла, імідазотіазоліла, дигідробензизоксазиніла, бензизоксазиніла, бензоксазиніла, дигідробензизотіазиніла, бензопіраніла, бензотіопіраніла, кумариніла, ізокумариніла, хромоніла, хроманоніла, тетрагідрохінолініла, дигідрохінолініла, дигідрохіноліноніла, дигідрокумариніла, дигідроізокумариніла, ізоіндоліноніла, бензодіоксаніла, бензоксазолиноніла, піридиніла N-оксиду, піроліла N-оксиду, піримідиніла N-оксиду, піридазиніла N-оксиду, піразиніла

N-оксиду, хінолініла N-оксиду, індоліла N-оксиду, індолініла N-оксиду, ізохіноліла N-оксиду, хіназолініла N-оксиду, хіноксалініла N-оксиду, фталазиніла N-оксиду, імідазоліла N-оксиду, ізоксазоліла N-оксиду, оксазоліла N-оксиду, тiazоліла N-оксиду, індолізиніла N-оксиду, індазоліла N-оксиду, бензо-тіазоліла N-оксиду, бензімідазоліла N-оксиду, піроліла N-оксиду, оксадіазоліла N-оксиду, тіадіазоліла N-оксиду, триазоліла N-оксиду, тетразоліла N-оксиду, бензотіопіраніла S-оксиду і бензотіопіраніла S,S-діоксида,

де група $R_{1-гетероарил}$ зв'язана з групою $-(CH_2)_{n1}$ за допомогою будь-якого атома кільця вихідної групи $R_{N-гетероарил}$, заміщеного воднем, таким чином, що новий зв'язок із групою $R_{1-гетероарил}$ заміщає атом водню і його зв'язок, при цьому гетероарил необов'язково заміщений одним, двома, трьома, чотирма чи п'ятьма наступними замісниками:

- (1) C_1-C_6 -алкілом, необов'язково заміщеним одним, двома чи трьома замісниками, обраними з групи, що складається з C_1-C_3 -алкілу, -F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, $NR_{1-a}R_{1-b}$, $-C\equiv N$, $-CF_3$ і C_1-C_3 -алкокси,
- (2) C_2-C_6 -алкенілом, що містить одну чи два подвійні зв'язки, необов'язково заміщеним одним, двома чи трьома замісниками, обраними з групи, що складається з -F, -Cl, -OH, -SH, $-C\equiv N$, $-CF_3$, C_1-C_3 -алкокси і $NR_{1-a}R_{1-b}$,
- (3) C_2-C_6 -алкінілом, що містить один чи два потрійні зв'язки, необов'язково заміщеним одним, двома чи трьома замісниками, обраними з групи, що складається з -F, -Cl, -OH, -SH, $-C\equiv N$, $-CF_3$, C_1-C_3 -алкокси і $NR_{1-a}R_{1-b}$,
- (4) -F, -Cl, -Br і -I,
- (5) C_1-C_6 -галогеналкокси,
- (6) C_1-C_6 -алкокси,
- (7) $NR_{N-2}R_{N-3}$,
- (8) -OH
- (9) $-C\equiv N$,
- (10) C_3-C_7 -циклоалкілом, необов'язково заміщеним одним, двома чи трьома замісниками, незалежно обраними з групи, що складається з -F, -Cl, -OH, -SH, $-C\equiv N$, $-CF_3$, C_1-C_3 -алкокси і $NR_{1-a}R_{1-b}$,
- (11) $-CO-(C_1-C_4)$ -алкілом),
- (12) $-SO_2-NR_{1-a}R_{1-b}$,
- (13) $-CO-NR_{1-a}R_{1-b}$,
- (14) $-SO_2-(C_1-C_4)$ -алкілом), за умови, що якщо n_1 дорівнює 0, $R_{1-гетероарил}$ не зв'язаний з вуглецевим ланцюгом через атом азоту,

(VIII) $-(CH_2)_{n1}-(R_{1-гетероцикл})$, де n_1 - як визначено вище, а $R_{1-гетероцикл}$ обраний із групи, що складається з морфолініла, тіоморфолініла, тіоморфолініла S-оксиду, тіоморфолініла S,S-діоксида, піперазиніла, гомопіперазиніла, піролідиніла, піролініла, тетрагідропіраніла, піперидиніла, тетрагідрофураніла, тетрагідротиєніла, гомопіперидиніла, гомоморфолініла, гомотіоморфолініла, гомотіоморфолініла S,S-діоксида, оксазолідиноніла, дигідропіразоліла, дигідропіроліла, дигідропіразиніла, дигідропіридиніла, дигідропіримідиніла, дигідрофураніла, дигідропіраніла, тетрагідротиєніла S-оксиду, тетрагідротиєніла S,S-діоксида, гомотіоморфолініла S-оксиду, дитіаніла, піраніла, дигідрофураніла, піролідіноніла, імідазолідиноніла, імідазолідинондіоніла, де кожний з перерахованих вище радикалів необов'язково сконденсований з

бензольним, піридиновим чи піримідиновим кільцем і

де група $R_{1-гетероцикл}$ бере участь у зв'язку за допомогою будь-якого атома вихідної групи $R_{1-гетероцикл}$ заміщеного воднем, таким чином, що новий зв'язок із групою $R_{1-гетероцикл}$ заміщає атом водню і його зв'язок, при цьому гетероцикл необов'язково заміщений одним, двома, трьома чи чотирма наступними замісниками:

- (1) C_1-C_6 -алкілом, необов'язково заміщеним одним, двома чи трьома замісниками, незалежно обраними з групи, що складається з C_1-C_3 -алкілу, -F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, $NR_{1-a}R_{1-b}$, $-C\equiv N$, $-CF_3$ і C_1-C_3 -алкокси,
- (2) C_2-C_6 -алкенілом, необов'язково заміщеним одним, двома чи трьома замісниками, обраними з групи, що складається з -F, -Cl, -OH, -SH, $-C\equiv N$, $-CF_3$, C_1-C_3 -алкокси і $NR_{1-a}R_{1-b}$,
- (3) C_2-C_6 -алкінілом, необов'язково заміщеним одним, двома чи трьома замісниками, незалежно обраними з групи, що складається з -F, -Cl, -OH, -SH, $-C\equiv N$, $-CF_3$, C_1-C_3 -алкокси і $NR_{1-a}R_{1-b}$,
- (4) -F, -Cl, -Br і -I,
- (5) C_1-C_6 -алкокси,
- (6) C_1-C_6 -галогеналкокси,
- (7) $NR_{N-2}R_{N-3}$,
- (8) -OH
- (9) $-C\equiv N$,
- (10) C_3-C_7 -циклоалкілом, необов'язково заміщеним одним, двома чи трьома замісниками, незалежно обраними з групи, що складається з -F, -Cl, -OH, -SH, $-C\equiv N$, $-CF_3$, C_1-C_3 -алкокси і $NR_{1-a}R_{1-b}$,
- (11) $-CO-(C_1-C_4)$ -алкілом),
- (12) $-SO_2-NR_{1-a}R_{1-b}$,
- (13) $-CO-NR_{1-a}R_{1-b}$,
- (14) $-SO_2-(C_1-C_4)$ -алкілом),
- (15) =O, за умови, що якщо n_1 дорівнює 0, $R_{1-гетероцикл}$ не зв'язаний з вуглецевим ланцюгом через атом азоту;

де R_2 обраний із групи, що складається з:

- (I) -H,
- (II) C_1-C_6 -алкілу, необов'язково заміщеного одним, двома чи трьома замісниками, незалежно обраними з групи, що складається з C_1-C_3 -алкілу, -F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, $-C\equiv N$, $-CF_3$, C_1-C_3 -алкокси і $NR_{1-a}R_{1-b}$,
- (III) $-(CH_2)_{0-4}-R_{30}$, де R_{30} означає $R_{1-арил}$, $R_{1-гетероарил}$ чи $R_{1-гетероцикл}$,

(IV) C_2-C_6 -алкеніла, що містить одну чи два подвійні зв'язки, необов'язково заміщеного одним, двома чи трьома замісниками, незалежно обраними з групи, що складається з -F, -Cl, -OH, -SH, $-C\equiv N$, $-CF_3$, C_1-C_3 -алкокси і $NR_{1-a}R_{1-b}$,

(V) C_2-C_6 -алкініла, необов'язково заміщеного одним, двома чи трьома замісниками, незалежно обраними з групи, що складається з -F, -Cl, -OH, -SH, $-C\equiv N$, $-CF_3$, C_1-C_6 -алкокси і $NR_{1-a}R_{1-b}$,

(VI) $-(CH_2)_{0-4}-C_3-C_7$ -циклоалкіла, необов'язково заміщеного одним, двома чи трьома замісниками, незалежно обраними з групи, що складається з -F, -Cl, -OH, -SH, $-C\equiv N$, $-CF_3$, C_1-C_6 -алкокси і $NR_{1-a}R_{1-b}$, де R_3 обраний із групи, що складається з:

- (I) -H,
- (II) C_1-C_6 -алкілу, необов'язково заміщеного одним, двома чи трьома замісниками, обраними з групи, що складається з C_1-C_6 -алкілу, -F, -Cl, -Br, -I,

-OH, -SH, -C≡N, -CF₃, C₁-C₆-алкокси і NR_{1-a}R_{1-b},

(III) -(CH₂)₀₋₄-R₃₀,

(IV) C₂-C₆-алкеніла,

(V) C₂-C₆-алкініла,

(VI) -(CH₂)₀₋₄-C₃-C₇-циклоалкіла, необов'язково заміщеного одним, двома чи трьома замісниками, незалежно обраними з групи, що складається з -F, -Cl, -OH, -SH, -C≡N, -CF₃, C₁-C₆-алкокси і NR_{1-a}R_{1-b}, чи R₂ і R₃ разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, утворюють вуглецевий цикл з трьох, чотирьох, п'яти, шести чи семи атомів вуглецю, у якому один з вуглецевих атомів необов'язково заміщений гетероатомом, обраним із групи, що складається з -O-, -S-, -SO₂-, -NR_{N-2}-;

R_N означає:

(I) R_{N-1}-X_N-, де X_N обраний із групи, що складається з:

(A) -CO-,

(B) -SO₂-,

(C) -(CR''')₁₋₆, де

R' і R'' у кожному випадку є однаковими чи різними і являють собою -H, C₁-C₄-алкіл,

(D) -CO-(CR''')₁₋₆-X_{N-1} де X_{N-1} обраний із групи, що складається з -O-, -S- і -NR'-,

(E) одинарного зв'язку і

(F) -CO-(CR''')₁₋₆-,

де R_{N-1} обраний із групи, що складається з:

(A) R_N-арил, де R_N-арил у кожному випадку незалежно являє собою феніл; нафтил; тетралініл; інданіл; інденіл; дигідронафтил; чи 6,7,8,9-тетрагідро-5H-бензо[а]циклогептил; кожний з яких необов'язково заміщений 1, 2 чи 3 групами, що у кожному випадку незалежно являють собою:

(1) C₁-C₆-алкіл, необов'язково заміщений одним, двома чи трьома замісниками, обраними з групи, що складається з C₁-C₃-алкілу, -F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, -C≡N, -CF₃, C₁-C₃-алкокси і NR_{1-a}R_{1-b}, де R_{1-a} і R_{1-b} у кожному випадку незалежно являють собою -H чи C₁-C₆-алкіл,

(2) -OH,

(3) -NO₂,

(4) -F, -Cl, -Br, -I,

(5) -CO₂H,

(6) -C≡N,

(7) -(CH₂)₀₋₄-CO-NR_{N-2}R_{N-3}, де R_{N-2} і R_{N-3} у кожному випадку є однаковими чи різними й обрані з групи, що складається з:

(a) -H,

(b) -C₁-C₈-алкілу, що необов'язково заміщений одним замісником, обраним із групи, що складається з:

(i) -OH,

(ii) -NH₂,

(iii) фенілу,

(c) -C₁-C₈-алкілу, що необов'язково заміщений 1, 2 чи 3 групами, що незалежно представляють собою -F, -Cl, -Br чи -I,

(d) -C₃-C₈-циклоалкіла,

(e) -(C₁-C₂-алкіл)-(C₃-C₈-циклоалкіла),

(f) -(C₁-C₆-алкіл)-O-(C₁-C₃-алкілу),

(g) -C₂-C₆-алкеніла,

(h) -C₂-C₆-алкініла,

(i) -C₁-C₆-алкільного ланцюга, що містить один подвійний й один потрійний зв'язок,

(j) -R₁-арил,

(k) -R₁-гетероарила,

(l) -R₁-гетероцикла, чи

(m) R_{N-2}, R_{N-3} і атом азоту, до якого вони приєднані, утворюють 5, 6 чи 7-членну гетероциклічну алкільну чи гетероарильну групу, де дана гетероциклічна алкільна чи гетероарильна група необов'язково сконденсована з бензольним, піридиновим чи піримідиновим кільцем, при цьому зазначені групи можуть бути незаміщеними чи бути заміщені 1, 2, 3, 4 чи 5 групами, що у кожному випадку незалежно являють собою C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-алкокси, галоген, галоген-C₁-C₆-алкіл, галоген-C₁-C₆-алкокси, -CN, NO₂, -NH₂, NH(C₁-C₆-алкіл), N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкіл), -OH, -C(O)NH₂, -C(O)NH(C₁-C₆-алкіл), C(O)N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкіл), C₁-C₆-алкокси-C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-тіоалкокси і C₁-C₆-тіоалкокси-C₁-C₆-алкіл;

(8) -(CR'R'')₀₋₄CO-OR',

(B) R_N-гетероарила, де R_N-гетероарил обраний із групи, що складається з піридиніла, піримідиніла, хінолініла, бензотиєніла, індоліла, індолініла, піридазиніла, піразиніла, ізоіндоліла, ізохіноліла, хіназолініла, хіноксалініла, фталазиніла, імідазоліла, ізоксазоліла, піразоліла, оксазоліла, тіазоліла, індолізиніла, індазоліла, бензотіазоліла, бензімідазоліла, бензофураніла, фураніла, тиєніла, піроліла, оксадіазоліла, тіадиазоліла, триазоліла, тетразоліла, оксазоліпіридиніла, імідазоліпіридиніла, ізотіазоліла, нафтиридиніла, цинолініла, кархазоліла, бета-карболініла, ізохроманіла, хроманіла, тетрагідроізохінолініла, ізоіндолініла, ізобензотетрагідрофураніла, ізобензотетрагідротиєніла, ізобензотиєніла, бензоксазоліла, піридопіридиніла, бензотетрагідрофураніла, бензотетрагідротиєніла, пуриніла, бензодіоксоліла, триазиніла, феноксазиніла, фенотіазиніла, птеридиніла, бензотіазоліла, імідазотіазоліла, дигідробензизоксазиніла, бензизоксазиніла, бензоксазиніла, дигідробензизотіазиніла, бензопіраніла, бензотіопіраніла, кумариніла, ізокумариніла, хромоніла, хроманоніла, тетрагідрохінолініла, дигідрохінолініла, дигідрохіноліноніла, дигідрокумариніла, дигідрізокумариніла, ізоіндоліноніла, бензодіоксаніла, бензоксазоліноніла, піридиніла N-оксиду, піроліла N-оксиду, піримідиніла N-оксиду, піридазиніла N-оксиду, піразиніла N-оксиду, хінолініла N-оксиду, індолініла N-оксиду, ізохіноліла N-оксиду, хіназолініла N-оксиду, хіноксалініла N-оксиду, фталазиніла N-оксиду, імідазоліла N-оксиду, ізоксазоліла N-оксиду, оксазоліла N-оксиду, тіазоліла N-оксиду, індолізиніла N-оксиду, індазоліла N-оксиду, бензотіазоліла N-оксиду, бензімідазоліла N-оксиду, піроліла N-оксиду, оксадіазоліла N-оксиду, тіадиазоліла N-оксиду, триазоліла N-оксиду, тетразоліла N-оксиду, бензотіопіраніла S-оксиду, бензотіопіраніла S,S-діоксида, імідазопіразоліла, хіназоліноніла, піразопіридила, бензоксадіазоліла, дигідропіримідиноніла і дигіробензофураноніла, кожний з яких необов'язково сконденсований з бензольним, піридиновим чи піримідиновим кільцем,

де група R_N-гетероарил бере участь у зв'язку за допомогою будь-якого атома вихідної групи R_N-гетероарил, заміщеного воднем, таким чином, що новий зв'язок із групою R_N-гетероарил заміщає атом водню і його зв'язок, при цьому гетероарил необов'яз-

зково заміщений одним, двома, трьома чи чотирма наступними замісниками:

(1) C_1-C_6 -алкілом, необов'язково заміщеним одним, двома чи трьома замісниками, що незалежно обрані з групи, що складається з C_1-C_3 -алкілу, -F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, $-C\equiv N$, $-CF_3$, C_1-C_3 -алкокси і $NR_{1-a}R_{1-b}$,

- (2) -OH,
- (3) $-NO_2$,
- (4) -F, -Cl, -Br, -I,
- (5) $-CO_2H$,
- (6) $-C\equiv N$,
- (7) $-(CH_2)_{0-4}-CO-NR_{N-2}R_{N-3}$,
- (8) $-(CH_2)_{0-4}-CO-(C_1-C_{12}$ -алкілом),
- (9) $-(CH_2)_{0-4}-CO-(C_2-C_{12}$ -алкенілом),
- (10) $-(CH_2)_{0-4}-CO-(C_2-C_{12}$ -алкінілом),
- (11) $-(CH_2)_{0-4}-CO-(C_3-C_8$ -циклоалкілом),
- (12) $-(CH_2)_{0-4}-CO-R_{1-арил}$,
- (13) $-(CH_2)_{0-4}-CO-R_{1-гетероарил}$,
- (14) $-(CH_2)_{0-4}-CO-R_{1-гетероцикл}$,
- (15) $-(CH_2)_{0-4}-CO-R_{N-4}$,
- (16) $-(CH_2)_{0-4}-CO_2-R_{N-5}$,
- (17) $-(CH_2)_{0-4}-SO_2-NR_{N-2}R_{N-3}$,
- (18) $-(CH_2)_{0-4}-SO_2$ -(арил- C_1-C_8 -алкілом),
- (19) $-(CH_2)_{0-4}-SO_2$ -(C_1-C_{12} -алкілом),
- (20) $-(CH_2)_{0-4}-SO_2$ -(C_3-C_8 -циклоалкілом),
- (21) $-(CH_2)_{0-4}-N(H$ чи $R_{N-5})-CO-O-R_{N-5}$,
- (22) $-(CH_2)_{0-4}-N(H$ чи $R_{N-5})-CO-N(R_{N-5})_2$,
- (23) $-(CH_2)_{0-4}-N-CS-N(R_{N-5})_2$,
- (24) $-(CH_2)_{0-4}-N(H$ чи $R_{N-5})-CO-R_{N-2}$,
- (25) $-(CH_2)_{0-4}-NR_{N-2}R_{N-3}$,
- (26) $-(CH_2)_{0-4}-R_{N-4}$,
- (27) $-(CH_2)_{0-4}-O-CO-(C_1-C_6$ -алкілом),
- (28) $-(CH_2)_{0-4}-O-P(O)-(OR_{100})_2$,
- (29) $-(CH_2)_{0-4}-O-CO-N(R_{N-5})_2$,
- (30) $-(CH_2)_{0-4}-O-CS-N(R_{N-5})_2$,
- (31) $-(CH_2)_{0-4}-O-(R_{N-5})$,
- (32) $-(CH_2)_{0-4}-O-(R_{N-5})-COOH$,
- (33) $-(CH_2)_{0-4}-S-(R_{N-5})$,
- (34) $-(CH_2)_{0-4}-O-(C_1-C_6$ -алкілом, що необов'язково заміщений одним, двома, трьома, чотирма чи п'ятьма атомами -F),

(35) C_3-C_8 -циклоалкілом,

(36) C_2-C_6 -алкенілом, що необов'язково заміщений C_1-C_6 -алкілом, -F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, $-C\equiv N$, $-CF_3$, C_1-C_3 -алкокси і $NR_{1-a}R_{1-b}$,

(37) C_2-C_6 -алкінілом, необов'язково заміщеним C_1-C_6 -алкілом, -F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, $-C\equiv N$, $-CF_3$, C_1-C_6 -алкокси і $NR_{1-a}R_{1-b}$,

(38) $-(CH_2)_{0-4}-N(H$ чи $R_{N-5})-SO_2-R_{N-2}$,

(39) $-(CH_2)_{1-4}-C_3-C_8$ -циклоалкілом,

(C) R_N -арил- $W-R_N$ -арила,

(D) R_N -арил- $W-R_N$ -гетероцикла,

(E) R_N -арил- $W-R_{1-гетероцикла}$,

(F) R_N -гетероарил- $W-R_N$ -арила

(G) R_N -гетероарил- $W-R_N$ -гетероарила,

(H) R_N -гетероарил- $W-R_{1-гетероцикла}$,

(I) R_N -гетероцикл- $W-R_N$ -арила,

(J) R_N -гетероцикл- $W-R_N$ -гетероарила,

(K) R_N -гетероцикл- $W-R_{1-гетероцикла}$,

де W означає

(1) $-(CH_2)_{1-4}$,

(2) -O-,

(3) $-S(O)_{1-2}$,

(4) $-N(R_{N-5})$,

(5) $-CO$,

(6) зв'язок;

(II) $-CO-(C_1-C_{10}$ -алкіл), де алкіл необов'язково заміщений одним, двома чи трьома замісниками, незалежно обраними з групи, що складається з:

(A) -OH,

(B) $-C_1-C_6$ -алкокси,

(C) $-C_1-C_6$ -тіоалкокси,

(D) $-CO_2-R_{N-8}$, де R_{N-8} у кожному випадку незалежно являє собою -H, C_1-C чи 6-алкіл-феніл, необов'язково заміщений 1 чи 2 замісниками, що незалежно представляють собою галоген, C_1-C_4 -алкокси, C_1-C чи 4-алкіл $-C(O)NH_2$,

(E) $-CO-NR_{N-2}R_{N-3}$,

(F) $-CO-R_{N-4}$,

(G) $-SO_2-(C_1-C_8$ -алкілу),

(H) $-SO_2-NR_{N-2}R_{N-3}$,

(I) $-NH-CO-(C_1-C_6$ -алкілу),

(J) $-NH-CO-O-R_{N-8}$,

(K) $-NR_{N-2}R_{N-3}$,

(L) $-R_{N-4}$,

(M) $O-CO-(C_1-C_6$ -алкілу),

(N) $O-CO-NR_{N-8}R_{N-8}$,

(O) $O-(C_1-C_5$ -алкіл)- $COOH$,

(P) $O-(C_1-C_6$ -алкілу, необов'язково заміщеного однією, двома чи трьома групами, що незалежно представляють собою -F, -Cl, -Br чи -I),

(Q) $-NH-SO_2-(C_1-C_6$ -алкілу),

(R) галогену,

(S) $-N(H$ чи $R_{N-5})-SO_2-R_{N-2}$,

(T) $-N(H$ чи $R_{N-5})-CO-R_{N-2}$ I

(U) $-SO_2-R_{N-2}$,

(V) $-R_N$ -арила,

(III) $-CO-(C_1-C_6$ -алкіл)- $O-(C_1-C_6$ -алкіл), де кожен алкіл є незаміщеним чи незалежно заміщений одним, двома чи трьома замісниками, обраними з групи, що складається з:

(A) -OH,

(B) C_1-C_6 -алкокси,

(C) C_1-C_6 -тіоалкокси,

(D) $-CO_2-R_{N-8}$,

(E) $-CO-NR_{N-2}R_{N-3}$,

(F) $-CO-R_{N-4}$,

(G) $-SO_2-(C_1-C_8$ -алкілу),

(H) $-SO_2-NR_{N-2}R_{N-3}$,

(I) $-NH-CO-(C_1-C_6$ -алкілу),

(J) $-NH-CO-O-R_{N-8}$,

(K) $-NR_{N-2}R_{N-3}$,

(L) $-R_{N-4}$,

(M) $O-CO-(C_1-C_6$ -алкілу),

(N) $O-CO-NR_{N-8}R_{N-8}$,

(O) $O-(C_1-C_5$ -алкіл)- CO_2H ,

(P) $O-(C_1-C_6$ -алкілу, необов'язково заміщеного однією, двома чи трьома групами, що незалежно представляють собою -F, -Cl, -Br чи -I),

(Q) $-NH-SO_2-(C_1-C_6$ -алкілу),

(R) галогену,

(S) $-N(H$ чи $R_{N-5})-SO_2-R_{N-2}$,

(T) $-N(H$ чи $R_{N-5})-CO-R_{N-2}$ I

(U) $-SO_2-R_{N-2}$,

(V) $-R_N$ -арила,

(IV) $-CO-(C_1-C_6$ -алкіл)- $S-(C_1-C_6$ -алкіл), де кожен алкіл є незаміщеним чи заміщений одним, двома чи трьома замісниками, незалежно обраними з групи, що складається з:

(A) -OH,

(B) C_1-C_6 -алкокси,

- (C) C_1-C_6 -тіоалкокси,
 (D) $-CO_2-R_{N-8}$,
 (E) $-CO-NR_{N-2}R_{N-3}$,
 (F) $-CO-R_{N-4}$,
 (G) $-SO_2-(C_1-C_8\text{-алкілу})$,
 (H) $-SO_2-NR_{N-2}R_{N-3}$,
 (I) $-NH-CO-(C_1-C_6\text{-алкілу})$,
 (J) $-NH-CO-O-R_{N-8}$,
 (K) $-NR_{N-2}R_{N-3}$,
 (L) $-R_{N-4}$,
 (M) $O-CO-(C_1-C_6\text{-алкілу})$,
 (N) $-O-CO-NR_{N-8}R_{N-8}$,
 (O) $-O-(C_1-C_5\text{-алкіл})-COOH$,
 (P) $-O-(C_1-C_6\text{-алкілу})$, необов'язково заміщеного однією, двома чи трьома групами, що незалежно представляють собою $-F$, $-Cl$, $-Br$ чи $-I$),
 (Q) $-NH-SO_2-(C_1-C_6\text{-алкілу})$,
 (R) галогену,
 (S) $-N(H \text{ чи } R_{N-5})-SO_2-R_{N-2}$,
 (T) $-N(H \text{ чи } R_{N-5})-CO-R_{N-2}$ і
 (U) $-SO_2-R_{N-2}$, і
 (V) $-R_{N-арила}$,
 (V) $-CO-CH(-(CH_2)_{0-2}-O-R_{N-10})-(CH_2)_{0-2}-(R_{N-арил} \text{ чи } R_{N-гетероарил})$, де R_{N-10} обраний із групи, що складається з:
 (1) $-H$,
 (2) $C_1-C_6\text{-алкілу}$,
 (3) $C_3-C_8\text{-циклоалкіла}$,
 (4) $C_2-C_6\text{-алкеніла}$,
 (5) $C_2-C_6\text{-алкініла}$,
 (6) $-R_1\text{-арила}$,
 (k) $-R_{N-гетероарила}$,
 l) $-R_{N-гетероцикла}$,
 (VI) $-CO-(C_3-C_8\text{-циклоалкіл})$, де циклоалкільна група необов'язково заміщена одним чи двома замісниками, незалежно обраними з групи, що складається з:
 (A) $-(CH_2)_{0-4}-OH$,
 (B) $-(CH_2)_{0-4}-C_1-C_6\text{-алкокси}$,
 (C) $-(CH_2)_{0-4}-C_1-C_6\text{-тіоалкокси}$,
 (D) $-(CH_2)_{0-4}-CO-O-R_{N-8}$,
 (E) $-(CH_2)_{0-4}-CO-NR_{N-2}R_{N-3}$,
 (F) $-(CH_2)_{0-4}-CO-R_{N-4}$,
 (G) $-(CH_2)_{0-4}-SO_2-(C_1-C_8\text{-алкіли})$,
 (H) $-(CH_2)_{0-4}-SO_2-NR_{N-2}R_{N-3}$,
 (I) $-(CH_2)_{0-4}-NH-CO-(C_1-C_6\text{-алкіли})$,
 (J) $-NH-CO-O-R_{N-8}$,
 (K) $-(CH_2)_{0-4}-NR_{N-2}R_{N-3}$,
 (L) $-(CH_2)_{0-4}-R_{N-4}$,
 (M) $-O-CO-(C_1-C_6\text{-алкілу})$,
 (N) $-O-CO-NR_{N-8}R_{N-8}$,
 (O) $-O-(C_1-C_6\text{-алкіл})-CO_2H$,
 (P) $O-(C_1-C_6\text{-алкілу})$, що необов'язково заміщений однією, двома чи трьома групами, незалежно обраними з $-F$, $-Cl$, $-Br$ чи $-I$),
 (Q) $-NH-SO_2-(C_1-C_6\text{-алкілу})$,
 (R) галогену,
 (S) $-N(H \text{ чи } R_{N-5})-SO_2-R_{N-2}$,
 (T) $-N(H \text{ чи } R_{N-5})-CO-R_{N-2}$ і
 (U) $-SO_2-R_{N-2}$, і
 (V) $-R_{N-арила}$, де R_C означає:
 (I) $C_1-C_{10}\text{-алкіл}$, необов'язково заміщений одним, двома чи трьома замісниками, обраними з групи, що складається з $C_1-C_3\text{-алкілу}$, $-F$, $-Cl$, $-Br$, $-I$, $-OH$, $-SH$, $-C\equiv N$, $-CF_3$, $C_1-C_6\text{-алкокси}$, $-O\text{-фенілу}$, $-NR_{1-a}R_{1-b}$, $-OC=ONR_{1-a}R_{1-b}$, $-S(=O)_{0-2}-R_{1-a}$, $-NR_{1-}$

- $a=ONR_{1-a}R_{1-b}$, $-C=ONR_{1-a}R_{1-b}$ і $-S(=O)_2NR_{1-a}R_{1-b}$,
 (II) $-(CH_2)_{0-3}-(C_3-C_8\text{-циклоалкіл})$, де циклоалкіл може бути необов'язково заміщений одним, двома чи трьома замісниками, незалежно обраними з групи, що складає з $C_1-C_3\text{-алкілу}$, $-F$, $-Cl$, $-Br$, $-I$, $-OH$, $-SH$, $-C\equiv N$, $-CF_3$, $C_1-C_6\text{-алкокси}$, $-O\text{-фенілу}$, $-CO_2H$, $-CO_2-(C_1-C_4\text{-алкілу})$ і $-NR_{1-a}R_{1-b}$,
 (III) $-(CR_{C-x}R_{C-y})_{0-4}-R_{C-арил}$ у кожному випадку незалежно являє собою феніл; нафтил; тетралініл; інданіл; інденіл; дигідронафтил; чи 6,7,8,9-тетрагідро-5H-бензо[а]циклопентеніл; кожний з яких необов'язково заміщений 1, 2 чи 3 групами, у кожному випадку незалежно представляють собою:
 (1) $C_1-C_6\text{-алкіл}$, необов'язково заміщений одним, двома чи трьома замісниками, обраними з групи, що складається з $C_1-C_3\text{-алкілу}$, $-F$, $-Cl$, $-Br$, $-I$, $-OH$, $-SH$, $-C\equiv N$, $-CF_3$, $C_1-C_3\text{-алкокси}$ і $NR_{1-a}R_{1-b}$,
 (2) $-OH$,
 (3) $-NO_2$,
 (4) $-F$, $-Cl$, $-Br$, $-I$,
 (5) CO_2H ,
 (6) $-C\equiv N$, і
 (7) $-(CH_2)_{0-4}-CO-NR_{N-2}R_{N-3}$,
 де R_{C-x} і R_{C-y} незалежно являють собою $-H$,
 $C_1-C_4\text{-алкіл}$, необов'язково заміщений однією чи двома групами $-OH$,
 $C_1-C_4\text{-алкокси}$, необов'язково заміщений 1, 2 чи 3 атомами $-F$,
 $-(CH_2)_{0-4}-C_3-C_8\text{-циклоалкіл}$,
 $C_2-C_6\text{-алкеніл}$,
 $C_2-C_6\text{-алкініл}$ і феніл,
 чи R_{C-x} і R_{C-y} разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, утворюють вуглецевий цикл із трьох, чотирьох, п'яти, шести чи семи атомів вуглецю, у якому один з вуглецевих атомів необов'язково заміщений гетероатомом, обраним із групи, що складається з $-O-$, $-S-$, $-SO_2-$, $-NR_{N-2}-$, а $R_{C-арил}$ визначений як описано вище;
 (IV) $-(CR_{C-x}R_{C-y})_{0-4}-R_{C-гетероарил}$, де $R_{C-гетероарил}$ у кожному випадку незалежно обраний із групи, що складає з піридиніла, піримідиніла, хінолініла, бензотиєніла, індоліла, індолініла, піридазиніла, піразиніла, ізоіндоліла, ізохіноліла, хіназолініла, хіноксалініла, фталазиніла, імідазоліла, ізоксазоліла, піразоліла, оксазоліла, тiazоліла, індолізиніла, індазоліла, бензоізотіазоліла, бензімідазоліла, бензофураніла, фураніла, таєніла, піроліла, оксадиазоліла, тіадиазоліла, тріазоліла, тетразоліла, оксазолопіридиніла, ізотіазоліла, нафтиридиніла, цінолініла, кархазоліла, бета-карболініла, ізохроманіла, хроманіла, тетрагідроізохінолініла, ізоіндолініла, ізобензотетрагідрофураніла, ізобензотетрагідротиєніла, ізобензотиєніла, бензоксазоліла, піридопіридиніла, бензотетрагідрофураніла, бензотетрагідротиєніла, пуриніла, бензодіоксоліла, тріазиніла, феноксазиніла, фенотіазиніла, птеридиніла, бензотіазоліла, імідазопіридиніла, імідазотіазоліла, дигідробензизоксазиніла, бензизоксазиніла, бензоксазиніла, дигідробензизотіазиніла, бензопіраніла, бензотіопіраніла, кумариніла, ізокумариніла, хромоніла, хроманоніла, тетрагідрохінолініла, дигідрохінолініла, дигідрохіноліноніла, дигідроізохіноліноніла, дигідрокумариніла, дигідроізокумариніла, ізоіндоліноніла, бензодіоксаніла,

бензоксазоліноніла, імідазопіразоліла, хіназоліноніла, піразопіридила, бензоксадіазоліла, дигідропіримідиніла, дигідробензофураноніла, піридиніла N-оксиду, піроліла N-оксиду, піримідиніла N-оксиду, піридазиніла N-оксиду, піразиніла N-оксиду, хінолініла N-оксиду, індоліла N-оксиду, індолініла N-оксиду, ізохіноліла N-оксиду, хіназолініла N-оксиду, хіноксалініла N-оксиду, фталазиніла N-оксиду, імідазоліла N-оксиду, ізоксазоліла N-оксиду, оксазоліла N-оксиду, тіазоліла N-оксиду, індолізиніла N-оксиду, індазоліла N-оксиду, бензотіазоліла N-оксиду, бензімідазоліла N-оксиду, піроліла N-оксиду, оксадіазоліла N-оксиду, тіадиазоліла N-оксиду, триазоліла N-оксиду, тетразоліла N-оксиду, бензотіопіраніла S-оксиду і бензотіопіраніла S,S-діоксида,

де група $R_{C-гетероарил}$ бере участь у зв'язку за допомогою будь-якого атома вихідної групи $R_{C-гетероарил}$, заміщеного воднем, таким чином, що новий зв'язок із групою $R_{C-гетероарил}$ заміщає атом водню і його зв'язок, при цьому гетероарил необов'язково заміщений 1, 2, 3 чи 4 групами, що незалежно представляють собою:

(1) C_1-C_6 -алкіл, необов'язково заміщений 1, 2 чи 3 замісниками, незалежно обраними з групи, що складається з C_1-C_3 -алкілу, -F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, $-C\equiv N$, $-CF_3$, C_1-C_3 -алкокси і $NR_{1-a}R_{1-b}$,

(2) -OH,

(3) $-NO_2$,

(4) -F, -Cl, -Br, -I,

(5) $-CO-OH$,

(6) $-C\equiv N$,

(7) $-(CH_2)_{0-4}-CO-NR_{N-2}R_{N-3}$,

(8) $-(CH_2)_{0-4}-CO-(C_1-C_{12}$ -алкіл),

(9) $-(CH_2)_{0-4}-CO-(C_2-C_{12}$ -алкеніл),

(10) $-(CH_2)_{0-4}-CO-(C_2-C_{12}$ -алкініл),

(11) $-(CH_2)_{0-4}-CO-(C_3-C_7$ -циклоалкіл),

(12) $-(CH_2)_{0-4}-CO-R_1$ -арил,

(13) $-(CH_2)_{0-4}-CO-R_1$ -гетероарил,

(14) $-(CH_2)_{0-4}-CO-R_1$ -гетероцикл,

(15) $-(CH_2)_{0-4}-CO-R_{N-4}$,

(16) $-(CH_2)_{0-4}-CO_2-R_{N-5}$,

(17) $-(CH_2)_{0-4}-SO_2-NR_{N-2}R_{N-3}$,

(18) $-(CH_2)_{0-4}-SO-(C_1-C_6$ -алкіл),

(19) $-(CH_2)_{0-4}-SO_2-(C_1-C_{12}$ -алкіл),

(20) $-(CH_2)_{0-4}-SO_2-(C_3-C_7$ -циклоалкіл),

(21) $-(CH_2)_{0-4}-N(H$ чи $R_{N-5})-CO-O-R_{N-5}$,

(22) $-(CH_2)_{0-4}-N(H$ чи $R_{N-5})-CO-N(R_{N-5})_2$,

(23) $-(CH_2)_{0-4}-N-CS-N(R_{N-5})_2$,

(24) $-(CH_2)_{0-4}-N(H$ чи $R_{N-5})-CO-R_{N-2}$,

(25) $-(CH_2)_{0-4}-NR_{N-2}R_{N-3}$,

(26) $-(CH_2)_{0-4}-R_{N-4}$,

(27) $-(CH_2)_{0-4}-O-CO-(C_1-C_6$ -алкіл),

(28) $-(CH_2)_{0-4}-O-P(O)-(OR_{100})_2$,

(29) $-(CH_2)_{0-4}-O-CO-N(R_{N-5})_2$,

(30) $-(CH_2)_{0-4}-O-CS-N(R_{N-5})_2$,

(31) $-(CH_2)_{0-4}-O-(R_{N-5})$,

(32) $-(CH_2)_{0-4}-O-(R_{N-5})-COOH$,

(33) $-(CH_2)_{0-4}-S-(R_{N-5})$,

(34) $-(CH_2)_{0-4}-O-(C_1-C_6$ -алкіл, необов'язково заміщений одним, двома, трьома, чотирма чи п'ятьма атомами -F),

(35) C_3-C_8 -циклоалкіл,

(36) C_2-C_6 -алкеніл, необов'язково заміщений C_1-C_3 -алкілом, -F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, $-C\equiv N$, $-CF_3$, C_1-C_3 -алкокси і $NR_{1-a}R_{1-b}$,

(37) C_2-C_6 -алкініл, необов'язково заміщений C_1-C_3 -алкілом, -F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, $-C\equiv N$, $-CF_3$, C_1-C_3 -алкокси і $NR_{1-a}R_{1-b}$,

(38) $-(CH_2)_{0-4}-N(H$ чи $R_{N-5})-SO_2-R_{N-2}$ і

(39) $-(CH_2)_{1-4}-(C_3-C_8$ -циклоалкіл),

(V) $-(CR_{C-x}R_{C-y})_{0-4}-R_{C-арил}-R_{C-арил}$,

(VI) $-(CR_{C-x}R_{C-y})_{0-4}-R_{C-арил}-R_{C-гетероарил}$,

(VII) $-(CR_{C-x}R_{C-y})_{0-4}-R_{C-гетероарил}-R_{C-арил}$,

(VIII) $-(CR_{C-x}R_{C-y})_{0-4}-R_{C-гетероарил}-R_{C-гетероарил}$,

(IX) $-(CR_{C-x}R_{C-y})_{0-4}-R_{C-арил}-R_{C-гетероцикл}$, де $R_{C-гетероцикл}$ обраний із групи, що складається з мор-

фолініла, тіоморфолініла, тіоморфолініла S-оксиду, тіоморфолініла S,S-діоксида, піперазиніла, гомопіперазиніла, піролідиніла, піролініла, тетрагідропіраніла, піперидиніла, тетрагідрофураніла, тетрагідротаеніла, гомопіперидиніла, гомоморфолініла, гомотіоморфолініла, гомотіоморфолініла S,S-діоксида, оксазолідиніла, дигідропіразоліла, дигідропіроліла, дигідропіразиніла, дигідропіридиніла, дигідропіримідиніла, дигідрофураніла, дигідропіраніла, тетрагідротаеніла S-оксиду, тетрагідротаеніла S,S-діоксида, гомотіоморфолініла S-оксиду, дитіаніла, піраніла, дигідрофураніла, піролідиніла, імідазолідиніла, імідазолідинондіоніла, де кожний з перерахованих вище радикалів необов'язково сконденсований з бензольним, піридиновим чи піримідиновим кільцем, і

де група $R_{C-гетероцикл}$ бере участь у зв'язку за допомогою будь-якого атома вихідної групи $R_{C-гетероцикл}$, заміщеного воднем, таким чином, що новий зв'язок із групою $R_{C-гетероцикл}$ заміщає атом водню і його зв'язок, при цьому гетероцикл необов'язково заміщений одним, двома, трьома чи чотирма наступними замісниками:

(1) C_1-C_6 -алкілом, необов'язково заміщеним одним, двома чи трьома замісниками, незалежно обраними з групи, що складається з C_1-C_3 -алкілу, -F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, $NR_{1-a}R_{1-b}$, $-C\equiv N$, $-CF_3$ і C_1-C_3 -алкокси,

(2) C_2-C_6 -алкенілом, необов'язково заміщеним одним, двома чи трьома замісниками, обраними з групи, що складається з -F, -Cl, -OH, -SH, $-C\equiv N$, $-CF_3$, C_1-C_3 -алкокси і $NR_{1-a}R_{1-b}$,

(3) C_2-C_6 -алкінілом, необов'язково заміщеним одним, двома чи трьома замісниками, незалежно обраними з групи, що складається з -F, -Cl, -OH, -SH, $-C\equiv N$, $-CF_3$, C_1-C_3 -алкокси і $NR_{1-a}R_{1-b}$,

(4) -F, -Cl, -Br і -I,

(5) C_1-C_6 -алкокси,

(6) $-C_1-C_6$ -галогеналкокси,

(7) $-NR_{N-2}R_{N-3}$,

(8) -OH

(9) $-C\equiv N$,

(10) C_3-C_7 -циклоалкілом, необов'язково заміщеним одним, двома чи трьома замісниками, незалежно обраними з групи, що складається з -F, -Cl, -OH, -SH, $-C\equiv N$, $-CF_3$, C_1-C_3 -алкокси і $NR_{1-a}R_{1-b}$,

(11) $-CO-(C_1-C_4$ -алкілом),

(12) $-SO_2-NR_{1-a}R_{1-b}$,

(13) $-CO-NR_{1-a}R_{1-b}$,

(14) $-SO_2-(C_1-C_4$ -алкілом),

(15) =O, за умови, що якщо n_1 дорівнює 0, $R_{C-гетероцикл}$ не зв'язаний з вуглецевим ланцюжком через атом азоту;

(X) $-(CR_{C-x}R_{C-y})_{0-4}-R_{C-гетероарил}-R_{C-гетероцикл}$,

(XI) $-(CR_{C-x}R_{C-y})_{0-4}-R_{C-гетероцикл}-R_{C-арил}$,

(XII) $-(\text{R}_{\text{C}-\text{x}}\text{R}_{\text{C}-\text{y}})_{0-4}\text{-R}_{\text{C}}\text{-гетероцикл-R}_{\text{C}}\text{-гетероарил}$,
 (XIII) $-(\text{R}_{\text{C}-\text{x}}\text{R}_{\text{C}-\text{y}})_{0-4}\text{-R}_{\text{C}}\text{-гетероцикл-R}_{\text{C}}\text{-гетероцикл}$,
 (XIV) $-(\text{R}_{\text{C}-\text{x}}\text{R}_{\text{C}-\text{y}})_{0-4}\text{-R}_{\text{C}}\text{-гетероцикл}$,
 (XV) $-\text{[C(R}_{\text{C}-1}\text{)(R}_{\text{C}-2}\text{)]}_{1-3}\text{-CO-N(R}_{\text{C}-3}\text{)}_2$, де $\text{R}_{\text{C}-1}$ і $\text{R}_{\text{C}-2}$ є однаковими чи різними й обрані з групи, що складається з:

(A) -H,

(B) $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-алкіл}$, необов'язково заміщеного одним, двома чи трьома замісниками, обраними з групи, що складається з $\text{C}_1\text{-C}_3\text{-алкіл}$, -F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, -C≡N, -CF₃, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-алкокси}$, -O-фенілу і -NR_{1-a}R_{1-b},

(C) $\text{C}_2\text{-C}_6\text{-алкеніл}$, необов'язково заміщеного одним, двома чи трьома замісниками, обраними з групи, що складається з $\text{C}_1\text{-C}_3\text{-алкіл}$, -F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, -C≡N, -CF₃, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-алкокси}$, -O-фенілу і -NR_{1-a}R_{1-b},

(D) $\text{C}_2\text{-C}_6\text{-алкініл}$, необов'язково заміщеного одним, двома чи трьома замісниками, обраними з групи, що складається з $\text{C}_1\text{-C}_3\text{-алкіл}$, -F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, -C≡N, -CF₃, $\text{C}_1\text{-C}_3\text{-алкокси}$, -O-фенілу і -NR_{1-a}R_{1-b},

(E) $-(\text{CH}_2)_{1-2}\text{-S(O)}_{0-2}\text{-(C}_1\text{-C}_6\text{-алкіл)}$,

(F) $-(\text{CH}_2)_{0-4}\text{-C}_3\text{-C}_8\text{-циклоалкіл}$, необов'язково заміщеного одним, двома чи трьома замісниками, обраними з групи, що складається з $\text{C}_1\text{-C}_3\text{-алкіл}$, -F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, -C≡N, -CF₃, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-алкокси}$, -O-фенілу і -NR_{1-a}R_{1-b},

(G) $-(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкіл})\text{-R}_{\text{C}}\text{-арила}$,

(H) $-(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкіл})\text{-R}_{\text{C}}\text{-гетероарила}$,

(I) $-(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкіл})\text{-R}_{\text{C}}\text{-гетероцикла}$,

(J) -R_C-гетероарила,

(K) -R_C-гетероцикла,

(M) $-(\text{CH}_2)_{1-4}\text{-R}_{\text{C}-4}\text{-(CH}_2)_{0-4}\text{-R}_{\text{C}}\text{-арила}$, де $\text{R}_{\text{C}-4}$ означає -O-, -S- чи NR_{C-5}, де $\text{R}_{\text{C}-5}$ є $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-алкілом}$,

(N) $-(\text{CH}_2)_{1-4}\text{-R}_{\text{C}-4}\text{-(CH}_2)_{0-4}\text{-R}_{\text{C}}\text{-гетероарила}$,

(O) R_C-арила,

і де $\text{R}_{\text{C}-3}$ у кожному випадку є однаковим чи різним й означає:

(A) -H,

(B) $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-алкіл}$, необов'язково заміщений одним, двома чи трьома замісниками, незалежно обраними з групи, що складається з $\text{C}_1\text{-C}_3\text{-алкіл}$, -F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, -C≡N, -CF₃, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-алкокси}$, -O-фенілу і -NR_{1-a}R_{1-b},

(C) $\text{C}_2\text{-C}_6\text{-алкеніл}$, що містить одну чи два подвійні зв'язки, необов'язково заміщений одним, двома чи трьома замісниками, незалежно обраними з групи, що складається з $\text{C}_1\text{-C}_3\text{-алкіл}$, -F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, -C≡N, -CF₃, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-алкокси}$, -O-фенілу і -NR_{1-a}R_{1-b},

(D) $\text{C}_2\text{-C}_6\text{-алкініл}$, необов'язково заміщений одним, двома чи трьома замісниками, незалежно обраними з групи, що складається з $\text{C}_1\text{-C}_3\text{-алкіл}$, -F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, -C≡N, -CF₃, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-алкокси}$, -O-фенілу і -NR_{1-a}R_{1-b},

(E) $-(\text{CH}_2)_{0-4}\text{-C}_3\text{-C}_8\text{-циклоалкіл}$, необов'язково заміщений одним, двома чи трьома замісниками, незалежно обраними з групи, що складається з $\text{C}_1\text{-C}_3\text{-алкіл}$, -F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, -C≡N, -CF₃, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-алкокси}$, -O-фенілу і -NR_{1-a}R_{1-b},

(F) -R_C-арил,

(G) -R_C-гетероарил,

(H) -R_C-гетероцикл,

(I) $-(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкіл})\text{-R}_{\text{C}}\text{-арил}$,

(J) $-(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкіл})\text{-R}_{\text{C}}\text{-гетероарил}$,

(K) $-(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкіл})\text{-R}_{\text{C}}\text{-гетероцикл}$,

(XVI) $-\text{CH(R}_{\text{C}}\text{-арил)}_2$,

(XVII) $-\text{CH(R}_{\text{C}}\text{-гетероарил)}_2$,

(XVIII) $-\text{CH(R}_{\text{C}}\text{-арил)(R}_{\text{C}}\text{-гетероарил)}$,

(XIX) -циклопентильне, -циклогексильне чи -циклогептильне кільце, сконденсоване з R_C-арилом чи R_C-гетероарилом чи R_C-гетероциклом, де один атом вуглецю циклопентильного, циклогексильного чи циклогептильного фрагмента необов'язково заміщений NH, NR_{N-5}, O, S(O)₀₋₂, і де циклопентил, циклогексил чи циклогептил може бути необов'язково заміщений одним чи двома наступними замісниками: $\text{C}_1\text{-C}_3\text{-алкілом}$, -F, -OH, -SH, -C≡N, -CF₃, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-алкокси}$, =O і -NR_{1-a}R_{1-b},

(XX) $\text{C}_2\text{-C}_{10}\text{-алкеніл}$, необов'язково заміщений одним, двома чи трьома замісниками, обраними з групи, що складається з $\text{C}_1\text{-C}_3\text{-алкіл}$, -F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, -C≡N, -CF₃, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-алкокси}$, -O-фенілу і -NR_{1-a}R_{1-b},

(XXI) $\text{C}_2\text{-C}_{10}\text{-алкініл}$, необов'язково заміщений одним, двома чи трьома замісниками, обраними з групи, що складається з $\text{C}_1\text{-C}_3\text{-алкіл}$, -F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, -C≡N, -CF₃, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-алкокси}$, -O-фенілу і -NR_{1-a}R_{1-b},

(XXI) $-(\text{CH}_2)_{0-1}\text{-CH(R}_{\text{C}-6}\text{)-(CH}_2)_{0-1}\text{-R}_{\text{C}}\text{-арил}$, де $\text{R}_{\text{C}-6}$ означає $-(\text{CH}_2)_{0-6}\text{-OH}$,

(XXII) $-(\text{CH}_2)_{0-1}\text{-CH(R}_{\text{C}-6}\text{)-(CH}_2)_{0-1}\text{-R}_{\text{C}}\text{-гетероарил}$,

(XXIII) $-\text{CH(R}_{\text{C}}\text{-арил, чи R}_{\text{C}}\text{-гетероарил-CO}_2\text{(C}_1\text{-C}_4\text{-арил)})$,

(XXIV) $-\text{CH(CH}_2\text{-OH)-CH(OH)-NO}_2$,

(XXV) $(\text{C}_1\text{-C}_6\text{-алкіл})\text{-O-(C}_1\text{-C}_6\text{-алкіл)-OH}$,

(XXVII) $-\text{CH}_2\text{-NH-CH}_2\text{-CH(O-CH}_2\text{-CH}_3\text{)}_2$,

(XXVIII) -H,

(XXIX) $-(\text{CH}_2)_{0-6}\text{-C(=NR}_{1-a}\text{)(NR}_{1-a}\text{R}_{1-b})$;

R₂₅ у кожному випадку включає спосіб лікування із групи, що складається з водню, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-алкіл}$, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-алкокси}$, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-алкокси-C}_1\text{-C}_6\text{-алкіл}$, гідрокси- $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-алкіл}$, галоген- $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-алкіл}$, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-алканол}$, кожний з яких є незаміщеним чи заміщеним 1, 2, 3 чи 4 групами, незалежно обраними з галогену, алкілу, гідроксилу, алкокси, NH₂ і -R₂₆-R₂₇, де

R₂₆ обраний із групи, що складається з -C(O)-, -O-, -S-, -SO-, -SO₂-, -CO₂-, -C(O)NH- і -C(O)N(C₁-C₆-алкіл)-;

R₂₇ обраний із групи, що складається з алкілу, алкокси, фенілу, піридила і циклопропіла, і фармацевтично прийнятні солі даної сполуки.

Даний винахід також включає спосіб лікування чи профілактики захворювання чи стану, що обраний з групи, що складається з хвороби Альцгеймера, включаючи попередження чи уповільнення її початку, легкого когнітивного розладу (ЛКР), включаючи попередження чи уповільнення початку хвороби Альцгеймера, якщо існує ризик розвитку хвороби від ЛКР до ХА, синдрому Дауна, уродженого внутрішньомозкового крововиливу з голландським амілоїдозом, церебральної амілоїдної ангіопатії, включаючи попередження її можливих наслідків, тобто одиничних і рецидивуючих лобарних крововиливів, лікування інших дегенеративних деменцій, включаючи деменції змішаної судинної і дегенеративної природи, деменцію, що зумовлена хворобою Паркінсона, деменцію, що зумовлена прогресуючим надядерним паралічем, деменцію, що зумовлена кортикальною базальною дегене-

рацією, чи різновиду хвороби Альцгеймера з дифузійними тільцями Леві, що включає введення пацієнту, що потребує таке лікування, терапевтично ефективного кількості сполуки формули (I) і його фармацевтично прийнятних солей.

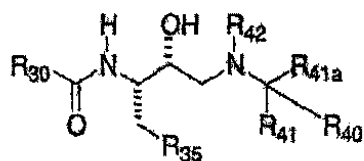
Даний винахід також включає способи інгібування активності бета-секретази, інгібування розщеплення білка-попередника амілоїда (APP), у реакційній суміші на сайті між Met596 і Asp597, пронумерованому для ізотипа амінокислоти APP-695, чи на відповідному сайті ізотипа чи його мутанта; інгібування продукування амілоїдного бета-пептиду (А-бета) у клітці; інгібування утворення бета-амілоїдної бляшки у тварини, а також лікування чи попередження захворювання, що характеризується бета-амілоїдними відкладеннями в головному мозку, що включають введення терапевтично ефективного кількості заміщеного аміну формули (I) і його фармацевтично прийнятних солей.

Даний винахід представляє сполуки, композиції, набори, а також способи інгібування обумовленого бета-секретазою розщеплення білка-попередника амілоїда (APP). Зокрема, сполуки, композиції і способи винаходу інгібують продукування А-бета-пептиду й ефективні для лікування чи попередження в людини чи тварин будь-якого захворювання чи стану, зв'язаного з патологічною формою А-бета-пептиду.

Сполуки, композиції і способи винаходу застосовні для лікування людей із хворобою Альцгеймера (ХА), включаючи попередження чи уповільнення її початку, для лікування пацієнтів з легким когнітивним розладом (ЛКР), для попередження чи уповільнення початку ХА в тих пацієнтів, для яких у протилежному випадку існує ризик прогресування захворювання від ЛКР до ХА, для лікування синдрому Дауна, спадкоємного внутрішньомозкового крововиливу з голландським амілоїдозом, церебральної бета-амілоїдної ангіопатії, включаючи попередження її можливих наслідків, таких як одиничні і рецидивуючі лобарні крововиливи, для лікування інших дегенеративних деменцій, включаючи деменції змішаної судинної і дегенеративної природи, для лікування деменції, що зумовлена хворобою Паркінсона, деменції, зумовлена прогресуючим надядерним паралічем, деменції, що зумовлена кортикальною базальною дегенерацією і різновиду хвороби Альцгеймера з дифузійними тільцями Леві.

Сполуки винаходу виявляють інгібуючу активність по відношенню до бета-секретази. Інгібуюча активність сполук винаходу легко може бути продемонстрована використанням одного чи більше аналізів, описаних тут чи відомих у даній області.

Відповідно до часткового аспекту Формули Х винахід представляє сполуки формули Z1:



чи їх фармацевтично прийнятні солі, де R_{30} обраний із групи, що складається з фенілу,

піразолопіримідиніла, оксазабензоазуленіла, ізоксазоліла, триазолопіридиніла, піролідіноніла, тетрагідротіазафлуореніла, піридила, піперидиніла, дигідроциклопентахінолініла, фурила, нафтіотеніла, фталазиноніла, тіадиазоліла, тиенопіримідиніла, оксадиазациклопентанафталеніла, дигідробензодіоксепініла, хроманоніла, хроменоніла, оксазолідиніла, бензофенона, піразиніла моно-N-оксиду, бензофураніла, піразоліла, ізоксазолілфеніла, фенілтріазоліла, бензімідазоліла, індоліла, фенілпіроліла, хроманіла, ізохінолініла, -тиєнілтиєніла, бензотиєніла, фенілтіадиазоліла, хроманоніла, хінолініла, піроліл-C(O)-фенілу, -фенілу-про-фенілу, фенілоксазоліла, -піролідінонілфеніла, фенілпіримідиніла, фенілоксадиазоліла, біцикло[2.2.1]гептеніла, циклопентила, тієно[2,3-b]тіофена, циклогексила, -фенілімідазоліла, бензоксазола; дигідро-1H-індоліла; 2,3-дигідро-бензо[б]тіофена 1,1 -діоксида; бензо[б]тіофена 1,1 -діоксида; 2,3-дигідро-бензо[с]ізо-тіазола 1,1 -діоксида; -фенілтіазоліла; -фенілпіразоліла, -феніл-C(O)- піперидила, -феніл-C(O)-піролідініла, -фенілізоксазоліла, ізоіндоліла, пуриніла, оксазоліла, тіазоліла, піридазиноніла, тіазоліла, піраніла, дигідропіранопіридиніла, диазепаніла, циклопропіла, дигідронафтоізоксазоліла, бензоіндазола, дигідроциклопента-хроменоніла, імідазопіразоліла, тетрагідроциклопентахроменоніла, дигідро-хіноліноніла, піридила N-оксиду, ізохроманіла, хіназоліноніла, піразолопіридиніла, дигідробензотіофена діоксида, дигідрофуорбензо-ізоксазоліла, дигідропіримідиніла, тієнопіразоліла, оксазоліла, тетрагідротициклопентапіразоліла, дигідронафталеноніла, дигідробензо-фураноніла, дигідроциклопентатиєніла, тетрагідроциклопентапіразоліла, тетрагідропіразолоазепініла, індазоліла, тетрагідроциклопентаізоксазоліла, тетрагідроіндолоніла, піролідініла, тієнопіридиніла, діоксидигідробензо-ізотіазолоніла, триазолопіримідиніла, тиєніла, дигідротієнопіримідиноніла і бензоксадиазоліла, де кожний з перерахованих вище радикалів є незаміщеним чи заміщений 1, 2, 3, 4 чи 5 замісниками, незалежно обраними з групи, що складається з

C_1 - C_{10} -алкілу, необов'язково заміщеного 1 фенілом чи 1 групою CN; OH, гідрокси- C_1 - C_{10} -алкілу, необов'язково заміщеного фенілом чи (C_1 - C_4 -алкіл)фенілом, C_1 - C_6 -алкокси, необов'язково заміщеного 1 чи 2 групами, що незалежно представляють собою гідроксил чи феніл; галогеналкіла, галогеналкокси, $(CH_2)_{0-4}C(O)NR_{31}R_{32}$, - $NR_{31}-SO_2-(C_1-C_6-алкілу)$, де алкільна група необов'язково заміщена 1, 2 чи 3 групами, що незалежно представляють собою галоген чи R_{33} , - $SO_2-NH(C_1-C_6-алкілу)$, де алкільна група необов'язково заміщена 1 чи 2 групами, що незалежно представляють собою галоген, OH, алкокси чи R_{33} ; -(C_1 - C_6 -алкілу)- $SO_2-(C_1-C_6-алкілу)$, де алкільна група необов'язково заміщена 1 чи 2 групами, що незалежно представляють собою галоген, OH, C_1 - C_6 -алкокси чи R_{33} ; - $SO_2-(C_1-C_6-алкілу)$, де алкільна група необов'язково заміщена 1 чи 2 групами, що незалежно представляють собою OH чи C_1 - C_4 -алкокси; - $SO_2-N(C_1-C_6-алкіл)(C_1-C_6-алкілу)$, де кожна алкільна група необов'язково заміщена 1 чи 2 групами, що

незалежно представляють собою галоген, OH чи R₃₃; -SO₂-NH(C₁-C₆-алкіл)фенілу, де феніл необов'язково заміщений 1 чи 2 групами, що незалежно представляють собою C₁-C₄-алкокси чи галоген, -O-(C₁-C₆-алкіл)фенілу, -(C₁-C₆-алкіл)-O-фенілу, -(C₁-C₆-алкіл)-O-(C₁-C₆-алкіл)фенілу, триазиолін-3,5-діона, галогену, -NHC(O)NH₂, -NHC(O)NH(C₁-C₆-алкілу), -NHC(O)N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкілу), -N(C₁-C₆-алкіл)C(O)NH₂, -N(C₁-C₆-алкіл)C(O)NH(C₁-C₆-алкілу), -N(C₁-C₆-алкілу)C(O)N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкілу), -(C₁-C₆-алкіл)тиєніла, -(C₁-C₆-алкіл)фураніла, -S-(C₁-C₆-алкіл)фенілу, -SO₂NR₃₁₃₂, C(O)-NR₃₁₃₂, -NR₃₁₃₂, дитіана, -NHC(S)NH₂, -NHC(S)NH(C₁-C₆-алкілу), -NHC(S)N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкілу), -CO₂(C₁-C₆-алкілу), тетрагідропірана, фенілу, необов'язково заміщеного 1 чи 2 групами, що незалежно представляють собою F, Cl чи Br; піридину, -C₂-C₄-алкілфеніла, -O-C₃-C₅-циклоалкіла, -O-(C₁-C₆-алкіл)-R₃₃; пірола, необов'язково заміщеного 1 чи 2 металними групами; 2,3-дигідробензофурана; бензо[1, 2,5]оксадіазола, -C(O)(C₁-C₁₀-алкілу), де алкільна група необов'язково заміщена NH₂, N(C₁-C₆-алкілом) чи N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкілом); C(O)NH-фенілу, -C(O)N(C₁-C₆-алкіл)фенілу, 4,4-диметил-4,5-дигідроксазола; -(C₁-C₆-алкіл)-S-піридину, -(C₁-C₆-алкіл)-SO₂-піридину, -(C₁-C₆-тіоалкокси)піридину, тіазола, необов'язково заміщеного 1 чи 2 металними групами, піразола, -S-(C₁-C₆-алкілу), індола, (C₁-C₆-тіоалкокси)-(C₁-C₆-алкілу), C₂-C₈-алкініла, -CO₂-(C₁-C₆-алкілу), C₁-C₁₀-алканоїла; -(CH₂)₀₋₄-SO₂-(C₁-C₁₀-алкіли), де алкільна група необов'язково заміщена OH;

де R₃₁ і R₃₂ у кожному випадку незалежно обрані з групи, що складається з водню, C₁-C₈-алкілу, C₂-C₈-алкеніла, гідрокси-C₁-C₆-алкілу, C₁-C₆-галогеналкіла, C₁-C₆-алкокси, C₁-C₆-алкілу, -(CH₂)₀₋₄-SO₂-(C₁-C₆-алкіли), де алкіл необов'язково заміщений 1, 2, 3 чи 4 незалежно обраними атомами галогену; -(CH₂)₀₋₄-SO₂-імідазоліла, -(C₁-C₆-алкіл)-C(O)NH₂, -(C₁-C₆-алкіл)-C(O)NH(C₁-C₆-алкілу), -(C₁-C₆-алкіл)-C(O)N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкілу), -(C₁-C₆-алкіл)-NH₂, -(C₁-C₆-алкіл)-NH(C₁-C₆-алкілу), -(C₁-C₆-алкіл)-N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкілу), -(C₁-C₆-алкіл)фенілу, -(C₁-C₆-алкіл)піридила, -C(O)фураніла, (C₁-C₆-алкіл)тетрагідропірана, циклопропіла, циклобутила, циклопентила, циклогексила, -CO₂-(C₁-C₆-алкілу), -(C₁-C₆-алкіл)фураніла, -(CH₂)₀₋₄-SO₂-тиєніла, де

феніл і піридил є незаміщеними чи заміщені 1, 2, 3, 4 чи 5 групами, що незалежно представляють собою C₁-C₄-алкіл, гідроксильну групу, C₁-C₄-алкокси, галоген, чи

R₃₁, R₃₂ і атом азоту, до якого вони приєднані, утворюють 5, 6 чи 7-членний гетероциклічний алкіл чи 6-членний гетероарильний цикл, кожний з яких необов'язково сконденсований з бензольним, піридиновим чи піримідиновим кільцем і кожний з яких необов'язково заміщений C₁-C₆-алкокси, гідроксильною, гідрокси-C₁-C₆-алкілом, C₁-C₄-алкокси-C₁-C₆-алкілом, -C(O)NH₂, -C(O)NH-(C₁-C₆-алкіл)фенілом;

R₃₃ у кожному випадку незалежно являє собою H, NH₂, NH(C₁-C₆-алкіл), N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкіл), N(C₁-C₆-алкіл)феніл, N(C₁-C₆-алкіл)бензил;

R₃₅ означає феніл, C₃-C₈-циклоалкіл, -S-феніл,

бензодіоксол, тиєніл, C₁-C₆-алкіл, фураніл, імідазоліл, кожний з яких є незаміщеним чи заміщений 1, 2, 3, 4 чи 5 групами, що незалежно представляють собою C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-алкокси, OH, гідрокси-C₁-C₆-алкіл, галоген, галоген-C₁-C₆-алкіл, галоген-C₁-C₆-алкокси, -O-(C₁-C₆-алкіл)феніл, -CO₂-(C₁-C₆-алкіл), -(C₁-C₄-алкіл)-(C₅-C₆-циклоалкіл) чи (CH₂)₀₋₄CN;

R₄₀ являє собою феніл, -фенілпіридил, біфеніл, -фенілбензотиєніл, -фенілтиєніл, -фенілфураніл, -фенілпіримідиніл, -фенілїзоксазоліл, -C(O)-піридил, -(C₁-C₄-алкіл)-O-C(O)NH-феніл, де феніл необов'язково заміщений 1, 2 чи 3 атомами галогену; -(C₁-C₄-алкіл)-O-C(O)N(C₁-C₆-алкіл)феніл, -(C₁-C₆-алкіл)феніл, -(C₁-C₄-алкіл)-SO₂NH₂, -(C₁-C₄-алкіл)-SO₂NH(C₁-C₆-алкіл), -(C₁-C₄-алкіл)-SO₂N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкіл), -SO₂NH₂, -SO₂NH(C₁-C₆-алкіл), -SO₂N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкіл), CN, -(CH₂)₀₋₄-(C₃-C₈-циклоалкіл), -(C₁-C₄-алкіл)-C(O)O-(C₁-C₄-алкіл), -(C₁-C₄-алкіл)-R₃₃, C₁-C₁₀-алкіл, C₂-C₈-алкеніл, -(C₁-C₄-алкіл)-NHC(O)-(C₁-C₄-алкіл), -(CH₂)₀₋₄-C(O)NH₂, (CH₂)₀₋₄-C(O)NH(C₁-C₆-алкіл), -(CH₂)₀₋₄-C(O)N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкіл), нафтил, тетрагідронафтил, дигідронафтил, -(CH₂)₀₋₄-імідазоліл, -(CH₂)₀₋₄-піридиніл, оксазолідинон, 3,4-дигідробензо[e][1,2]оксатііна 2,2-діоксид, піримідиніл, 3,4-дигідро-2H-бензо[e][1,2]тіазин 1,1-діоксид, піридил чи піримідил, алкоксиалкіл, -фенілбензотиєніл, -фенілциклогексил, -фенілциклопентил, -феніл-(C₁-C₆-алкіл)циклопентал, -феніл-(C₁-C₆-алкіл)циклогексил, -фенілоксазоліл, фураніл, тетрагідропіридиніл, де кожна з перерахованих вище груп є незаміщеною чи заміщена 1, 2, 3, 4 чи 5 замісниками, що незалежно представляють собою галоген, C₁-C₈-алкіл, необов'язково заміщений 1 чи 2 групами, що незалежно представляють собою CN чи OH; C₁-C₆-алкокси, галоген-(C₁-C₈-алкіл), галоген-(C₁-C₆-алкокси), -O-(C₁-C₄-алкіл)феніл, де феніл необов'язково заміщений 1 чи 2 атомами галогену, CN, -CHO, C₁-C₆-тіоалкокси, -NHSO₂-(C₁-C₆-алкіл), -N(C₁-C₄-алкіл)SO₂-(C₁-C₄-алкіл), де алкільні групи необов'язково заміщені 1, 2 чи 3 атомами галогену; OH; -SO₂R₃₃; R₃₃; C₂-C₈-алкініл; C₂-C₈-алкеніл; тіоалкоксиалкіл; -SO₂-(C₁-C₁₀-алкіл); -NR₃₁₃₂; -C(O)-NR₃₁₃₂; -OC(O)R₃₃; C₁-C₈-алканоїл; і -(C₁-C₆-алкіл)-C(O)-(C₁-C₆-алкокси);

R_{41a} і R₄₁ незалежно являють собою H, циклогексил, чи феніл C₁-C₆-алкіл, необов'язково заміщений 1 чи 2 групами, що незалежно представляють собою феніл, гідроксил, C₁-C₄-тіоалкокси, C₁-C₆-тіоалкокси-C₁-C₆-алкіл; чи -C₁-C₆-алкіл-SO₂-C₁-C₆-алкіл;

R₄₀, R₄₁ і атом, до якого вони приєднані, утворюють циклоалкільне кільце C₃-C₈, необов'язково заміщене C₁-C₄-алкілом, C₁-C₆-алкокси, галогеном, -CO₂NH₂, CO₂NH(C₁-C₆-алкілом) чи -CO₂N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкілом); тиазоліл, необов'язково заміщений C₁-C₆-алкілом; ізоксазоліл, необов'язково заміщений C₁-C₆-алкілом, чи феніл, необов'язково заміщений 1, 2 чи 3 групами, що незалежно представляють собою чи галоген C₁-C₆-алкіл; і

R₄₂ означає H, C₁-C₆-алкіл, необов'язково заміщений OH; бензил; NHC(O)-(C₁-C₆-алкіл); -NHC(O)феніл, де феніл необов'язково заміщений 1 чи 2 алкільними групами.

Переважні сполуки формули Z1 включають сполуки формули Z2:



чи їх фармацевтично прийнятні солі, де

R₅₁ у кожному випадку незалежно означає C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-алкокси, -NHSO₂-(C₁-C₄-алкіл), де алкільна група необов'язково заміщена 1, 2 чи 3 атомами галогену, -SO₂-NH-(C₁-C₆-алкіл)-NH₂, -SO₂-NH-(C₁-C₆-алкіл)-NH(C₁-C₄-алкіл), -SO₂-NH-(C₁-C₆-алкіл)-N(C₁-C₄-алкіл)(C₁-C₄-алкіл), [1,2,4]триазолідин-3,5-діон, -NHC(O)NH₂, -NHC(O)NH(C₁-C₆-алкіл), -NHC(O)N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкіл), -N(C₁-C₆-алкіл)C(O)NH₂, -N(C₁-C₆-алкіл)C(O)NH(C₁-C₆-алкіл), -N(C₁-C₆-алкіл)C(O)N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкіл), галоген, -CF₃, OH, -SO₂NR₃₁₃₂, -C(O)NR₃₁₃₂, -NR₃₁₃₂, гідрокси-C₁-C₁₀-алкіл, необов'язково заміщений фенолом чи (C₁-C₄-алкіл)фенолом, -O-(C₁-C₄-алкіл)феніл, -NHC(S)NH₂, -NHC(S)NH(C₁-C₆-алкіл), -NHC(S)N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкіл), (C₁-C₄-алкіл)-O-феніл, -C(O)-(C₁-C₆-алкіл), де алкільна група необов'язково заміщена NH₂, N(C₁-C₆-алкілом) чи N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкілом); -O-C₃-C₆-циклоалкіл, оксазол, необов'язково заміщений 1 чи 2 групами, що незалежно представляють собою C₁-C₄-алкіл чи феніл, гідрокси-C₁-C₄-алкокси, аміноалкокси, NH(C₁-C₆-алкіл)алкокси, N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкіл)алкокси,

де R₃₁ і R₃₂ у кожному випадку незалежно обрані з групи, що складається з водню, C₁-C₆-алкілу, гідрокси-C₁-C₆-алкілу, C₁-C₆-галогеналкіла, -(C₁-C₆-алкіл)-C(O)NH₂, -(C₁-C₆-алкіл)-C(O)NH(C₁-C₆-алкілу), -(C₁-C₆-алкіл)-C(O)N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкілу), -(C₁-C₆-алкіл)-NH₂, -(C₁-C₆-алкіл)-NH(C₁-C₆-алкілу), -(C₁-C₆-алкіл)-N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкілу), -(C₁-C₆-алкіл)фенілу, -(C₁-C₆-алкіл)піридила, -C(O)фураніла, (C₁-C₆-алкіл)тетрагідрофурана, де феніл і піридил є незаміщеними чи заміщені 1, 2, 3, 4, чи 5 групами, що незалежно представляють собою C₁-C₆-алкіл, гідроксильну групу, C₁-C₄-алкокси, галоген, чи

де в кожному випадку R₃₁, R₃₂ і атом азоту, до якого вони приєднані, утворюють піролідинільне, піперазинільне, піперидинільне, азепапанільне, піридинільне чи піримідинільне кільце, кожне з яких необов'язково сконденсоване з бензольним, піридиновим чи піримідиновим циклом і кожне з яких необов'язково заміщене C₁-C₆-алкокси, C₁-C₆-алкілом, гідроксильом, гідрокси-C₁-C₆-алкілом, C₁-C₄-алкокси-C₁-C₆-алкілом, -C(O)NH₂ чи -C(O)NH-(C₁-C₆-алкіл)фенілом.

Переважними є сполуки формули Z2, у яких R₄₁ і R₄₂ означають водень.

Іншими переважними сполуками формули Z2 є сполуки, у яких R₃₅ означає феніл, циклогексил, -S-феніл, бензодіоксол, тиєніл, C₃-C₆-алкіл, фураніл, кожний з яких є незаміщеним чи заміщений 1, 2, 3, 4 чи 5 групами, що незалежно представляють

собою C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-алкокси, OH, гідрокси-C₁-C₆-алкіл, галоген, галоген-C₁-C₆-алкіл, галоген-C₁-C₆-алкокси, -O-(C₁-C₆-алкіл)феніл, -CO₂-(C₁-C₆-алкіл), -(C₁-C₄-алкіл)-(C₅-C₆-циклоалкіл).

Іншими переважними сполуками формули Z2 є сполуки, у яких

R₃₅ означає феніл, циклогексил, -S-феніл, бензодіоксол, тиєніл, C₃-C₆-алкіл, фураніл, кожний з яких є незаміщеним чи заміщений 1, 2, 3, 4 чи 5 групами, що незалежно представляють собою C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-алкокси, OH, гідрокси-C₁-C₆-алкіл, галоген, галоген-C₁-C₆-алкіл, галоген-C₁-C₆-алкокси, -O-(C₁-C₆-алкіл)феніл, -CO₂-(C₁-C₆-алкіл), -(C₁-C₄-алкіл)(C₅-C₆-циклоалкіл);

R₄₀ являє собою феніл, -фенілпіридин, біфеніл, -фенілбензотиєніл, -фенілтиєніл, -фенілфураніл, -фенілпіримідиніл, -фенілізоксазоліл, -C(O)-піридил, -(C₁-C₄-алкіл)OC(O)NH-феніл, -(C₁-C₄-алкіл)-O-C(O)N(C₁-C₆-алкіл)феніл, -(C₁-C₄-алкіл)феніл, -(C₁-C₄-алкіл)-SO₂NH₂, -(C₁-C₄-алкіл)-SO₂NH(C₁-C₆-алкіл), -(C₁-C₄-алкіл)-SO₂N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкіл), CN, -(CH₂)₀₋₄-(C₃-C₆-циклоалкіл), -(C₁-C₄-алкіл)-C(O)O-(C₁-C₄-алкіл), -(C₁-C₄-алкіл)-R₃₃, C₁-C₈-алкіл, -(C₁-C₄-алкіл)-NHC(O)-(C₁-C₄-алкіл), -(CH₂)₀₋₄-C(O)NH₂, -(CH₂)₀₋₄-C(O)NH(C₁-C₆-алкіл), -(CH₂)₀₋₄-C(O)N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкіл), тетрагідронафтил, дигідронафтал, де кожна з перерахованих вище груп є незаміщеною чи заміщена 1, 2, 3, 4 чи 5 замісниками, що незалежно представляють собою галоген, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₄-алкокси, галогенні -C₄-алкіл, -O-(C₁-C₄-алкіл)феніл, де феніл необов'язково заміщений 1 чи 2 атомами галогену, -CHO, C₁-C₆-тіоалкокси, -NHSO₂-(C₁-C₄-алкіл), -N(C₁-C₄-алкіл)SO₂-(C₁-C₄-алкіл), де алкільні групи необов'язково заміщені 1, 2 чи 3 атомами галогену; OH, SO₂R₃₃, R₃₃;

R₄₁ означає H, циклогексил, чи феніл C₁-C₆-алкіл, необов'язково заміщений 1 чи 2 групами, що представляють собою феніл, чи гідроксил C₁-C₄-тіоалкокси; і

R₄₂ означає чи водень -CH₂CN.

Більш переважні сполуки формули Z2 включають сполуки, у яких

R₃₅ означає феніл, C₃-C₆-циклоалкіл, -S-феніл, бензодіоксол, тиєніл, C₃-C₆-алкіл, фураніл, кожний з яких є незаміщеним чи заміщений 1, 2, 3, 4 чи 5 групами, що незалежно представляють собою C₁-C₄-алкіл, C₁-C₆-алкокси, OH, гідрокси-C₁-C₆-алкіл, галоген, CF₃, OCF₃, -O-бензил, -CO₂-(C₁-C₆-алкіл), -(C₁-C₄-алкіл)-(C₅-C₆-циклоалкіл);

R₄₀ являє собою феніл, -фенілпіридин, біфеніл, -фенілбензотиєніл, -фенілтиєніл, -фенілфураніл, -фенілпіримідиніл, -фенілізоксазоліл, -C(O)-піридил, -(C₁-C₆-алкіл)-O-C(O)NH-феніл, -(C₁-C₄-алкіл)OC(O)N(C₁-C₆-алкіл)феніл, -(C₁-C₆-алкіл)феніл, -(C₁-C₄-алкіл)-SO₂NH₂, -(C₁-C₄-алкіл)-SO₂NH(C₁-C₆-алкіл), -(C₁-C₄-алкіл)-SO₂N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкіл), CN, -(C₁-C₄-алкіл)-(C₃-C₆-циклоалкіл), -(C₁-C₄-алкіл)-C(O)O-(C₁-C₆-алкіл), -(C₁-C₄-алкіл)-R₃₃, C₁-C₈-алкіл, -(C₁-C₄-алкіл)-NHC(O)-(C₁-C₄-алкіл), C(O)NH₂, де кожний з перерахованих вище циклів є незаміщеним чи заміщений 1, 2 чи 3 групами, що незалежно представляють собою галоген, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-алкокси, CF₃, -O-(C₁-C₄-алкіл)феніл, де феніл не-

обов'язково заміщений 1 чи 2 атомами галогену, -CHO, -NHSO₂-(C₁-C₆-алкіл), -N(C₁-C₄-алкіл)SO₂-(C₁-C₄-алкіл), де алкіл необов'язково заміщений 1, 2 чи 3 атомами галогену,

R₄₁ означає Н, циклогексил, чи феніл C₁-C₆-алкіл, необов'язково заміщений 1 чи 2 групами, що представляють собою феніл, чи гідроксил C₁-C₆-тіоалкокси; і

R₄₂ є чи воднем -CH₂CN;

R₅₁ у кожному випадку незалежно означає C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-алкокси, -NHSO₂-(C₁-C₄-алкіл), де алкільна група необов'язково заміщена 1, 2 чи 3 атомами галогену, -SO₂-NH-(C₁-C₆-алкіл)-NH₂, -SO₂-NH-(C₁-C₆-алкіл)-NH(C₁-C₄-алкіл), -SO₂-NH-(C₁-C₆-алкіл)-N(C₁-C₄-алкіл)(C₁-C₄-алкіл), [1,2,4]триазолідин-3,5-діон, -NHC(O)NH₂, -NHC(O)NH(C₁-C₆-алкіл), -NHC(O)N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкіл), -N(C₁-C₆-алкіл)C(O)NH₂, -N(C₁-C₆-алкіл)C(O)NH(C₁-C₆-алкіл), -N(C₁-C₆-алкіл)C(O)N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкіл), галоген, -CF₃, OH, -SO₂NR₃₁₃₂, -C(O)NR₃₁₃₂, -NR₃₁₃₂, гідрокси-C₁-C₁₀-алкіл, необов'язково заміщений чи фенілом 2-метилфенілом, -O-(C₁-C₄-алкіл)феніл, -NHC(S)NH₂, -NHC(S)NH(C₁-C₆-алкіл), -NHC(S)N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкіл), (C₁-C₄-алкіл)-О-феніл, -C(O)-(C₁-C₆-алкіл), де алкільна група необов'язково заміщена NH₂, N(C₁-C₆-алкілом) чи N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкілом); -O-C₃-C₆-циклоалкіл, оксазол, необов'язково заміщений 1 чи 2 групами, що незалежно представляють собою C₁-C₄-алкіл чи феніл, гідрокси-C₁-C₄-алкокси, аміноалкокси, NH(C₁-C₆-алкіл)алкокси, N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкіл)алкокси,

де R₃₁ і R₃₂ у кожному випадку незалежно обрані з групи, що складається з водню, C₁-C₆-алкілу, гідрокси-C₁-C₆-алкілу, -(C₁-C₆-алкіл)-C(O)N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкілу), -(C₁-C₆-алкіл)-NH(C₁-C₆-алкілу), -(C₁-C₆-алкіл)-N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкілу), -(C₁-C₆-алкіл)фенілу, -(C₁-C₆-алкіл)піридила, -C(O)фураніла, (C₁-C₆-алкіл)тетрагідрофурана, де фенільна група є незаміщеною чи заміщена 1, 2 чи 3 групами, що незалежно представляють собою C₁-C₆-алкокси чи галоген, де в кожному випадку R₃₁, R₃₂ і атом азоту, до якого вони приєднані, незалежно утворюють піролідиніл, піперазиніл, піперидиніл чи азепаніл, кожний з яких необов'язково сконденсований з бензольним, піридиновим чи піримідиновим кільцем і кожний з яких необов'язково заміщений гідроксилом, C₁-C₆-алкілом, гідрокси-C₁-C₆-алкілом, C₁-C₄-алкокси-C₁-C₆-алкілом, -C(O)NH₂ чи -C(O)NH-бензилом.

Ще більш переважними є сполуки формули Z2, у яких

R₃₅ означає феніл; галогенфеніл, дигалогенфеніл; тригалогенфеніл; тетрагалогенфеніл; пентагалогенфеніл; галоген-бензилоксифеніл; галоген-алкілфеніл; бензилоксифеніл; циклогексил; (C₁-C₄-алкокси)карбонілфеніл; (C₁-C₄-алкокси)феніл; -S-феніл чи бензодиоксол;

R₄₁ являє собою Н, циклогексил, чи феніл C₁-C₆-алкіл, необов'язково заміщений 1 чи 2 групами, що незалежно представляють собою феніл, гідроксил чи C₁-C₄-тіоалкокси; і

R₄₂ є чи воднем -CH₂CN.

Іншими переважними сполуками формули Z2 є

сполуки, у яких

R₃₅ означає 3, 5-дигалогенфеніл;

R₄₀ являє собою феніл, -фенілпіридин, біфеніл, -фенілбензотиеніл, -фенілтиеніл, -фенілфураніл, -фенілпіримідиніл, -фенілізоксазоліл, -(C₁-C₄-алкіл)-O-C(O)NH-феніл, -(C₁-C₄-алкіл)-O-C(O)N(C₁-C₆-алкіл)феніл, -(C₁-C₄-алкіл)-SO₂NH₂, CN, -(C₁-C₄-алкіл)(C₃-C₆-циклоалкіл), -(C₁-C₄-алкіл)-C(O)O-(C₁-C₄-алкіл), -(C₁-C₄-алкіл)-R₃₃ чи C₁-C₈-алкіл, де кожна з перерахованих вище груп є незаміщеною чи заміщена 1, 2 чи 3 замісниками, що незалежно представляють собою галоген, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-алкокси, CF₃, -O-(C₁-C₄-алкіл)феніл, де феніл необов'язково заміщений 1 чи 2 атомами галогену, -CHO чи -NHSO₂-(C₁-C₄-алкіл).

Ще більш переважні сполуки формули Z2, у яких

R₃₅ означає 3,5-дифторфеніл; 3,5-дихлорфеніл; чи 3-хлор-5-фторфеніл; і

R₄₀ являє собою феніл, незаміщений чи заміщений 1, 2 чи 3 групами, що незалежно представляють собою фтор, хлор, бром, йод, метил, етил, метокси, етокси, CF₃ чи -O-бензил, у якому феніл необов'язково заміщений 1 чи 2 групами, що незалежно представляють собою чи галоген -NHSO₂CH₃.

Ще більш переважні сполуки формули Z2, у яких

R₅₁ у кожному випадку незалежно означає C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-алкокси, -NHSO₂CH₃, -SO₂-NH.етил.NH(CH₃), [1,2,4]триазолідин-3,5-діон, -NHC(O)NH₂, -CF₃, OH, -SO₂NR₃₁₃₂, -C(O)NR₃₁₃₂, гідроксиоктил, -CH(OH)-2-метилфеніл, -O-бензил чи NHC(S)NH(CH₃);

де R₃₁ і R₃₂ у кожному випадку незалежно обрані з групи, що складається з водню, C₁-C₆-алкілу, гідрокси-C₁-C₆-алкілу, -(CH₂)-C(O)N(CH₃)₂, -CH₂CH₂N(CH₃)₂, фенетила; -CH₂CH₂-піридила, -C(O)-фураніла, чи у кожному випадку R₃₁, R₃₂ і атом азоту, до якого вони приєднані, незалежно утворюють піролідиніл, піперазиніл, піперидиніл чи азепаніл, кожний з яких необов'язково заміщений гідроксиметильною, гідроксметильною, метоксиметильною групою чи групою -C(O)NH₂.

Ще переважніше сполуки формули Z2, у яких

R₄₀ означає 3-етилфеніл чи 3-метоксифеніл; і

R₄₂ є воднем.

Переважні сполуки формули Z2 включають сполуки, у яких

R₅₁ у кожному випадку незалежно означає C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-алкокси, -C(O)NR₃₁₃₂, -C(O)CH₂NH₂, циклопентилокси, -NHC(O)NH(етил), оксазол, необов'язково заміщений 1 чи 2 групами, що незалежно представляють собою C₁-C₄-алкіл чи феніл, гідроксиетокси, диетиламіноетокси,

де R₃₁ і R₃₂ у кожному випадку незалежно обрані з групи, що складається з водню, C₁-C₆-алкілу, гідрокси-C₁-C₆-алкілу, -CH₂-тетрагідрофурана.

Інші переважні сполуки формули Z2 включають сполуки, у яких R₃₅ означає циклогексил.

Більш переважними є сполуки, у яких

R₄₀ означає чи феніл C₁-C₈-алкіл, кожний з яких є незаміщеним чи заміщений 1, 2, 3, 4 чи 5 групами, що незалежно представляють собою га-

логен, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-алкокси, галоген-(C₁-C₄-алкіл); а

R₄₂ і R₄₁ являють собою водень.

Більш переважні сполуки, у яких

R₄₀ означає феніл, 3-метоксифеніл, 4-метоксифеніл, 3-етоксифеніл, 4-етоксифеніл, 3-трифторметалфеніл, 4-трифторметилфеніл, 2-метилфеніл, 3-металфеніл, 2-етилфеніл, 3-еталфеніл чи C₃-C₆-алкіл; і

R₅₁ у кожному випадку незалежно означає C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-алкокси чи галоген,

де R₃₁ і R₃₂ у кожному випадку незалежно обрані з групи, що складається з водню, C₁-C₆-алкілу, гідрокси-C₁-C₆-алкілу і -(C₁-C₆-алкіл)фенілу, де фенільна група є незаміщеною чи заміщена 1, 2 чи 3 групами, що незалежно представляють собою C₁-C₆-алкокси чи галоген,

де в кожному випадку R₃₁, R₃₂ і атом азоту, до якого вони приєднані, незалежно утворюють піролідініл, піперазиніл, піперидиніл чи азепаніл, кожний з яких необов'язково сконденсований з бензольним, піридиновим чи піримідиновим кільцем і кожний з яких необов'язково заміщений гідроксильом, гідрокси-C₁-C₆-алкілом, C₁-C₄-алкокси-C₁-C₆-алкілом, -C(O)NH₂ чи -C(O)NH-бензилом.

Більш переважні сполуки включають сполуки, у яких

R₃₅ означає 3-галоген-5-бензилоксифеніл; 3-бензилоксифеніл; чи 4-бензилоксифеніл;

R₄₁ являє собою Н, циклогексил, феніл, чи C₁-C₆-алкіл, необов'язково заміщений 1 чи 2 групами, що представляють собою феніл, гідроксил чи C₁-C₄-тіоалкокси; і

R₄₂ є чи воднем -CH₂CN.

Більш переважні сполуки, у яких

R₄₀ являє собою феніл, -фенілпіридин, біфеніл, -(C₁-C₄-алкіл)-О-С(O)NH-феніл, -(C₁-C₄-алкіл)-О-С(O)N(C₁-C₆-алкіл)феніл, -(C₁-C₄-алкіл)-SO₂NH₂, -(C₁-C₄-алкіл)(C₃-C₆-циклоалкіл), -(C₁-C₄-алкіл)-С(O)O(C₁-C₄-алкіл), -(C₁-C₄-алкіл)-R₃₃ чи C₁-C₈-алкіл, де кожна з перерахованих вище груп є незаміщеною чи заміщена 1, 2 чи 3 замісниками, що незалежно представляють собою галоген, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-алкокси, CF₃, -О-бензил, у якому феніл необов'язково заміщений 1 чи 2 атомами галогену, -СНО чи -NHSO₂-(C₁-C₄-алкіл).

Більш переважні сполуки включають сполуки, у яких

R₄₀ означає чи феніл C₁-C₈-алкіл, кожний з яких є незаміщеним чи заміщений 1, 2 чи 3 групами, що незалежно представляють собою галоген, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-алкокси, CF₃, -О-бензил, у якому феніл необов'язково заміщений 1 чи 2 атомами галогену, -СНО чи -NHSO₂-(C₁-C₄-алкіл); і

R₄₁ являє собою чи водень C₁-C₆-алкіл, необов'язково заміщений 1 чи 2 групами, що незалежно представляють собою феніл, чи гідроксил C₁-C₄-тіоалкокси;

R₄₂ є воднем; а

R₅₁ у кожному випадку незалежно означає C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-алкокси, -NHSO₂-(C₁-C₄-алкіл), де алкільна група необов'язково заміщена 1, 2 чи 3 атомами галогену, -SO₂-NH-(C₁-C₆-алкіл)-NH₂, -SO₂-NH-(C₁-C₆-алкіл)-NH(C₁-C₄-алкіл), -SO₂-NH-(C₁-C₆-алкіл)-N(C₁-C₄-алкіл)(C₁-C₄-алкіл), -NHC(O)NH₂, -NHC(O)NH(C₁-C₆-алкіл), -

NHC(O)N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкіл), -N(C₁-C₆-алкіл)C(O)NH₂, -N(C₁-C₆-алкіл)C(O)NH(C₁-C₆-алкіл), -(C₁-C₆-алкіл)C(O)N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкіл), галоген, -CF₃, OH, -SO₂NR₃₁₃₂, -C(O)NR₃₁₃₂, -NR₃₁₃₂, гідрокси-C₁-C₁₀-алкіл, -О-бензил, -NHC(S)NH₂, -NHC(S)NH(C₁-C₆-алкіл), -NHC(S)N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкіл), (C₁-C₄-алкіл)-О-феніл, -C(O)-(C₁-C₆-алкіл), -О-циклопентил, -О-циклогексил, гідрокси-C₁-C₄-алкокси, аміноалкокси, NH(C₁-C₆-алкіл)алкокси, N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкіл)алкокси,

де R₃₁ і R₃₂ у кожному випадку незалежно обрані з групи, що складається з водню, C₁-C₆-алкілу, гідрокси-C₁-C₆-алкілу, -(C₁-C₆-алкіл)-NH(C₁-C₆-алкілу), -(C₁-C₆-алкіл)-N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкілу) і бензила, у якому фенільна група є незаміщеною чи заміщена 1 чи 2 групами, що незалежно представляють собою C₁-C₄-алкокси чи галоген,

де в кожному випадку R₃₁, R₃₂ і атом азоту, до якого вони приєднані, незалежно утворюють піролідініл, піперазиніл чи піперидиніл, кожних з яких необов'язково заміщений гідроксильом, гідрокси-C₁-C₆-алкілом, C₁-C₄-алкокси-C₁-C₆-алкілом, -C(O)NH₂ чи -C(O)NH-бензилом.

Більш переважні сполуки включають сполуки, у яких

R₄₀ означає чи феніл C₁-C₈-алкіл, кожний з яких є незаміщеним чи заміщений 1, 2 чи 3 групами, що незалежно представляють собою галоген, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-алкокси чи CF₃; і

R₅₁ у кожному випадку незалежно означає C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-алкокси, -NHSO₂CH₃, -NHSO₂CF₃, галоген, -CF₃, OH, -SO₂NR₃₁₃₂, -C(O)NR₃₁₃₂, -NR₃₁₃₂, гідрокси-C₁-C₁₀-алкіл, гідрокси-C₁-C₄-алкокси, аміноалкокси, NH(C₁-C₆-алкіл)алкокси, N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкіл)алкокси,

де R₃₁ і R₃₂ у кожному випадку незалежно обрані з групи, що складає з водню, C₁-C₆-алкілу, гідрокси-C₁-C₆-алкілу і бензила, у якому фенільна група є незаміщеною чи заміщена 1 чи 2 групами, що незалежно представляють собою метокси, етоксиди чи галоген, чи

де в кожному випадку R₃₁, R₃₂ і атом азоту, до якого вони приєднані, незалежно утворюють піролідинільне, піперазининільне чи піперидининільне кільце, кожне з яких необов'язково заміщене гідроксильом, гідрокси-C₁-C₆-алкілом, C₁-C₄-алкокси-C₁-C₆-алкілом -C(O)NH₂.

Більш переважні сполуки включають сполуки, у яких

R₃₅ означає 3-фтор-5-бензилоксифеніл чи 3-хлор-5-бензилоксифеніл.

Більш переважні сполуки включають сполуки, у яких

R₃₅ являє собою -S-феніл, бензо[1,3]диоксол, фураніл чи тиеніл;

R₄₁ означає Н, циклогексил, чи феніл C₁-C₆-алкіл, необов'язково заміщений 1 чи 2 групами, що представляють собою феніл, чи гідроксил C₁-C₄-тіоалкокси; і

R₄₂ є чи воднем -CH₂CN.

Більш переважні сполуки включають сполуки, у яких

R₄₀ являє собою феніл, -фенілпіридин, біфеніл, -фенілпіримідиніл, -(C₁-C₄-алкіл)-О-С(O)NH-

феніл, $-(C_1-C_4\text{-алкіл})-O-C(O)N(C_1-C_6\text{-алкіл})\text{феніл}$, $-(C_1-C_4\text{-алкіл})-SO_2NH_2$, $-(C_1-C_4\text{-алкіл})(C_3-C_6\text{-циклоалкіл})$, $-(C_1-C_4\text{-алкіл})-C(O)O-(C_1-C_4\text{-алкіл})$, $-(C_1-C_4\text{-алкіл})-R_{33}$ чи $C_1-C_8\text{-алкіл}$, де кожна з перерахованих вище груп є незаміщеною чи заміщена 1, 2 чи 3 замісниками, що незалежно представляють собою галоген, $C_1-C_4\text{-алкіл}$, $C_1-C_4\text{-алкокси}$, CF_3 , $-O\text{-бензил}$, у якому феніл необов'язково заміщений 1 чи 2 атомами галогену, $-CHO$ чи $-NHSO_2-(C_1-C_4\text{-алкіл})$, $-NHSO_2CF_3$.

Ще переважніші сполуки, у яких

R_{40} означає чи феніл $C_1-C_8\text{-алкіл}$, кожен їх яким є незаміщеним чи заміщений 1, 2 чи 3 групами, що незалежно представляють собою галоген, $C_1-C_4\text{-алкіл}$, $C_1-C_4\text{-алкокси}$, CF_3 , $-O\text{-бензил}$, у якому феніл необов'язково заміщений 1 чи 2 атомами галогену, $-CHO$ чи $-NHSO_2-(C_1-C_4\text{-алкіл})$; і

R_{41} являє собою водень чи $C_1-C_6\text{-алкіл}$, необов'язково заміщений 1 чи 2 групами, що представляють собою феніл, чи гідроксил $C_1-C_6\text{-тіоалкокси}$; і

R_{42} є воднем; а

R_{51} у кожному випадку незалежно означає $C_1-C_6\text{-алкіл}$, $C_1-C_6\text{-алкокси}$, $-NHSO_2-(C_1-C_4\text{-алкіл})$, де алкільна група необов'язково заміщена 1, 2 чи 3 атомами галогену, $-SO_2-NH-(C_1-C_6\text{-алкіл})-NH_2$, $-SO_2-NH-(C_1-C_6\text{-алкіл})-NH(C_1-C_4\text{-алкіл})$, $-SO_2-NH-(C_1-C_6\text{-алкіл})-N(C_1-C_4\text{-алкіл})(C_1-C_4\text{-алкіл})$, $-NHC(O)NH_2$, $-NHC(O)NH(C_1-C_6\text{-алкіл})$, $-NHC(O)N(C_1-C_6\text{-алкіл})(C_1-C_6\text{-алкіл})$, $-N(C_1-C_6\text{-алкіл})C(O)NH_2$, $-N(C_1-C_6\text{-алкіл})C(O)NH(C_1-C_6\text{-алкіл})$, $-N(C_1-C_6\text{-алкіл})C(O)N(C_1-C_6\text{-алкіл})(C_1-C_6\text{-алкіл})$, галоген, $-CF_3$, OH , $-SO_2NR_{3132}$, $-C(O)NR_{3132}$, $-NR_{3132}$, гідрокси- $C_1-C_{10}\text{-алкіл}$, $-O\text{-бензил}$, $-NHC(S)NH_2$, $-NHC(S)NH(C_1-C_6\text{-алкіл})$, $-NHC(S)N(C_1-C_6\text{-алкіл})(C_1-C_6\text{-алкіл})$, $(C_1-C_4\text{-алкіл})-O\text{-феніл}$, $-C(O)-(C_1-C_6\text{-алкіл})$, $-O\text{-циклопентил}$, $-O\text{-циклогексил}$, гідрокси- $C_1-C_4\text{-алкокси}$, аміноалкокси, $NH(C_1-C_6\text{-алкіл})\text{алкокси}$, $N(C_1-C_6\text{-алкіл})(C_1-C_6\text{-алкіл})\text{алкокси}$,

де R_{31} і R_{32} у кожному випадку незалежно обрані з групи, що складається з водню, $C_1-C_6\text{-алкілу}$, гідрокси- $C_1-C_6\text{-алкілу}$, $-(C_1-C_6\text{-алкіл})-NH(C_1-C_6\text{-алкілу})$, $-(C_1-C_6\text{-алкіл})-N(C_1-C_6\text{-алкіл})(C_1-C_6\text{-алкілу})$ і бензила, у якому фенільна група є незаміщеною чи заміщена 1 чи 2 групами, що незалежно представляють собою $C_1-C_4\text{-алкокси}$ чи галоген,

де в кожному випадку R_{31} , R_{32} і атом азоту, до якого вони приєднані, незалежно утворюють піролідиніл, піперазиніл чи піперидиніл, кожний з яких необов'язково заміщений гідроксильною, гідрокси- $C_1-C_6\text{-алкілом}$, $C_1-C_4\text{-алкокси-}C_1-C_6\text{-алкілом}$, $-C(O)NH_2$ чи $-C(O)NH\text{-бензилом}$.

Ще більш переважні сполуки, у яких

R_{40} означає чи феніл $C_1-C_8\text{-алкіл}$, кожен їх яким є незаміщеним чи заміщений 1, 2 чи 3 групами, що незалежно представляють собою галоген, $C_1-C_4\text{-алкіл}$, $C_1-C_4\text{-алкокси}$ чи CF_3 ; і

R_{51} у кожному випадку незалежно означає $C_1-C_6\text{-алкіл}$, $C_1-C_6\text{-алкокси}$, $-NHSO_2CH_3$, $-NHSO_2CF_3$, галоген, $-CF_3$, OH , $-SO_2NR_{3132}$, $-C(O)NR_{3132}$, $-NR_{3132}$, гідрокси- $C_1-C_{10}\text{-алкіл}$, гідрокси- $C_1-C_4\text{-алкокси}$, аміноалкокси, $NH(C_1-C_6\text{-алкіл})\text{алкокси}$, $N(C_1-C_6\text{-алкіл})(C_1-C_6\text{-алкіл})\text{алкокси}$,

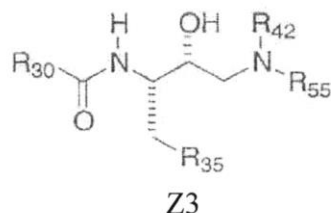
де R_{31} і R_{32} у кожному випадку незалежно об-

рані з групи, що складається з водню, $C_1-C_6\text{-алкілу}$, гідрокси- $C_1-C_6\text{-алкілу}$ і бензила, у якому фенільна група є незаміщеною чи заміщена 1 чи 2 групами, що незалежно представляють собою метокси, етокси чи галоген, чи

де в кожному випадку R_{31} , R_{32} і атом азоту, до якого вони приєднані, незалежно утворюють піролідинільне, піперазинільне чи піперидинільне кільце, кожне з яких необов'язково заміщене гідроксильною, гідрокси- $C_1-C_6\text{-алкілом}$, $C_1-C_4\text{-алкокси-}C_1-C_6\text{-алкілом}$ чи $-C(O)NH_2$.

Особливо переважними є сполуки Формули X, у яких R_1 означає 3,5-дифторфеніл.

Відповідно до іншого конкретного аспекту Формули X винахід представляє сполуки формули Z3:



чи їх фармацевтично прийнятні солі, де

R_{30} обраний із групи, що складається з фенілу, піразолопіримідиніла, оксазабензоазуленіла, ізоксазоліла, триазолопіридиніла, піролідіноніла, тетрагідротіазафлуореніла, піридила, піперидиніла, дигідроциклопентахінолініла, фурила, нафтотиєніла, фталазиноніла, тіадиазоліла, тиєнопіримідиніла, оксадіазаціклопентафтаєніла, дигідробензодіоксепініла, хроманоніла, хроменоніла, оксазолініла, пуриніла, оксазоліла, тіазоліла, піридазиноніла, тіазоліла, піраніла, дигідропіранопіридиніла, діазепаніла, циклопропіла, дигідронафтоїзоксазоліла, бензоіндазола, дигідроциклопентахроменоніла, імідазопіразоліла, тетрагідроциклопентахроменоніла, дигідрохіноліноніла, піридила, ізохроманіла, хіназоліноніла, піразолопіридиніла, дигідробензотіофена діоксида, дигідрофуробензоїзоксазоліла, дигідропіримідиніноніла, тиєнопіразоліла, оксазоліла, тетрагідроциклопентапіразоліла, дигідронафталеноніла, дигідробензофураноніла, дигідроциклопентатиєніла, тетрагідроциклопентапіразоліла, тетрагідропіразолоазепініла, індазоліла, тетрагідроциклопентаізоксазоліла, тетрагідроіндолоніла, піролідиніла, тиєнопіридиніла, діоксидигідробензоізотіазолоніла, триазолопіримідиніла, тиєніла, дигідротиєнопіримідиноніла і бензоксадіазоліла, де кожна з перерахованих вище груп є незаміщеною чи заміщена 1, 2, 3, 4 чи 5 замісниками, незалежно обраними з групи, що складається з

$C_1-C_{10}\text{-алкілу}$, необов'язково заміщеного фенілом, гідроксильною, гідрокси- $C_1-C_{10}\text{-алкілу}$, необов'язково заміщеного чи фенілом $(C_1-C_4\text{-алкіл})\text{фенілом}$, $C_1-C_6\text{-алкокси}$, необов'язково заміщеного 1 чи 2 гідроксильними групами, $-C(O)NR_{3132}$, $-NR_{3132}-SO_2-(C_1-C_6\text{-алкіл})$, де алкільна група необов'язково заміщена 1, 2 чи 3 групами R_{33} , $-SO_2-NH(C_1-C_6\text{-алкіл})$, де алкільна група необов'язково заміщена 1 чи 2 групами R_{33} , $-SO_2-N(C_1-C_6\text{-алкіл})(C_1-C_6\text{-алкіл})$, де кожна алкільна група необов'язково заміщена 1 чи 2 групами R_{33} ,

SO₂-NH(C₁-C₆-алкіл)фенілу, де феніл необов'язково заміщений 1 чи 2 групами, що незалежно представляють собою C₁-C₄-алкокси чи галоген, -O-(C₁-C₆-алкіл)-фенілу, -(C₁-C₆-алкіл)-O-фенілу, -(C₁-C₆-алкіл)-O-(C₁-C₆-алкіл)фенілу, триазолідин-3,5-діона, галогену, -NHC(O)NH₂, -N(C₁-C₆-алкіл)C(O)NH₂, -N(C₁-C₆-алкіл)C(O)NH(C₁-C₆-алкілу), -N(C₁-C₆-алкіл)C(O)N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкілу), -(C₁-C₆-алкіл)тиєніла, -(C₁-C₆-алкіл)фураніла, -S-(C₁-C₆-алкіл)фенілу, -SO₂NR₃₁₃₂, -C(O)-NR₃₁₃₂, -NR₃₁₃₂, дитіана, -NHC(S)NH₂, -NHC(S)NH(C₁-C₆-алкілу), -NHC(S)N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкілу), -CO₂(C₁-C₆-алкіли), тетрагідропірана, фенілу, необов'язково заміщеного 1 чи 2 групами, що незалежно представляють собою F, Cl чи Br, піридину, -C₂-C₄-алкінілфеніла, -O-C₃-C₆-циклоалкіла, -O-(C₁-C₆-алкіл)-R₃₃, бензо[1,2,5]оксадіазола, -C(O)(C₁-C₆-алкілу), де алкільна група необов'язково заміщена NH₂, N(C₁-C₆-алкілом) чи N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкілом); -C(O)NH-фенілу, -C(O)N(C₁-C₆-алкіл)фенілу, 4,4-диметил-4,5-дигідрооксазола, -(C₁-C₆-алкіл)-S-піридину, -(C₁-C₆-алкіл)-SO₂-піридину, -(C₁-C₆-тіоалкокси)піридину, де

R₃₁ і R₃₂ у кожному випадку незалежно обрані з групи, що складається з водню, C₁-C₆-алкілу, гідрокси-(C₁-C₆-алкілу), C₁-C₆-галогеналкіла, -(C₁-C₆-алкіл)-C(O)NH₂, -(C₁-C₆-алкіл)-C(O)N(C₁-C₆-алкілу), -(C₁-C₆-алкіл)-C(O)N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкілу), -(C₁-C₆-алкіл)-NH₂, -(C₁-C₆-алкіл)-NH(C₁-C₆-алкілу), -(C₁-C₆-алкіл)N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкілу), -(C₁-C₆-алкіл)фенілу, -(C₁-C₆-алкіл)піридила, -C(O)фураніла, (C₁-C₆-алкіл)тетрагідрофурана, де феніл і піридил є незаміщеними чи заміщени 1, 2, 3, 4 чи 5 групами, що незалежно представляють собою C₁-C₄-алкіл, гідроксильну групу, C₁-C₄-алкокси, галоген, чи

R₃₁, R₃₂ і атом азоту, до якого вони приєднані, утворюють 5, 6 чи 7-членний гетероциклічний чи алкіл 6-членний стероарильний цикл, кожний з яких необов'язково сконденсований з бензольним, піридиновим чи піримідиновим кільцем і кожний з яких необов'язково заміщений C₁-C₆-алкокси, гідроксилом, гідрокси-C₁-C₆-алкілом, C₁-C₆-алкокси-C₁-C₆-алкілом, -C(O)NH₂, -C(O)NH-(C₁-C₆-алкіл)фенілом;

R₃₃ у кожному випадку незалежно являє собою H, NH₂, NH(C₁-C₆-алкіл), N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкіл), N(C₁-C₆-алкіл)феніл;

R₃₅ означає феніл, C₃-C₈-циклоалкіл, -S-феніл, бензодіоксол, тиєніл, C₁-C₆-алкіл, фураніл, кожний з яких є незаміщеним чи заміщений 1, 2, 3, 4 чи 5 групами, що незалежно представляють собою C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-алкокси, OH, гідрокси-C₁-C₆-алкіл, галоген, галоген-C₁-C₆-алкіл, галоген-C₁-C₆-алкокси, -O-(C₁-C₆-алкіл)феніл, -CO₂-(C₁-C₆-алкіл), -(C₁-C₄-алкіл)-(C₅-C₆-циклоалкіл);

R₄₂ означає H, C₁-C₆-алкіл, бензил, NHC(O)-(C₁-C₆-алкіл) чи -NHC(O)феніл, де феніл необов'язково заміщений 1 чи 2 алкільними групами,

R₅₅ являє собою циклогексил; циклопентил; азепазон; феніл; піперидиніл; SO₂-феніл; піролідиніл чи 4,5,6,7-тетрагідротіазоло[5,4-с]піридин; кожний з яких необов'язково заміщений -C(O)NH₂, -C(O)NH(C₁-C₆-алкілом), -C(O)N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкілом); C₁-C₆-алкоксикарбоніл; -O-(C₁-C₆-алкіл)-

C(O)NR₃₁₃₂; -(C₁-C₆-алкіл)феніл; 4,5-дигідро-2H-піридазин-3-он; C₅-C₆-циклоалкіл, необов'язково заміщений однією групою CN, фенілокси, у якому фенільна група необов'язково заміщена -NHC(O)C₁-C₆-алкілом, -N(C₁-C₆-алкіл)C(O)(C₁-C₆-алкілом),

де R₃₁, R₃₂ і атом азоту, до якого вони приєднані, утворюють піролідинове, піперидинове, піперазинове, морфолінове чи тіаморфолінове кільце, кожне з яких є незаміщеним чи заміщено 1, 2 чи 3 групами, що незалежно представляють собою OH, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-алкокси, -(C₁-C₆-алкіл)імідазол, де імідазол необов'язково заміщений 1 чи 2 груп C₁-C₄-алкіл, чи гідрокси-(C₆-алкіл), у якому алкільна група необов'язково заміщена 1 фенільним кільцем,

чи

R₄₂, R₅₅ і атом азоту, до якого вони приєднані, утворюють тетрагідроізохінолінілну, дигідроізохінолінілну чи ізохінолінілну групу, що необов'язково заміщена 1, 2, 3 чи 4 замісниками, що незалежно представляють собою галоген, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-алкокси, CN, OH і феніл, де феніл необов'язково заміщений галогеном, гідроксилом, C₁-C₄-алкокси і C₁-C₄-алкілом.

Більш переважні сполуки формули Z3 включають сполуки, у яких

R₃₀ обраний із групи, що складається з фенілу, піролідиноніла, піридила, піперидиніла, фурила, циклопропіла і тиєніла, кожний з яких є незаміщеним чи заміщений 1, 2, 3, 4 чи 5 замісниками, незалежно обраними з групи, що складається з C₁-C₁₀-алкілу, гідроксилу, гідрокси-C₁-C₁₀-алкіл-C₁-C₆-алкокси, -NR₃₁-SO₂-(C₁-C₆-алкілу), -SO₂-NH(C₁-C₆-алкілу), -SO₂-N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкілу), галогену, -NHC(O)NH₂, -N(C₁-C₆-алкіл)C(O)NH₂, -N(C₁-C₆-алкіл)C(O)NH(C₁-C₆-алкілу), -N(C₁-C₆-алкіл)C(O)N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкілу), -SO₂NR₃₁₃₂, -C(O)-NR₃₁₃₂, -NR₃₁₃₂, -C₂-C₄-алкінілфеніла, -O-C₃-C₆-циклоалкіла, -O-(C₁-C₆-алкіл)-R₃₃, бензо[1,2,5]оксадіазола, -C(O)(C₁-C₆-алкілу); де R₃₁ і R₃₂ у кожному випадку незалежно обрані з групи, що складається з водню, C₁-C₆-алкілу, гідрокси-(C₁-C₆-алкілу), C₁-C₆-галогеналкіла, -(C₁-C₆-алкіл)-C(O)NH₂, -(C₁-C₆-алкіл)-C(O)NH(C₁-C₆-алкілу), -(C₁-C₆-алкіл)-C(O)N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкілу), -(C₁-C₆-алкіл)-NH₂, -(C₁-C₆-алкіл)-NH(C₁-C₆-алкілу), -(C₁-C₆-алкіл)-N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкілу), бензила і -C(O)фураніла, де феніл і піридил є незаміщеними чи заміщені 1, 2 чи 3 групами, що незалежно представляють собою C₁-C₄-алкіл, гідроксильну групу, C₁-C₄-алкокси

чи галоген, чи

R₃₁, R₃₂ і атом азоту, до якого вони приєднані, утворюють 5, 6 чи 7-членний гетероциклічний алкіл чи 6-членний гетероарильний цикл, кожний з яких необов'язково заміщений C₁-C₆-алкокси, гідроксилом, гідрокси-C₁-C₆-алкілом, C₁-C₄-алкокси-C₁-C₆-алкілом чи -C(O)NH₂;

R₃₅ означає феніл, C₃-C₆-циклоалкіл чи -S-феніл, кожний з яких є незаміщеним чи заміщений 1, 2 чи 3 групами, що незалежно представляють собою C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-алкокси, CF₃, OCF₃, галоген, O-бензин, -CO₂-(C₁-C₆-алкіл), -(C₁-C₄-алкіл)-(C₅-C₆-циклоалкіл);

R₄₂ означає H, C₁-C₆-алкіл, бензин, NHC(O)-

(C₁-C₆-алкіл) чи -NHC(O)феніл, де феніл необов'язково заміщений 1 чи 2 алкільними групами,

R₅₅ являє собою циклогексил; азепанон; феніл; пиперидинил; -SO₂-феніл; пірролидинил; чи 4,5,6,7-тетрагідротіазоно[5,4-с]піридин, де кожен необов'язково заміщений -C(O)NH₂; C₁-C₆-алкоксикарбоніл; -O-(C₁-C₆-алкіл)-C(O)NR₃₁₃₂; -(C₁-C₆-алкіл)феніл; 4,5-дигідро-2Н-піридазин-3-он; циклопентил, необов'язково заміщений однією групою CN, фенілокси, у якому фенільна група необов'язково заміщена -NHC(O)C₁-C₆-алкілом, де

R₃₁, R₃₂ і атом азоту, до якого вони приєднані, утворюють піролідинове, піперидинове, піперазинове чи морфолінове кільце, кожне з яких є незаміщеним чи заміщено 1, 2 чи 3 групами, що незалежно представляють собою OH, -(C₁-C₆-алкіл)імідазол, де імідазол необов'язково заміщений 1 чи 2 C₁-C₆-алкільними групами, чи гідрокси-C₁-C₆-алкіл, у яких алкільна група необов'язково заміщена 1 кільцем,

чи

R₄₂, R₅₅ і атом азоту, до якого вони приєднані, утворюють тетрагідроізохінолініл, що необов'язково заміщений 1, 2, 3 чи 4 групами, що незалежно представляють собою галоген, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-алкокси, CN, OH і феніл, де феніл необов'язково заміщений галогеном, гідроксилом, C₁-C₄-алкокси і C₁-C₄-алкілом. Ще більш переважні сполуки формули Z3 включають сполуки, у яких

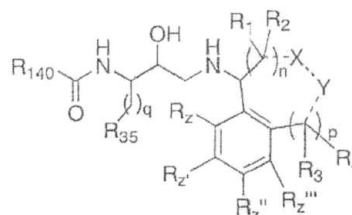
R₃₀ обраний із групи, що складає з фенілу, піридила чи піперидиніла, де кожна з перерахованих вище груп є незаміщеною чи заміщена 1, 2, 3, 4 чи 5 замісниками, незалежно обраними з групи, що складається з C₁-C₁₀-алкілу, гідроксилу, гідрокси-C₁-C₁₀-алкіл-C₁-C₆-алкокси, галогену, -SO₂NR₃₁₃₂, -C(O)-NR₃₁₃₂, -NR₃₁₃₂, -O-C₃-C₆-циклоалкіла, -C(O)(C₁-C₆-алкілу);

де R₃₁ і R₃₂ у кожному випадку незалежно обрані з групи, що складається з водню, C₁-C₆-алкілу, гідрокси-(C₁-C₆-алкілу), -(C₁-C₆-алкіл)-NH₂, -(C₁-C₆-алкіл)-NH(C₁-C₆-алкілу), -(C₁-C₆-алкіл)-N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкілу), бензила і -C(O)фураніла, де фенільна група є незаміщеною чи заміщена 1, 2 чи 3 групами, що незалежно представляють собою C₁-C₄-алкіл, гідроксильну групу, C₁-C₆-алкокси чи галоген, чи

R₃₁, R₃₂ і атом азоту, до якого вони приєднані, утворюють піролідинільне, піперидинільне, морфолінільне, піридинільне чи піримідинільне кільце, кожне з яких необов'язково заміщене C₁-C₆-алкокси, гідроксилом, гідрокси-C₁-C₆-алкілом, C₁-C₆-алкокси-C₁-C₆-алкілом-C(O)NH₂;

R₃₅ означає феніл, циклогексил, циклопентил чи -S-феніл, кожний з яких є незаміщеним чи заміщений 1, 2 чи 3 групами, що незалежно представляють собою C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-алкокси, CF₃, OCF₃, галоген, О-бензил, -CO₂-(C₁-C₆-алкіл), -(C₁-C₄-алкіл)-(C₅-C₆-циклоалкіл).

Згідно з конкретним аспектом, винахід представляє сполуки формули X100:



X100

і їх фармацевтично прийнятні солі, де n, p, і q незалежно означають 0, 1 чи 2; пунктирна лінія означає одинарний чи подвійний зв'язок;

R₁, R₂, R₃ і R₄ незалежно обрані з

водню, галогену, C₁-C₆-алкілу, гідроксилу, C₁-C₆-алкокси, галоген-(C₁-C₆-алкілу), гідрокси-(C₁-C₆-алкілу), галоген-(C₁-C₆-алкокси), тіо-(C₁-C₆-алкілу), (C₁-C₆-алкокси)-(C₁-C₆-алкілу), аміно-(C₁-C₆-алкілу), моно(C₁-C₆-алкіламіно)-(C₁-C₆-алкілу), ди(C₁-C₆-алкіламіно)-(C₁-C₆-алкілу),

-(CH₂)₀₋₄-арила чи -(CH₂)₀₋₄-гетероарила,

C₂-C₆-алкеніла чи C₂-C₆-алкініла, кожний з яких необов'язково заміщений 1, 2 чи 3 замісниками, незалежно обраними з групи, що складається з галогену, гідроксилу, -SH, ціаногрупи, -CF₃, C₁-C₃-алкокси, аміногрупи, моно-(C₁-C₆-алкіламіногрупи і ди-(C₁-C₆-алкіламіногрупи,

-(CH₂)₀₋₄-C₃-C₇-циклоалкіла, де циклоалкіл не-

обов'язково заміщений 1, 2 чи 3 замісниками, незалежно обраними з групи, що складається з галогену, гідроксилу, -SH, ціаногрупи, -CF₃, C₁-C₆-алкокси, аміногрупи, моно(C₁-C₆-алкіламіногрупи і ди(C₁-C₆-алкіламіногрупи;

R₂, R₂', R₂''' і R₂''' незалежно являють собою

C₁-C₆-алкіл, необов'язково заміщений 1, 2 чи 3 замісниками, незалежно обраними з C₁-C₃-алкілу, галогену, -OH, -SH, -C≡N, -CF₃, C₁-C₆-алкокси, аміногрупи, моно(C₁-C₆-алкіламіногрупи і ди(C₁-C₆-алкіламіногрупи,

гідроксил, нітрогрупу, галоген, -CO₂H, ціаногрупу,

-(CH₂)₀₋₄-CO-NR₁₄₂R₁₄₄, де R₁₄₂ і R₁₄₄ незалежно являють собою водень, C₁-C₆-алкіл, гідрокси-(C₁-C₆-алкіл), аміно-(C₁-C₆-алкіл), галогеналкіл, C₃-C₇-циклоалкіл, -(C₁-C₂-алкіл)-(C₃-C₇-циклоалкіл), -(C₁-C₆-алкіл)-O-(C₁-C₃-алкіл), -C₂-C₆-алкеніл, що містить 1 чи 2 подвійні зв'язки, -C₂-C₆-алкініл, що містить 1 чи 2 потрійні зв'язки, -C₁-C₆-алкільний ланцюг, що містить 1 подвійну і 1 потрійний зв'язок, -R₁-арил, де R₁-арил як визначено вище, чи -R₁-гетероарил, де R₁-гетероарил,

-(CH₂)₀₋₄-CO-(C₁-C₁₂-алкіл), -(CH₂)₀₋₄-CO-(C₂-C₁₂-алкеніл), -(CH₂)₀₋₄-CO-(C₂-C₁₂-алкініл), -(CH₂)₀₋₄-CO-(C₃-C₇-циклоалкіл), -(CH₂)₀₋₄-CO-R₁-арил, де R₁-арил як визначено вище, -(CH₂)₀₋₄-CO-R₁-гетероарил, де R₁-гетероарил як визначено вище, -(CH₂)₀₋₄-CO-R₁-гетероцикл, -(CH₂)₀₋₄-CO-R₁₄₆, де R₁₄₆ є гетероциклоалкілом, де гетероциклоалкіл необов'язково заміщений 1-4 групами C₁-C₆-алкіл,

-(CH₂)₀₋₄-CO-O-R₁₄₈, де R₁₄₈ обраний із групи, що складає з C₁-C₆-алкілу, -(CH₂)₀₋₂-(R₁-арила), C₂-C₆-алкеніла, C₂-C₆-алкініла, C₃-C₇-циклоалкіла і -(CH₂)₀₋₂-(R₁-гетероарила),

-(CH₂)₀₋₄-SO₂-NR₁₄₂R₁₄₄, -(CH₂)₀₋₄-SO-(C₁-C₈-

алкіл), $-(CH_2)_{0-4}-SO_2-(C_1-C_{12}-алкіл)$, $-(CH_2)_{0-4}-SO_2-(C_3-C_7-циклоалкіл)$, $-(CH_2)_{0-4}-N(H \text{ чи } R_{148})-CO-O-R_{148}$, $-(CH_2)_{0-4}-N(H \text{ чи } R_{148})-CO-N(R_{148})_2$, $-(CH_2)_{0-4}-N-CS-N(R_{148})_2$, $-(CH_2)_{0-4}-N(H \text{ чи } R_{148})-CO-R_{142}$, $-(CH_2)_{0-4}-NR_{142}R_{144}$, $-(CH_2)_{0-4}-R_{146}$, де R_{N-4} як визначено вище,

$-(CH_2)_{0-4}-O-CO-(C_1-C_6-алкіл)$, $-(CH_2)_{0-4}-O-P(O)-(OR_{150})_2$, де кожен радикал R_{150} незалежно являє собою чи водень C_1-C_4 -алкіл, $-(CH_2)_{0-4}-O-CO-N(R_{148})_2$, $-(CH_2)_{0-4}-O-CS-N(R_{148})_2$, $-(CH_2)_{0-4}-O-(R_{148})_2$, $-(CH_2)_{0-4}-O-(R_{148})_2-CO_2H$, $-(CH_2)_{0-4}-S-(R_{148})_2$, $-(CH_2)_{0-4}-O-галоген-(C_1-C_6)алкіл$, $-(CH_2)_{0-4}-O-(C_1-C_6)алкіл$, $C_3-C_7-циклоалкіл$,

C_2-C_6 -алкеніл чи C_2-C_6 -алкініл, кожний з яких необов'язково заміщений C_1-C_3 -алкілом, галогеном, гідроксилом, $-SH$, ціаногрупою, $-CF_3$, C_1-C_6 -алкокси, аміногрупою, моно(C_1-C_6)алкіламіногрупою і ди(C_1-C_6)алкіламіногрупою, $-(CH_2)_{0-4}-N(H \text{ чи } R_{149})-SO_2-R_{142}$ чи $-(CH_2)_{0-4}-C_3-C_7-циклоалкіл$;

R_{35} означає феніл, циклогексил, $-S$ -феніл, бензодіоксол, тиєніл, C_3-C_6 -алкіл, фураніл, кожний з яких є незаміщеним чи заміщений 1, 2, 3, 4 чи 5 групами, що незалежно представляють собою C_1-C_4 -алкіл, C_1-C_4 алкокси, OH , гідрокси- C_1-C_6 -алкіл, галоген, галоген- C_1-C_6 -алкіл, галоген- C_1-C_6 -алкокси, $-O-(C_1-C_6-алкіл)феніл$, $-CO_2-(C_1-C_6-алкіл)$, чи $-(C_1-C_4-алкіл)-(C_5-C_6-циклоалкіл)$;

X і Y незалежно обрані з O , NR_5 , $S(O)$, CR_1R_2 , SO_2 і S ,

де R_5 є воднем, C_1-C_6 -алкілом, SO_2R_5' , $S(O)R_5'$, де R_5' означає водень, галоген, C_1-C_6 -алкіл, гідроксил, C_1-C_6 -алкокси, галоген- $(C_1-C_6)алкіл$, галоген- $(C_1-C_6)алкокси$, тіо- $(C_1-C_6)алкіл$, $(C_1-C_6)алкокси$ - $(C_1-C_6)-алкіл$, аміно- $(C_1-C_6)алкіл$, моно(C_1-C_6)алкіламіно- $(C_1-C_6)алкіл$, ди(C_1-C_6)алкіламіно- $(C_1-C_6) алкіл$,

$-(CH_2)_{0-4}$ -арила чи $-(CH_2)_{0-4}$ -гетероарила,

C_2-C_6 -алкеніла чи C_2-C_6 -алкініла, кожний з яких необов'язково заміщений 1, 2 чи 3 замісниками, незалежно обраними з групи, що складається з галогену, гідроксилу, $-SH$, ціаногрупи, $-CF_3$, C_1-C_3 -алкокси, аміногрупи, моно(C_1-C_6)алкіламіногрупи і ди(C_1-C_6)алкіламіногрупи,

$-(CH_2)_{0-4}-C_3-C_7-циклоалкіла$, де циклоалкіл необов'язково заміщений 1, 2 чи 3 замісниками, незалежно обраними з групи, що складається з галогену, гідроксилу, $-SH$, ціаногрупи, $-CF_3$, C_1-C_6 -алкокси, аміногрупи, моно(C_1-C_6)алкіламіногрупи і ди(C_1-C_6)алкіламіногрупи;

R_{140} являє собою чи феніл нафтил, кожний з яких необов'язково заміщений 1-5 групами, незалежно обраними з C_1-C_6 -алкілу, необов'язково заміщеного 1, 2 чи 3 замісниками, обраними з групи, що складається з C_1-C_3 -алкілу, галогену, гідроксилу, $-SH$, ціаногрупи, $-CF_3$, C_1-C_6 -алкокси, аміногрупи, моно(C_1-C_6)алкіламіногрупи і ди(C_1-C_6)алкіламіногрупи, гідроксилу, нітрогрупи, галогену, $-CO_2H$, ціаногрупи, $-(CH_2)_{0-4}-CO-NR_{142}R_{144}$, де R_{142} і R_{144} незалежно являють собою водень, C_1-C_6 -алкіл, гідрокси- $(C_1-C_6)алкіл$, аміно- $(C_1-C_6)алкіл$, галогеналкіл, $C_3-C_7-циклоалкіл$, $-(C_1-C_2-алкіл)-(C_3-C_7-циклоалкіл)$, $-(C_1-C_6-алкіл)-O-(C_1-C_3-алкіл)$, $-C_2-C_6$ -алкеніл, що містить 1 чи 2 подвійні зв'язки, $-C_2-C_6$ -алкініл, що містить 1 чи 2 потрійні зв'язки, $-C_1-C_6$ -алкільний ланцюг, що містить 1 подвійний і 1

потрійний зв'язок, $-R_1$ -арил, де R_1 -арил як визначено вище, чи $-R_1$ -гетероарил, де R_1 -гетероарил,

$-(CH_2)_{0-4}-CO-(C_1-C_{12}-алкіли)$, $-(CH_2)_{0-4}-CO-(C_2-C_{12}-алкеніла)$, $(CH_2)_{0-4}-CO-(C_2-C_{12})алкініла$, $-(CH_2)_{0-4}-CO-(C_3-C_7-циклоалкіла)$, $-(CH_2)_{0-4}-CO-R_1$ -арила, де R_1 -арил як визначено вище, $-(CH_2)_{0-4}-CO-R_1$ -гетероарила, де R_1 -гетероарил як визначено вище, $-(CH_2)_{0-4}-CO-R_1$ -гетероцикла, $-(CH_2)_{0-4}-CO-R_{146}$, де R_{146} є гетероциклоалкілом, де гетероциклоалкіл необов'язково заміщений 1-4 групами C_1-C_6 -алкіл,

$-(CH_2)_{0-4}-CO-O-R_{148}$, де R_{148} обраний із групи, що складається з C_1-C_6 -алкілу, $-(CH_2)_{0-2}-(R_1-арила)$, C_2-C_6 -алкеніла, C_2-C_6 -алкініла, C_3-C_7 -циклоалкіла і $-(CH_2)_{0-2}-(R_1\text{-гетероарила})$,

$-(CH_2)_{0-4}-SO_2-NR_{142}R_{144}$, $-(CH_2)_{0-4}-SO-(C_1-C_8-алкіли)$, $-(CH_2)_{0-4}-SO_2-(C_1-C_{12}-алкіли)$, $-(CH_2)_{0-4}-SO_2-(C_3-C_7-циклоалкіла)$, $-(CH_2)_{0-4}-N(H \text{ чи } R_{148})-CO-O-R_{148}$, $-(CH_2)_{0-4}-N(H \text{ чи } R_{148})-CO-N(R_{148})_2$, $-(CH_2)_{0-4}-N-CS-N(R_{148})_2$, $-(CH_2)_{0-4}-N(H \text{ чи } R_{148})-CO-R_{142}$, $-(CH_2)_{0-4}-NR_{142}R_{144}$, $-(CH_2)_{0-4}-R_{146}$, де R_{N-4} як визначено вище,

$-(CH_2)_{0-4}-O-CO-(C_1-C_6-алкіли)$, $-(CH_2)_{0-4}-O-P(O)-(OR_{150})_2$, де кожен замісник R_{150} незалежно являє собою чи водень C_1-C_4 -алкіл, $-(CH_2)_{0-4}-O-CO-N(R_{148})_2$, $-(CH_2)_{0-4}-O-CS-N(R_{148})_2$, $-(CH_2)_{0-4}-O-(R_{148})_2$, $-(CH_2)_{0-4}-O-(R_{148})_2-CO_2H$, $-(CH_2)_{0-4}-S-(R_{148})_2$, $-(CH_2)_{0-4}-O-галоген-(C_1-C_6)алкілу$, $-(CH_2)_{0-4}-O-(C_1-C_6)алкіли$, C_3-C_7 -циклоалкіла,

C_2-C_6 -алкеніла чи C_2-C_6 -алкініла, кожний з яких необов'язково заміщений C_1-C_3 -алкілом, галогеном, гідроксилом, $-SH$, ціаногрупою, $-CF_3$, C_1-C_3 -алкокси, аміногрупою, моно(C_1-C_6)алкіламіногрупою і ди(C_1-C_6)алкіламіногрупою, і $-(CH_2)_{0-4}-N(H \text{ чи } R_{148})-SO_2-R_{142}$ чи $-(CH_2)_{0-4}-C_3-C_7-циклоалкіла$.

Відповідно до найбільше переважного здійснення, q дорівнює 1.

Відповідно до найбільше переважного здійснення, два чи три замісники з R_z , R_z' , R_z'' і R_z''' є воднем, а ті, що залишились один чи два замісники з R_z , R_z' , R_z'' і R_z''' означають гідроксил, нітрогрупу, галоген, CO_2H , ціаногрупу чи C_1-C_6 -алкіл, де алкіл необов'язково заміщений 1, 2 чи 3 групами, незалежно обраними з C_1-C_3 -алкілу, галогену, $-OH$, $-SH$, $-C\equiv N$, $-CF_3$, C_1-C_6 -алкокси, аміногрупи, моно(C_1-C_6)алкіламіногрупи і ди(C_1-C_6)алкіламіногрупи.

Переважні сполуки формули X100 включають сполуки, у яких три замісники з R_z , R_z' , R_z'' і R_z''' є воднем, а четвертий - (C_1-C_6) -алкілом, чи галогеном (C_1-C_6) -алкокси.

Інші переважні сполуки формули X100 включають сполуки, у яких R_{140} являє собою феніл, заміщений 1, 2 чи 3 групами, незалежно обраними з C_1-C_6 -алкілу, необов'язково заміщеного 1, 2 чи 3 групами, незалежно обраними з C_1-C_3 -алкілу, галогену, гідроксилу, $-SH$, ціаногрупи, $-CF_3$, C_1-C_6 -алкокси, аміногрупи, моно(C_1-C_6)алкіламіногрупи і ди(C_1-C_6)алкіламіногрупи, гідроксилу, нітрогрупи, галогену, $-CO_2H$, ціаногрупи, $-(CH_2)_{0-4}-CO-NR_{142}R_{144}$, де R_{142} і R_{144} незалежно являють собою водень, C_1-C_6 -алкіл, гідрокси- $(C_1-C_6)алкіл$, аміно- $(C_1-C_6)алкіл$ і C_3-C_7 -циклоалкіл.

Переважними також є сполуки формули X100, у яких R_{140} означає феніл, заміщений однією з наступних груп: гідроксилом, нітрогрупою, галогеном, -

CO₂H, ціаногрупою чи C₁-C₆-алкілом, де алкіл необов'язково заміщений 1, 2 чи 3 групами, незалежно обраними з C₁-C₃-алкілу, -галогену, гідроксилу, -SH, ціаногрупи, -CF₃, C₁-C₃-алкокси, аміногрупи, моно(C₁-C₆)алкіл аміногрупи і ди(C₁-C₆)алкіламіногрупи; і одним замісником (CH₂)₀₋₄-CO-NR₁₄₂R₁₄₄.

Іншими переважними сполуками формули X100 є сполуки, у яких R₁₄₀ означає феніл, заміщений однією групою -C(O)NR₁₄₂R₁₄₄, а R₁₄₂ і R₁₄₄ незалежно являють собою водень чи C₁-C₆-алкіл.

Більш переважні сполуки формули X100 включають сполуки, у яких R₁₄₂ і R₁₄₄ є однаковими й означають пропіл.

Інші конкретні сполуки формули X100 включають сполуки, у яких R₃₅ є фенілом, заміщеним 1-5 атомами галогену, чи заміщеним 1, 2 чи 3 групами, незалежно обраними з (C₁-C₆)-алкілу, гідроксилу, галогену, (C₁-C₆)алкокси, аміногрупи, моно(C₁-C₆)алкіламіногрупи і ди(C₁-C₆)алкіламіногрупи.

Переважні сполуки формули X100 включають сполуки, у яких R₃₅ є фенілом, заміщеним 2 атомами галогену.

Також переважними є сполуки формули X100, у яких R₃₅ є 3,5-дифторфенілом.

Інші конкретні сполуки формули X100 включають сполуки, у яких R₁₄₀ є фенілом, заміщеним однією з наступних груп: гідроксилу, нітрогрупою, галогеном, -CO₂H, ціаногрупою чи C₁-C₆-алкілом, де алкіл необов'язково заміщений 1, 2 чи 3 групами, незалежно обраними з C₁-C₃-алкілу, -галогену, гідроксилу, -SH, ціаногрупи, -CF₃, C₁-C₃-алкокси, аміногрупи, моно(C₁-C₆)алкіламіногрупи і ди(C₁-C₆)алкіламіногрупи; і одним замісником (CH₂)₀₋₄-CO-NR₁₄₂R₁₄₄.

Конкретними переважними сполуками формули X100 є сполуки, у яких R₁₄₀ означає феніл, заміщений однією групою -C(O)NR₁₄₂R₁₄₄, а R₁₄₂ і R₁₄₄ незалежно являють собою чи водень C₁-C₆-алкіл.

Іншими конкретними переважними сполуками формули X100 є сполуки, у яких R₁₄₂ і R₁₄₄ є однаковими й означають пропіл.

Переважними є сполуки формули X100, у яких n дорівнює 1, а r дорівнює 0.

Також переважними є сполуки формули X100, де всі пунктирні лінії означають одинарні зв'язки.

В інших переважних сполуках формули X100 R₁ є воднем, а X означає SO₂.

В інших переважних сполуках формули X100 Y означає метилен.

Більш переважними є сполуки формули X100, у яких Z' означає 2-пропіл.

Також переважними є сполуки формули X100, у яких R₂ означає водень, гідрокси-(C₁-C₃) алкіл чи (C₁-C₃)алкіл.

Переважною групою R₂ є метил.

Відповідно до іншого конкретного аспекту формули X100, R₁ є воднем; X означає SO₂, а Y - NR₅, чи X означає NR₅, а Y - SO₂, де кожен замісник R₅ являє собою водень, (C₁-C₆) алкіл чи гідрокси-(C₁-C₆)алкіл.

Відповідно до переважного аспекту формули X100,

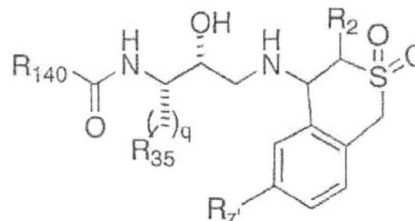
R₁ є воднем;

X означає C(O), а Y - NR₅, чи X означає NR₅, а

Y - C(O), де кожен замісник R₅ являє собою водень, (C₁-C₆)алкіл чи гідрокси-(C₁-C₆)алкіл.

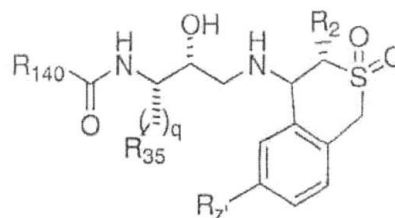
Переважні сполуки формули X100 включають сполуки формули X101

Переважні сполуки формули X100 включають сполуки формули X102



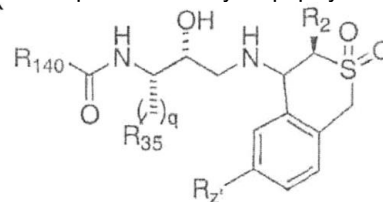
X102.

Переважні сполуки формули X100 включають сполуки формули X103



103.

Інші переважні сполуки формули X104



104.

Переважні сполуки формули X103 включають сполуки, у яких R₂ означає (C₁-C₃)алкіл.

Інші переважні сполуки формули X103 включають сполуки, у яких R₂ означає метил.

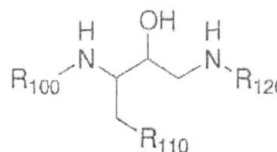
Також переважними є сполуки формули X103, у яких R₂ означає гідрокси-(C₁-C₃)алкіл.

Переважні сполуки формули X104 включають сполуки, у яких R₂ означає (C₁-C₃)алкіл.

Інші переважні сполуки формули X104 включають сполуки, у яких R₂ означає метил.

Також переважні є сполуки формули X104, у яких R₂ означає гідрокси-(C₁-C₃)алкіл.

Згідно з часткою аспекту, винахід представляє сполуки формули Z4:



Z4

де

R₁₀₀ означає Н, С₁-С₈-алкоксикарбоніл, феніл-С₁-С чи 6-алкіл феніл-С₁-С₆-алкоксикарбоніл;

R₁₁₀ являє собою феніл-С₁-С₆-алкіл, тиеніл, -S-феніл, фураніл чи бензодіоксоліл, кожний з яких необов'язково заміщений 1, 2, 3, 4 чи 5 групами, що незалежно представляють собою галоген, С₁-С₄-алкіл, С₁-С₄-алкокси чи феніл-С₁-С₆-алкокси; і

R₁₂₀ означає Н, феніл-С₁-С₆-алкіл, С₃-С₈-циклоалкіл, необов'язково заміщений С₁-С₆-алкілом чи фенілом, С₃-С₈-циклоалкіл-С₁-С₄-алкіл чи С₁-С₆-алкіл, необов'язково заміщений -C(O)NR₁₂₁R₁₂₂, де кожний з перерахованих вище замісників необов'язково заміщений 1, 2 чи 3 групами, що незалежно представляють собою С₁-С₆-алкіл, С₂-С₆-алкеніл, С₂-С₆-алкініл, чи галоген С₁-С₆-алкокси; де R₁₂₁ і R₁₂₂ незалежно означають Н чи С₁-С₆-алкіл.

Більш переважною є сполука формули Z4, у якому R₁₀₀ означає трет-бутоксикарбоніл.

Більш переважна сполука формули Z4 включає сполуку, у якій R₁₁₀ означає феніл-С₁-С₆-алкіл, необов'язково заміщений 1, 2, 3, 4 чи 5 групами, що незалежно представляють собою галоген, С₁-С₄-алкіл, С₁-С₄-алкокси, чи феніл-С₁-С₆-алкокси.

Більш переважною є сполука формули Z4, у якій R₁₁₀ являє собою моногалогенфеніл, дигалогенфеніл чи тригалогенфеніл.

Більш переважна сполука формули Z4 включає сполуку, у якому R₁₁₀ означає тиеніл чи -S-феніл, кожний з яких необов'язково заміщений 1, 2, 3, 4 чи 5 групами, що незалежно представляють собою галоген, С₁-С₆-алкіл, С₁-С₆-алкокси, бензил-окси.

Більш переважною є сполука формули Z4, у якій R₁₁₀ означає фураніл чи бензодіоксоліл, кожний з яких необов'язково заміщений 1, 2, 3, 4 чи 5 групами, що незалежно представляють собою галоген, С₁-С₆-алкіл, С₁-С₆-алкокси, бензил-окси.

Більш переважною є сполука формули Z4, у якій R₁₂₀ являє собою бензил, необов'язково заміщений 1, 2 чи 3 групами, що незалежно представляють собою С₁-С₆-алкіл, С₂-С₆-алкеніл, С₂-С₆-алкініл, чи галоген С₁-С₆-алкокси.

Більш переважною є сполука формули Z4, у якій R₁₂₀ означає циклопропіл, необов'язково заміщений С₁-С₆-алкілом чи фенілом; чи циклопропіл-С₁-С₄-алкіл, де кожний з перерахованих вище замісників необов'язково заміщений 1, 2 чи 3 групами, що незалежно представляють собою С₁-С₆-алкіл, С₂-С₆-алкеніл, С₂-С₆-алкініл, чи галоген С₁-С₆-алкокси.

Ще більш переважною є сполука формули Z4, у якій R₁₁₀ являє собою феніл-С₁-С₆-алкіл, необов'язково заміщений 1, 2, 3, 4 чи 5 групами, що незалежно представляють собою галоген, С₁-С₆-алкіл, С₁-С₆-алкокси чи феніл-С₁-С₆-алкокси; і

R₁₂₀ означає Н чи бензил, необов'язково заміщений 1, 2 чи 3 групами, що незалежно представляють собою С₁-С₆-алкіл, С₂-С₆-алкеніл, С₂-С₆-алкініл, чи галоген С₁-С₆-алкокси.

Іншою, ще більш переважною сполукою формули Z4 є сполука, у якій

R₁₁₀ являє собою феніл-С₁-С₆-алкіл, необов'язково заміщений 1, 2, 3, 4 чи 5 групами, що незалежно представляють собою галоген, С₁-С₄-алкіл, С₁-С₄-алкокси чи феніл-С₁-С₆-алкокси; і

R₁₂₀ означає циклопропіл, необов'язково заміщений С₁-С₆-алкілом чи фенілом; чи циклопропіл-С₁-С₄-алкіл, де кожний з перерахованих вище замісників необов'язково заміщений 1, 2 чи 3 групами, що незалежно представляють собою С₁-С₆-алкіл, С₂-С₆-алкеніл, С₂-С₆-алкініл, чи галоген С₁-С₆-алкокси. Іншою, ще більш переважною сполукою формули Z4 є сполука, у якій

R₁₁₀ означає тиеніл чи -S-феніл, кожний з яких необов'язково заміщений 1, 2, 3, 4 чи 5 групами, що незалежно представляють собою галоген, С₁-С₄-алкіл, С₁-С₄-алкокси, бензил-окси; і

R₁₂₀ являє собою Н чи бензил, необов'язково заміщений 1, 2 чи 3 групами, що незалежно представляють собою С₁-С₆-алкіл, С₂-С₆-алкеніл, С₂-С₆-алкініл, чи галоген С₁-С₆-алкокси.

Іншою, ще більш переважною сполукою формули Z4 є сполука, у якій

R₁₁₀ означає тиеніл чи -S-феніл, кожний з яких необов'язково заміщений 1, 2, 3, 4 чи 5 групами, що незалежно представляють собою галоген, С₁-С₄-алкіл, С₁-С₄-алкокси, бензил-окси; і

R₁₂₀ означає циклопропіл, необов'язково заміщений С₁-С чи 6-алкілом фенілом; чи циклопропіл-С₁-С₄-алкіл, де кожний з перерахованих вище замісників необов'язково заміщений 1, 2 чи 3 групами, що незалежно представляють собою С₁-С₆-алкіл, С₂-С₆-алкеніл, С₂-С₆-алкініл, чи галоген С₁-С₆-алкокси.

Іншою, ще більш переважною сполукою формули Z4 є сполука, у якій

R₁₁₀ означає фураніл чи бензодіоксоліл, кожний з яких необов'язково заміщений 1, 2, 3, 4 чи 5 групами, що незалежно представляють собою галоген, С₁-С₄-алкіл, С₁-С₄-алкокси, бензил-окси.

R₁₂₀ означає Н чи бензил, необов'язково заміщений 1, 2 чи 3 групами, що незалежно представляють собою С₁-С₆-алкіл, С₂-С₆-алкеніл, С₂-С₆-алкініл, чи галоген С₁-С₆-алкокси.

Ще більш переважною сполукою формули Z4 є сполука, у якій

R₁₁₀ означає фураніл чи бензодіоксоліл, кожний з яких необов'язково заміщений 1, 2, 3, 4 чи 5 групами, що незалежно представляють собою галоген, С₁-С₄-алкіл, С₁-С₄-алкокси, бензил-окси;

R₁₂₀ означає циклопропіл, необов'язково заміщений С₁-С₆-алкілом чи фенілом; чи циклопропіл-С₁-С₆-алкіл, де кожний з перерахованих вище замісників необов'язково заміщений 1, 2 чи 3 групами, що незалежно представляють собою С₁-С₆-алкіл, С₂-С₆-алкеніл, С₂-С₆-алкініл, чи галоген С₁-С₆-алкокси.

Іншими ще більш переважними сполуками даного винаходу є сполуки, у яких

R₅₁ у кожному випадку незалежно означає Н, -SO₂NH-пропіл-OH, -SO₂NH-етил-OH, -SO₂NH-етил-OCH₃, -SO₂NH-CH(CH₃)₂-CH₂OH, -SO₂NH-(CH₂CH(OH)CH₃), -SO₂NH-етил-NH(CH₃), -SO₂NH(CH₂CH₂OH)₂, -SO₂NHCH(CH₃)CH₂OH, SO₂N(CH₃)₂, -SO₂NH(CH₂CH(OH)CH₃), -SO₂-піролідін, -SO₂-(2,6-диметилпіперидін), -SO₂-(2-пропілпіперидін), -SO₂-(гідроксипропіл), -C(O)-(2-метоксиметилпіролідін), -C(O)-(2-метилпіролідін), -C(O)-(2,6-диметилпіролідін), -C(O)-(2-гідроксиметилпіролідін), -C(O)N(метил)(етил), -C(O)N(метил)(пропіл), -C(O)N(метил)(бутил), -

C(O)N(пропіл)(бутил), -C(O)N(аліл)(циклопентил),
 C(O)N(аліл)(циклогексил), -C(O)N(метил)(метил), -
 C(O)N(етил)(етил), C(O)N(бутил)(бутил), -
 C(O)N(ізопропіл)(ізопропіл), -
 C(O)N(пропіл)(пропіл), -
 C(O)N(метил)(циклогексил), -
 C(O)N(етил)(циклогексил), -C(O)NH(циклобутил), -
 C(O)N((циклопентил),-C(O)N(CH₃)(циклопентил),-
 C(O)NH(2-метилциклогексил), -C(O)NH(пентил), -
 C(O)N(пентил)(пентил), C(O)NH(ізопентил), -
 C(O)NH(етоксиетил), -C(O)N(CH₃)(метоксиетил),
 C(O)N(пропіл)(метоксиетил),
 C(O)N(метоксиетил)(метоксиетил),
 C(O)N(етоксиетил)(етоксиетил),
 C(O)N(етил)(метоксиетил),
 C(O)N(пропіл)(гідроксиетил),
 C(O)N(гідроксиетил)(етил), етиніл, метал, бром,
 N(CH₃)SO₂(CH₃), N(CH₃)SO₂-тиєніл,
 N(гідроксипропіл)SO₂CH₃, -(CH₂)-SO₂(CH₃) чи -
 C(O)-CH(CH₃)CH₂CH₂CH₃.

Ще більш переважними є сполуки, що містять дві групи R₅₁.

І ще більш переважні сполуки, у яких групи R₅₁ знаходяться в 3- і 5-положеннях фенільного кільця.

Більш переважними сполуками даного винаходу є сполуки, у яких R₅₁ у кожному випадку незалежно обраний із групи, що складається з C₁-C₄-алкілу, -C(O)N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкіл), -C(O)NH₂, -C(O)N(C₂-C₆-алкеніл)(C₃-C₈-циклоалкіла), -C(O)NH(C₃-C₈-циклоалкіла), -C(O)NH(C₁-C₆-алкіл), C(O)-піролідина, необов'язково заміщеного 1 чи 2 групами, що незалежно представляють собою алкоксиалкіл чи гідроксил, галогену, -C(O)N(C₁-C₆-гідроксиалкіл)(C₁-C₆-алкіл), C(O)NH(алкоксиалкіла), -C(O)N(алкоксиалкіл)(алкоксиалкіла), -C(O)N(C₁-C₆-алкіл)(алкоксиалкіла), -C(O)N(C₁-C₆-гідроксиалкіл)(алкіл), -NHSO₂CF₃, -N(C₁-C₆-алкіл)-SO₂-тиєніла, -N(C₁-C₆-гідроксиалкіл)SO₂-(C₁-C₆-алкіл), -NHC(O)C₁-C₄-алкілу, оксазоліла, необов'язково заміщеного 1 чи 2 металними групами, тіазоліла, необов'язково заміщеного 1 чи 2 металними групами, піразоліла, необов'язково заміщеного 1 чи 2 металними групами, імідазоліла, необов'язково заміщеного 1 чи 2 металними групами, ізоксазоліла, необов'язково заміщеного 1 чи 2 металними групами, піримідиніла, необов'язково заміщеного 1 чи 2 металними чи групами атомами галогену, -NHSO₂CH₃, -NHSO₂-імідазоліла, у якому імідазоліне кільце необов'язково заміщено 1 чи 2 металними групами, -N(C₁-C₆-алкіл)SO₂(C₁-C₆-алкілі), -SO₂NH-C₁-C₆-гідроксиалкіла, -SO₂NH-C₁-C₆-алкіл-NH(C₁-C₄-алкілі), -SO₂-піперазиніла, необов'язково заміщеного 1 чи 2 металними групами, -SO₂-піролідина, необов'язково заміщеного 1 чи 2 металними групами, -SO₂-піперидина, необов'язково заміщеного 1 чи 2 групами C₁-C₄-алкіл, -SO₂N(C₁-C₄-гідроксиалкіл)(C₁-C₄-гідроксиалкіла), -SO₂NH₂, -SO₂N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкілу), C₂-C₆-алкініла, -SO₂-(C₁-C₆-гідроксиалкіла), SO₂NH(C₁-C₆-гідроксиалкіла), -SO₂N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-гідроксиалкіла), -(C₁-C₄-алкіл)-SO₂-(C₁-C₄-алкілу) чи C(O)-(C₁-C₁₀-алкілу).

Ще більш переважні сполуки даного винаходу,

у яких R₅₁ у кожному випадку незалежно обраний із групи, що складається з -SO₂NH-пропіл-OH, -SO₂NH-етил-OH, -SO₂NH-етил-OCH₃, -SO₂NH-CH(CH₃)₂-CH₂OH, -SO₂NH-(CH₂CH(OH)CH₃), -SO₂NH-етил-NH(CH₃), -SO₂NH(CH₂CH₂OH)₂, -SO₂NHCH(CH₃)CH₂OH, -SO₂N(CH₃)₂, -SO₂NH(CH₂CH(OH)CH₃), -SO₂-піролідина, -SO₂-(2,6-диметилпіперидина), -SO₂-(2-пропілпіперидина), -SO₂-(гідроксипропіла), -C(O)-(2-метоксиметилпіролідина), -C(O)-(2-метилпіролідина), -C(O)-(2,6-диметилпіролідина), -C(O)-(2-гідроксиметилпіролідина), -C(O)(метил)(етила), -C(O)N(метил)(пропіла), C(O)N(метил)(бутила), -C(O)N(пропіл)(бутила), -C(O)N(аліл)(циклопентила), C(O)N(аліл)(циклогексила), -C(O)(метил)(метила), -C(O)N(етил)(етила), C(O)N(бутил)(бутила), -C(O)N(ізопропіл)(ізопропіла), -C(O)N(пропіл)(пропіла), -C(O)N(метил)(циклогексила), -C(O)N(етил)(циклогексила), -C(O)NH(циклобутила), -C(O)NH(циклопентила), -C(O)N(CH₃)(циклопентила), -C(O)NH(2-метилциклогексила), -C(O)NH(пентила), -C(O)N(пентил)(пентила), -C(O)NH(ізопентила), -C(O)NH(етоксиетила), C(O)N(метоксиетил)(метоксиетила), C(O)N(CH₃)(метоксиетила), -C(O)N(пропіл)(метоксиетила), C(O)N(етоксиетил)(етоксиетил), -C(O)N(етил)(метоксиетила), C(O)N(пропіл)(гідроксиетила), -C(O)N(гідроксиетил)(етила), етиніла, метила, бром, -N(CH₃)SO₂(CH₃), -N(CH₃)SO₂-тиєніла, -N(гідроксипропіл)SO₂CH₃, -(CH₂)-SO₂(CH₃) чи -C(O)-CH(CH₃)CH₂CH₂CH₃.

Більш переважними сполуками даного винаходу є сполуки, у яких

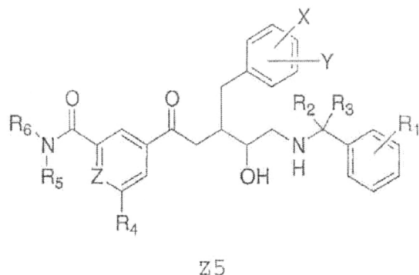
R₃₀ являє собою піридил, незаміщений чи заміщений 1 чи 2 замісниками, незалежно обраними з групи, що складається з C₁-C₄-алкілу, -C(O)N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкілу), -C(O)NH₂, -C(O)N(C₂-C₆-алкеніл)(C₃-C₈-циклоалкіла), -C(O)NH(C₃-C₈-циклоалкіла), -C(O)NH(C₁-C₆-алкілу), S(O)-піролідина, необов'язково заміщеного 1 чи 2 групами, що незалежно представляють собою алкоксиалкіл чи гідроксил, галогену, -C(O)N(C₁-C₆-гідроксиалкіл)(C₁-C₆-алкілу), C(O)NH(алкоксиалкіла), C(O)N(алкоксиалкіл)(алкоксиалкіла), -C(O)N(C₁-C₆-алкіл)(алкоксиалкіла), -C(O)N(C₁-C₆-гідроксиалкіл)(алкіл), -NHSO₂CF₃, -N(C₁-C₆-алкіл)-SO₂-тиєніла, -N(C₁-C₆-гідроксиалкіл)-SO₂-(C₁-C₆-алкілу), -NHC(O)C₁-C₄-алкілу, оксазоліла, необов'язково заміщеного 1 чи 2 металними групами, тіазоліла, необов'язково заміщеного 1 чи 2 металними групами, піразоліла, необов'язково заміщеного 1 чи 2 металними групами, імідазоліла, необов'язково заміщеного 1 чи 2 металними групами, ізоксазоліла, необов'язково заміщеного 1 чи 2 металними групами, піримідиніла, необов'язково заміщеного 1 чи 2 металними чи групами атомами галогену, -NHSO₂CH₃, -NHSO₂-імідазоліла, у якому імідазоліне кільце необов'язково заміщено 1 чи 2 металними групами, -N(C₁-C₆-алкіл)SO₂(C₁-C₆-алкілі), -SO₂NH-C₁-C₆-гідроксиалкіла, SO₂NH-C₁-C₆-алкіл-NH(C₁-C₄-алкілі), -SO₂-піперазиніла, необов'язково заміщеного 1 чи 2 металними гру-

пами, SO₂-піролідина, необов'язково заміщеного 1 чи 2 металними групами, SO₂-піперидина, необов'язково заміщеного 1 чи 2 групами C₁-C₄-алкіл, -SO₂N(C₁-C₄-гідроксиалкіл)(C₁-C₄-гідроксиалкіл), -SO₂NH₂, -SO₂N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-алкіл), C₂-C₆-алкініла, -SO₂-(C₁-C₆-гідроксиалкіл), -SO₂NH(C₁-C₆-гідроксиалкіл), -SO₂N(C₁-C₆-алкіл)(C₁-C₆-гідроксиалкіл), -(C₁-C₄-алкіл)-SO₂-(C₁-C₄-алкіл) чи -C(O)-(C₁-C₁₀-алкіл).

Ще більш переважними є сполуки даного винаходу, у яких

R₃₀ являє собою піридил, незаміщений чи заміщений, щонайменше, однією з наступних груп: -SO₂NH-пропіл-ОН, -SO₂NH-етил-ОН, -SO₂NH-етил-ОCH₃, -SO₂NH-CH(CH₃)₂-CH₂OH, -SO₂NH-(CH₂CH(OH)CH₃), -SO₂NH-етил-NH(CH₃), SO₂NH(CH₂CH₂OH)₂, -SO₂NHCH(CH₃)CH₂OH, -SO₂N(CH₃)₂, -SO₂NH(CH₂CH(OH)CH₃), -SO₂-піролідин, -SO₂-(2,6-диметалпіперидин), -SO₂-(2-пропілпіперидин), -SO₂-(гідроксипропіл), -C(O)-(2-метоксиметалпіролідин), -C(O)-(2-металпіролідин), -C(O)-(2,6-диметалпіролідин), -C(O)-(2-гідроксиметалпіролідин), -C(O)N(метил)(етил), C(O)N(метил)(пропіл), -C(O)N(метил)(бутил), -C(O)N(пропіл)(бутил), C(O)N(аліл)(циклопентал), -C(O)N(аліл)(циклогексил), -C(O)N(метил)(метил), C(O)N(етил)(етил), -C(O)N(бутил)(бутил), -C(O)N(ізопропіл)(ізопропіл), C(O)N(пропіл)(пропіл), -C(O)N(метил)(циклогексил), -C(O)N(етил)(циклогексил), -C(O)NH(циклобутил), -C(O)NH(циклопентил), -C(O)N(CH₃)(циклопентил), -C(O)NH(2-метилциклогексил), -C(O)NH(пентил), -C(O)N(пентил)(пентил), -C(O)NH(ізопентил), -C(O)NH(етоксиетил), -C(O)N(CH₃)(метоксиетил), -C(O)N(пропіл)(метоксиетил), C(O)N(метоксиетил)(метоксиетил), -C(O)N(етоксиетил)(етоксиетил), C(O)N(етил)(метоксиетил), -C(O)N(пропіл)(гідроксиетил), -C(O)N(гідроксиетил)(етил), етиніл, метал, бром, -N(CH₃)SO₂(CH₃), -N(CH₃)SO₂-тиєніл, -N(гідроксипропіл)SO₂CH₃, -(CH₂)₂-SO₂(CH₃) чи -C(O)-CH(CH₃)CH₂CH₂CH₃.

Іншими переважними сполуками формули X є сполуки формули Z5



чи їх фармацевтично прийнятні солі, де R₁ означає C₁-C₄-алкіл, C₂-C₄-алкініл чи CF₃; R₂ і R₃ обидва являють собою водень; чи R₂, R₃ і атом вуглецю, до якого вони приєднані, утворюють циклопропільне кільце;

R₄ означає оксазоліл, необов'язково заміщений метилом, тiazоліл, C₂-C₄-алкініл чи C₁-C₄-алкіл;

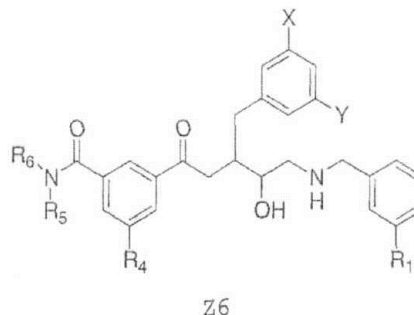
R₅ означає C₁-C₄-алкіл;

R₆ означає C₁-C₄-алкіл;

X і Y незалежно являють собою галоген;

Z означає CH чи N.

Переважними сполуками формули Z5 є сполуки, у яких Z означає CH. У цій групі більш переважні сполуки, у яких обидва замісники R₂ і R₃ означають H. Іншими переважними сполуками винаходу є сполуки формули Z6

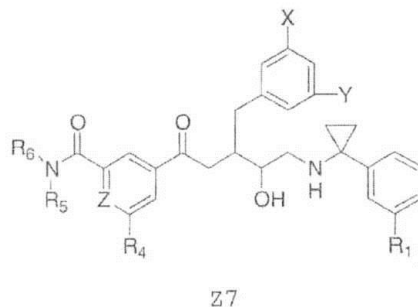


Переважні сполуки формули Z6 включають сполуки, у яких R₁ являє собою етил, етиніл чи CF₃; а R₄ означає 2-оксазоліл, необов'язково заміщений метилом, 2-тіазоліл, етиніл чи метил, позначені надалі як сполуки Z6-1. Переважними сполуками Z6-1 є сполуки, у яких R₅ означає пропіл; і R₆ є пропілом. Більш переважно, щоб R₁ означав етил; R₄ являв собою 2-оксазоліл, необов'язково заміщений метилом; а обидва замісники X і Y були F.

Іншими переважними сполуками Z6-1 є сполуки, у яких R₁ означає етил чи CF₃; а R₄ являє собою 2-тіазоліл. Більш переважно, щоб R₅ означав пропіл; і R₆ був пропілом; чи R₅ означав метил; а R₆ був пропілом чи бутилом; а обидва замісники X і Y являли собою F. Ще більш переважними є сполуки, у яких R₁ означає CF₃; R₅ являє собою пропіл; і R₆ є пропілом.

Іншими переважними сполуками Z6-1 є сполуки, у яких R₁ означає етиніл; а R₄ є етинілом, метилом чи 2-оксазолілом. Більш переважно, щоб R₅ являв собою пропіл; і R₆ був пропілом; а обидва замісники X і Y означали F. Ще більш переважні сполуки, у яких R₄ означає етиніл чи метил.

Іншими переважними сполуками винаходу є сполуки формули Z7

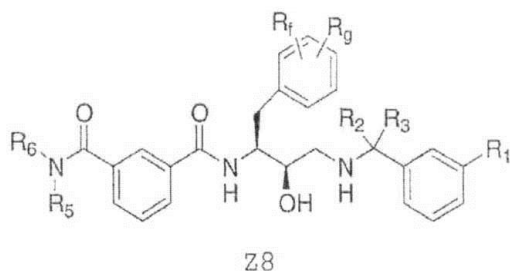


Переважними є сполуки формули Z7, у яких R₁ означає етил чи етиніл; R₄ є металом чи 2-оксазолілом, позначені надалі як сполуки Z7-1.

Переважні сполуки Z7-1 включають сполуки, у яких обидва замісники R₅ і R₆ означають пропіл; а обидва замісники X і Y є F. Більш переважно, щоб Z означав N; а R₄ був метилом. Ще більш переважні сполуки Z7-1, у яких Z означає CH; а R₄ є

тилом чи 2-оксазолілом.

Іншими переважними сполуками винаходу є сполуки формули Z8



чи їх фармацевтично придатні солі, де

R₁ означає C₂-C₃-алкіл;

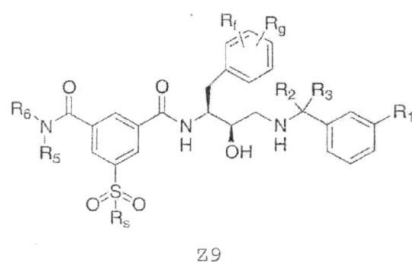
R₂ і R₃ обидва є воднем; чи

R_f і R_g незалежно являють собою галоген;

R₅ означає C₂-C₃-алкілсульфоніл;

R₆ являє собою гідрокси(C₁-C₄.алкіл), переважно, гідроксиетил, чи (C₁-C₄)АКОКСИ(C₁-C₄)алкіл, переважно, метоксиетал.

Іншими переважними сполуками винаходу є сполуки формули Z9 чи їх фармацевтично прийнятні солі, де



R₁ означає C₂-C₃-алкіл;

R₂ і R₃ обидва є воднем; чи

R_f і R_g незалежно являють собою галоген;

R₅ і R₆ незалежно означають C₃-C₄-алкіл; чи

R₅ означає H, а R₆ - C₃-алкіл; чи

R₅, R₆ і атом азоту, до якого вони приєднані, утворюють піролідинільне кільце, необов'язково заміщене метоксиметилом; і

R₅ являє собою C₁-C₂-алкіл, гідрокси-(C₂-C₄)алкіл, N-[гідрокси-(C₂-C₄)алкіл]-N(C₁-C₂)алкіламіногрупу, N-метил-N-(C₄-(1-бутил)алкіл)аміногрупу, -NH(C₁-C₄-гідроксиалкіл), -N(C₁-C₃-гідроксиалкіл)(C₁-C₃-гідроксиалкіл), -N(C₁-C₂-алкіл)(C₁-C₂-алкіл), піролідін-1-іл, необов'язково заміщений гідроксиметилом чи метоксиметилом, C₁-C₂-алкокси-C₂-C₃-алкіл, 1-піперазиніл, -NH₂, -NH(C₂-C₃-алкіл, NH(C₁-C₂-алкіл)) чи C₁-C₄-алкіламіногрупу.

Переважними є сполуки формули Z9, у яких R₅ являє собою N-[гідрокси-(C₄-алкіл)]-N-метиламіногрупу, N-(C₁-C₃-гідроксиалкіл)(C₁-C₃-гідроксиалкіл) чи -NH(C₁-C₄-гідроксиалкіл), що називаються надалі сполуками Z9-1.

Переважні сполуки формули Z9-1 включають сполуки, у яких гідроксиалкіл являє собою 2-гідрокси-1,1-диметилетил; 2-гідроксиетил; 3-гідроксипропіл; 1(R)-2-гідрокси-1-метилетил; 1(S)-2-гідрокси-1-метилітил; 2(R)-2-гідроксипропіл; чи 2(S)-2-гідроксипропіл.

Переважні сполуки формули Z9 включають сполуки, у яких R₅ означає 3-гідроксипропіл чи 4-

гідроксибутил.

Іншими переважними сполуками формули Z9 є сполуки, у якому R₅ являє собою 2(R)-2-метоксиметилпіролідін-1-іл, 2(R)-2-гідроксиметилпіролідін-1-іл, 2(S)-2-гідроксиметилпіролідін-1-іл, піролідін-1-іл чи 1-піперазиніл, що називається далі Z9-1A. Більш переважно, щоб R₅ являв собою 2(R)-2-метоксиметилпіролідін-1-іл, 2(R)-2-гідроксиметилпіролідін-1-іл чи 2(S)-2-гідроксиметилпіролідін-1-іл.

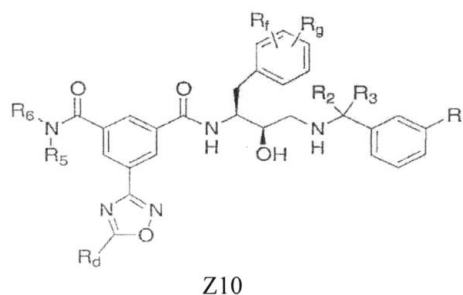
Переважні сполуки формули Z9 включають також сполуки, у яких R₅, R₆ і атом азоту, до якого вони приєднані, утворюють 2(S)-2-метоксиметилпіролідін-1-іл, що називається далі сполуки Z9-2.

Переважними сполуками формули Z9-2 є сполуки, у якому R₅ являє собою -NH(трет-бутил), -N(CH₃)(CH₂CH₃), -N(CH₃)₂ чи 2(S)-2-метоксиметилпіролідін-1-іл, що називається надалі Z9-3.

Переважні сполуки формули Z9 включають сполуки, у яких R₅ являє собою N-[гідрокси-(C₄-алкіл)]-N-метиламіногрупу. Найбільш переважні сполуки, у яких R₅ означає N-(гідрокси-трет-бутил)-N-метиламіногрупу. Під "гідрокси-трет-бутил" мається на увазі група 1-гідрокси-1-метилетил.

Інші переважні сполуки включають сполуки Z9, Z9-1, Z9-1A, Z9-2 і Z9-3, у яких R₁ означає етил чи ізопропіл. Більш переважно, щоб R₁ був етилом.

Іншими переважними сполуками винаходу є сполуки формули Z10



чи їх фармацевтично прийнятні солі, де

R₁ означає C₂-C₃-алкіл;

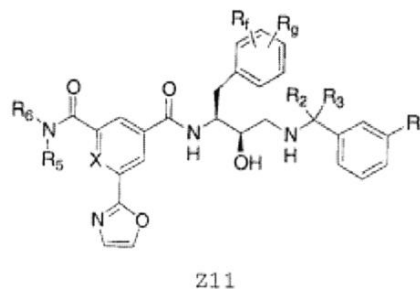
R₂ і R₃ обидва є воднем; чи

R_f і R_g незалежно являють собою галоген;

R₅ і R₆ незалежно означають C₁-C₄-алкіл; і

R_d являє собою C₁-C₂-алкіл (переважно, метил), N-гідрокси-(C₂-C₃)алкіл-(C₁-C₂)алкіламіногрупу чи C₁-C₂-алкіламіногрупу.

Ще одними переважними сполуками винаходу є сполуки формули Z11



чи їх фармацевтично прийнятні солі, де

X означає чи азот CH;

R₁ являє собою C₂-C₃-алкіл, аміногрупу, моно(C₁-C₃)алкіламіногрупу, ді(C₁-C₃)алкіламіногрупу, аміно-(C₁-C₃)алкіл, моно(C₁-C₃)алкіламіно-(C₁-C₂) чи алкіл ді(C₁-C₃)алкіламіно-(C₁-C₂)-алкіл;

R₂ і R₃ обидва є воднем; чи

R_f і R_g обидва є воднем або незалежно являють собою галоген;

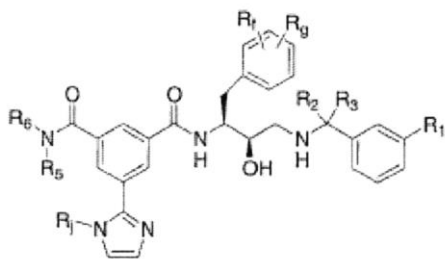
R₅ і R₆ незалежно означають метил чи C₂-C₃-C₄-алкіл, у якому, принаймні, один із замісників R₅ і R₆ не є метилом.

Переважають сполуки формули Z11 включають сполуки, у яких, принаймні, один із замісників R₅ і R₆ є C₃-алкілом, далі називані сполуками Z11-1. Найбільш переважні сполуки формули Z11, у яких кожний із замісників R₅ і R₆ означає пропіл.

Переважними сполуками формул Z11 і Z11-1 є сполуки, у яких X означає CH. Більш переважно, щоб R₁ був ді(C₁-C₂)алкіламіногрупою. Ще більш переважні сполуки, у яких, принаймні, один із замісників R₅ і R₆ є пропілом.

Іншими переважними сполуками Z11-1 є сполуки, у яких X являє собою азот. Більш переважно, щоб жоден із замісників R₅ і R₆ не був метилом. Переважними також є сполуки Z11-1, у яких R₁ означає ді(C₁-C₂)алкіламіно(C₁-C₂)алкіл. Більш переважно, щоб ді(C₁-C₂)алкіламіно(C₁-C₂)алкіл був N,N-диметил-(C₁-C₂)алкілом.

Іншими переважними сполуками винаходу є сполуки формули Z12



Z12

чи їх фармацевтично прийнятні солі, де

R₁ означає C₂-C₃-алкіл;

R₂ і R₃ обидва є воднем; чи

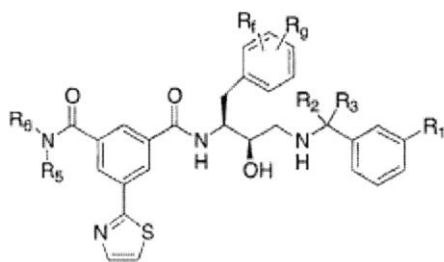
R₂, R₃ і атом вуглецю, до якого вони приєднані, утворюють циклопропільне кільце;

R_f і R_g незалежно являють собою галоген;

R₅ і R₆ незалежно означають C₃-C₄-алкіл (більш переважно, щоб, принаймні, один із замісників R₅ і R₆ був пропілом); і

R_j є чи воднем C₁-C₃-алкоксиметил.

Іншими переважними сполуками винаходу є сполуки формули Z13



Z13

чи їх фармацевтично прийнятні солі, де

R₁ означає C₂-C₄-алкіл, C₂-C₄-алкіл, переважно, етил, ізопропіл, чи трифторметил;

R₂ і R₃ обидва є воднем; чи

R₂ і R₃ разом утворюють 3-членний цикл з атомом вуглецю, до якого вони приєднані;

R_f і R_g незалежно являють собою галоген; і

R₅ і R₆ незалежно означають C₃-C₄-алкіл; чи один із замісників R₅ і R₆ є метилом чи етилом, а інший - C₃ чи C_{4,5}-(бутил)алкілом.

Переважають сполуки формули Z3 включають сполуки, у яких R₁ означає етил, н-пропіл, ізопропіл чи трифторметил, більш переважні етил чи ізопропіл. Ще переважніші сполуки, у яких R₅ і R₆ незалежно означають пропіл чи бутіл. Ще більш переважні сполуки, у яких обидва замісники R₂ і R₃ являють собою водень. Особливо переважними є сполуки, у яких обидва замісники R_f і R_g означають хлор чи фтор.

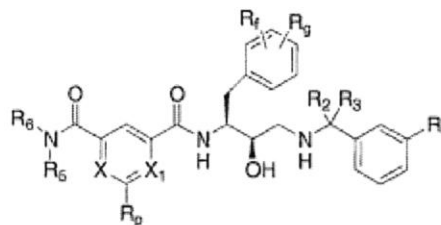
Іншими переважними сполуками формули Z13 є сполуки, у яких R₁ означає етил чи трифторметил, що називаються далі сполуками Z13-1. Серед них переважними будуть сполуки, у яких R₅ означає метил, етил чи пропіл, а R₆ є C₃-C₄-алкілом. Ще більш переважні сполуки, у яких R₆ означає пропіл чи бутіл. І особливо переважні сполуки, у яких R₆ є бутилом, а R₅ - метилом.

Іншими переважними сполуками формули Z13 є сполуки, у яких R₅ означає метил, що називаються далі сполуками Z13-2. Переважні сполуки Z13-2 включають сполуки, у яких обидва замісники R_f і R_g є хлором чи фтором. Більш переважно, щоб обидва замісники R₂ і R₃ минулого воднем.

Іншими переважними сполуками формули Z13 є сполуки, у яких R₂ і R₃ обидва є воднем; а R₁ означає C₂-C₃-алкіл.

Також переважними є сполуки формули Z13, у яких R₅ і R₆ незалежно означають пропіл чи бутіл, далі сполуки Z13-3. Більш переважно, щоб у сполуках формули Z13-3 обидва замісники R₂ і R₃ минулого воднем. Ще переважніше, щоб і R_f і R_g були чи хлором фтором. Ще більш переважні сполуки, у яких R₂ і R₃ разом утворюють 3-членний цикл з атомом вуглецю, до якого вони приєднані.

Іншими переважними сполуками винаходу є сполуки формули Z14



Z14

чи їх фармацевтично прийнятні солі, де один із замісників X чи X₁ є чи азотом N⁺-O⁻, тоді як інший являє собою CH;

R₁ означає C₂-C₄-алкіл, ціаногрупу чи C₁-C₃-алкіл;

R₂ і R₃ обидва є воднем; чи

R₂ і R₃ разом утворюють 3-членний цикл з атомом вуглецю, до якого вони приєднані;

R_f і R_g незалежно являють собою галоген;

R_p є воднем, C_1 - C_2 -алкілом чи оксазолілом; i
 R_5 і R_6 незалежно означають C_3 - C_4 -алкіл.

Переважні сполуки формули Z14 включають сполуки, у яких X є азотом; R_1 означає C_1 - C_2 -алкіл; R_2 і R_3 являють собою водень; а R_p є воднем, C_1 - C_2 -алкілом чи оксазол-2-ілом.

Іншими переважними сполуками формули Z14 є сполуки, у яких X являє собою азот; R_1 означає C_2 - C_3 -алкіл; R_2 і R_3 разом утворюють 3-членний цикл з атомом вуглецю, до якого вони приєднані; а R_p є C_1 - C_2 -алкілом. Ще більш переважні сполуки, у яких X є азотом; а R_1 означає C_2 -алкіл.

Іншими переважними сполуками формули Z14 є сполуки, у яких X являє собою азот; R_1 означає C_1 - C_2 -алкіл, переважно, етил; R_2 і R_3 є воднем; а R_p являє собою водень, C_1 - C_2 -алкіл оксазол-2-іл.

Ще більш переважні сполуки формули Z14, у яких X являє собою азот; R_1 означає C_1 - C_2 -алкіл; R_2 і R_3 є воднем; а R_p являє собою водень, C_1 - C_2 -алкіл, оксазол-2-іл чи ціаногрупу. Більш переважно, щоб R_p був ціаногрупою, метилом чи оксазол-2-ілом. Ще більш переважно, щоб R_p був метилом. В однаковій мірі переважно, щоб R_p був оксазол-2-ілом. В однаковій мірі переважно, щоб R_p був ціаногрупою.

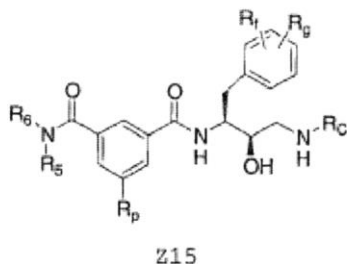
Ще одними переважними сполуками формули Z14 є сполуки, у яких X являє собою азот; R_1 означає C_2 - C_3 -алкіл; R_2 і R_3 разом утворюють 3-членний цикл з атомом вуглецю, до якого вони приєднані; а R_p є C_1 - C_2 -алкілом.

Переважні сполуки формули Z14 включають сполуки, у яких обидва замісники R_f і R_g є хлором чи фтором. Переважні також сполуки формули Z14, у яких R_5 і R_6 незалежно означають пропіл чи бутіл.

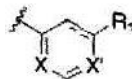
Крім того, ще переважні сполуки формули Z14 включають сполуки, у яких R_f і R_g обидва є чи хлором фтором, а R_5 і R_6 незалежно означають пропіл чи бутіл.

Також переважні сполуки формули Z14 включають сполуки, у яких X являє собою CH , а X_1 означає N . Більш переважно, щоб R_p був ціаногрупою, метилом чи оксазол-2-ілом. Більш переважно, щоб R_f і R_g були хлором чи фтором, а R_5 і R_6 незалежно означали пропіл чи бутіл. В однаковій мірі переважно, щоб сполуки формули Z14 включали сполуки, у яких R_2 і R_3 разом утворюють 3-членний цикл з атомом вуглецю, до якого вони приєднані.

Іншими переважними сполуками винаходу є сполуки формули Z15



чи їх фармацевтично прийнятні солі, де R_c являє собою групу формули



де один із замісників X і X' є азотом, інший являє собою CH , а R_1 означає C_2 - C_4 -алкіл чи $-(C_1-C_2$ -алкіл)- $N(C_1-C_2$ -алкіл)(C_1-C_2 -алкіл);

R_f і R_g незалежно являють собою галоген;

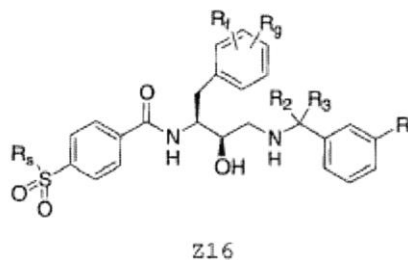
R_p є C_1 - C_2 -алкілом; i

R_5 і R_6 незалежно означають чи водень C_3 - C_4 (втор-бутил)алкіл.

Переважні сполуки формули Z15 включають сполуки, у яких X є азотом; X' являє собою CH ; а R_5 і R_6 незалежно означають пропіл чи бутіл.

Іншими переважними сполуками формули Z15 є сполуки, у яких X являє собою CH ; X' є азотом; а R_5 і R_6 незалежно означають пропіл чи бутіл. Більш переважно, щоб R_1 являв собою $-CH_2N(CH_3)CH_3$ чи етил. Ще більш переважно, щоб R_1 являв собою $-CH_2N(CH_3)CH_3$.

Найбільш переважні сполуки формули Z15 включають сполуки, у яких один із замісників R_5 і R_6 є воднем, а іншої являє собою C_4 -бутил, більш переважно, втор-бутил. Іншими переважними сполуками винаходу є сполуки формули Z16



чи їх фармацевтично прийнятні солі, де R_5 являє собою металаміногрупу, етиламіногрупу, C_3 -алкіламіногрупу, ді(C_3 -алкіл)аміногрупу чи групу формули



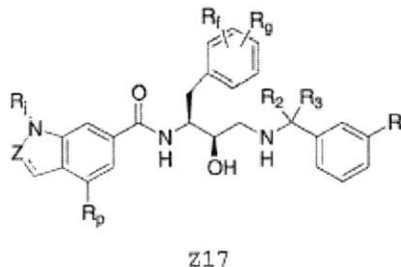
де R_q означає C_1 - C_2 -алкокси- (C_1-C_2) алкіл;

R_1 означає C_2 - C_3 -алкіл;

R_2 і R_3 обидва є воднем; а

R_f і R_g незалежно являють собою галоген.

Іншими переважними сполуками винаходу є сполуки формули Z17



чи їх фармацевтично прийнятні солі, де Z являє собою CH_2 , якщо пунктирна лінія означає одинарний зв'язок, або CH чи атом азоту, якщо пунктирна лінія означає подвійний зв'язок;

R_1 означає C_2 - C_3 -алкіл;

R_2 і R_3 обидва є воднем;

R_f і R_g незалежно являють собою галоген;
 R_p є воднем, ціаногрупою, C_1 - C_3 -алкілом, аміногрупою, N -(C_1 - C_3 -алкілсульфоніл)- N -((C_1 - C_3)алкіл)аміногрупою (добре, якщо $Z=CH$), 2-оксазолілом чи 1-піролілом, необов'язково заміщеним по 2- і 5-положеннях C_1 - C_2 -алкілом; і

R_j означає C_1 - C_5 -алкіл.

Переважають сполуки формули Z17 включають сполуки, у яких R_p є $-N(CH_3)SO_2(C_1-C_2$ -алкілом); а R_1 означає етил.

Інші переважні сполуки формули Z17 включають сполуки, у яких Z означає CH_2 , далі називані сполуками Z17-1. Переважають сполуки Z17-1 включають сполуки, у яких R_p є N -(C_1 - C_2 -алкілсульфоніл)- N -((C_1 - C_2)алкіл)аміногрупою.

Також переважні сполуки формули Z17, у яких R_j означає метил.

Іншими переважними сполуками формули Z17 є сполуки, у яких R_p являє собою N -(метилсульфоніл)- N -((C_1 - C_2)алкіл)аміногрупу; а R_j означає C_3 - C_4 -алкіл, переважно, бутіл, далі називані Z17-2.

Переважають сполуки Z17-2 включають сполуки, у яких R_p є $-N(CH_3)SO_2(C_1-C_2$ -алкілом); а R_1 означає етил.

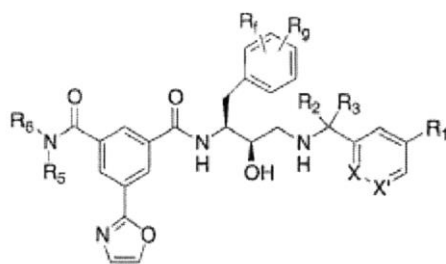
Переважають також сполуки Z17-2, у яких R_p є 2-оксазолілом. Переважно, щоб у таких сполуках Z являв собою CH_2 чи CH . Більш переважно, щоб Z був CH .

Іншими переважними сполуками формули Z17 є сполуки, у яких R_p є ціаногрупою; Z означає CH_2 чи CH ; а R_j являє собою C_3 - C_4 -(бутіл)алкіл. Переважно, щоб Z був CH , а R_j - бутилом.

Крім того, переважними є сполуки формул Z17, Z17-1 і Z17-2, у яких, принаймні, одна з груп R_f і R_g являє собою фтор. Більш переважно, щоб обидва замісники були фтором.

Іншими переважними сполуками формул Z17, Z17-1 і Z17-2 є сполуки, у яких R_2 і R_3 разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, утворюють циклопропільне кільце.

Іншими переважними сполуками винаходу є сполуки формули Z18



Z18

чи їх фармацевтично прийнятні солі, де обидва замісники X і X' означають CH , чи один із замісників X і X' є азотом, а інший - CH ;

R_1 означає C_2 - C_3 -алкініл, $C_{1,2}$ - C_3 -алкіл, аміногрупу, моно-(C_1 - C_3)алкіламіногрупу чи ді-(C_1 - C_3)алкіламіногрупу, аміноалкіл, моно-(C_1 - C_3)алкіламіно-(C_1 - C_2)алкіл, ді-(C_1 - C_3)алкіламіно-(C_1 - C_2)алкіл, CF_3 , C_1 - C_2 -алкокси, галоген, $-NHSO_2(C_1-C_2$ -алкіл);

R_2 і R_3 обидва є воднем; чи

R_2 і R_3 разом утворюють 3-членний цикл з ато-

мом вуглецю, до якого вони приєднані;

R_f і R_g обидва є чи воднем незалежно являють собою галоген;

R_5 і R_6 незалежно означають $C_{1,2,3}$ - C_4 -алкіл; чи один із замісників R_5 і R_6 є метилом чи етилом, а інший являє собою C_3 чи C_4 -алкіл, переважно, бутіл.

Переважають сполуки формули Z18 включають сполуки, у яких R_1 є бромом чи хлором.

Інші переважні сполуки Z18 включають сполуки Z18-1, тобто сполуки формули Z18, у яких R_1 є C_2 - C_3 -алкілом.

Ще одні переважні сполуки Z18 включають сполуки Z18-2, тобто сполуки формули Z18, у яких R_1 є ді-(C_1 - C_3)алкіламіногрупою, а обидва замісники R_f і R_g являють собою хлор чи фтор.

Крім того, переважні сполуки Z18 включають сполуки Z18-3, тобто сполуки формули Z18, у яких R_1 є ді-(C_1 - C_3)алкіламіно-(C_1 - C_2)алкілом, а обидва замісники R_f і R_g являють собою хлор чи фтор.

Більш переважні сполуки формули Z18, у яких X є азотом; обидва замісники R_f і R_g являють собою фтор; R_1 є C_1 - C_3 -алкілом; а R_2 і R_3 разом утворюють 3-членний цикл з атомом вуглецю, до якого вони приєднані.

Переважають сполуки Z18-1 включають сполуки, у яких обидва замісники X і X' є CH ; а обидва замісники R_f і R_g являють собою хлор чи фтор, далі називані сполуками формули Z18-1-A. Більш переважними сполуками Z18-1 і Z18-1-A є сполуки, у яких один із замісників R_5 і R_6 є метилом чи етилом, а іншої являє собою C_3 - чи C_4 -алкіл, переважно, бутіл.

Крім того, інші більш переважні сполуки Z18-1 включають сполуки формули Z18-1-B, тобто сполуки Z18-1, у яких R_5 і R_6 незалежно являють собою C_2 - C_4 -алкіл. Переважають сполуки Z18-1-B включають сполуки, у яких R_5 є C_2 - C_4 -алкілом, а R_6 являє собою етил.

Іншими переважними сполуками Z18-1-A є сполуки, у яких один із замісників R_5 і R_6 є метилом чи етилом, а іншої являє собою C_3 - чи C_4 -алкіл. Більш переважно, щоб один із замісників R_5 і R_6 був метилом. Крім того, переважними є сполуки Z18-1-A, у яких R_5 і R_6 незалежно являють собою пропіл чи бутіл.

Інші переважні сполуки Z18 включають сполуки Z18-4, тобто сполуки формули Z18, у яких R_1 є C_2 -алкінілом. Переважають сполуки Z18-4 включають сполуки, у яких обидва замісники X і X' є CH ; а обидва замісники R_f і R_g являють собою хлор чи фтор.

Інші переважні сполуки Z18-4 включають сполуки, у яких X є азотом, а X' являє собою CH_3 .

Інші переважні сполуки Z18-4 включають сполуки, у яких R_5 і R_6 незалежно являють собою пропіл чи бутіл.

Крім того, переважні сполуки формули Z18 включають такі сполуки, у яких R_1 являє собою CF_3 чи $-NHSO_2CH_3$; обидва замісники R_2 і R_3 означають H ; а R_5 і R_6 незалежно являють собою C_3 - чи C_4 -алкіл, далі - сполуки Z18-5.

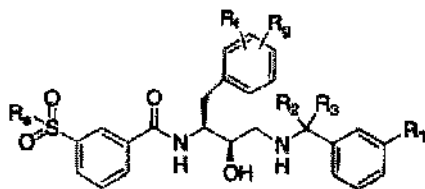
Крім того, переважні сполуки формули Z18 включають сполуки, у яких X означає CH , а X' є азотом, називані далі сполуками Z18-6.

Переважними сполуками кожного зі здійснень

Z18, Z18-1-Б, -1-В, Z18-2, Z18-3, Z18-4, Z18-5, Z18-6 є сполуки, у яких R_2 і R_3 разом утворюють 3-членний цикл з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, далі - Z18-7.

Більш переважні сполуки Z18-7 включають сполуки, у яких, принаймні, один із замісників R_f і R_g являє собою фтор. Більш переважно, щоб обидва замісники R_f і R_g були фтором.

Іншими переважними сполуками винаходу є сполуки формули Z19



Z19

чи їх фармацевтично прийнятні солі, де

R_1 означає C_2 -С чи 3-алкіл C_1 - C_2 -алкокси;

R_2 і R_3 обидва є воднем;

R_f і R_g незалежно являють собою галоген;

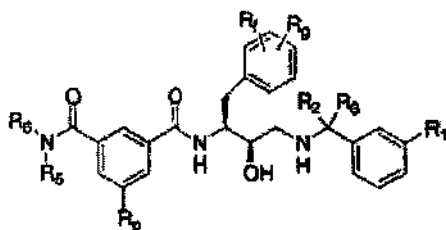
R_5 є C_3 - C_9 -алкілом (переважно, C_3 - C_4 -алкілом), тiazолінілом чи тiazолідинілом.

Переважні сполуки формули Z19 включають сполуки, у яких R_5 є 2-тіазолідинілом чи 2-тіазолінілом, а R_1 означає C_2 - C_3 -алкіл.

Іншими переважними сполуками формули Z19 є сполуки, у яких R_5 являє собою метил, чи пропіл, більш переважно, трет-бутил. Ще більш переважно, щоб, щонайменше, один із замісників R_f і R_g був фтором. І ще більш переважно, щоб, крім того, R_1 був C_2 - C_3 -алкілом.

Інші переважні сполуки формули Z19 включають сполуки, у яких R_5 є C_8 -алкілом. Більш переважно, щоб C_8 -алкіл являв собою $-\text{CH}_2\text{CH}(\text{n-пропіл})(\text{n-пропіл})$. Ще більш переважно, щоб, крім того, R_1 був C_1 - C_2 -алкокси. І ще більш переважно, щоб R_1 означав метокси.

Іншими переважними сполуками винаходу є сполуки формули Z20



Z20

чи їх фармацевтично прийнятні солі, де

R_1 означає C_2 - C_3 -алкіл, CF_3 чи $-\text{NH}(\text{C}_3$ - C_6 -циклоалкіл);

R_2 і R_3 обидва є воднем; чи

R_2 і R_3 разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, утворюють 3-членний цикл;

R_p означає піридил, піперазиніл, аміногрупу, аміно- $(\text{C}_1$ - $\text{C}_{5(3)})$ -алкіл, моно- $(\text{C}_1$ - $\text{C}_2)$ -алкіламіно- $(\text{C}_1$ - $\text{C}_5)$ -алкіл, ди- $(\text{C}_1$ - $\text{C}_2)$ -алкіламіно- $(\text{C}_1$ - $\text{C}_5)$ -алкіл, моно- $(\text{C}_1$ - $\text{C}_3)$ -алкіламіногрупу, ди- $(\text{C}_1$ - $\text{C}_3)$ -алкіламіногрупу, аміно- $(\text{C}_3$ - $\text{C}_4)$ -алкініл, моно- $(\text{C}_1$ - $\text{C}_2)$ -алкіламіно- $(\text{C}_3$ - $\text{C}_4)$ -алкініл, ди- $(\text{C}_1$ - $\text{C}_2)$ -алкіламіно- $(\text{C}_3$ - $\text{C}_5)$ -алкініл, $-\text{N}(\text{C}_1$ - C_2 -алкіл)- $\text{SO}_2(\text{C}_1$ - C_2 -

алкіл), $-\text{NH}-\text{SO}_2(\text{C}_1$ - C_2 -алкіл), $-\text{N}(\text{C}_1$ - C_2 -алкіл)- SO_2 -тиєніл, $-\text{N}(\text{C}_1$ - C_2 -алкіл)- $\text{SO}_2(\text{C}_1$ - C_2 -галогеналкіл), ди- $(\text{C}_1$ - $\text{C}_2)$ -алкіламіно- $(\text{C}_3$ - $\text{C}_4)$ -алкініл, піримідиніл, піразоліл, імідазоліл чи C_2 - C_4 -алкініл;

R_f і R_g незалежно являють собою галоген;

R_5 і R_6 незалежно означають C_3 - C_4 -алкіл.

Переважні сполуки формули Z20 включають сполуки формули Z20-1, тобто сполуки формули Z20, у яких обидва замісники R_5 і R_6 являють собою C_3 -алкіл.

Інші переважні сполуки формули Z20 включають сполуки формули Z20-2, тобто сполуки формули Z20, у яких обидва замісники R_2 і R_3 є воднем.

Ще одні переважні сполуки формули Z20 включають сполуки формули Z20-3, тобто сполуки формули Z20, у яких R_2 і R_3 разом утворюють 3-членний цикл з атомом вуглецю, до якого вони приєднані.

Переважними сполуками Z20-1, -2 і -3 є сполуки, у яких R_p означає 4-піридил, 2-піримідиніл, 4-піразоліл чи 4-імідазоліл, більш переважно, щоб R_p був 4-піридил, далі - сполуки Z20-3A. Іншими переважними сполуками Z20-1, -2 і -3 є сполуки, у яких R_p являє собою диетиламіно- чи диметиламіногрупу, далі - Z20-3B. Крім того, переважними сполуками Z20-1, -2 і -3 є сполуки, у яких R_p означає аміно- чи C_1 - C_6 -алкіламіногрупу, далі - Z20-3C. І ще одними переважними сполуками Z20-1, -2 і -3 є сполуки, у яких R_p означає 1-піперазиніл, далі - Z20-3D. І крім того, переважні сполуки Z20-1, -2 і -3 включають сполуки, у яких R_p являє собою аміно- $(\text{C}_2$ - $\text{C}_4)$ -алкіл, де аміногрупа необов'язково монозаміщена C_1 - C_2 -алкілом, далі - Z20-3E; чи в який R_p являє собою $-\text{N}(\text{CH}_3)-\text{SO}_2\text{CH}_3$, $-\text{NH}-\text{SO}_2\text{CH}_3$, $-\text{N}(\text{CH}_3)-\text{SO}_2$ -тиєніл чи $-\text{N}(\text{CH}_3)-\text{SO}_2\text{CF}_3$, далі - Z20-3F.

Іншими переважними сполуками Z20 є сполуки, у яких R_p являє собою ди- $(\text{C}_1$ - $\text{C}_2)$ -алкіламіно- $(\text{C}_3$ - $\text{C}_5)$ -алкіл, більш переважно, N,N -диметиламіно- $(\text{C}_3$ - $\text{C}_5)$ -алкіл, далі - Z20-3G.

Найбільш переважними сполуками Z20-1, -2 і -3 є сполуки, у яких R_p означає 3-(моно- $(\text{C}_1$ - $\text{C}_2)$ -алкіламіно)пропіл-1-іл, далі - Z20-3H. Іншими найбільш переважними сполуками Z20 є сполуки, у яких R_p означає 3-(моно- $(\text{C}_1$ - $\text{C}_2)$ -алкіламіно)пропіл-1-іл, 3-(ди- $(\text{C}_1$ - $\text{C}_2)$ -алкіламіно)пропіл-1-іл чи 4-(ди- $(\text{C}_1$ - $\text{C}_2)$ -алкіламіно)пропіл-1-іл, далі - Z20-3I.

Іншими переважними сполуками Z20-1, -2 і -3 є сполуки, у яких R_p являє собою ди- $(\text{C}_1$ - $\text{C}_2)$ -алкіламіно- $(\text{C}_3$ - $\text{C}_5)$ -алкіл; а R_5 і R_6 обидва є C_3 -алкілом, далі - Z20-3J.

І ще одними переважними сполуками Z20-1, -2 і -3 є сполуки, у яких R_p являє собою C_2 - C_3 -алкініл, далі - Z20-4. Більш переважно, щоб R_p був C_2 -алкінілом.

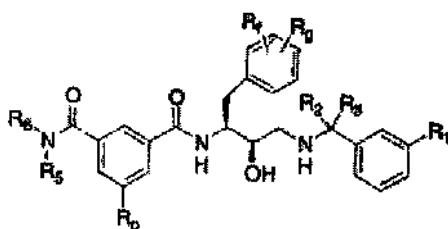
Крім того, переважними є сполуки формул Z20, Z20-1, -2, -3, -3A -3J і Z20-4, якщо R_1 означає $-\text{NH}(\text{C}_3$ - C_6 -циклопропіл), переважно, $-\text{NH}$ -циклопропіл. Більш переважно, щоб, щонайменше, один із замісників R_f і R_g був фтором. Ще більш переважно, щоб обидва замісники були фтором.

Переважними також є сполуки формул Z20, Z20-1, -2, -3, -3A -3J і Z20-4, у яких R_1 означає $-\text{CF}_3$. Більш переважно, щоб, щонайменше, один із

замісників R_f і R_g був фтором. Ще більш переважно, щоб обидва замісники були фтором.

Інші переважні сполуки формул Z20, Z20-1, -2, -3, -3A -3J і Z20-4 включають сполуки, у яких R_1 означає етил чи ізопропіл. Переважно, щоб R_1 був ізопропілом. Більш переважно, щоб R_1 був етилом. Більш переважно, щоб, щонайменше, один із замісників R_f і R_g був фтором. Ще більш переважно, щоб обидва замісники були фтором. І ще більш переважно, щоб замісники R_f і R_g знаходилися в 3 і 5 положеннях фенільного кільця (стосовно положення 1, що є місцем приєднання групи CH_2).

Іншими переважними сполуками винаходу є сполуки формули Z21



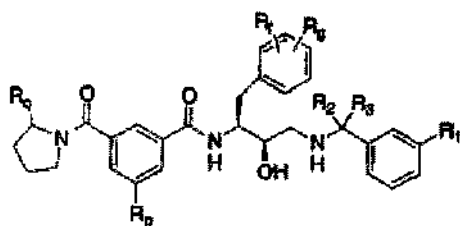
Z21

чи їх фармацевтично прийнятні солі, де R_1 означає C_2 - C_3 -алкіл; R_2 і R_3 обидва є воднем; R_p являє собою C_1 - C_3 -алкіл; R_f і R_g незалежно являють собою галоген; R_5 і R_6 незалежно означають C_3 - C_4 -алкіл; чи один із замісників R_5 і R_6 є метилом, а іншої являє собою C_3 - чи C_4 -алкіл.

Переважні сполуки формули Z21 включають сполуки, у яких один із замісників R_5 і R_6 є метилом, а іншої являє собою бутил, далі - Z21-1.

Інші переважні сполуки формул Z21 і Z21-1 включають сполуки, у яких R_p є метилом.

Іншими переважними сполуками винаходу є сполуки формули Z22



Z22

чи їх фармацевтично прийнятні солі, де R_1 означає C_1 - C_2 -алкіл, C_2 - C_4 -алкіл чи C_3 (ізопропіл)- C_4 -алкіл; R_2 і R_3 обидва є воднем; чи R_2 і R_3 разом утворюють 3-членний цикл з атомом вуглецю, до якого вони приєднані; R_f і R_g незалежно являють собою галоген; R_p являє собою C_1 - C_3 -алкіл чи групу формули R_5SO_2 -, де R_5 означає $R_{51}R_{61}N$ -, а R_{51} і R_{61} незалежно являють собою водень чи групи C_1 - C_4 -алкіл; або групу формули:



де R_1 означає C_1 - C_2 -алкокси-(C_1 - C_2)алкіл; і R_q являє собою C_1 - C_3 -алкокси-(C_1 - C_2)алкіл, C_1 - C_4 -алкіл, -3(O)NH₂ чи H.

Переважні сполуки формули Z22 включають сполуки, у яких R_1 означає C_2 -алкіл; R_2 і R_3 разом утворюють 3-членний цикл з атомом вуглецю, до якого вони приєднані; а R_p являє собою R_5SO_2 -,



де R_5 означає

Інші переважні сполуки формули Z22 включають сполуки, у яких R_1 означає C_1 - C_2 -алкіл; R_2 і R_3 є воднем; а R_p являє собою R_5SO_2 -, де R_5 означає C_3 - C_4 -аміногрупу, переважно, пропіл-, більш переважно, трет-бутиламіногрупу.

Також переважні сполуки формули Z22 включають сполуки, у яких R_1 означає C_1 - C_2 -алкіл; R_2 і R_3 є воднем; R_p являє собою C_1 - C_2 -алкіл; і R_q означає C_3 - C_4 -алкіл, переважно, пропіл чи бутил.

Крім того, інші переважні сполуки формули Z22 включають сполуки, у яких R_1 означає C_1 - C_2 -алкіл; R_2 і R_3 є воднем; R_p являє собою C_1 - C_2 -алкіл; а R_q означає пропокси(C_1 - C_2)алкіл.

Інші переважні сполуки формули Z22 включають сполуки, у яких R_1 означає C_1 - C_2 -алкіл; R_2 і R_3 є воднем; R_p являє собою C_1 - C_2 -алкіл; а R_q означає метокси(C_1 - C_2)алкіл.

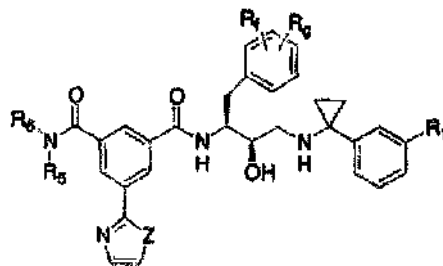
Інші переважні сполуки формули Z22 включають сполуки, у яких R_1 означає C_1 - C_2 -алкіл; R_2 і R_3 разом утворюють 3-членний цикл з атомом вуглецю, до якого вони приєднані; R_p являє собою C_1 - C_2 -алкіл; і R_q означає C_1 - C_2 -алкіл.

Інші переважні сполуки формули Z22 включають сполуки, у яких R_1 означає C_1 - C_2 -алкіл; R_2 і R_3 є воднем; R_p являє собою C_1 - C_2 -алкіл; а R_q означає C_1 - C_2 -алкіл.

Найбільш переважними є сполуки формули Z22, у яких R_1 являє собою ізопропіл.

Інші переважні сполуки формули Z22 включають сполуки, у яких R_q означає (R)-метоксиметил, метил, пропіл, (S)-пропіл, (R)-пропіл, бутил, (R)-бутил, (S)-бутил, (R)-2-метоксиметил чи (R)-2-метоксиетил.

Іншими переважними сполуками винаходу є сполуки формули Z23



Z23

чи їх фармацевтично прийнятні солі, де Z означає кисень, чи азот сірку;

R_1 являє собою хлор, бром, водень чи C_1 - C_2 -алкіл;

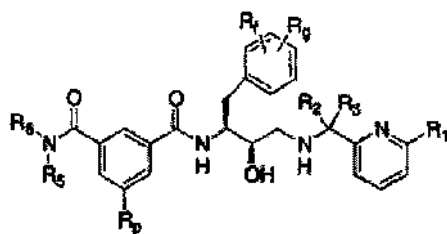
R_f і R_g незалежно означають галоген; і
 R_5 і R_6 незалежно означають C_3 - C_4 -алкіл; чи
 один із замісників R_5 і R_6 є метилом, а інший
 являє собою C_3 - чи C_4 -алкіл.

Переважаючі сполуки формули Z23 включають
 сполуки, у яких Z є азотом; а R_1 являє собою C_1 -
 C_3 -алкіл.

Переважними сполуками формули Z23 є спо-
 луки, у яких R_1 являє собою бром, а Z є киснем,
 далі - Z23-1. Іншими переважними сполуками фо-
 рмули Z23 є сполуки, у яких Z є азотом, далі - Z23-
 2. Переважними сполуками формули Z23 також є
 сполуки, у яких Z є сіркою, далі - Z23-3.

Особливо переважними сполуками формул
 Z23, Z23-1, Z23-2 і Z23-3 є сполуки, у яких один із
 замісників R_5 і R_6 є метилом, а інший являє собою
 бутіл. В однаковій мірі переважні сполуки, у яких,
 щонайменше, один із замісників R_5 і R_6 є пропілом.
 Ще більш переважно, щоб R_1 являв собою C_1 - C_3 -
 алкіл. Також R_1 може бути етилом.

Іншими переважними сполуками винаходу є
 сполуки формули Z24



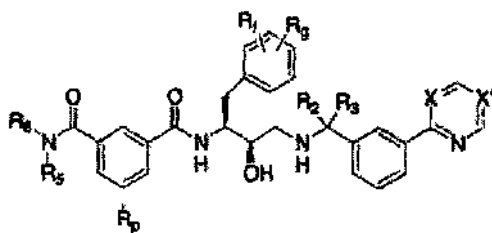
Z24

чи їх фармацевтично прийнятні солі, де
 R_1 означає C_1 - C_2 - C_3 -алкіл;
 R_2 і R_3 обидва є воднем; чи
 R_p являє собою C_1 - C_2 -алкіл;
 R_f і R_g обидва є воднем чи незалежно являють
 собою галоген; і

R_5 і R_6 незалежно означають C_3 - C_4 -алкіл.

Переважаючі сполуки формули Z24 включають
 сполуки, у яких R_1 є етилом. Більш переважно,
 щоб, крім того, R_p був метилом. Ще більш перева-
 жно, щоб обидва замісники R_f і R_g були галогеном.

Іншими переважними сполуками винаходу є
 сполуки формули Z25



Z25

чи їх фармацевтично прийнятні солі, де
 один із замісників X і X' є азотом, а інший яв-
 ляє собою CH чи CR_1 ;

R_1 означає C_1 - C_2 - C_3 -алкіл;

R_2 і R_3 обидва є воднем; чи

R_2 і R_3 і атом вуглецю, до якого вони приєдна-
 ні, утворюють циклопропільне кільце;

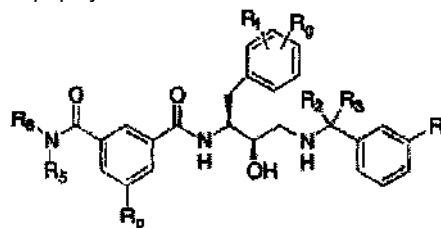
R_p являє собою C_1 - C_2 -алкіл;

R_f і R_g незалежно являють собою галоген; і

R_5 і R_6 незалежно означають C_3 - C_4 -алкіл.

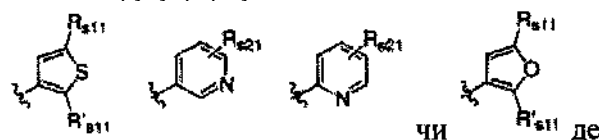
Переважаючі сполуки формули Z25 включають
 сполуки, у яких X означає CH, а X' є азотом. Най-
 більш переважні сполуки формули Z25 включають
 сполуки, у яких R_1 означає етил. Ще більш пере-
 важно, щоб обидва замісники R_2 і R_3 були воднем.

Іншими переважними сполуками винаходу є
 сполуки формули Z26



Z26

чи їх фармацевтично прийнятні солі, де R_1 яв-
 ляє собою групу формули



чи де

один із замісників R_{511} і R'_{511} є воднем, а інший
 являє собою C_1 - C_3 -ацил, C_1 - C_2 -алкіл чи CHO;

або один із замісників R_{511} і R'_{511} є метилом, а
 інший являє собою CHO чи метил,

кожен замісник R_{521} являє собою C_1 - C_3 -
 алкокси, галоген, H, C_1 - C_2 -алкіл чи ціаногрупу; чи

R_1 означає циклопентил, циклогексил, оксазо-
 ліл, ізоксазоліл, необов'язково заміщений 1 чи 2
 групами C_1 - C_2 -алкіл, феніл, тиен-2-іл, необов'язко-
 во заміщений CHO, незаміщений тиен-3-іл;

R_2 і R_3 обидва є воднем;

R_p являє собою C_1 - C_2 -алкіл;

R_f і R_g незалежно являють собою галоген; і

R_5 і R_6 незалежно означають C_3 - C_4 -алкіл.

Переважаючі сполуки формули Z26 включають
 сполуки Z26, у яких R_1 означає 6-(C_1 -
 C_2)алкоксипіридин-2-іл.

Інші переважні сполуки формули Z26 включа-
 ють сполуки Z26, у яких R_1 означає 2-формілтиен-
 3-іл.

Також переважні сполуки формули Z26 вклю-
 чають сполуки Z26, у яких R_1 означає 5-
 формілтиен-3-іл.

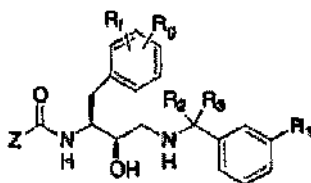
Інші переважні сполуки формули Z26 включа-
 ють сполуки, у яких R_{521} являє собою ціаногрупу.

Ще одні переважні сполуки формули Z26
 включають сполуки Z26, у яких R_1 означає 5-
 ціанопірид-3-іл.

Іншими переважними сполуками формули Z26
 є сполуки формули Z26-1, тобто сполуки Z26, у
 яких R_1 означає 6-галогенпірид-3-іл. Найбільш
 переважними є сполуки Z26-1, у яких галоген у
 заміснику R_1 є фтором чи хлором.

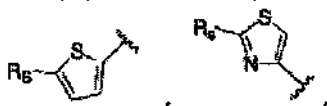
Іншими переважними сполуками формули Z26
 є сполуки, у яких R_1 являє собою тиенільну групу,
 необов'язково заміщену R_{511} чи R'_{511} , циклопентил,
 циклогексил, оксазоліл, ізоксазоліл, необов'язково
 заміщений 1 чи 2 групами C_1 - C_2 -алкіл, феніл чи
 тиен-2-іл, необов'язково заміщений CHO. Більш
 переважно, щоб незаміщена тиенільна група була
 тиен-3-ілом чи тиен-2-ілом.

Іншими переважними сполуками винаходу є сполуки формули Z27



Z27

чи їх фармацевтично прийнятні солі, де



Z являє собою піридил чи піридил N-оксид, де піридил чи піридил N-оксид є незаміщеними чи заміщеними групою C(O)NR₅R₆, де

R₅ і R₆ незалежно означають C₃-C₄-алкіл; чи

R₅ є метилом чи етилом, а R₆ являє собою C₃-алкіл;

R₁ означає C₁-C₃-алкіл чи галоген;

R₂ і R₃ обидва є воднем;

R₅ означає C₁-C₃-алкілсульфоніл, C₁-C₃-алкілсульфоніл(C₁-C₃)алкіл, -NHSO₂(C₁-C₂-алкіл) чи -N(C₁-C₂-алкіл)SO₂(C₁-C₂-алкіл); і

R₁ і R₉ незалежно являють собою галоген.

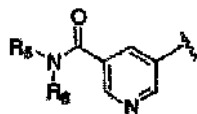
Переважним значенням R₁ у сполуках формули Z27 є етил. Більш переважно, щоб

Z являв собою



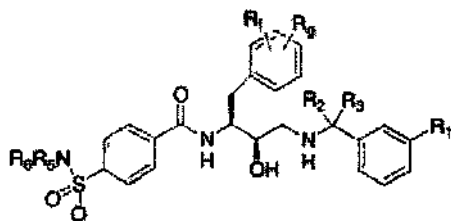
Однаково переважно, щоб R₅ означав C₁-C₃-алкілсульфоніл, C₁-C₃-алкілсульфоніл(C₁-C₃)алкіл, -NHSO₂CH₃ чи -NCH₃SO₂CH₃.

Інші переважні сполуки включають сполуки, у яких Z являє собою піридил, заміщений групою C(O)NR₅R₆, де R₅ і R₆ незалежно означають C₃-C₄-алкіл; чи R₅ є метилом чи етилом, а R₆ являє собою C₃-алкіл. Більш переважно, щоб R₅ і R₆ означали пропіл. Ще більш переважно, щоб Z являв



сполукою чи його N-оксид.

Іншими переважними сполуками винаходу є сполуки формули Z28



Z28

чи їх фармацевтично прийнятні солі, де

R₁ означає C₂-C₃-алкіл;

R₂ і R₃ обидва є воднем;

R₅ і R₆ незалежно означають (а) C₁-C₃-алкіл, необов'язково заміщений фенілом і (б) феніл, не-

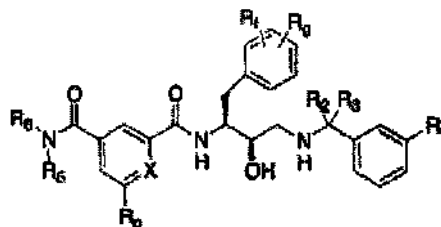
обов'язково заміщений галогеном; а

R₁ і R₉ незалежно являють собою галоген.

Переважні сполуки формули Z28 включають сполуки, у яких R₅ означає метил, необов'язково заміщений фенілом, а R₆ є фенілом.

Інші переважні сполуки формули Z28 включають сполуки, у яких R₅ означає C₁-C₂-алкіл, а R₆ є 4-галогенфенілом, переважно, 4-хлорфенілом.

Іншими переважними сполуками винаходу є сполуки формули Z29



Z29

чи їх фармацевтично прийнятні солі, де

X є чи азотом N⁺-O⁻;

R₁ означає C₂-C₄-алкіл чи C₁-C₃-алкіл;

R₂ і R₃ обидва є воднем; чи

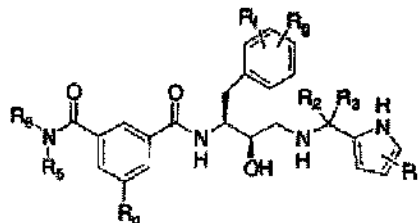
R₂ і R₃ разом утворюють 3-членний цикл з атомом вуглецю, до якого вони приєднані; R₁ і R₉ незалежно являють собою галоген;

R_p є воднем чи C₁-C₂-алкілом; і

R₅ і R₆ незалежно означають C₃-C₄-алкіл.

Переважні сполуки формули Z29 включають сполуки, у яких R₁ означає етил. Більш переважні сполуки формули Z29 включають сполуки, у яких X є азотом; R_p являє собою C₁-C₂-алкіл (переважно, метил); а R₁ є етилом.

Іншими переважними сполуками винаходу є сполуки формули Z30



Z30

чи їх фармацевтично прийнятні солі, де

R₁ означає водень чи C₁-C₃-алкіл;

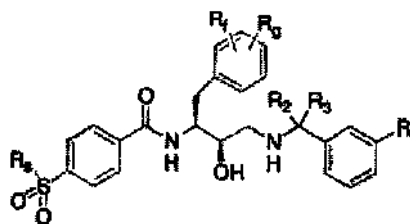
R₂ і R₃ обидва є воднем; чи

R_p означає C₁-C₂-алкіл;

R₁ і R₉ незалежно являють собою галоген; і

R₅ і R₆ незалежно означають C₃-C₄-алкіл.

Ще одну переважну групу сполук винаходу складають сполуки, представлені формулою Z31



Z31

чи їх фармацевтично прийнятні солі, де R_5 являє собою $NR_{531}R_{541}$ де R_{531} є C_1 - C_2 -алкілом; а R_{541} означає C_1 - C_6 -алкіл, аліл, ціано- (C_1-C_3) алкіл, (C_4-C_7) циклоалкіл, піридил- (C_1-C_3) алкіл, феніл, феніл- (C_1-C_3) алкіл, аміно- (C_1-C_3) алкіл, моно- (C_1-C_3) алкіламіно- (C_1-C_2) алкіл чи ді- (C_1-C_3) алкіламіно- (C_1-C_2) алкіл; або R_5 являє собою CH_3 , - $N(C_1-C_2$ -алкіл)феніл чи - $H(C_2$ - C_3 .алкіл) $(C_3-C_4$ -алкіл);

R_1 означає C_2 - C_3 -алкіл;

R_2 і R_3 обидва є воднем; а

R_f і R_g незалежно являють собою галоген.

Переважні сполуки формули Z31 включають сполуки, у яких R_{541} означає піридилетил чи фенілетил.

Іншими переважними сполуками Z31 є сполуки, у яких R_{541} означає діетиламіно- (C_1-C_2) алкіл, більш переважний діетиламінометил.

Ще одними переважними сполуками Z31 є сполуки, у яких R_{541} означає C_3 -5-алкіл.

Найбільш переважні сполуки формули Z31 включають сполуки, у яких R_5 являє собою (2-ціаноетил)метиламіногрупу.

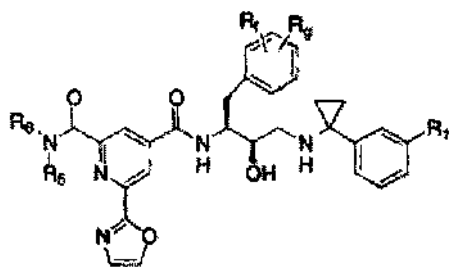
Інші найбільш переважні сполуки формули Z31 включають сполуки, у яких R_5 являє собою (циклогексил)метиламіногрупу.

Відповідно до переважного аспекту формули Z31, R_{541} являє собою C_1 - C_6 -алкіл, аліл, ціано- (C_1-C_3) алкіл, (C_4-C_7) циклоалкіл, піридил- (C_1-C_3) алкіл, феніл чи феніл- (C_1-C_3) алкіл.

Відповідно до іншого переважного аспекту Z31, R_{541} є фенілом чи циклогексил.

Згідно ще одному переважному аспекту Z31, R_5 являє собою - $N(CH_3)$ феніл чи - N (етил) $(C_3-C_4$ -алкіл).

Іншими переважними сполуками винаходу є сполуки формули Z32



Z32

чи їх фармацевтично прийнятні солі, де

R_1 означає C_2 - C_3 -алкініл чи C_1 - C_3 -алкіл;

R_f і R_g незалежно являють собою галоген;

R_5 і R_6 незалежно означають C_1 - C_4 -алкіл.

Переважні сполуки формули Z32 включають сполуки, у яких R_5 і R_6 означають C_3 -алкіл.

Інші переважні сполуки формули Z32 включають сполуки, у яких R_5 є метилом, а R_6 являє собою C_3 -алкіл.

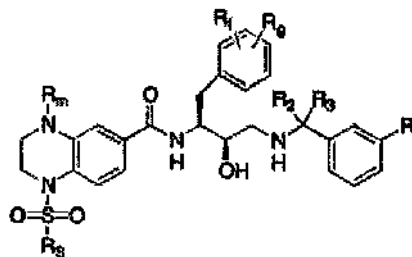
Найбільш переважні сполуки формули Z32 включають сполуки, у яких R_1 є етилом.

Ще одні найбільш переважні сполуки формули Z32 включають сполуки, у яких обидва замісники R_5 і R_6 є чи пропілом R_5 означає метил, а R_6 - пропіл, далі - Z32-1.

Ще одні переважні сполуки формул Z32 і Z32-1

включають сполуки, у яких R_1 є C_2 - C_3 -алкінілом (переважно, C_2 -алкінілом).

Іншими переважними сполуками винаходу є сполуки формули Z33



Z33

чи їх фармацевтично прийнятні солі, де

R_5 являє собою C_1 - C_4 -алкіл;

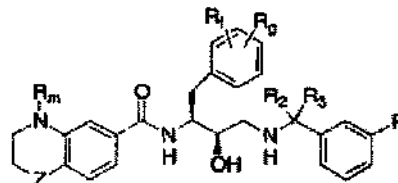
R_m означає C_1 - C_4 -алкіл;

R_1 є C_2 - C_3 -алкінілом;

R_2 і R_3 обидва є воднем; а

R_f і R_g незалежно являють собою галоген.

Ще одними переважними сполуками винаходу є сполуки формули Z34



Z34

чи їх фармацевтично прийнятні солі, де

R_m означає C_1 - C_4 -алкіл;

R_1 є C_2 - C_3 -алкінілом;

R_2 і R_3 обидва є воднем; і

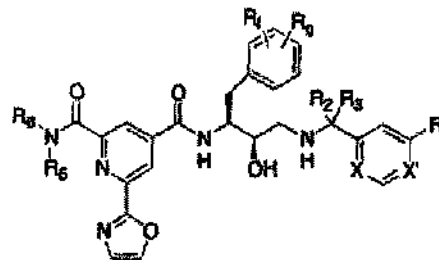
R_f і R_g незалежно являють собою галоген;

Z означає S, S(O), S(O)₂ чи O.

Переважні сполуки формули Z34 включають сполуки, у яких Z означає S чи S(O).

Більш переважно, щоб R_1 був C_2 -алкінілом.

Ще одними переважними сполуками винаходу є сполуки формули Z35



Z35

чи їх фармацевтично прийнятні солі, де

один із замісників X і X' є CH, а інший - N;

R_1 означає C_2 - C_4 -алкініл; аміно- (C_1-C_3) алкіл, моно- (C_1-C_3) алкіламіно- (C_1-C_2) алкіл чи ді- (C_1-C_3) алкіламіно- (C_1-C_2) алкіл;

R_2 і R_3 обидва є воднем; чи

R_2 і R_3 разом утворюють 3-членний цикл з атомом вуглецю, до якого вони приєднані;

R_f і R_g незалежно являють собою галоген;

R_5 і R_6 незалежно означають C_1 - C_3 - C_4 -алкіл.

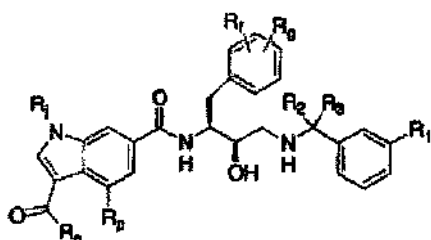
Переважні сполуки формули Z35 включають

сполуки, у яких R_2 і R_3 разом утворюють 3-членний цикл з атомом вуглецю, до якого вони приєднані; X означає N , а X' є CH , далі - Z35-1.

Інші переважні сполуки формули Z35 включають сполуки формули Z35-1, тобто сполуки Z35, у яких R_2 і R_3 є воднем; X' означає N , а X є CH , далі - Z35-2.

Більш переважні сполуки Z35, Z35-1 і Z35-2 включають сполуки, у яких R_1 означає C_2 -алкіл. Більш переважно, щоб R_1 , крім того, був ді(C_1 - C_3)алкіламіно(C_1 - C_3)алкілом. Ще більш переважно, щоб R_1 був диметиламіно(C_1 - C_2)алкілом.

Іншими переважними сполуками винаходу є сполуки формули Z36



Z36

чи їх фармацевтично прийнятні солі, де R_1 означає C_2 - C_3 -алкіл; R_2 і R_3 обидва є воднем; R_4 і R_5 незалежно являють собою галоген; R_6 є воднем, ціаногрупою, C_1 - C_3 -алкілом, аміногрупою, N -(C_1 - C_3 -алкілсульфоніл)- N -((C_1 - C_3)алкіл)аміногрупою, 2-оксазолілом чи 1-піролілом, необов'язково заміщеним по 2- і 5-положеннях C_1 - C_2 -алкілом;

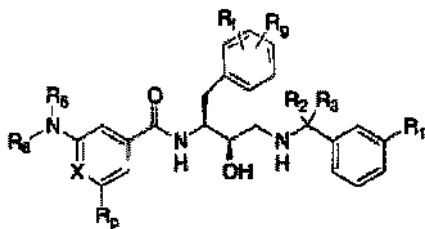
R_8 являє собою C_1 - C_3 -алкіл, 3 чи трифторметил; а

R_7 означає C_1 - C_5 -алкіл.

Переважні сполуки Z36 включають сполуки, у яких R_j є метилом чи етилом, а R_p являє собою водень, метил чи етил.

Інші переважні сполуки Z36 включають сполуки, у яких R_j є метилом, а R_p означає водень.

Ще одними переважними сполуками винаходу є сполуки формули Z37



Z37

чи їх фармацевтично прийнятні солі, де X є азотом N^+ чи $-O$; R_1 означає C_2 - C_4 -алкіл, ціаногрупу, C_1 - C_3 -алкіл чи CF_3 ;

R_2 і R_3 обидва є воднем; чи

R_2 і R_3 разом утворюють 3-членний цикл з атомом вуглецю, до якого вони приєднані;

R_4 і R_5 незалежно являють собою галоген;

R_6 є воднем, ціаногрупою чи C_1 - C_2 -алкілом; а

R_5 і R_6 незалежно означають C_1 - C_4 -алкіл.

Переважні сполуки формули Z37 включають

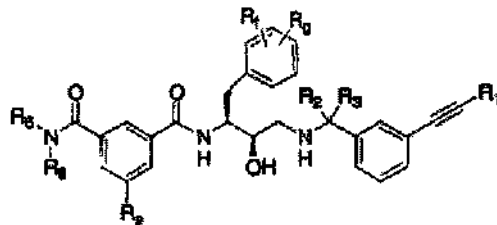
сполуки формули Z37-1, тобто сполуки Z37, у яких X означає N . Переважні сполуки Z37-1 включають сполуки, у яких R_p є ціаногрупою. Більш переважні сполуки Z37-1, у яких R_5 є метилом, а R_6 означає C_2 - C_4 -алкіл. Особливо переважні сполуки Z37-1, у яких R_6 є пропілом.

Інші переважні сполуки формули Z37 включають сполуки, у яких R_1 означає C_2 - C_3 -алкіл; R_p є метилом чи етилом; а R_5 і R_6 незалежно означають C_3 - C_4 -алкіл. Більш переважно, щоб обидва замісники R_2 і R_3 також були воднем.

Інші переважні сполуки Z37 включають сполуки, у яких R_1 означає C_2 - C_3 -алкіл чи C_2 -алкіл; а R_p є метилом.

Крім того, ще одні переважні сполуки Z37 включають сполуки, у яких R_1 означає CF_3 . Більш переважно, щоб, крім того, R_p був метилом. Ще більш переважно, щоб X означав CH .

Іншими переважними сполуками винаходу є сполуки формули Z38



Z38

чи їх фармацевтично прийнятні солі, де R_1 означає водень, чи метил $-CH_2OH$; R_2 і R_3 обидва є воднем; чи R_2 і R_3 разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, утворюють 3-членний цикл; R_p є C_2 - C_3 -алкіліном чи C_1 - C_3 -алкілом; R_4 і R_5 незалежно являють собою галоген; R_5 і R_6 незалежно означають C_3 - C_4 -алкіл; чи R_5 є метилом, а R_6 являє собою C_3 - C_4 -алкіл.

Переважні сполуки формули Z38 включають сполуки, у яких R_p є метилом, далі - Z38-1.

Інші переважні сполуки формули Z38 включають сполуки, у яких R_p є C_2 -алкіліном, далі - Z38-2.

Ще одні переважні сполуки Z38, Z38-1 і Z38-2 включають сполуки, у яких R_1 означає водень, і обидва замісники R_2 і R_3 також є воднем, далі - Z38-3. Переважні сполуки Z38-3 включають сполуки, у яких обидва замісники R_5 і R_6 являють собою C_3 - C_4 -алкіл. Ще більш переважно, щоб обидва вони були C_3 -алкілом.

Ще одні переважні сполуки Z38, Z38-1 і Z38-2 включають сполуки, у яких R_1 означає водень, а R_2 і R_3 утворюють 3-членний цикл, далі - Z38-4.

Інші переважні сполуки Z38, Z38-1 і Z38-2 включають сполуки, у яких R_1 означає $-CH_2OH$. Переважно, щоб, крім того, R_2 і R_3 були воднем, далі - Z38-4A.

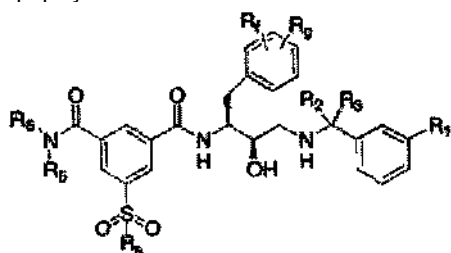
Ще більш переважними є сполуки формули Z38, у яких R_1 означає водень, а R_2 і R_3 разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, утворюють 3-членний цикл, далі - Z38-5.

Переважні сполуки формули Z38-5 включають сполуки, у яких R_p є C_2 - C_3 -алкіліном (переважно, C_2 -алкілом) чи метилом. Більш переважно, щоб, принаймні, один із замісників R_5 і R_6 був C_3 -алкілом. Ще більш переважно, щоб R_5 був мети-

лом чи пропілом, а R_6 - пропілом, далі - Z38-5A.

Ще одні переважні сполуки Z38, Z38-1, Z38-2, Z38-3, Z38-4, Z38-4A, Z38-5 і Z38-5A включають собою, у яких обидва замісники R_f і R_g являють собою хлор чи фтор. Найбільш переважними в ряді сполук Z38 є сполуки, у яких обидва замісники R_f і R_g являють собою фтор і знаходяться в положеннях 3 і 5 стосовно місця приєднання фенільної групи.

Іншими переважними сполуками винаходу є сполуки формули Z39



Z39

де

R_1 означає C_2 - C_3 -алкіл;

R_2 і R_3 обидва є метилом чи

R_2 , R_3 і атом вуглецю, до якого вони приєднані, утворюють циклопропільне кільце;

R_f і R_g незалежно являють собою галоген;

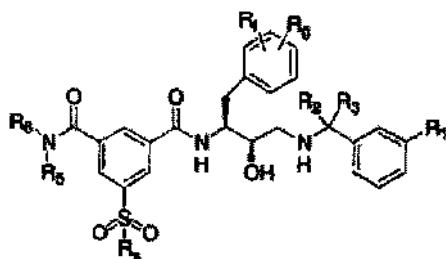
R_5 і R_6 незалежно означають C_3 - C_4 -алкіл; і

R_5 являє собою -NH(C_1 - C_4 -гідроксиалкіл).

Переважні сполуки Z39 включають сполуки, у яких гідроксиалкільна група являє собою 2-гідрокси-1,1-диметилетил. Більш переважно, щоб, крім того, R_1 означав етил.

Переважно, щоб обидва замісники R_2 і R_3 були метилом. В однаковій мірі переважно, якщо R_2 , R_3 і атом вуглецю, до якого вони приєднані, утворюють циклопропільне кільце.

Іншими переважними сполуками винаходу є сполуки формули Z40



Z40

де

R_1 означає C_2 - C_3 -алкініл;

R_2 і R_3 обидва є воднем; чи

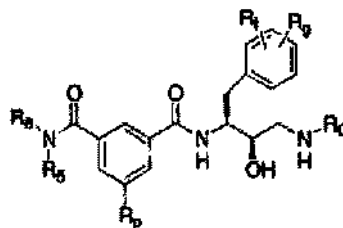
R_f і R_g незалежно являють собою галоген;

R_5 і R_6 незалежно означають C_3 - C_4 -алкіл; і

R_5 являє собою -NH(C_2 - C_4 -гідроксиалкіл).

Переважні сполуки Z40 включають сполуки, у яких гідроксиалкільна група являє собою 2-гідрокси-1,1-диметилетил; чи 2-гідроксиетил.

Іншими переважними сполуками винаходу є сполуки формули Z41



Z41

де

R_c означає C_4 - C_5 -алкіл; циклопропіл; тетрагідронафтиленіл;

-CH(C_2 -алкіл-S-(C_1 - C_2)-алкіл)C(O)NH(C_4 -алкіл);

-CH(C_2 -алкіл-SO2-(C_1 - C_2)-алкіл)C(O)NH(C_4 -алкіл);

піримідил, необов'язково заміщений C_3 - C_4 -алкілом;

-CH2-тіазоліл, необов'язково заміщений C_3 - C_4 -алкілом, чи

-CH2-ізоксазоліл, необов'язково заміщений C_1 - C_5 -алкілом;

R_f і R_g незалежно являють собою галоген;

R_p означає -NHSO2CF3, -SO2NH(C_3 - C_4 -гідроксиалкіл),

-NHSO2CH3, оксазол-2-іл чи C_2 - C_4 -алкініл; а

R_5 і R_6 незалежно означають C_3 - C_4 -алкіл.

Переважні сполуки Z41 включають сполуки, у яких R_c означає C_4 - C_5 -алкіл (переважно, ізобутил чи ізопентил); циклопропіл; тетрагідронафтиленіл;

-CH(C_2 -алкіл-S-(C_1 - C_2)-алкіл)C(O)NH(C_4 -алкіл);

-CH(C_2 -алкіл-SO2-(C_1 - C_2)-алкіл)C(O)NH(C_4 -алкіл);

піримідил, необов'язково заміщений C_3 - C_4 -алкілом;

тіохроман 1,1-діоксид; -CH2-тіазоліл, необов'язково заміщений C_3 - C_4 -алкілом, далі - Z41-1.

Більш переважні сполуки Z41 включають сполуки, у яких R_c означає ізобутил; 1,2,3,4-тетрагідронафтилен-1-іл,

CH(CH2CH2-S-CH3)C(O)NH(C_1 - C_5 -алкіл), де переважною алкільною групою є ізобутил, чи 2-трет-бутилпіримідин-4-іл, далі - Z41-2.

Інші переважні сполуки Z41 включають сполуки, у яких R_p означає -SO2NH(2-гідрокси-1,1-диметилетил), далі - Z41-3.

Інші переважні сполуки Z41, Z41-1, Z41-2 і Z41-3 включають сполуки, у яких обидва замісники R_5 і R_6 означають C_3 -алкіл.

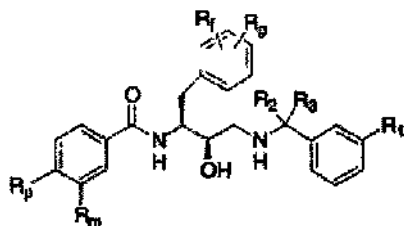
Ще одні переважні сполуки Z41 включають сполуки, у яких R_p означає 2-оксазол-2-іл; а R_c являє собою -CH2-(2-ізобутилтіазол-5-іл).

Ще одні переважні сполуки Z41 включають сполуки, у яких R_p означає C_2 - C_3 -алкініл (переважно, C_2 -алкініл), а R_c являє собою -CH2-(2-ізобутилтіазол-5-іл).

І ще одні переважні сполуки Z41 включають сполуки, у яких R_p означає -CH2-ізоксазоліл, необов'язково заміщений C_1 - C_5 -алкілом. Більш переважно, щоб R_p був -CH2-ізоксазол-5-ілом. Ще більш переважно, щоб він був -CH2-(3-ізобутилтіазол-5-ілом).

Ще більш переважно, щоб, крім того, R_p означав C_2 - C_3 -алкініл. Крім того, більш переважно, щоб обидва замісники R_5 і R_6 означали C_3 -алкіл.

Іншими переважними сполуками винаходу є сполуки формули Z42



Z42

де

R_1 означає C_2 - C_3 -алкіл чи галоген;

R_2 і R_3 обидва є воднем; чи

R_2 , R_3 і атом вуглецю, до якого вони приєднані, утворюють циклопропільне кільце;

R_1 і R_9 незалежно являють собою галоген; і

R_m означає $-NH-SO_2CF_3$, оксазол-2-іл, $-N(CH_3)SO_2CH_3$, $-N(C_3-C_4-гідроксиалкіл)SO_2(C_1-C_2-алкіл)$, а R_p є H; чи

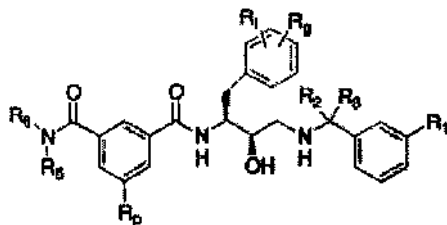
R_m означає H, а R_p є $-NH-SO_2CF_3$, $-CH_2SO_2(C_1-C_2-алкіл)$, де переважною алкільною групою є метил; чи

R_m означає $-C(O)піролідиніл$, а R_p є OH.

Переважні сполуки Z42 включають сполуки, у яких R_m означає H, а R_p є $-NH-SO_2CF_3$, $-CH_2SO_2(C_1-C_2-алкіл)$, далі - Z42-1. Крім того, переважними є сполуки Z42, у яких R_m означає $-NH-SO_2CF_3$, оксазол-2-іл, $-N(CH_3)SO_2CH_3$, $-N(C_3-C_4-гідроксиалкіл)SO_2(C_1-C_2-алкіл)$, а R_p є 3, далі - Z42-2.

Переважні сполуки Z42, Z42-1 і Z42-2 включають сполуки, у яких R_1 є етилом, бромом чи йодом. Більш переважно, якщо обидва замісники R_2 і R_3 є воднем.

Іншими переважними сполуками винаходу є сполуки формули Z43



Z43

де

R_1 означає C_2 - C_5 -алкіл, C_3 - C_6 -ціаноалкіл, C_3 - C_6 -алкеніл, $-NHSO_2(C_1-C_2-алкіл)$, C_4 - C_5 -галогеналкіл, $-C_3$ -алкіл- $CO_2(C_1-C_2-алкіл)$, CN, $-N(C_1-C_2-алкіл)SO_2(C_1-C_2-алкіл)$, $-SO_2(C_1-C_2-алкіл)$, $-S(O)(C_1-C_6-алкіл)$, $-NH-(C_3-C_6-циклоалкіл)$ чи $-OC(O)N(C_1-C_2-алкіл)(C_1-C_2-алкіл)$;

R_2 і R_3 обидва є воднем;

R_1 і R_9 незалежно являють собою галоген;

R_p є C_1 - C_2 -алкілом;

R_5 і R_6 незалежно означають C_3 - C_5 -алкіл, C_1 - C_2 -алкокси- C_1 - C_2 -3-алкіл чи C_3 - C_5 -алкеніл (переважно, C_3 -алкеніл), чи

R_5 є H, а R_6 являє собою C_4 - C_6 -алкіл (C_1 - C_2 -алкокси)-(C_2 - C_3 -алкіл);

R_5 є етилом, а R_6 являє собою C_2 - C_3 -гідроксиалкіл чи $-(C_1-C_2-алкіл)-N(C_1-C_2-алкіл)(C_1-C_2-алкіл)$; чи

R_5 є CH_3 , а R_6 являє собою C_4 - C_5 -алкіл, циклогексил, $-(C_1-C_2-алкіл)феніл$, $-(C_1-C_2-алкіл)піридил$ чи CH_2 -фурил; чи

R_5 є метилом чи етилом, а R_6 являє собою (C_1 - C_2 -алкокси)-(C_2 - C_3 -алкіл) чи $-CH_2$ -(C_3 - C_6 -циклоалкіл), чи

R_5 , R_6 і атом азоту, до якого вони приєднані, утворюють піперидинільне кільце, необов'язково заміщене C_3 - C_4 -алкілом чи OH, азепаніл, амід піролідин-2-карбонової кислоти, 3-гідроксипіперидин-1-іл.

Переважні сполуки формули Z43 включають сполуки, у яких R_1 є C_2 - C_4 -алкілом, далі - Z43-1. Переважно, щоб R_1 був етилом, ізопропілом, ізобутилом, втор-бутилом чи ізопентином. Більш переважні етил чи ізопропіл. Ще більш переважний етил.

Інші переважні сполуки формул Z43 і Z43-1 включають сполуки, у яких R_5 і R_6 одночасно являють собою етоксietил (далі - Z43-1A), R_5 є пропілом, а R_6 являє собою бутіл (далі - Z43-1B), R_5 є етилом, а R_6 являє собою бутіл (далі - Z43-1C), R_5 є метилом чи етилом, а R_6 представляє собою $-CH_2$ -циклопропіл, ізобутил чи C_2 - C_4 -алкініл (далі - Z43-1D), чи R_5 є етилом, а R_6 являє собою пропіл (далі - Z43-1E), чи R_5 є воднем, а R_6 являє собою втор-бутил (далі - Z43-1F).

Ще більш переважні сполуки Z43, Z43-1, Z43-1A, Z43-1B, Z43-1C, Z43-1D, Z43-1E і Z43F, у яких R_p є метилом чи C_2 -алкінілом.

Інші переважні сполуки формули Z43 включають сполуки, у яких R_5 , R_6 і атом азоту, до якого вони приєднані, утворюють циклічний 2-пропілпіперидин-1-іл.

Також переважні сполуки формули Z43 включають сполуки, у яких R_1 означає циклопентил, циклогексил, пропеніл, аліл чи (C_3 - C_6 -алкіл)-CN, 4-хлорбутил, 3-піридил, метил-2-метилпропанат, гекс-5-еніл, CN, $-N(CH_3)SO_2CH_3$, $-SO_2CH_2CH_3$, 3-метилпірид-2-іл, оксазол-2-іл, 3,5-диметилізоксазол-4-іл, 3-метилтиен-2-іл, 2-піридил, 4-карбальдегідфуран-5-іл і 2-карбальдегідтиен-5-іл, 2-карбальдегід-3-метилтиен-5-іл, 2-метоксипіридин-4-іл, $-NH$ -циклопропіл, $NHSO_2CH_3$; а R_p є метилом, далі - Z43-2. Переважні сполуки формули Z43-2 включають сполуки, у яких обидва замісники R_5 і R_6 є C_3 -алкілом. Крім того, переважно, якщо R_5 є етилом, а R_6 являє собою бутіл.

Переважні сполуки Z43, Z43-1 і Z43-2 включають сполуки, у яких R_1 означає C_2 - C_3 -алкініл (переважно, C_2 -алкініл), далі - Z43-3.

Переважні сполуки Z43, Z43-1, Z43-2 і Z43-3 включають сполуки, у яких R_5 і R_6 незалежно означають C_3 - C_5 -алкіл, C_1 - C_2 -алкокси- C_1 - C_3 -алкіл. Інші переважні сполуки Z43, Z43-1, Z43-2 і Z43-3 включають сполуки, у яких R_5 є H, а R_6 являє собою $C_{4,5}$ - C_6 -алкіл чи (C_1 - C_2 -алкокси)-(C_2 - C_3 -алкіл). Також переважні сполуки Z43, Z43-1, Z43-2 і Z43-3 включають сполуки, у яких R_5 є етилом, а R_6 являє собою C_2 - C_3 -гідроксиалкіл чи $-(C_1-C_2-алкіл)-N(C_1-C_2-алкіл)(C_1-C_2-алкіл)$. Більш переважно, щоб $-(C_1-C_2-алкіл)-N(C_1-C_2-алкіл)(C_1-C_2-алкіл)$ означав $-(C_1-C_2-алкіл)-N(CH_3)_2$.

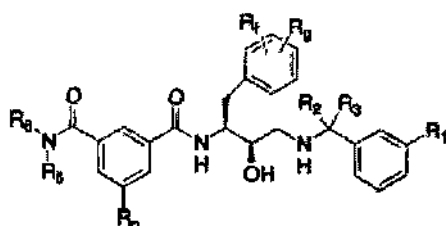
І ще одні переважні сполуки Z43, Z43-1, Z43-2 і Z43-3 включають сполуки, у яких R_5 є CH_3 , а R_6

являє собою C_4 - C_5 -алкіл, циклогексил, $-(C_1$ - C_2 -алкіл)феніл, $-(C_1$ - C_2 -алкіл)піридил чи CH_2 -фурил. Переважно, щоб R_5 означав CH_3 , а R_6 являв собою C_4 - C_5 -алкіл, далі - Z43-4. Крім того, ще одні переважні сполуки Z43, Z43-1, Z43-2 і Z43-3 включають сполуки, у яких R_5 є метилом чи етилом, а R_6 являє собою $(C_1$ - C_2 -алокси)- $(C_2$ - C_3 -алкіл).

Інші переважні сполуки Z43, Z43-1, Z43-2 і Z43-3 включають сполуки, у яких R_5 , R_6 і атом азоту, до якого вони приєднані, утворюють піперидинільне кільце, необов'язково заміщене C_3 - C_4 -алкілом чи OH, азепаніл, амід піролідін-2-карбонової кислоти чи 3-гідроксипіперидин-1-іл.

Ще одні переважні сполуки Z43, Z43-1, Z43-2, Z43-3 і Z43-4 включають сполуки, у яких R_p є метилом.

Іншими переважними сполуками винаходу є сполуки формули Z44



Z44

ДЕ

R_1 означає C_2 - C_3 -алкіл, галоген, $-NH$ (циклоалкіл), переважно, щоб циклоалкільна група була циклопропільною групою,

R_f і R_g незалежно являють собою галоген;

R_p означає C_1 - C_2 -алкіл, оксазоліл, тiazоліл чи C_2 - C_3 -алкініл;

R_2 , R_3 і атом вуглецю, до якого вони приєднані, утворюють циклопропільне кільце; чи

R_2 і R_3 обидва є метилом;

R_5 і R_6 незалежно означають C_3 - C_4 -алкіл; чи

R_5 є метилом, а R_6 являє собою C_3 - C_5 -алкіл.

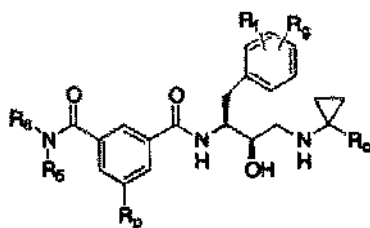
Переважні сполуки формули Z44 включають сполуки, у яких обидва замісники R_2 і R_3 є метилом, а R_5 і R_6 незалежно означають C_3 - C_4 -алкіл, далі - Z44-1.

Переважні сполуки формули Z44 і Z44-1 включають сполуки, у яких R_p означає оксазол-2-іл чи тiazол-2-іл.

Переважні сполуки формули Z44 включають сполуки, у яких R_p означає C_2 - C_3 -алкініл; а R_5 і R_6 незалежно являють собою C_3 - C_4 -алкіл.

Крім того, переважними є сполуки, у яких R_1 означає бром, хлор чи йод, або $-NH$ (циклопротил).

Іншими переважними сполуками винаходу є сполуки формули Z45



Z45

де

R_c означає ізоксазоліл, необов'язково заміщений C_3 - C_5 -алкілом, тiazоліл, необов'язково заміщений C_3 - C_4 -алкілом, чи $-C_1$ - C_3 -алкіл- $C(O)NH(C_1$ - C_3 -алкіл);

R_f і R_g незалежно являють собою галоген;

R_p означає C_1 - C_2 -алкіл, оксазоліл, тiazоліл чи C_2 - C_4 -алкініл;

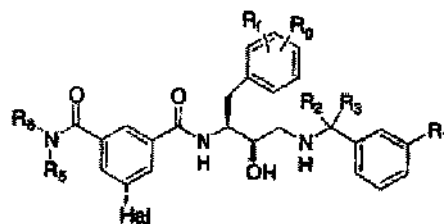
R_5 і R_6 незалежно означають C_3 - C_4 -алкіл.

Переважні сполуки формули Z45 включають сполуки, у яких R_p означає оксазол-2-іл чи тiazол-2-іл, далі - Z45-1. Більш переважні сполуки Z45-1 включають сполуки, у яких R_c означає 3-ізобутилізоксазол-5-іл чи N-ізобутил-2-метилпропіон-2-іламід; а R_f і R_g незалежно являють собою Cl чи F.

Інші переважні сполуки формули Z45 включають сполуки, у яких R_c означає 2-ізобутилтiazол-2-іл; а R_f і R_g незалежно являють собою Cl чи F.

Ще одні переважні сполуки формули Z45 включають сполуки, у яких R_c означає 3-ізобутилізоксазол-5-іл чи N-ізобутил-2-метилпропіон-2-іламід; R_f і R_g незалежно являють собою Cl чи F; а R_p є C_2 - C_3 -алкінілом.

Іншими переважними сполуками винаходу є сполуки формули Z46



Z46

де

Hal означає галоген;

R_1 є C_1 - C_2 -алкілом чи галогеном;

R_2 і R_3 обидва є воднем;

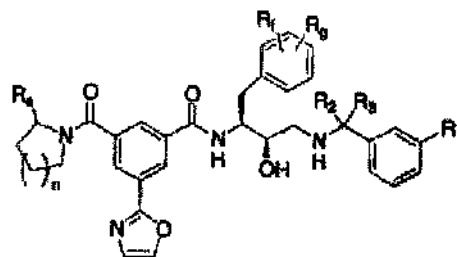
R_f і R_g незалежно являють собою галоген;

R_z означає C_1 - C_2 -алкіл;

R_5 і R_6 незалежно означають C_3 - C_4 -алкіл.

Переважні сполуки формули Z46 включають сполуки, у яких Hal є бромом чи хлором. Більш переважно, щоб, крім того, R_1 означав метил, етил, бром чи йод. Більш переважно, щоб R_1 був метилом чи етилом. Ще більш переважно, щоб він був етилом.

Іншими переважними сполуками винаходу є сполуки формули Z47



Z47

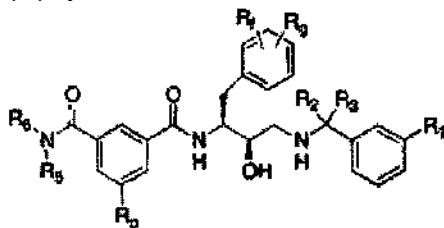
де

n дорівнює 0, 1 чи 2;

R_1 є C_1 - C_2 -алкілом;
 R_2 і R_3 обидва є воднем;
 R_f і R_g незалежно являють собою галоген;
 R_s означає (C_1-C_2) алкокси- (C_1-C_2) алкіл.

Переважають сполуки Z47 включають сполуки, у яких R_s є метоксиметил. Переважно, щоб n дорівнювало 1.

Іншими переважними сполуками винаходу є сполуки формули Z48



Z48

де

R_1 означає C_1 - C_2 -алкіл;
 R_2 і R_3 , обидва є воднем;
 R_f і R_g незалежно являють собою галоген;
 R_p є ізоксазолом, необов'язково заміщеним C_1 - C_2 -алкілом;

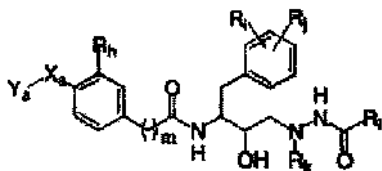
R_5 і R_6 незалежно означають C_3 - C_4 -алкіл.

Переважні сполуки формули Z48 включають сполуки, у яких R_p означає 3-метилізоксазол-4-іл, 5-оксазоліл, 3-оксазоліл, 3-метилоксазол-2-іл, 3-етилоксазол-2-іл.

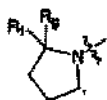
Переважають сполуки формул Z1 - Z48 включають сполуки, у яких, принаймні, один із замісників R_f і R_g є фтором. Більш переважно, щоб обидва ці замісники були фтором.

Ще більш переважно, щоб замісники R_f і R_g знаходилися в положеннях 3 і 5 стосовно місця приєднання фенільної групи.

Відповідно до іншого аспекту, винахід включає сполуки формули Z49:



Z49



де Y_a являє собою $N(CH_2CH_2CH_3)_2$ чи -

R_f і R_g обидва є воднем чи разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, утворюють карбоніл;

X_a означає ковалентний зв'язок чи карбоніл;

R_h є воднем чи гідроксилом;

R_i і R_j незалежно являють собою водень чи галоген, обраний з Br, F, Cl чи I;

R_k означає C_1 - C_6 -алкіл;

R_l означає C_1 - C_6 -алкіл феніл, необов'язково заміщений C_1 - C_6 -алкілом, C_1 - C_6 -алкокси, галогеном, гідроксилом, аміногрупою, моно(C_1 - C_6)алкіламіногрупою, ді(C_1 - C_6)алкіламіногрупою,

трифторметилом; а

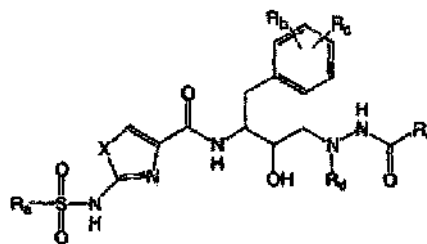
m дорівнює 0 чи 1.

Відповідно до даного здійснення, переважно, щоб R_f і R_g разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, утворювали карбоніл, X_a означали ковалентний зв'язок, R_h був воднем, m дорівнювало 1, а R_i і R_j являли собою водень. Більш переважно, щоб R_k був етилом, а R_e - заміщеним по позначці-положенню етилфенілом, $-CH_2CH_2CH(CH_3)_2$, метилом чи фенілом. Переважно, щоб R_l означав феніл.

Відповідно до іншого переважного аспекту Z49, R_f і R_g означають водень, X_a являє собою карбоніл, R_h є гідроксилом, R_i і R_j означають водень, а R_k є етилом. Згідно ще одному аспекту і відповідно до перерахованих переважних груп, бажано, щоб R_e був заміщеним по позначці-положенню етилфенілом, $-CH_2CH_2CH(CH_3)_2$ чи метилом.

Відповідно до даного здійснення, переважно, щоб R_a означав метил, R_d був етилом, X був O, а R_b і R_c означали водень. Відповідно до іншого аспекту і відповідно до перерахованих переважних груп, бажано, щоб R_e був заміщеним по позначці-положенню етилфенілом, $-CH_2CH_2CH(CH_3)_2$, метилом чи фенілом. Або ж і відповідно до даного винаходу, бажано, щоб X означав S, R_b і R_c були воднем, а R_e являв собою заміщений по позначці-положенню етилфеніл чи метил. Переважно, щоб R_e був фенілом.

Відповідно до іншого аспекту, винахід представляє сполуки формули Z50:



Z50

де

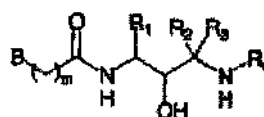
R_a і R_d є C_1 - C_6 -алкілом;

X означає O чи S;

R_b і R_c незалежно являють собою водень чи галоген, обраний з Br, F, Cl чи I;

R_e означає C_1 - C_6 -алкіл чи феніл, необов'язково заміщений C_1 - C_6 -алкілом, C_1 - C_6 -алкокси, галогеном, гідроксилом, аміногрупою, моно(C_1 - C_6)алкіламіногрупою, ді(C_1 - C_6)алкіламіногрупою, трифторметилом.

Відповідно до іншого аспекту, винахід представляє сполуки формули Z51:



Z51

і їх фармацевтично прийнятні солі, де

m дорівнює 0-5;

V означає арил чи гетероарил, необов'язково заміщений однією чи двома групами, незалежно обраними з R_6 , R'_6 , R''_6 і R'''_6 , чи

В є циклоалкілом чи гетероциклоалкілом, не-
обов'язково заміщеним однією, двома, трьома,
чотирма, п'ятьма, шістьма, сьома чи вісьма гру-
пами, незалежно обраними з R_{6a} , R_{6b} , R'_{6a} , R'_{6b} , R''_{6a} ,
 R''_{6b} , R'''_{6a} , R'''_{6b} ; C_1 - C_8 -алкілом, C_2 - C_7 -алкенілом
або C_2 - C_7 -алкінілом, кожний з яких необов'язково
заміщений однією, двома чи трьома групами, об-
раними з $-NRR'$, $-SR$, $-CN$, $-OCF_3$, $-CF_3$, $-CONRR'$, $-$
 CO_2R , $-SO_2NRR'$, $-O-P(=O)(OR)(OR')$, $-N(R)-$
 $C(=O)(R')$, $-N(R)(SO_2R')$, $-SO_2R$, $-C(=O)R$, $-NO_2$, га-
логену, $-(CH_2)_{0-4}$ -арила і $-(CH_2)_{0-4}$ -гетероарила, чи

R і R' незалежно являють собою $-H$, $-(C_1-C_{10})$ -
алкіл, $-(CH_2)_{0-4}$ - $R_{арил}$, $-(CH_2)_{0-4}$ - $R_{гетероарил}$, $-(CH_2)_{0-4}$ -
 $R_{гетероцикліл}$, чи

C_2 - C_7 -алкеніл або C_2 - C_7 -алкініл, кожний з яких
необов'язково заміщений одним, двома чи трьома
замісниками, обраними з групи, що складається з
галогену, $-OH$, $-SH$, $-C\equiv N$, $-CF_3$, C_1 - C_3 -алкокси, амі-
ногрупи, моно- чи діалкіламіногрупи і C_1 - C_6 -алкілу,
чи

$-(CH_2)_{0-4}$ - C_3 - C_7 -циклоалкіл, необов'язково за-
міщений одним, двома чи трьома замісниками,
обраними з групи, що складається з галогену, $-OH$,
 $-SH$, $-C\equiv N$, $-CF_3$, C_1 - C_3 -алкокси, аміногрупи, моно-
чи діалкіламіногрупи і C_1 - C_6 -алкілу; бензилу, у
якому фенільне кільце необов'язково заміщено 1-3
групами, незалежно обраними з галогену, $-OH$, $-$
 SH , $-C\equiv N$, моно- чи діалкіламіногрупи, C_1 - C_6 -
алкокси чи трифторметила;

R_6 , R'_6 , R''_6 , R'''_6 , R_{6a} , R_{6b} , R'_{6a} , R'_{6b} , R''_{6a} , R''_{6b} ,
 R'''_{6a} і R'''_{6b} незалежно один від одного являють
собой $-OR$, $-NO_2$, галоген, $-CO_2R$, $-C\equiv N$, NRR' , $-SR$,
 $-SO_2R$, $-C(=O)R$, $-OCF_3$, $-CF_3$, $-CONRR'$, $-SO_2NRR'$, $-$
 $O-P(=O)(OR)(OR')$, $-N(R)(COR')$, $-N(R)(SO_2R')$, $-$
 $(CH_2)_{0-4}$ - $CO-NR_7R'_7$, $-(CH_2)_{0-4}$ - $O-(CH_2)_{0-4}$ - $CONRR'$, $-$
 $(CH_2)_{0-4}$ - $CO-(C_1-C_{12}$ -алкіл), $-(CH_2)_{0-4}$ - $CO-(C_2-C_{12}$ -
алкеніл), $-(CH_2)_{0-4}$ - $CO-(C_2-C_{12}$ -алкініл), $-(CH_2)_{0-4}$ - $CO-$
 $(C_3-C_7$ -циклоалкіл), $-(CH_2)_{0-4}$ - $R_{арил}$, $-(CH_2)_{0-4}$ -
 $R_{гетероарил}$, $-(CH_2)_{0-4}$ - $R_{гетероцикліл}$, $-(CH_2)_{0-4}$ - $CO-R_{арил}$, $-$
 $(CH_2)_{0-4}$ - $CO-R_{гетероарил}$, $-(CH_2)_{0-4}$ - $CO-R_{гетероцикліл}$, $-$
 $(CH_2)_{0-4}$ - $CO-R_{10}$, $-(CH_2)_{0-4}$ - $CO-O-R_{11}$, $-(CH_2)_{0-4}$ - SO_2-
 $NR_7R'_7$, $-(CH_2)_{0-4}$ - $SO-(C_1-C_8$ -алкіл), $-(CH_2)_{0-4}$ - $SO_2-(C_1-$
 C_{12} -алкіл), $-(CH_2)_{0-4}$ - $SO_2-(C_3-C_7$ -циклоалкіл), $-(CH_2)_{0-4}$ -
 $N(H$ чи $R_{11})$ - $CO-O-R_{11}$, $-(CH_2)_{0-4}$ - $N(H$ чи $R_{11})$ - $CO-$
 $N(R_{11})_2$, $-(CH_2)_{0-4}$ - $N(H$ чи $R_{11})$ - $CS-N(R_{11})_2$, $-(CH_2)_{0-4}$ -
 $N(H$ чи $R_{11})$ - $CO-R_7$, $-(CH_2)_{0-4}$ - $NR_7R'_7$, $-(CH_2)_{0-4}$ - R_{10} , $-$
 $(CH_2)_{0-4}$ - $O-CO-(C_1-C_6$ -алкіл), $-(CH_2)_{0-4}$ - $O-P(O)-(O-$
 $R_{арил})_2$, $-(CH_2)_{0-4}$ - $O-CO-N(R_{11})_2$, $-(CH_2)_{0-4}$ - $O-CS-$
 $N(R_{11})_2$, $-(CH_2)_{0-4}$ - $O-(R_{11})$, $-(CH_2)_{0-4}$ - $O-(R_{11})$ - $COOH$, $-$
 $(CH_2)_{0-4}$ - $S-(R_{11})$, C_3 - C_7 -циклоалкіл, $-(CH_2)_{0-4}$ - $N(H$ чи
 $R_{11})$ - SO_2-R_7 чи $-(CH_2)_{0-4}$ - C_3 - C_7 -циклоалкіл, чи C_1 - C_8 -
алкіл, необов'язково заміщений однією, двома чи
трьома групами, незалежно обраними з C_1 - C_6 -
алкілу, $-F$, $-Cl$, $-Br$, $-I$, $-OR$, $-NO_2$, $-F$, $-Cl$, $-Br$, $-I$, $-$
 CO_2R , $-C\equiv N$, $-NRR'$, $-SR$, $-SO_2R$, $-C(=O)R$, $-OCF_3$, $-$
 CF_3 , $-CONRR'$, SO_2NRR' , $-O-P(=O)(OR)(OR')$, $-$
 $N(R)(COR')$, $-N(R)(SO_2R')$, $-(CH_2)_{0-4}$ - $CO-NR_7R'_7$, $-$
 $(CH_2)_{0-4}$ - $CO-(C_1-C_{12}$ -алкілі), $-(CH_2)_{0-4}$ - $CO-(C_2-C_{12}$ -
алкеніла), $-(CH_2)_{0-4}$ - $CO-(C_2-C_{12}$ -алкініла), $-(CH_2)_{0-4}$ -
 $CO-(C_3-C_7$ -циклоалкіла), $-(CH_2)_{0-4}$ - $R_{арила}$, $-(CH_2)_{0-4}$ -
 $R_{гетероарила}$, $-(CH_2)_{0-4}$ - $R_{гетероцикліла}$, $-(CH_2)_{0-4}$ - $CO-$
 $R_{арила}$, $-(CH_2)_{0-4}$ - $CO-R_{гетероарила}$, $-(CH_2)_{0-4}$ - $CO-$
 $R_{гетероцикліла}$, $-(CH_2)_{0-4}$ - $CO-R_{10}$, $-(CH_2)_{0-4}$ - $CO-O-R_{11}$, $-$
 $(CH_2)_{0-4}$ - $SO_2-NR_7R'_7$, $-(CH_2)_{0-4}$ - $SO-(C_1-C_8$ -алкілі), $-$
 $(CH_2)_{0-4}$ - $SO_2-(C_1-C_{12}$ -алкілі), $-(CH_2)_{0-4}$ - $SO_2-(C_3-C_7$ -
циклоалкіла), $-(CH_2)_{0-4}$ - $N(H$ чи $R_{11})$ - $CO-O-R_{11}$, $-$

$(CH_2)_{0-4}$ - $N(H$ чи $R_{11})$ - $CO-N(R_{11})_2$, $-(CH_2)_{0-4}$ - $N(H$ чи
 $R_{11})$ - $CS-N(R_{11})_2$, $-(CH_2)_{0-4}$ - $N(H$ чи $R_{11})$ - $CO-R_7$, $-$
 $(CH_2)_{0-4}$ - $NR_7R'_7$, $-(CH_2)_{0-4}$ - R_{10} , $-(CH_2)_{0-4}$ - $O-CO-(C_1-C_6$ -
алкілу), $-(CH_2)_{0-4}$ - $O-P(O)-(O-R_{арил})_2$, $-(CH_2)_{0-4}$ - $O-CO-$
 $N(R_{11})_2$, $-(CH_2)_{0-4}$ - $O-CS-N(R_{11})_2$, $-(CH_2)_{0-4}$ - $O-(R_{11})$, $-$
 $(CH_2)_{0-4}$ - $O-(R_{11})$ - $COOH$, $-(CH_2)_{0-4}$ - $S-(R_{11})$, C_3 - C_7 -
циклоалкіла, $-(CH_2)_{0-4}$ - $N(H$ чи $R_{11})$ - SO_2-R_7 чи $-$
 $(CH_2)_{0-4}$ - C_3 - C_7 -циклоалкіла, чи

C_2 - C_7 -алкеніла або C_2 - C_7 -алкініла, кожний з
яких необов'язково містить один, два чи три заміс-
ника, незалежно обраних чи з галогену $-OH$, чи C_2 -
 C_7 -алкеніл або C_2 - C_7 -алкініл, кожний з яких необо-
в'язково заміщений однією, двома чи трьома гру-
пами, незалежно обраними з галогену, C_1 - C_3 -
алкілу, $-OH$, $-SH$, $-C\equiv N$, $-CF_3$, C_1 - C_3 -алкокси, аміно-
і моно- чи діалкіламіногрупи, чи $-(CH_2)_{0-4}$ - $O-(C_1-C_6$ -
алкіл), де алкіл необов'язково заміщений одним,
двома, трьома, чотирма чи п'ятьма атомами гало-
гену, чи будь-які два з замісників R_{6a} , R_{6b} , R'_{6a} , R'_{6b} ,
 R''_{6a} , R''_{6b} , R'''_{6a} , R'''_{6b} разом складають оксогрупу;

R_7 і R'_7 є однаковими чи різними і являють со-
бою $-H$, $-C_3$ - C_7 -Циклоалкіл, $-(C_1-C_2$ -алкіл)- $(C_3-C_7$ -
циклоалкіл), $-(C_1-C_6$ -алкіл)- $O-(C_1-C_3$ -алкіл), $-C_2$ - C_6 -
алкеніл, $-C_2$ - C_6 -алкініл, $-C_1$ - C_6 -алкільний ланцюг з
одним подвійним й одним потрійним зв'язком, чи $-$
 C_1 - C_6 -алкіл, необов'язково заміщений $-OH$ чи $-NH_2$
; чи $-C_1$ - C_6 -алкіл, необов'язково заміщений однією,
двома чи трьома групами, незалежно обраними з
галогену; чи гетероцикліл, необов'язково заміще-
ний галогеном, аміно-, моно- чи діалкіламіногру-
пою, $-OH$, $-C\equiv N$, $-SO_2-NH_2$, $-SO_2-NH-C_1-C_6$ -алкілом,
 $-SO_2-N(C_1-C_6$ -алкіл) $_2$, $-SO_2-(C_1-C_4$ -алкілом), $-CO-$
 NH_2 , $-CO-NH-C_1-C_6$ -алкілом, оксогрупою і $-CO-$
 $N(C_1-C_6$ -алкіл) $_2$; чи

C_1 - C_6 -алкілом, необов'язково заміщений одні-
єю, двома чи трьома групами, незалежно обрани-
ми з C_1 - C_3 -алкілу, галогену, $-OH$, $-SH$, $-C\equiv N$, $-CF_3$,
 C_1 - C_3 -алкокси, аміно- і моно- чи діалкіламіногрупи;
чи

C_2 - C_6 -алкенілом або C_2 - C_6 -алкінілом, кожний з
яких необов'язково заміщений однією, двома чи
трьома групами, незалежно обраними з C_1 - C_3 -
алкілу, галогену, $-OH$, $-SH$, $-C\equiv N$, $-CF_3$, C_1 - C_3 -
алкокси, аміно- і моно- чи діалкіламіногрупи; чи

C_1 - C_6 -алкокси, необов'язково заміщений од-
ним, двома чи трьома атомами галогену; арил чи
гетероарил, кожний з яких необов'язково заміще-
ний галогеном, аміно-, моно- чи діалкіламіногру-
пою, $-OH$, $-C\equiv N$, $-SO_2-NH_2$, $-SO_2-NH-C_1-C_6$ -алкілом,
 $-SO_2-N(C_1-C_6$ -алкіл) $_2$, $SO_2-(C_1-C_4$ -алкілом), $-CO-$
 NH_2 , $-CO-NH-C_1-C_6$ -алкілом і $-CO-N(C_1-C_6$ -алкіл) $_2$;
чи

C_1 - C_6 -алкілом, необов'язково заміщений одні-
єю, двома чи трьома групами, незалежно обрани-
ми з C_1 - C_3 -алкілу, галогену, $-OH$, $-SH$, $-C\equiv N$, $-CF_3$,
 C_1 - C_3 -алкокси, аміно- і моно- чи діалкіламіногрупи;
чи

C_2 - C_6 -алкенілом або C_2 - C_6 -алкінілом, кожний з
яких необов'язково заміщений однією, двома чи
трьома групами, незалежно обраними з C_1 - C_3 -
алкілу, $-C\equiv N$, $-OH$, $-SH$, $-C\equiv N$, $-CF_3$, C_1 - C_3 -алкокси,
аміно- і моно- чи діалкіламіногрупи; чи

C_1 - C_6 -алкокси, необов'язково заміщений од-
ним, двома чи трьома атомами галогену;

R_{10} являє собою гетероцикліл, необов'язково
заміщений однією, двома, трьома чи чотирма гру-

пами, незалежно обраними з C_1 - C_6 -алкілу;

R_{11} означає C_1 - C_6 -алкіл, C_2 - C_6 -алкеніл, C_2 - C_6 -алкініл, C_3 - C_7 -циклоалкіл, $-(CH_2)_{0-2}-R_{арил}$ чи $-(CH_2)_{0-2}-R_{гетероарил}$;

$R_{арил}$ означає арил, необов'язково заміщений галогеном, аміно-, моно- чи діалкіламіногрупою, $-OH$, $-C\equiv N$, $-SO_2-NH_2$, $-SO_2-NH-C_1-C_6$ -алкілом, $-SO_2-N(C_1-C_6\text{-алкіл})_2$, $-SO_2-(C_1-C_4\text{-алкілом})$, $-CO-NH_2$, $-CO-NH-C_1-C_6$ -алкілом чи $-CO-N(C_1-C_6\text{-алкіл})_2$; чи

C_1 - C_6 -алкілом, необов'язково заміщеним однією, двома чи трьома групами, незалежно обраними з C_1 - C_3 -алкілу, галогену, $-OH$, $-SH$, $-C\equiv N$, $-CF_3$, C_1 - C_3 -алкокси, аміно- і моно- чи діалкіламіногрупи; чи

C_2 - C_6 -алкенілом або C_2 - C_6 -алкінілом, кожний з яких необов'язково заміщений однією, двома чи трьома групами, незалежно обраними з C_1 - C_3 -алкілу, галогену, $-OH$, $-SH$, $-C\equiv N$, $-CF_3$, C_1 - C_3 -алкокси, аміно- і моно- чи діалкіламіногрупи; чи

C_1 - C_6 -алкокси, необов'язково заміщений одним, двома чи трьома атомами галогену;

$R_{гетероарил}$ означає гетероарил, кожний з яких необов'язково заміщений галогеном, аміно-, моно- чи діалкіламіногрупою, $-OH$, $-C\equiv N$, $-SO_2-NH_2$, $-SO_2-NH-C_1-C_6$ -алкілом, $-SO_2-N(C_1-C_6\text{-алкіл})_2$, $-SO_2-(C_1-C_4\text{-алкілом})$, $-CO-NH_2$, $-CO-NH-C_1-C_6$ -алкілом чи $-CO-N(C_1-C_6\text{-алкіл})_2$; чи

C_1 - C_6 -алкілом, необов'язково заміщеним однією, двома чи трьома групами, незалежно обраними з C_1 - C_3 -алкілу, галогену, $-OH$, $-SH$, $-C\equiv N$, $-CF_3$, C_1 - C_3 -алкокси, аміно- і моно- чи діалкіламіногрупи; чи

C_2 - C_6 -алкенілом або C_2 - C_6 -алкінілом, кожний з яких необов'язково заміщений однією, двома чи трьома групами, незалежно обраними з C_1 - C_3 -алкілу, галогену, $-OH$, $-SH$, $-C\equiv N$, $-CF_3$, C_1 - C_3 -алкокси, аміно- і моно- чи діалкіламіногрупи; чи

C_1 - C_6 -алкокси, необов'язково заміщений одним, двома чи трьома атомами галогену;

$R_{гетероцикл}$ означає гетероцикл, необов'язково заміщений галогеном, аміно-, моно- чи діалкіламіногрупою, $-OH$, $-C\equiv N$, $-SO_2-NH_2$, $-SO_2-NH-C_1-C_6$ -алкілом, $-SO_2-N(C_1-C_6\text{-алкіл})_2$, $-SO_2-(C_1-C_4\text{-алкілом})$, $-CO-NH_2$, $-CO-NH-C_1-C_6$ -алкілом $-CO-N(C_1-C_6\text{-алкіл})_2$; чи

C_1 - C_6 -алкілом, необов'язково заміщений однією, двома чи трьома групами, незалежно обраними з C_1 - C_3 -алкілу, галогену, $-OH$, $-SH$, $-C\equiv N$, $-CF_3$, C_1 - C_3 -алкокси, аміно- і моно- чи діалкіламіногрупи; чи

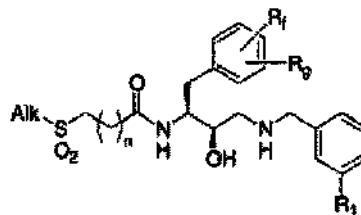
C_2 - C_6 -алкенілом або C_2 - C_6 -алкінілом, кожний з яких необов'язково заміщений однією, двома чи трьома групами, незалежно обраними з C_1 - C_3 -алкілу, галогену, $-OH$, $-SH$, $-C\equiv N$, $-CF_3$, C_1 - C_3 -алкокси, аміно- і моно- чи діалкіламіногрупи; чи C_1 - C_6 -алкокси, необов'язково заміщеним одним, двома чи трьома атомами галогену;

R_2 і R_3 незалежно друг від друга є $-H$ чи C_1 - C_6 -алкілом; чи

R_2 і R_3 разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, утворюють 3 чи 4-членний цикл;

R_6 являє собою чи водень феніл, необов'язково заміщений C_1 - C_3 -алкілом, C_2 - C_4 -алкінілом, трифторметилом чи C_1 - C_2 -алкокси.

Згідно ще одному аспекту, винахід представляє сполуки формули Z52:



Z53

чи їх фармацевтично прийнятні солі, де n дорівнює 0, 1, 2 чи 3 (переважно, 1);

R_1 означає C_1 - C_3 -алкокси (переважно, метокси), галоген (переважно, йод), C_1 - C_3 -алкіл (переважно, етил чи ізопропіл) або C_2 - C_3 -алкініл (переважно, C_2 -алкініл); R_f і R_g незалежно являють собою чи галоген обидва є воднем; і

Alk означає C_1 - C_6 -алкіл (переважно, метил, етил, ізобутіл чи ізопентил).

Переважні приклади Z52 включають сполуки, у яких n дорівнює 1, а R_1 означає метокси, C_2 -алкініл чи етил. Більш переважно, щоб R_1 був метокси.

Сполуки винаходу інгібують бета-секретазу і, отже, можуть використовуватися для лікування і попередження хвороби Альцгеймера. Сполуки винаходу одержують способами, добре відомими фахівцям у даній області, з відомих вихідних реагентів. Хімізм процесу добре знайомий фахівцям у даній області. Найбільш загальний спосіб одержання сполук винаходу представлений на Схемі А. Як правило, спочатку аміногрупу амінокислоти захищають, одержуючи захищену амінокислоту (II). Сполуки (II) перетворюють у проміжний ефір, що взаємодіє з нуклеофільним вуглецем з утворенням сполуки (III). Кетонну функцію сполуки (III) відновлюють і одержують спирт (IV), з якого утвориться епоксид (V). Після додатка аміну R_c-NH_2 (VI) відбувається розкриття епоксиду з утворенням захищеного спирту (VII). Після зняття захисту з аміногрупи незахищений амін (VIII) взаємодіє з амідотворюючим агентом формули $(R_{N-1}-X_N)_2O$ чи $R_{N-1}-X_N-X_2$ чи $R_{N-1}-X_N-OH$ (IX) з утворенням цільового продукту формули (X).

Основою сполук винаходу є фрагмент гідроксиетиламіна, $-NH-CH(R)-CH(OH)-$. Його можна легко одержати різними способами, описаними в літературі і відомими фахівцям. Способи одержання сполук типу гідроксиетиламіна описані, наприклад, у J. Med. Chem., 36, 288-291 (1992), Tetrahedron Letters, 28, 5569-5572 (1987), J. Med. Chem., 38, 581-584 (1994) і Tetrahedron Letters, 38, 619-620 (1997).

На Схемі А представлений загальний спосіб, використаний у даному винаході для синтезу цільових заміщених амінів (X). Сполуки винаходу одержують з відповідної амінокислоти (I). Амінокислоти (I) добре відомі фахівцям чи можуть бути легко отримані з відомих сполук відомими способами. У молекулі заміщених амінів (X) винаходу є, щонайменше, два енантімерних центри, що можуть давати чотири енантіомера (оптичних ізомери). Один з цих енантімерних центрів йде від вихідної амінокислоти (I). Переважніше відразу купувати чи синтезувати необхідний енантіомер (S), а не одержувати суміш оптичних ізомерів і далі відокремлювати необхідний енантіомер (S).

Переважніше починати процес з оптично чистої (S)-амінокислоти (I) тієї ж конфігурації, що буде і в продукті - заміщеного аміну (X).

Першою стадією процесу є захист вільної аміногрупи (S)-амінокислоти (I) за допомогою захисної групи з утворенням захищеної (S)-амінокислоти (II) за методиками, добре відомими фахівцям у даній області. Фахівцям знайомі захисні групи для аміногрупи. Див., наприклад, "Protecting Groups in Organic Synthesis" ("Захисні групи в органічному синтезі"), John Wiley and Sons, New York, N.Y., 1981, глава 7; "Protecting Groups in Organic Chemistry" ("Захисні групи в органічній хімії"), Plenum Press, New York, N.Y., 1973, розділ 2. Функція захисної групи полягає в захисті функціональності вільної аміногрупи ($-NH_2$) під час наступних реакцій по (S)-амінокислоті, що не зможуть протікати в потрібному напрямку, якщо аміногрупа, прореагувавши, виявиться до деякої міри задіяною, що суперечить необхідності для наступних реакцій наявності вільної аміногрупи, або якщо вільна аміногрупа буде втручатися в протікання реакції. Коли необхідність у захисній групі відпадає, її видаляють добре знайомими фахівцям способами. Фахівцям у даній області відомо, що, по визначенню, захист для аміногрупи повинен видалятися легко за відомими методиками. Придатні захисні групи для амінофункції обрані з групи, що складається з трет-бутоксикарбоніла, бензилоксикарбоніла, форміла, тритила, ацетила, трихлорацетила, хлорацетила, трифторацетила, дифторацетила, фторацетила, 4-фенілбензилоксикарбоніла, 2-метилбензилоксикарбоніла, 4-етоксибензилоксикарбоніла, 4-фторбензилоксикарбоніла, 3-хлорбензилоксикарбоніла, 2-хлорбензилоксикарбоніла, 2,4-дихлорбензилоксикарбоніла, 4-бромбензилоксикарбоніла, 3-бромбензилоксикарбоніла, 4-нітробензилоксикарбоніла, 4-ціанобензилоксикарбоніла, 2-(4-хсеніл)ізопропоксикарбоніла, 1,1-дифеніл-1-ілоксикарбоніла, 1,1-дифенілпроп-1-ілоксикарбоніла, 2-фенілпроп-2-ілоксикарбоніла, 2-(п-толуіл)проп-2-ілоксикарбоніла, циклопентанілоксикарбоніла, 1-метилциклопентанілоксикарбоніла, циклогексанілоксикарбоніла, 1-метилциклогексанілоксикарбоніла, 2-метилциклогексанілоксикарбоніла, 2-(4-толуілсульфоніл)етоксикарбоніла, 2-(метилсульфоніл)етоксикарбоніла, 2-(трифенілфосфіно)етоксикарбоніла, флуоренілметоксикарбоніла, 2-(триметилсиліл)етоксикарбоніла, алілоксикарбоніла, 1-(триметилсилілметил)проп-1-енілоксикарбоніла, 5-бензізоксалілметоксикарбоніла, 4-ацетоксибензилоксикарбоніла, 2,2,2-трихлоретоксикарбоніла, 2-етиніл-2-пропоксикарбоніла, циклопропілметоксикарбоніла, 4-(децилоксил)бензилоксикарбоніла, ізоборнілоксикарбоніла, 1-піперидилоксикарбоніла, 9-флуоренілметилкарбоната, $-CH=CH=CH_2$ чи феніл-

C (=N)-H. Переважно, щоб захисними групами були трет-бутоксикарбоніл (BOC) і бензилоксикарбоніл (CBZ), більш переважна як захисна група трет-бутоксикарбоніл. Фахівець зуміє визначити переважні способи введення трет-бутоксикарбонільної чи бензилоксикарбонільної захисних груп, а додаткову інформацію можна одержати, керуючись книгою T.W.Green і P.G.M. Wuts "Protective Groups in Organic Chemistry" ("Захисні групи в органічній хімії"), John Wiley and Sons, 1991.

Захищену (S)-амінокислоту (II) перетворюють у відповідно захищені (S)-сполуки (III), спочатку перетворивши захищену (S)-амінокислоту (II) у відповідний алкіловий ефір загальноприйнятими методами, наприклад, реакцією з діазосполученням. Проміжний ефір далі взаємодіє з відомим карбаніонним нуклеофілом, наприклад, з металоорганічною сполукою, отриманою взаємодією сполуки формули $X_1-C(R_2)(R_3)-X_1$ із сильною основою металу, де в ході реакції відбувається обмін галоген-метал і де $-X_1$ являє собою галоген, обраний із групи, що складається з хлору, бромов чи йоду. Додаток такого карбаніонного нуклеофіла до проміжного ефіру приводить до утворення захищеної (S)-сполуки (III). Прийнятні основи включають, не вичерпуючи переліком, алкіловий, включаючи, наприклад, втор-бутиловий, н-бутиловий і трет-бутиловий. Переважно, щоб реакції проходили при низькій температурі, наприклад, при -78° . Прийнятні реакційні умови включають проведення реакції в присутності інертних розчинників чи їхньої суміші, наприклад, не вичерпуючи переліком, в ефірі, тетрагідрофурані чи їхній суміші. Якщо R_2 і R_3 є воднем, приклади $X_1-C(R_2)(R_3)-X_1$ включають дибромметан, диіодметан, хлоріодметан, броміодметан і бромхлорметан. Фахівцю відомі переважні умови проведення такої реакції. Крім того, якщо R_2 і/чи R_3 не є $-H$, то в результаті додатка $-C(R_2)(R_3)-X_1$ до ефірів захищеної (S)-амінокислоти (II) для одержання захищеної (S)-сполуки (III) у продукт буде введений додатковий хіральний центр, за умови що R_2 і R_3 різні.

Захищені (S)-сполуки (III) далі відновлюють до відповідного спирту (IV) за відомими методиками відновлення кетонів. Реагенти й умови реакцій відновлення захищеної (S)-сполуки (III) до відповідного спирту (IV) включають, наприклад, боргідрид натрію, боргідрид літію, боран, гідрид діізобутилалюмінія й алюмогідрид літію. Переважним відновником є боргідрид натрію. Відновлення проводять протягом від 1 години до 3 днів при температурі від $-78^\circ C$ до температури кипіння реакційної суміші. Переважно проводити відновлення в інтервалі температур приблизно від $-78^\circ C$ до $0^\circ C$. Боран може використовуватися у виді комплексу, наприклад, боран-метилсульфідного комплексу, боран-піперидинового комплексу чи боран-тетрагідрофуранового комплексу. Фахівцям відомі переважні сполучення відновників і прийнятні реакційні умови; див., наприклад, Larock, R.C. у книзі Comprehensive Organic Transformations (Повні органічні перетворення), VCH Publishers, 1989. Відновлення захищеної (S)-сполуки (III) до відповідного спирту (IV) продукує другий хіральний центр (третій хіральний центр, якщо замісники R_2 і R_3

різні). При відновленні захищеної (S)-сполуки (III) утвориться суміш енантіомерів по іншому центру, (S, R/S)-спирт (IV). Цю оптичну суміш далі розділяють відомими методами, такими як селективна низькотемпературна перекристалізація чи хроматографічний розподіл, наприклад, за допомогою ВЕРХ, використовуючи продажні хіральні стаціонарні фази. Енантіомером, що використовують далі в процесі за Схемою А, є (S,S)-спирт (IV), оскільки саме цей оптичний ізомер є попередником необхідного біологічно активного антиальцгеймеровського (S,R)-аміну (X).

У результаті відомої внутрішньомолекулярної реакції (S,S)-спирту (IV) утвориться відповідний епоксид (V). Стереохімія атома вуглецю, зв'язаного з групою -ОН у сполуці (IV), зберігається в епоксиді (V). Переважні умови реакції включають взаємодію сполуки (IV) з такою основою, як, наприклад, але не вичерпуючи переліком, гідроксид натрію, гідроксид калію, гідроксид літію тощо. Умови реакції включають використання в якості розчинників C_1 - C_6 -спиртів; переважним є етанол. Також може застосовуватися загальний співрозчинник, такий як, наприклад, етилацетат. Реакції переважно проводять при температурі в інтервалі від -45°C до температури кипіння реакційної суміші; переважний інтервал температур від -20°C до 20 - 25°C .

Епоксид (V) далі взаємодіє з відповідним чином заміщеним С-кінцевим аміном, $R_c\text{-NH}_2$ (VI) у відомих умовах з розкриттям епоксиду й утворенням оптично чистого захищеного (S,R)-спирту (VII). Захищені С-кінцеві аміни $R_c\text{-NH}_2$ (VI), використані в даному винаході, є комерційно доступними чи знайомі фахівцям і можуть бути легко отримані з відомих сполук. Крім того, якщо R_c є фенілом, переважно, щоб він був заміщений за 3- чи 3,5-положеннях.

Придатні реакційні умови розкриття епоксиду (V) полягають у проведенні реакції в органічних, переважно, інертних розчинниках. Переважними є C_1 - C_6 -спирти, а найбільш переважний ізопропіловий спирт. Реакції можуть протікати при температурі приблизно від 20 - 25°C до температури кипіння реакційної суміші, переважно, при температурі приблизно від 50°C до температури кипіння реакційної суміші. Якщо заміщеним С-кінцевим аміном (VI) є 1-аміно-3,5-цис-диметилциклогексилдикарбоксилат, його переважно одержувати в такий спосіб. В апараті високого тиску до диметил-5-аміноізофталату в оцтовій кислоті і метанолі додають родій на алюмінії. Апарат заповнюють воднем під тиском 55 псі і струшують протягом тижня. Потім суміш фільтрують через шар діатомової землі і тричі промивають метанолом, розчинник відганяють при зниженому тиску (при нагріванні) до одержання концентрату. Концентрат розтирають з ефіром, знову фільтрують і одержують необхідний С-кінцевий амін (VI). Якщо заміщеним С-кінцевим аміном (VI) є 1-аміно-3,5-цис-диметоксициклогексан, його одержують за наведеною вище загальною методикою з незначними змінами, але виходячи з 3,5-диметоксианіліна. Якщо заміщеним С-кінцевим аміном (VI) є амінометильна група, у якій замісник при метильній групі являє собою арильну групу,

наприклад, $\text{NH}_2\text{-CH}_2\text{-R}_{\text{C-арил}}$, і $\text{NH}_2\text{-CH}_2\text{-R}_{\text{C-арил}}$ не є продажним реактивом, його більш переважно одержувати в такий спосіб. Придатною вихідною сировиною буде арилальна сполука (відповідним чином заміщена). На першій стадії здійснюють бромовання алкільного замісника за відомими методиками, див., наприклад, Larock, R.C. у книзі *Comprehensive Organic Transformations* (Повні органічні перетворення), VCH Publishers, 1989, стор. 313. Далі алкілгалогенід взаємодіє з азидом з одержанням арил(алкіл)азиду. І, нарешті, отриманий азид відновлюють до відповідного аміну в системі водень/катализатор і одержують С-кінцевий амін (VI) формули $\text{NH}_2\text{-CH}_2\text{-R}_{\text{C-арил}}$. С-кінцеві аміни (VI) із придатними функціональними групами легко можуть бути отримані фахівцями з відомих літературних методик з незначними змінами. Добірка літературних посилань включає 1) Calderwood, et al., *Tet. Lett.*, 1997, 38, 1241, 2) Ciganek, J. *Org. Chem.*, 1992, 57, 4521, 3) Thurkauf, et al., *J. Med. Chem.*, 1990, 33, 1452, 4) Werner, et al., *Org. Syn., Coll. Vol.* 5, 273, 5) *J. Med. Chem.*, 1999, 42, 4193, 6) *Chem. Rev.* 1995, 95, 2457, 7) *J. Am. Chem. Soc.*, 1986, 3150, 8) Felman et al., *J. Med. Chem.*, 1992, 35, 1183, 9) *J. Am. Chem. Soc.* 1970, 92, 3700, 10) *J. Med. Chem.*, 1997, 40, 2323.

Схема В розкриває альтернативний спосіб синтезу оптично чистого захищеного (S,R)-спирту (VII) із захищеної (S)-сполуки (III). Відповідно до цього способу, захищена (S)-сполука (III) взаємодіє з відповідним чином заміщеним С-кінцевим аміном (VI) у переважних реакційних умовах, викладених вище, з утворенням захищеного (S)-кетона (XI) який відновлюють у переважних умовах, описаних вище, і одержують захищений (S,R)-спирт (VII).

Схема С розкриває альтернативний спосіб синтезу оптично чистого захищеного (S,R)-спирту (VII) з епоксиду (V). Епоксид (V) взаємодіє з азидом з утворенням оптично чистого захищеного (S,R)-азиду (XII) у відомих реакційних умовах, див. наприклад, J. March, "Advanced Organic Chemistry", 3rd Edition, John Wiley & Sons Publisher, 1985, стор. 380. Захищений (S,R)-азид (XII) відновлюють до захищеного аміну (XIII) за відомими методиками відновлення азидогрупи в присутності трет-бутоксикарбонільної N-захисної групи, наприклад, каталітичним гідруванням. Фахівцям також відомі альтернативні умови відновлення, що можуть бути використані щоб уникнути зняття N-захисної групи, відмінної від трет-бутоксикарбонільної, див. наприклад, Larock, R.C. у книзі *Comprehensive Organic Transformations* (Повні органічні перетворення), VCH Publishers, 1989, стор. 409.

У захищеній (S,R)-сполуці (XIII) знімають захист за відомими методиками зняття захисту з аміногрупи й одержують (S,R)-амін (VII). Прийнятні реакційні умови для зняття захисту з аміногрупи залежать від типу захисної групи. Наприклад, переважну захисну групу (BOC) бажано видаляти взаємодією захищеного (S,R)-спирту (VII) із сумішшю кислоти й органічного розчинника, наприклад, із сумішшю трифтороцтова кислота/дихлорметан, одержуючи протоновану сіль (S,R)-аміну (VII). При необхідності (S,R)-амін (VII) може бути очищений відомими фахівцям метода-

ми, наприклад, перекристалізацією. Вільний (S,R)-амін (VII) може бути отриманий способами, відомими фахівцям, такими, як, наприклад, синтез вільного аміну взаємодією солі в м'яких лужних умовах. Додаткові умови зняття ВОО-захисту, а також умови зняття інших захисних груп можна знайти в роботі T.W. Greene і P.G.M. Wuts у книзі "Protective Groups in Organic Synthesis" ("Захисні групи в органічному синтезі"), John Wiley and Sons, 1991, стор. 309. Типові хімічно прийнятні солі включають трифторацетат, хлорид, сульфат, фосфат; переважними є трифторацетат і фосфат.

(S,R)-Амін (VIII) взаємодіє з відповідним чином заміщеним ацилюючим агентом (IX), таким як ангідрид, ацилгалогенід чи кислота, формули $(R_{N-1}-X_N)_2O$ чи $R_{N-1}-i-X_N-X_2$ чи $R_{N-1}-i-X_N-OH$ у реакційних умовах, відомих фахівцям у даній області, з утворенням заміщеного (S,R)-аміну (X). Опис умов реакції, відомих фахівцям, можна знайти, наприклад, у Larock, R.C. у книзі Comprehensive Organic Transformations (Повні органічні перетворення), VCH Publishers, 1989, стор. 981,979 і 972.

R_N переважно обраний із групи, що складається з:

$R_{N-1}-X_N$ - , де X_N являє собою CO, R_{N-1} означає R_N -арил чи R_N -гетероарил, де R_N -арил означає феніл, у якому замісники знаходяться в 1,-3-положенні, і де R_N -арил і R_N -гетероарил заміщені одним замісником -CO-NR_{N-2}R_{N-3},

$R_{N-1}-X_N$ - , де X_N являє собою CO, R_{N-1} означає R_N -арил чи R_N -гетероарил, де R_N -арил є фенілом, заміщеним 1 групою C₁-алкіл, де замісники у фенільному кільці знаходяться в 1,3,5-положеннях, і де R_N -арил і R_N -гетероарил заміщені одним замісником -CO-NR_{N-2}R_{N-3},

$R_{N-1}-X_N$ - , де X_N являє собою CO, R_{N-1} означає R_N -гетероарил, де R_N -гетероарил заміщений однією групою -CO-NR_{N-2}R_{N-3}. Переважно, щоб R_{N-2} і R_{N-3} були однаковими й означали C₃-алкіл,

$R_{N-1}-X_N$ - , де X_N являє собою CO, R_{N-1} означає R_N -арил, де R_N -арил заміщений однією групою -CO-NR_{N-2}R_{N-3}, де замісники у фенільному кільці знаходяться в 1,3-положеннях,

$R_{N-1}-X_N$ - , де X_N являє собою CO, R_{N-1} означає R_N -арил, де R_N -арил являє собою феніл, заміщений 1 групою C₁-алкіл і однією групою -CO-NR_{N-2}R_{N-3}, де замісники у фенільному кільці знаходяться в 1,3,5-положеннях. X_N переважно являє собою (A) -CO- і (B) -SO₂; більш переважно, щоб X_N був -CO-. X_2 обраний із групи, що складається з -Cl, -Br; більш переважно, щоб X_2 був -Cl.

Фахівцям відомі ацилюючі агенти $(R_{N-1}-X_N)_2O$ чи $R_{N-1}-X_N-X_2$ чи $R_{N-1}-X_N-OH$ (IX), що є продажними реактивами чи можуть бути легко отримані з відомих вихідних сполук за описаними у літературі методиками. Переважними ацилюючими агентами є похідні ізофталевої кислоти (IX) формули $R_{N-2}R_{N-3}N-CO$ -феніл-CO- чи похідні метилізофталевої кислоти (IX) формули $R_{N-2}R_{N-3}N-CO-(CH_3)$ -феніл-CO-, де заміщення являє собою 5-метил-1,3-ізофталеву кислоту. Найбільш переважним похідним 5-метил-1,3-ізофталевої кислоти є 3-[(N,N-дипропіламіно)карбоніл]-5-метилбензойна кислота (IX). Такі сполуки переважно синтезувати в такий спосіб. Ефір, переважно, монометилловий ефір ізофталевої кислоти чи метил-5-метил-1,3-

ізофталат, розчиняють в органічному розчиннику чи в суміші органічних розчинників, переважно, у суміші ТГФ/ДМФА. 1,1'-Карбонілдіімідазол додають при температурі близько 20-25°C. Додають переважний амін (H-NR_{N-2}R_{N-3}). Після перемішування протягом приблизно від 1 години до 24 годин при температурі приблизно від 20°C до температури кипіння реакційної суміші реакційну масу розподіляють між насиченим водяним розчином хлориду амонію й органічним розчинником, що не змішується з водою, наприклад, етилацетатом. Водяний шар відокремлюють і двічі екстрагують додатковою кількістю органічного розчинника. Органічні екстракти поєднують і промивають насиченим водяним розчином бікарбонату і сольовим розчином, і сушать над безводним сульфатом натрію чи сульфатом магнію. Осушувач відфільтровують і після відгону розчинників при зниженому тиску одержують цільовий метилловий ефір $R_{N-2}R_{N-3}N-CO$ -феніл-CO-O-CH₃ чи ацилюючий агент метилізофталевої кислоти (IX) $R_{N-2}R_{N-3}N-CO-(CH_3)$ -феніл-CO-O-CH₃. Очищення (метилового) ефіру можна проводити, наприклад, за допомогою хроматографії на силікагелі, елюючи сумішшю етилацетата і гексана як рухливу фазу. Ізофталевий ефір чи метилізофталевий ефір моноалкіл- чи диалкіламіда обробляють водяним розчином луку, наприклад, гідроксидом літію, у мінімальній кількості суміші ТГФ/метанол/вода і перемішують 3-24 години при температурі від 20°C до температури кипіння реакційної суміші. Далі розчинники відганяють при зниженому тиску і продукти розподіляють між водою і розчинником, що не змішується з водою, наприклад, етилацетатом. Якщо утворення емульсії утрудняє поділ двох фаз, для полегшення поділу додають невелику кількість сольового розчину. Водяну фракцію однократно екстрагують додатковою кількістю розчинника, що не змішується з водою, наприклад, етилацетата. Потім водяну фракцію підкислюють додаванням кислоти, переважно, соляної кислоти, до величини pH. Отриману суміш тричі екстрагують розчинником, що не змішується з водою, наприклад, етилацетатом. Об'єднані органічні фракції сушать над безводним сульфатом натрію чи магнію. Осушувач відфільтровують і після відгону розчинника при зниженому тиску одержують продукт. Моно- чи диалкіламіди ізофталата/метилізофталата взаємодіє з (S,R)-аміном (VIII) з утворенням заміщеного (S,R)-аміну (X).

Якщо обидва замісники R_{N-2} і R_{N-3} є H, переважним буде наступний спосіб. Ефір, переважно, метилловий ефір ізофталата чи метил-5-метил-1,3-ізофталат, розчиняють в органічному чи розчиннику суміші органічних розчинників, переважно, у суміші ТГФ/ДМФА. CDI додають при температурі близько 20-25°C. Через 5-30 хвилин через суміш барботують газоподібний аміак протягом 1 години. Під час барботування аміаку суміш прохолоджують приблизно до 0°C. Реакційну масу залишають перемішуватися приєднаної до балона з аміаком протягом ночі при температурі близько 20-25°C, після чого розподіляють між насиченим водяним розчином хлориду амонію і розчинником, що не змішується з водою, наприклад, етилацетатом. Фази розділяють і водяну фазу двічі екстрагують

етилацетатом. Органічні фракції промивають насиченими водяними розчинами бікарбонату і сольовим розчином і сушать над безводним сульфатом натрію чи магнію. Осушувач відфільтровують і після відгону розчинників при зниженому тиску одержують ефір цілловий ізопфталевої кислоти чи похідне ізопфталевої кислоти - ацилюючий агент (IX). Очищення (метилового) ефіру можна проводити, наприклад, за допомогою хроматографії на силікагелі, еліюючи сумішшю ізопропанол/хлороформ. Ізопфталевий чи ефір метилізопфталевий ефір первинного аміду обробляють водяним розчином луку, таким як гідроксид літію, у суміші ТГФ/метанол/вода і перемішують протягом ночі при температурі близько 20–25°C, після чого розчинники відганяють при зниженому тиску, а твердий залишок розподіляють між водою і розчинником, що не змішується з водою, наприклад, етилацетатом. Якщо утворення емульсії утрудняє поділ двох фаз, для полегшення поділу додають невелика кількість сольового розчину. Водяну фракцію відокремлюють і екстрагують розчинником, що не змішується з водою, наприклад, етилацетатом. Потім водяну фракцію підкисляють кислотою, переважно, соляною кислотою, до величини рН Отриману суміш екстрагують етилацетатом. Об'єднані органічні фракції сушать над безводним сульфатом чи натрію магнію. Осушувач відфільтровують і після відгону розчинника при зниженому тиску одержують продукт. Похідне аміду ізопфталевої кислоти взаємодіє зі сполукою (VIII) з утворенням сполуки (X).

Якщо потрібно, щоб амінофункція була частиною циклічної системи, наприклад, морфолініла, піперазиніла, піперидиніла і піролідиніла і т.д., переважно буде використовуватись наступний спосіб. Ефір, переважно, метиловий ефір ізофталевої кислоти чи метил-5-метил-1,3-ізофталат розчиняють у безводному розчиннику, наприклад, хлористому метилени, і додають невелику кількість дипольярного апротонного розчинника, наприклад, ДМФА. Суміш охолоджують приблизно до 0°C і додають оксалілхлорид. Реакційну масу перемішують при температурі близько 0°C протягом приблизно від 30 хвилин до 2 годин, після чого при зниженому тиску відганяють розчинники. Технічний твердий хлорид кислоти залишають у вакуумі на ніч, після чого розчиняють у сухому метилени і охолоджують приблизно до 0°C перед додаванням циклічного аміну і основи третинного аміну, наприклад, N-метилпіперидина. Реакційну масу перемішують при температурі близько 0°C протягом приблизно від 1 до 6 годин, після чого при зниженому тиску відганяють розчинники. Залишок розбавляють водою і розчинником, що незмішується з водою, наприклад, етилацетатом, і розділяють фази. Водяну фракцію екстрагують розчинником, що не змішується з водою, наприклад, етилацетатом і об'єднані органічні екстракти промивають насиченим водняним розчином бікарбонату і сушать над безводним сульфатом натрію чи магнію. Осушувач отфільтровують і після відгону розчинників при зниженому тиску одержують продукт - циклічний амід. Циклічний амід обробляють водняним розчином лугу, наприклад, гідроксидом літію, у суміші ТГФ/метанол/вода і перемішують протягом ночі

при температурі близько 20-25°C, після чого розчинники відганяють при зниженому тиску, а твердий залишок розподіляють між водою і розчинником, що не змішується з водою, наприклад, етилацетатом. Водяну фракцію екстрагують етилацетатом. Після видалення води при зниженому тиску одержують цільовий циклічний амід (IX).

Якщо група R_{N-1} у цільовому продукті є вуглецевим кільцем, наприклад, але не вичерпуючи переліком, циклогексаном, вихідним реагентом може бути диметилізоптатат, що містить відповідні функціональні групи, тоді за допомогою одного зі способів, зазначених у літературі (Meyers, A.I., Org. Syn., 1971, 51, 103), можна відновити шестичленне кільце такими відновниками, як родій (5%) на алюмінії в присутності оцтової кислоти і метанол в атмосфері азоту, до відповідного диметилциклогександикарбоксилата.

На Схемі D представлений альтернативний спосіб синтезу заміщеного (S,R)-аміну (X) із захищеного (S,R)-азиду (XII), що одержують з відповідного епоксиду за Схемою С. Знімають захист з аміногрупи й одержують відповідний незахищений азид (XIV) по методиках, описаними раніше в Схемі А для перетворення захищеного (S,R)-спирту (VII) у відповідний (S,R)-амін (VIII). Потім незахищений (S,R)-азид (XIV) ацилюють по азоту й одержують відповідний (S,R)-азид (XV). Далі азидну функцію відновлюють, як обговорювалося вище при перетворенні захищеного (S,R)-азиду (XII) у відповідний захищений (S,R)-амін (XIII), і одержують вільний (S,R)-амін (XVI). Нарешті, вільний (S,R)-амін (XVI) перетворюють у відповідний заміщений (S,R)-амін (X) алкілюванням по азоту сполуками формули R_c-X_3 з утворенням відповідного захищеного (S,R)-аміну (X). X_3 означає відповідну групу, що іде, таку як, не вичерпуючи переліком, Cl, -Br, -I, -O-мезилат, -O-тозилат, -O-трифлат і так далі. Крім того, X_3 може бути альдегідною функцією; відповідна взаємодія зі сполукою (XVI) для добре відомою методом відновлення дає заміщений (S,R)-амін (X).

Крім того, даним винаходом представлені також карбоциклічні амідоутворюючі агенти (IX). Наприклад, карбоциклічні амідоутворюючі агенти формули



R'-CH-C(R'')(R''')-CH-X_N-OH (IX) легко виходять з відомих вихідних сполук способами, описаними в літературі і відомими фахівцям, див. наприклад, J. Med. Chem., 1998, 41, 1581, J. Org. Chem., 2000, 65, 1305. Мається на увазі, що замість карбонової кислоти можна легко використовувати ацилгалогенід, у якому галогенід переважно означає хлорид, або придатну групу для одержання змішаного ангідриду; ці методи зазначені на Схемі А. Додатковим посібником при одержанні карбоциклів може служити робота M.P. Doyle, M.A. McKervery; T. Ye Modern Catalytic Methods for Organic Synthesis with Diazo Compounds From Cyclopropanes to Ylides (Методи каталізу в органічному синтезі з використанням діазосполучень від циклопропанів до ілідів), Wiley-Interscience, 1998, стор. 163-279.

Схеми E, F, G і 3 розкривають різні способи

одержання групи R_N заміщеного аміну (X), де фенільне кільце 1,3-дизамещеної групи R_N , -CO-феніл-CO-, далі заміщають по 5-положенню різними групами, такими як аміді, нітрили, галогеніди й аміни. Такі сполуки одержують за відомими методиками. Хімізм кожної реакції відомий фахівцям. Новизна тут полягає в порядку проходження стадій процесу і/чи в конкретних використаних реагентах. Фахівцю, якому потрібно одержати конкретну сполуку, звичайно відоме хоча б один спосіб одержання цільового продукту з відомих вихідних реагентів. Отже, подальше обговорення не є необхідним, але може послужити додатковою допомогою тим, хто зацікавиться синтезом сполук винаходу.

Схема Е розкриває альтернативні способи перетворення аніліну (XVII) чи ефіру кислоти (XVIII) у відповідну кислоту (IX-XXIII). Один зі способів починається з продажного аніліну (XVII). Анілін (XVII) спочатку обробляють діазотуючим агентом, таким як нітрит чи натрію калію, у мінеральній кислоті, а потім джерелом галогену-іона, таким як галогенід міді (II) чи галогенід лужного металу, чи органічним діазотуючим агентом, таким як алкілнітрит у сильній кислоті, такий як оцтова кислота чи трифтороцтова кислота з наступною обробкою джерелом галогену-іона, таким як галогенід міді (II) чи галогенід лужного металу, і одержують ефір галогенокислоти (XIX).

Чи ж, ефір кислоти (XVIII) обробляють N-галогенсукцинімідом і трифторметансульфоновою кислотою й одержують ефір галогенокислоти (XIX). Ефір галогенокислоти (XIX) потім перетворюють в амідоефір (XXI), використовуючи первинний чи вторинний амін формули $H-NGL_2$, де G_1 і G_2 є однаковими чи різними чи можуть бути зациклизовані. Замісники G_1 і G_2 стають частиною заміщеного аміну (X) і включаються у визначення замісника R_N . R_N включає $R_{N-1}-X_N$, де зв'язування, $-X_N$, означає -CO-, а R_{N-1} означає $R_{N-арил}$. По визначенню $R_{N-арил}$ включає феніл (-феніл), необов'язково заміщений одним чи двома амідями:

-CO-NR_{N-2}R_{N-3} і

-CO-R_{N-4}.

Чи ж, ефір галогенокислоти (XIX) за відомими методиками перетворюють в ефір хлорангідріда галогенокислоти (XX). Фахівцю зрозуміло, що можуть бути також використані й інші галогенангідріди кислот. Дигалогенефір (XX) обробляють первинним чи вторинним аміном формули $H-NGL_2$ і одержують амідоефір (XXI). Далі амідоефір взаємодіє з аміном в атмосфері монооксида вуглецю в присутності паладієвого каталізатора за методом, наприклад, розглянутому Heck (Palladium Reagents in Organic Synthesis (Реактиви паладія в органічному синтезі), 1985, стор. 342-365) з утворенням діаміда (XXII). Гідроліз ефірної частини діаміда (XXII) за добре відомими методиками дає діамід кислоти (XXIII).

На Схемі F представлений альтернативний підхід до проміжного діаміду (XXII) виходячи з продажного фенолу (XXIV). Фенол (XXIV) обробляють трифторметансульфоновим агентом, таким як ангідрид трифторметансульфонової кислоти, і одержують трифлат (XXV). Трифлат реагує в умовах каталізу паладієм у присутності монооксида вуглецю й аміну формули $H-NR_{N-альфа}R_{N-бета}$ (аміна),

аналогічно перетворенню амідоефіра (XXI) у відповідний діамід (XXII) за схемою Е, з утворенням діефіра (XXVI). Діефір (XXVI) гідролізують відомими способами й одержують одноосновну кислоту (XXVII). Одноосновну кислоту (XXVII) далі перетворюють у діамід (XXII) у тих же умовах, що використовувалися для перетворення ефіру галогенокислоти (XIX) в амідоефір (XXI) на схемі Е.

Схема G розкриває інший підхід до одержання амідоефіра (XXI). Реакція починається з продажною нітросполукою (XXVIII), що конденсують з (аміном) за відомими методиками конденсації й одержують нітроамід (XXX). Нітроамід (XXX) також може бути отриманий первісною обробкою нітросполуки (XXVIII) такими реагентами, як тионілхлорид, чи ДМФА й оксалілхлорид, або іншими відомими способами, з одержанням хлористого ацила (XXIX), що далі при обробці (аміном) дає нітроамід (XXX). Відновлення нітроаміда (XXX) за відомими методиками (див. наприклад, Smith і March, Advanced Organic Chemistry, 5th ed.) дає аміданілін (XXXI). Далі аміданілін (XXXI) обробляють діазотуючим агентом, таким як нітрит чи натрію калію, у мінеральній кислоті, і потім джерелом галогену-іона, таким як галогенід міді (II) чи галогенід лужного металу, чи органічним діазотуючим агентом, таким як алкілнітрит у сильній кислоті, такий як оцтова чи кислота трифтороцтова кислота з наступною обробкою джерелом галогену-іона, таким як галогенід міді (II) чи галогенід лужного металу, і одержують амідоефір (XXI).

Схема 3 розкриває спосіб одержання діаміда кислоти (IX-XXIII) з амідоефіра (XXI), де амід є незаміщеним і являє собою -CO-NH₂. Цей спосіб починається з ефіру чи з кислоти, наприклад, амідоефір (XXI) обробляють ціанідом міді (I) (CuCN) у N-метилпіролідіноні чи ДМФА, більш переважно, у N-метилпіролідіноні, і одержують нітрил (XXXII). Нітрил (XXXII) перетворюють у первинний амід (XXXIII), використовуючи комплекс сечовина-перекис водню (див. Synth. Commun. (1993) 3149) чи методики, описані в роботах Synth. Commun. (1990) 1445, Synth. Commun. (1997) 3119, J. Org. Chem. (1992) 2521, Tet. Lett. (1996) 6555, Ind. J. Chem., Sect. B, (1999) 974, Tet. Lett. (1995) 3469, Tet. Lett. (1998) 3005 і ін. При використанні амідоефіра (XXI) у формі ефіру для перетворення діамідоефіра (XXXIII) у діамід кислоти (IX-XXIII) вводять додаткову стадію гідролізу, використовуючи гідроксид літію, гідроксид натрію, гідроксид калію, гідроксид барію чи інші методики гідролізу, відомі фахівцям.

Схема I розкриває альтернативний шлях синтезу заміщеного аміну (X) із захищеного спирту (VII), при якому використовується дизахищений напівпродукт (XXXVI), у якому атом азоту, приєднаний до замісника R_c , захищений. Використовуючи спосіб Схеми I, монозахищений спирт (VII) взаємодіє з новою захисною групою з утворенням ортогонально захищеної сполуки (XXXIV). Це є загальною стратегією, що використовується в традиційній хімії пептидів, див. наприклад, M. Bodansky, Principles of Peptide Chemistry (Принципи хімії пептидів). Якщо монозахищений спирт (VII) захищений CBZ, його можна обробити або (BOC)₂O у хлористому метилені чи аналогічному

органічному розчиннику, або FMOC-Cl у хлористому метилени чи аналогічному органічному розчиннику з утворенням ортогонально захищеної сполуки (XXXIV). Далі групу CBZ видаляють гідруванням у присутності каталітичних кількостей паладія на вугіллі в спиртовому розчиннику, такому як метанол, чи в етилацетаті, або при каталізі паладієм на вугіллі в спиртових розчинниках у присутності форміату амонію, як відомо фахівцям. У результаті виходить захищена сполука R_c-N (XXXV). Аналогічно, якщо монозахищений спирт (VII) захищений BOC, він може взаємодіяти з CBZ-Cl в умовах реакції Шотена-Баумана чи з CBZ-OSu у ТГФ для одержання сполуки (XXXIV). Потім BOC-захист можна зняти соляною кислотою (4 N) у метанолі, етанолі чи діоксані, чи трифтороцтовою кислотою в хлористому метилени, або іншими способами, такими як описані в роботі The Peptides, Analysis, Synthesis, Biology (Пептиди. Аналіз, синтез, біологія), Vol. 3, Ed. E. Gross and J. Meienhofer (1981) для вивільнення R_c-N-сполуки (XXXV), захищеної групою CBZ. Подібні маніпуляції з функціональною групою дозволяють здійснювати різні перетворення на шляху від сполуки (VII) до сполук (XXXIV) і (XXXV), що є очевидним для фахівця в даній області. Коли відповідним чином R_c-N- захищена сполука (XXXV) взаємодіє з амідотворюючим агентом (IX) у кислій формі в стандартних умовах пептидної взаємодії, наприклад, EDC/HOBt у хлористому метилени чи ДМФА, чи у формі попередньо активованої кислоти, (R_N)₂O, утвориться відповідна RN-заміщена R_c-N-захищена сполука (XXXVI). Просте зняття захисту з RN-заміщеної R_c-N-захищеної сполуки (XXXVI) приводить далі до необхідного заміщеного аміну (X). Таким чином, якщо RN-заміщена R_c-N-захищена сполука (XXXVI) захищена групою BOC, обробка соляною кислотою (4N) у діоксані чи іншими реагентами, про які йшла мова вище, приводить до заміщеного аміну (X). Якщо RN-заміщена R_c-захищена N-сполука (XXXVI) захищена групою CBZ, обробка воднем під тиском 10-50 пси в спиртових розчинниках, таких як метанол, з каталітичною кількістю паладія на вугіллі буде давати, після обробки, необхідний заміщений амін (X). Аналогічно, якщо RN-заміщена R_c-N-захищена сполука (XXXVI) захищена групою FMOC, обробка вторинним аміном, переважно піперидином (10%) чи диетиламіном (10%), в інертному розчиннику, такому як, наприклад, хлористий метилен, приведе після обробки до необхідного захищеного аміну (X).

Схема J розкриває спосіб одержання сполук, у яких фенільне кільце RN-замісника, -CO-феніл-CO-, заміщене по 5-положенню сульфонамідною групою. Синтез починається з галогенованого амідоефіра (XXI, Схема E), що взаємодіє з нітритом натрію, діоксидом сірки, хлоридом міді (II) і оцтовою кислотою за методом, описаному в J. Med. Chem., 42, 3797 (1999) з одержанням сульфонілхлориду (XXXVII). Сульфонілхлорид (XXXVII) далі взаємодіє з аміном, як описано вище, за відомою методикою з утворенням відповідного сульфонаміда (XXXVIII). Сульфонамід (XXXVIII) перетворюють у відповідну сульфамідну кислоту (XXXIX) відомими способами, такими як з використанням гідроксида літію, гідроксида натрію, гідроксида

калію, гідроксида барію чи іншими відомими методами гідролізу.

Схема K показує, як можна одержувати RN-замісники, де R_N являє собою R_{N-1}-X_N-, де X_N означає -CO-, а R_{N-1}- означає R_N-арил, де R_N-арил являє собою феніл, заміщений однією алкільною групою й однією групою -CO-NR_{N-2}R_{N-3} чи -CO-R_{N-4}. Див. приведені вище обговорення Схеми E, що стосуються аміну формули H-NR_{N-альфа}R_{N-бета} (амін), використаного для утворення RN-замісників амідоефіра (XXI), що далі взаємодіє з алкільбороною кислотою, що містить необхідну алкільну групу, у присутності паладієвого каталізатора, такого як Pd(PPh₃)Cl₂ за загальною методикою, описаною в журналі J. Med. Chem., 4288, (2000). Алкільборонові кислоти мають у продажі чи можуть бути синтезовані за методикою, описаною в журналі J. Am. Chem. Soc., 60, 105, (1938). Переважно, щоб R_{N-b} означав бром. На цій стадії утвориться алкільовий ефір (XL), що далі гідролізують за відомою методикою з утворенням необхідної алкількислоти (XLI).

Схема L розкриває спосіб одержання амідотворюючого агента (IX - XLVII), де RN-замісник являє собою R_{N-1}-X_N-, де зв'язування, -X_N-, означає -CO-, а R_{N-1}- означає R_N-арил і де R_N-арил являє собою феніл (-феніл), заміщений групами:

C₁-C₆-алкіл, необов'язково заміщений 1, 2 чи 3 замісниками, обраними з групи, що складається з C₁-C₃-алкілу,), -F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, -C≡N, -CF₃, C₁-C₃-алкокси, NR_{1-a}R_{1-b}, де R_{1-a} і R_{1-b} - як визначено вище, і N(H і C₁-C₃-алкіл)-CO-R_{N-5}. Цей конкретний амідотворюючий агент (IX - XLVII) одержують з фенілнітросполуки (XLI), що відновлюють до відповідної фенілнітрогідроксисполуки (XLIII), використовуючи боран-метилсульфід чи боран у ТГФ. Фенілнітрогідроксисполуку (XLIII) відновлюють за відомою методикою, використовуючи водень і паладієвий каталізатор, до відповідної феніламіногідроксисполуки (XLIV).

Феніламіногідроксисполука (XLIV) взаємодіє з альдегідом у присутності відновника, такого як цианоборгідрид чи натрію триацетоксиборгідрид натрію з утворенням фенілу, заміщеного аміногідроксисполукою (XLV). Феніл, заміщений аміногідроксисполукою (XLV), гідролізують, використовуючи гідроксид лужного металу, потім підкисляють і одержують амідотворюючий агент (IX - XL VII). Амідотворюючий агент (XL VII) далі зв'язують з аміном (VIII), використовуючи методики, відомі фахівцям, а також методики, що обговорювалися раніше, такі як з використанням діетилціанофосфоната, і одержують заміщений амін (X). Наступна обробка заміщеного аміну (X) діетилціанофосфонатом дає заміщений амін, у якому гідроксиалкільний замісник у фенільному кільці заміщений фосфатною групою.

Схема M розкриває спосіб одержання амідотворюючих агентів (IX - L), де RN-замісник являє собою R_{N-1}-X_N-, де зв'язування, -X_N-, означає -CO-, а R_{N-1}- означає R_N-арил, і де R_N-арил являє собою феніл (-феніл), заміщений 2 групами. Перший замісник, до якого звичайно відноситься положення "5-", може бути або:

R_N-арил, або

R_N-гетероарил. Другий замісник, до якого зви-

чайно відноситься положення "3-", може бути або:

-CO-NR_{N-2}R_{N-3}, або

-CO-R_{N-4}. Обидва замісники RN-альфа і RN-бета включають нециклічні аміді, -CO-NR_{N-2}R_{N-3} і циклічні аміді -CO-R_{N-4}, де R_{N-2}, R_{N-3} і R_{N-4} - як визначений у формулі винаходу. Спосіб починається з тризаміщеного фенолу (XLVIII), у якому R_{N-d} означає Cl, -Br, -I чи -O-трифлат. Обробка арил- чи гетероарилбороновою кислотою або ефіром гетероарил- чи арилборонової кислоти, такими як (арил- чи гетероарил)-B(OH)₂ чи (арил- чи гетероарил)-B(OR^a)(OR^b) (де R^a і R^b означають нижчий алкіл, тобто C₁-C₆, чи узяті разом, R^a і R^b означають нижчий алкілен, тобто C₂-C₁₂) у присутності металевого каталізатора з чи підставою без нього в інертному розчиннику дає (XLIX). Металеві каталізатори для даного перетворення включають, не вичерпуючи переліком, солі фосфінові чи комплекси Cu, Pd чи Ni (наприклад, Cu(OAc)₂, PdCl₂(PPh₃)₂, Ni(PPh₃)₂). Основи можуть включати, не вичерпуючи переліком, карбонати лужноземельних металів, бікарбонати лужноземельних металів, гідроксиди лужноземельних металів, карбонати лужних металів, бікарбонати лужних металів, гідроксиди лужних металів, гідриди лужних металів (переважний гідрид натрію), алкохолати лужних металів (переважні метилат натрію чи етилат натрію), гідриди лужноземельних металів, діалкіламіди лужних металів (переважний діізопропіламід літію), біс(триалкілсиліл)аміді лужних металів (переважний біс(триметилсиліл)амід натрію), триалкіламіни (переважні діізопропіленамін чи триетиламін) чи ароматичні аміни (переважний піридин). Інертні розчинники можуть включати, не вичерпуючи переліком, ацетонітрил, діалкілові ефіри (переважний діетиловий ефір), циклічні ефіри (переважні тетрагідрофуран чи 1,4-діоксан), N,N-діалкілацетаміді (переважний диметилацетамід), N,N-діалкілформаміді (переважний диметилформамід), діалкілсульфоксиди (переважний диметилсульфоксид), ароматичні вуглеводні (переважні бензол чи толуол) чи галогеналкани (переважний хлористий метилен). Переважні величини температури реакції лежать в інтервалі від кімнатної температури до температури кипіння використаного розчинника. Реакції можуть проводитися в стандартному скляному посуді чи в одній з багатьох наявних у продажі рівнобіжних установок для синтезу. Комерційно недоступні боронові кислоти чи ефіри боронових кислот, як описано в статті в журналі Tetrahedron, 50, 979-988 (1994), можуть бути отримані з відповідних довільно заміщених арилгалогенідів. Напівпродукт (XLIX) далі гідролізують, використовуючи гідроксид лужного металу, наприклад, гідроксид літію, натрію чи калію, потім підкидують і одержують сполучені арил- чи гетероарилкислоти (IX-L). Чи ж, як описано в журналі Tetrahedron, 50, 979-988 (1994), можна перетворити R_{N-d} у відповідну боронову кислоту чи в ефір боронової кислоти, (OH)₂B- чи (OR^a)(OR^b)B-, і одержати ті ж самі продукти, описані вище, обробкою відповідним арил- чи гетероарилгалогенідом чи трифлатом.

Схема N розкриває спосіб одержання амідотворюючих агентів (IX - LII), де RN-замісник являє собою R_{N-1}-X_N-, де зв'язування, -X_N-, означає -CO-,

а R_{N-1}- означає R_N-арил, і де R_N-арил являє собою фенол (-феніл), заміщений 2 групами. Перший замісник, до якого звичайно відноситься положення "5-", є -C≡C-R. Другий замісник, до якого звичайно відноситься положення "3-", може бути або -CO-NR_{N-2}R_{N-3}, або -CO-R_{N-4}. Галогеноефір (XXI) обробляють сумішшю PdCl₂(PPh₃)₂ і триметилсилілацетиленом за відомими методиками і одержують ацетиленовий ефір (LI). Ацетиленовий ефір (LI) далі гідролізують гідроксидом лужного металу, потім підкидують і одержують ацетиленову кислоту (IX - LII).

Схеми O і O' розкривають способи одержання амідотворюючих агентів (IX - LX) і (IX - LXIII) з витягнутою метиленовою групою, де RN-замісник являє собою R_{N-1}-X_N-, де зв'язування, -X_N-, означає -CO-, а R_{N-1}- означає R_N-арил, і де R_N-арил являє собою фенол (-феніл), заміщений 2 групами. Замісник, до якого звичайно відноситься положення "3-", може бути або -CO-NR_{N-2}R_{N-3}, або -CO-R_{N-4}. Відповідно до способу, зображеному на Схемі O, замісником у 5-положенні є -CH₂CO-NH₂, а відповідно до способу Схеми O', замісником у 5-положенні є -CH₂C≡N. Вихідний діефір кислоти (LIII) відновлюють бораном у таких розчинниках, як ТГФ, і одержують відповідний спиртовий діефір (LIV). Спиртовий діефір (LIV) перетворюють у відповідний бромований діефір (LV), використовуючи такі бромуючі агенти, як PBr₃, CBr₄ чи інші відомі галогенуючі агенти.

Атом бромованого діефіра (LV) далі заміщають ціанідом і одержують відповідний нітрил (LVI). Відповідно до Схеми O', нітрил (LVI) потім гідролізують до відповідного ціаноефіра (LXI). Ціаноефір (LXI) далі обробляють H-NR_{N-d}R_{N-b} (аміном), як описано вище, використовуючи відомі методики, і одержують відповідний ціанамід (LXII). Далі ціанамід (LXII) гідролізують до відповідної ціанокислоти (IX - LXIII), що, у свою чергу, взаємодіє з аміном (VIII) з утворенням заміщеного аміну (X). Якщо замісником у витягнутої метальної групи є -CO-NH₂, використовують спосіб, зображений на Схемі O. У цьому випадку нітрил (LVI) перетворюють у відповідний амінодіефір (LVII) за відомими методиками. Наступні стадії є такими ж, як і для Схеми O': амінодіефір (LVII) гідролізують до відповідного амінофіра (LVIII), що далі перетворюють у відповідний діамід ефір а (LIX), що гідролізують до відповідного діаміда кислоти (IX - LX). Діамід кислоти (IX - LX) потім обробляють придатним аміном (VIII) і одержують заміщений амін (X).

Схема C розкриває спосіб одержання амідотворюючих агентів (IX - LXVII) з витягнутої гідроксиметиленової групи, де RN-замісник являє собою R_{N-1}-X_N-, де зв'язування, -X_N-, означає -CO-, а R_{N-1}- означає R_N-арил, і де R_N-арил являє собою фенол (-феніл), заміщений 2 групами. Замісник, до якого звичайно відноситься положення "3-", може бути або -CO-NR_{N-2}R_{N-3} або -CO-R_{N-4}. Спосіб починається з галогенаміда (LXIV), переважно, іодаміда, що перетворюють у відповідний альдегід (LXV), а потім у відповідний спирт (LXVI) за методикою, описаною в журналі Synth. Commun. 28, 4270 (1998), при необхідності зі змінами, відомими фахівцям. Гідроліз спирту (LXVI) гідроксидами лужних металів з наступним підкисленням дає необхідну окси-

кислоту (IX - LXVII). Оксикислоту (IX - LXVII) далі обробляють придатним аміном (VIII) і одержують цільовий заміщений амін (X).

Схема Q розкриває спосіб одержання амідотворюючих агентів (IX - LXXII) з алкільною групою чи атомом галогену чи аміногрупою у 5-положенні, де R_N -замісник являє собою $R_{N-1}-X_N$, де зв'язування, $-X_N$, означає $-CO-$, а R_{N-1} означає $R_{N-арил}$, і де $R_{N-арил}$ являє собою феніл (-феніл), заміщений 2 групами. Замісник, до якого звичайно відноситься положення "3-", може бути або $-CO-NR_{N-2}R_{N-3}$, або $-CO-R_{N-4}$. Спосіб починається з відповідним чином заміщеної по 5-положенню двоосновної кислоти (LXVIII), що етерифікують відомими способами й одержують відповідний діефір (LXIX). Діефір (LXIX) далі гідролізують гідроксидами лужних металів і після підкислення одержують відповідну одноосновну кислоту (LXX). Чи ж, одноосновна кислота (LXX) може бути отримана безпосередньо з двоосновної кислоти (LXVIII) за відомими методиками. Далі одноосновна кислота (LXVIII) взаємодіє з $H-NR_{N-альфа}R_{N-бета}$ (аміном) з утворенням відповідного амідоефіра (LXXI). Амідоефір (LXXI) потім гідролізують гідроксидами лужних металів і після підкислення одержують відповідний амід кислоти (IX - LXXII).

Схема R розкриває загальний спосіб одержання амідотворюючих агентів (IX - LXXVII), що містять, наприклад, алкільну групу в 5-положенні і кетонну функцію в 3-положенні. Такі кислоти (IX - LXXVII) одержують виходячи з кислоти (LXXIII), що за відомими методиками перетворюють у відповідний галогенангідрид (LXXIV). Переважним галогенангідридом кислоти (LXXIV) є хлорангідрид. Галогенангідрид кислоти (LXXIV) у присутності броміду міді (I) і тетрагідрофурану при температурі в інтервалі від $-78^{\circ}C$ до $0^{\circ}C$ обробляють реактивом Гриньяра (арил-Mg-X чи алкіл-Mg-X, де X означає $-Cl$ чи $-Br$) і одержують кетоефіри (LXXVI і LXXVI'). Багато реактивів Гриньяра мають в продажі; інші синтезують за відомими методиками. Альтернативний спосіб одержання кетоефірів (LXXVI, LXXVI') полягає в синтезі амиду Вейнреба (LXXV) або безпосередньо з кислоти (LXXIII), або використовуючи галогенангідрид кислоти (LXXIV) з наступною обробкою H,N -диметилгідроксиламіном з утворенням амиду Вейнреба (LXXV), що далі обробляють реактивом Гриньяра за відомими методиками. Далі кетоефіри гідролізують гідроксидами лужних металів, підкислюють і одержують кетокислоти (LXXVII, LXXVII').

Схема S розкриває різні способи видозміни R_N -групи заміщеного аміну (X), де фенільне кільце R_N -групи, крім того, заміщене по 3-положенню різними групами, такими як арил і гетероарил. Такі сполуки одержують за відомими методиками. Хімізм кожної реакції добре знайомий фахівцям у даній області. Новизна тут полягає в порядку проходження стадій і/чи в конкретних використаних реагентах. Фахівцю, якому потрібно одержати конкретну сполуку, звичайно відомий хоча б один спосіб одержання цільового продукту з відомих вихідних реагентів. Тому приведені нижче пояснення не є необхідними, але можна припустити, що вони виявляться корисними тим, хто зацікавиться синтезом сполук винаходу.

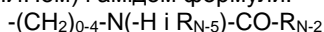
На Схемі S представлений загальний спосіб, використаний у винаході для одержання заміщених амінів (X), де $R_N = R_{N-арил}R_{N-арил}X_N$ чи $R_{N-гетероарил}R_{N-арил}X_N$. Обробкою (S,R)-аміну (VIII) амідотворюючим агентом (IX) за методиками, приведеними вище, де у випадку Схеми S R_{N-1} означає $Br-R_{N-арил}$, одержують відповідний заміщений (S,R)-амін (X), де R_N - означає $Br-R_{N-арил}X_N$. Наступна обробка арилбороною кислотою чи ефіром арилборонової кислоти, таким як (арил- чи гетероарил)- $B(OH)_2$ чи (арил- чи гетероарил)- $B(OR^a)(OR^b)$ (де R^a і R^b означають нижчий алкіл, тобто C_1-C_6 , чи узяті разом, R^a і R^b означають нижчий алкілен, тобто C_2-C_{12}) у присутності металевого каталізатора з основою чи без неї в інертному розчиннику дає заміщений (S,R)-амін (X), де R_N - означає $N_{R-арил}N_{R-арил}X_N$ [м.б., помилка? А д.б. $R_{N-арил}R_{N-арил}X_N$?] чи $R_{N-гетероарил}R_{N-арил}X_N$. Металеві Каталізатори ДЛЯ таких перетворень включають, не вичерпуючи переліком, солі фосфінові чи комплекси Cu , Pd чи Ni (наприклад, $Cu(OAc)_2$, $PdCl_2(PPh_3)_2$, $Ni(PPh_3)_2$). Основи можуть включати, не вичерпуючи переліком, карбонати лужноземельних металів, бікарбонати лужноземельних металів, гідроксиди лужноземельних металів, карбонати лужних металів, бікарбонати лужних металів, гідроксиди лужних металів, гідриди лужних металів (переважний гідрид натрію), алкоколяти лужних металів (переважні метилат натрію чи етилат натрію), гідриди лужноземельних металів, диалкіламіди лужних металів (переважний діізопропіламід літію), біс(триалкілсиліл)аміди лужних металів (переважний біс(триметилсиліл)амід натрію), триалкіламіни (переважні діізопропілетиламіни чи триетиламіни) чи ароматичні аміни (переважний піридин). Інертні розчинники можуть включати, не вичерпуючи переліком, ацетонітрил, диалкілові ефіри (переважний диетиловий ефір), циклічні ефіри (переважні тетрагідрофуран чи 1,4-діоксан), H,N -диалкілацетаміди (переважний диметилацетамід), H,N -диалкілформаміди (переважний диметилформамід), диалкілсульфоксиди (переважний диметилсульфоксид), ароматичні вуглеводні (переважні бензол чи толуол) чи галогеналкани (переважний хлористий метилен). Переважні величини температури реакції лежать в інтервалі від кімнатної температури до температури кипіння використаного розчинника. Реакції можуть проводитися в стандартному скляному посуді чи в одній з численних наявних у продажі рівнобіжних установок для синтезу. Комерційно недоступні боронові кислоти чи ефіри боронових кислот, як описано в статті в журналі Tetrahedron, 50, 979-988 (1994), можуть бути отримані з відповідних довільно заміщених арилгалогенідів.

Якщо викладена вище хімія є несумісною з іншим функціональними групами, що є в заміщеному (S,R)-аміні (X), де R_N означає $Br-R_{N-арил}X_N$, то цілком очевидно, що буде потрібно інший порядок чергування сполучених стадій. Наприклад, обробка відповідним чином заміщеного амідотворюючого агента (IX) $R_{N-1}X_N-OH$, де R_{N-1} означає $Br-R_{N-арил}$, бороною кислотою чи ефіром боронової кислоти в описаних вище умовах приведе до відповідним чином заміщеного амідотворюючого агента (IX), де R_{N-1} означає $N_{R-арил}N_{R-арил}$ чи $R_{N-гетероарил}N_{R-арил}$.

гетероарил- R_N -арил- X_N . При обробці амідотворюючого агента (IX), де R_{N-1} означає $N_{R-арил}-N_{R-арил}$ чи R_N -гетероарил- R_N -арил- X_N , (S,R)-аміном (VIII) виходять ті ж заміщені аміни (X), про які йшла мова в Схемі S.

Приведені вище для Схеми S приклади не лімітовані в хімічному відношенні. Крім бром у прийнятну групу може бути йод чи трифлат. Чи ж, як описано в статті журналу *Tetrahedron*, 50, 979-988 (1994), $Br-R_N$ -арил можна перетворити у відповідну боронову кислоту чи ефір боронової кислоти, $(OH)_2B-R_N$ -арил чи $(OR^a)(OR^b)B-R_N$ -арил, і одержати ті ж продукти, що описано вище, обробкою придатним арил- чи гетероарилгалогенідом чи трифлатом. Крім того, в описаній вище хімії кожен замісник $-R_N$ -арил чи $-R_N$ -гетероарил у кожному випадку є взаємозамінним.

Схема Ф розкриває спосіб одержання амідотворюючих агентів (IX - LXXIX), де R_N -замісник являє собою $R_{N-1}-X_N$, де зв'язування, $-X_N$, означає $-CO-$, а R_{N-1} означає R_N -арил, і де R_N -арил являє собою феніл, заміщений групою $-CO-NR_N$ -альфа R_N -бета (АМИНОМ) і амідом формули:



Спосіб починається з амиду аніліну (XXXI), що взаємодіє з відповідним галогенангідридом кислоти чи сульфонілхлоридом, або з ангідридом кислоти чи сульфонілангідридом з утворенням відповідного амідоефіра (LXXVIII). Прийнятні розчинники включають тетрагідрофуран чи дихлорметан при температурі в інтервалі від $-78^{\circ}C$ до $100^{\circ}C$. Амідоефір (LXXVIII) далі гідролізують до відповідного амиду кислоти (IX - LXXIX) за відомими методиками. При взаємодії амідотворюючого агента (IX - LXXIX) з відповідним аміном (VIII) утвориться необхідна сполука (X).

Схема U розкриває загальний спосіб одержання різних С-кінцевих амінів (VI) за допомогою синтезу С-кінцевого аміну (LXXXIV). Способи одержання амінів такого типу мають на увазі успішне використання відомих методик, або інформацію про їхнє одержання можна знайти в наступній літературі: 1) JACS, 1970, 92, 3700 і 2) патент US 4351842.

Схема V додатково розкриває загальні способи одержання різних С-кінцевих амінів (VI) за допомогою одержання С-кінцевих амінів (LXXXIX). Численні гетероциклічні карбонові кислоти чи хлорангідриди кислот є продажними реагентами. При необхідності карбонова кислота (LXXXV) може бути перетворена в хлорангідрид кислоти (LXXXVI) за допомогою таких реагентів, як, не вичерпуючи переліком, тіонілхлорид. У результаті заміщення аміаком утворюються загальновідомі проміжні аміді (LXXXVII), що легко можуть бути відновлені до амінів (VI - LXXXIX) за допомогою різних методик, розглянутих раніше. Як альтернативу, комерційно доступними є інші гетероарильні сполуки, такі як галогенметил (LXXXVII), при обробці аміаком яких також утворюються цільові С-кінцеві аміни (VI - LXXXVIII).

Схема W розкриває загальні способи одержання С-кінцевих амінів, що містять тіазоліл, за допомогою одержання С-кінцевих амінів (LXXXI). На Схемі W представлений синтез тіазолів; ці процедури досить добре вивчені в літературі і є мо-

дифікацією методик, описаних у роботах: Mashraqui, SH; Keehn, PM. J. Am. Chem. Soc, 1982, 104, 4461-4465. Заміщені 5-амінометилтіазолі (XCI) одержували з 5-гідроксиметилтіазола (XC) за методикою, описаною в роботі Alterman et al., J. Med.Chem., 1998, 41, 3782-3792. BCI інші тіазольні аналоги перетворювали за Схемою W у гідроксиметильні похідні з наступним перетворенням в амінометильні похідні за методикою Альтермана без значних змін.

Схема X розкриває загальні способи одержання С-кінцевих амінів, що містять ізоксазоліл, за допомогою одержання С-кінцевих амінів (XCII). Синтез похідних ізоксазола являв собою модифікацію методики, описаної в роботі Felman. SW et al. J. Med. Chem., 1992, 35, 1183-1190, з незначними змінами для одержання цільових сполук. Попередники заміщеного гідроксиламіна були синтезовані за методикою, вивченою Bousquet, EW. Org. Synth. Coll. Vol. II, 313-315. Комерційно доступний пропаргиламин може бути захищений за допомогою цілого ряду відомих методів (Див., Green, TW; Wuts PGM. Protective Groups in Organic Synthesis ("Захисні групи в органічному синтезі"), 3rd Ed. New York: John Wiley, 1999, глава 7), переважною захисною групою є БОС. Заміщені пропаргіламіни можуть бути отримані, використовуючи ряд загальновідомих методик.

Схема X розкриває загальний підхід до синтезу гідроксиетиламінів, один вуглецевий атом основ яких разом із групами R_2 і R_3 утворюють кільце. Зрозуміло, що винахід також враховує гетероатом, включений у кільце. У короткому викладі синтез сполук, у яких замісники R_2 і R_3 можуть утворювати кільце, починають з альдегіду відповідним чином захищеної амінокислоти і різновиду циклоалкілітія, що обидва є продажними чи реагентами для який відомі способи їхнього одержання. У загальному виді використана методика також описана в літературі, наприклад, у роботі Klump. Et al., J. Am. Chem. Soc, 1979, 101, 7065, і передбачається, що зробивши незначні зміни, можна синтезувати цільові сполуки, представлені Схемою Y. При взаємодії альдегіду відповідним чином захищеної амінокислоти і циклоалкілітія утворюється спирт (XCIII). Ці реакції проводять в інертному розчиннику, такому як, наприклад, тетрагідрофуран чи диетилловий ефір. Оптимальним є проведення реакції при низьких температурах, наприклад, нижче $0^{\circ}C$. Карбонілювання за методикою Клумпа приводить до кислоти (XCIV), що далі піддають реакції Курціуса чи схожим процедурам, добре відомим фахівцям, і одержують первинний амін (XCV). Первинні аміни (XCV) можуть бути 3-кінцевими в умовах, описаних на Схемах C і D, з наступним зняттям захисту з атома азоту і завершенням N-термінально в умовах, описаних на Схемі A.

Сполуки даного винаходу можуть містити геометричні або оптичні ізомери, а також таутомери. Таким чином, даний винахід включає всі таутомери і чисті геометричні ізомери, як-от E- і Z-геометричні ізомери, а також їхні суміші. Крім того, даний винахід включає чисті енантіомери і діастереоізомери, а також їхні суміші, включаючи рацемічні суміші. Індивідуальні геометричні ізомери, енантіомери або діастереоізомери можуть бути

одержані або виділені способами, відомими в даній галузі.

Сполуки даного винаходу зі стереохімією, вказаною у формулі X, можуть бути включені в суміші, включаючи рацемічні суміші, з іншими енантіомерами, діастереоізомерами, геометричними ізомерами або таутомерами. Вміст сполук даного винаходу зі стереохімією, вказаною у формулі X, звичайно в цих сумішах складає понад 50%. Бажаніше, щоб вміст сполук даного винаходу зі стереохімією, вказаною у формулі X, складав у цих сумішах понад 80%. Найкраще, щоб вміст сполук даного винаходу зі стереохімією, вказаною у формулі X, складав у цих сумішах понад 90%.

Сполуки винаходу є амінами, які при взаємодії з кислотами утворюють солі. Фармацевтично прийнятні солі кращі за відповідні (S,R)-заміщені аміни формули (X) і заміщені аміни з циклічним R_N (X'), оскільки являють собою сполуки, краще розчинні у воді, стабільніші й/або в більшому ступені кристалічні. Фармацевтично прийнятними є будь-які солі, що зберігають активність основного компонента і не завдають жодної шкоди або не мають небажаного впливу на суб'єкт, якому вони введені, й за тих умов, за яких вони введені. Фармацевтично прийнятні солі включають кислотні адитивні солі як неорганічних, так і органічних кислот. Кращі фармацевтично прийнятні солі включають солі таких кислот: оцтової, аспарагінової, бензолсульфонової, дикарбонової, дисірчаної, дивинної, масляної, кальцієву Сіль етилендіамінтетраоцтової кислоти, солі камфілової кислоти, вугільної, хлорбензойної, лимонної, етилендіамінтетраоцтової, 1,2-етандисульфонової, лаурилсульфонової, етансульфонової, етансульфінової, мурашиної, фумарової, глюкогептоневої, глюконової, глутамінової, гліколіларсанілової, гексамової, гексилрезорцинової, гідрабамової, бромистоводневої, хлористоводневої, йодистоводневої, гідроксинафтоїної, ізетіонової, молочної, лактобіонової, малеїнової, яблучної, малонової, мигдальної, метансульфонової, метилазотної, метилсірчаної, слизової, муконової, 2-нафталінсульфонової, азотної, щавлевої, n-нітрометансульфонової, памової, пантотенової, фосфорної, гідрофосфорної, дигідрофосфорної, фталевої, полігалактуронової, пропіонової, саліцилової, стеаринової, бурштинової, сульфамінової, сульфанілової, сульфонової, сірчаної, дубильної, винної, 8-хлортеофілінової і толуолсульфофосфатної. Приклади інших прийнятних солей див. *Int. J. Pharm.*, 33,201-217 (1986) і *J. Pharm. Sci.*, 66(1), 1, (1977).

Способи винаходу

Сполуки винаходу та їхні фармацевтично прийнятні солі використовують для лікування людей або тварин, що страждають на стани, які характеризуються патологічною формою амілоїдного бета-пептиду, як-от: бета-амілоїдні бляшки, включаючи попередження або уповільнення початку такого стану. Зокрема, сполуки й композиції винаходу особливо придатні для лікування або попередження хвороби Альцгеймера. Для лікування або попередження таких захворювань сполуки винаходу можуть бути використані окремо або в поєднанні, залежно від того, що краще для пацієнта.

В даному контексті термін "лікування" означає, що сполуки винаходу можуть використовуватися для людей, яким поставлений принаймні попередній діагноз захворювання. Сполуки винаходу будуть стримувати або уповільнювати розвиток захворювання, тим самим забезпечуючи пацієнту повноцінніше життя.

Термін "попередження" означає, що сполуки даного винаходу можуть застосовуватися пацієнтами, яким на момент призначення ліків не поставлений можливий діагноз захворювання, але в котрих звичайно очікується розвиток захворювання або які схильні до ризику захворювання. Сполуки винаходу послаблятимуть прояв симптомів захворювання, уповільнюватимуть його початок або цілком попереджуватимуть розвиток захворювання в пацієнта. Попередження також включає введення сполук винаходу тим пацієнтам, що можуть бути схильні до захворювання через вік, С₁мейний анамнез, генетичні або хромосомні аномалії й/або через наявність одного або більше біологічних маркерів захворювання, як-от відома генетична мутація APP або продукти розщеплення APP у тканинах або рідинах головного мозку.

Для лікування або попередження вищезгаданих захворювань сполуки винаходу вводять у терапевтично ефективній кількості. Як відомо фахівцям у даній галузі, терапевтично ефективна кількість буде різнитися залежно від конкретної використаної сполуки й способу введення.

Крім того, сполуки даного винаходу також можуть використовуватися разом з інгібіторами Р-глікопротеїну (Р-гр). Фахівцям відомо про використання інгібіторів Р-гр. Див., наприклад, *Cancer Research*, 53, 4595-4602 (1993), *Clin. Cancer Res.*, 2, 7-12 (1996), *Cancer Research*, 56, 4171-4179 (1996), Міжнародні публікації WO99/64001 і WO01/10387. Важливо, щоб рівень інгібітору Р-гр у крові був таким, щоб він інгібував Р-гр виходячи зі зниження рівня сполук даного винаходу в крові головного мозку. З цією метою інгібітор Р-гр і сполуки винаходу можна вводити одночасно однаково або різноманітними способами, або в різний час. Важливий не час введення, а наявний ефективний рівень інгібітору Р-гр у крові.

Прийнятні інгібітори Р-гр включають циклоспорин А, верапаміл, тамоксифен, гуїнідин, вітамін Е-TGPS, ритонавір, мегестролацетат, прогестерол, рапаміцин, 10,11-метанодибензосуберан, фенотіазини, похідні акридину, як-от GF120918, FK506, VX-710, LY335979, PSC-833, GF-102918 та інші стероїди. Слід розуміти, що з'являться ще агенти, що мають таку саму дію, що також можуть виявитися прийнятними.

Інгібітори Р-гр можна вводити перорально, парентерально, (в/в, в/м, депо-в/м, п/к, депо-п/к), місцево, під'язиково, ректально інтраназально, інтратекально й у вигляді імплантантів.

Терапевтично ефективна кількість інгібіторів Р-гр складає приблизно від 0,1 до 300мг/кг/день, краще приблизно від 0,1 до 150 мг/кг на день. Зрозуміло, що оскільки пацієнт може починати з однієї дози, дозування може змінитися з часом у міру зміни стану пацієнта.

Спеціалістам відомо, що при пероральному застосуванні інгібітори Р-гр можна вводити у ви-

гляді звичайних лікарських форм для перорального використання. Такі лікарські форми включають звичайні тверді одиниці лікарської форми у вигляді таблеток і капсул, а також рідкі лікарські форми, як-от розчини, суспензії й еліксири. При використанні твердих лікарських форм бажано, щоб вони були препаратами уповільненого вивільнення, оскільки інгібітори Р-гр необхідно приймати тільки раз або двічі на день. Пероральні лікарські форми призначають пацієнтам від одного до чотирьох разів на день. Бажано, щоб інгібітори Р-гр вводилися тричі на день або рідше, краще - раз або двічі на день. Отже, переважно, щоб інгібітори Р-гр застосовувалися у вигляді твердої лікарської форми і, крім того, переважно, щоб тверда лікарська форма була препаратом уповільненого вивільнення, що дозволяє дозування раз або двічі на день. Поза залежністю від використаної лікарської форми, переважно, щоб у ній був передбачений захист інгібіторів Р-гр від кислого середовища шлунка. Спеціалістам добре відомі таблетки, покриті ентросолюбильною оболонкою. Крім цього, спеціалістам також відомі капсули, заповнені невеличкими сферами, покритими оболонкою для захисту від кислого середовища шлунка.

Крім того, інгібітори Р-гр можна вводити парентерально. Парентеральне введення може бути в/в, в/м, депо-в/м, п/к або депо-п/к.

Інгібітори Р-гр можна застосовувати сублінгвально. При такому способі введення інгібітори Р-гр варто приймати від одного до чотирьох разів на день у тій самій кількості, що і при в/м введенні.

Інгібітори Р-гр можна застосовувати інтраназально. Фахівцям відомо, що при такому способі введення придатними лікарськими формами є назальний спрей або сухий порошок. Дозування інгібіторів Р-гр при інтраназальному введенні є таким самим, що й при в/м введенні.

Інгібітори Р-гр можна застосовувати інтратекально. Спеціалістам відомо, що при такому способі введення придатною лікарською формою може бути лікарська форма для парентерального введення.

Інгібітори Р-гр можуть застосовуватися місцево. При такому способі використання придатною лікарською формою є крем, мазь або пластр. Через кількість інгібітору Р-гр, що має бути введена, пластр є кращим. Проте кількість, що її слід нанести на пластр, обмежена. Тому можуть знадобитися два або більше пластрів. Спеціалістам відомо, що кількість і розмір пластрів не мають значення, важливо, щоб була доставлена терапевтично ефективна кількість інгібіторів Р-гр.

Спеціалістам відомо, що інгібітори Р-гр можуть вводитися ректально у вигляді супозиторію.

Як відомо спеціалістам у даній галузі, інгібітори Р-гр можуть застосовуватися у вигляді імплантантів.

Не існує жодних нових способів введення або лікарських форм для введення інгібіторів Р-гр. Якщо заданий конкретний інгібітор Р-гр і необхідна лікарська форма, спеціаліст у цій галузі зуміє приготувати відповідну лікарську форму для інгібітору Р-гр.

Спеціалісту має бути очевидно, що точна доза й частота прийому залежатимуть від конкретних

уведених сполук винаходу, конкретного стану, тяжкості захворювання, віку, ваги, загального фізичного стану даного пацієнта й іншої лікарської терапії, що їй може піддаватися пацієнт, що добре відомо лікарям, які спеціалізуються в цій галузі.

Лікарські форми й кількості

Сполуки винаходу можуть уводитися перорально, парентерально, (в/в, в/м, депо-в/м, п/к, депо-п/к), сублінгвально, інтраназально (інгалаційно), інтратекально, місцево або ректально. Для доставки сполук винаходу до ділянки дії підходять відомі спеціалістам лікарські форми.

Подано композиції, що містять терапевтично ефективну кількість сполук винаходу. Краще, щоб сполуки були оформлені у вигляді прийнятних фармацевтичних препаратів, як-от таблетки, капсули або еліксири для перорального застосування або стерильні розчини або суспензії для парентерального введення. Як правило, фармацевтичні композиції з описаних вище сполук готують, використовуючи добре відоме обладнання й методики.

Приблизно від 1 до 500 мг сполуки або суміші сполук винаходу або фізіологічно прийнятної солі або ефіру змішують із фізіологічно прийнятними розчинниками, носієм, наповнювачем, зв'язувальною речовиною, консервантом, стабілізатором, ароматичним і смаковим агентом тощо для одержання одиниці лікарської форми, як передбачено узвичаєною фармацевтичною практикою. Кількість активної субстанції в цих композиціях або препаратах беруть таку, щоб утворювалася відповідна доза в зазначеному інтервалі. Бажано, щоб композиції були оформлені у вигляді одиниці лікарської форми і кожна доза містила приблизно від 2 до 100 мг, краще, - приблизно від 10 до 30 мг активного інгредієнта. Термін "одиниця лікарської форми" стосується окремих фізичних одиниць, використовуваних як одинична доза для людей або інших ссавців, кожна одиниця містить заздалегідь визначену кількість активної речовини, необхідну для одержання необхідного бажаного ефекту, разом із придатним фармацевтичним наповнювачем.

Для одержання композицій одну або більше сполук винаходу змішують із придатним фармацевтично прийнятним носієм. Утворена в результаті змішування або додавання сполуки(сполук) суміш може мати вигляд розчину, суспензії, емульсії тощо. Як фармацевтично прийнятні носії можуть використовуватися ліпосомальні суспензії. Їх можна приготувати відомими методами. Вигляд утвореної суміші залежить від низки чинників, що включають очікуваний спосіб введення і розчинність сполуки у вибраному носії або розчиннику. Ефективна концентрація є достатньою для зменшення або поліпшення принаймні одного симптому захворювання, розладу або стану, і може бути визначена емпірично.

Фармацевтичні носії або розчинники, що підходять для введення поданих тут сполук, включають будь-які відомі спеціалістам носії, прийнятні для конкретного способу введення. Крім того, активні речовини також можуть бути змішані з іншими активними речовинами, що не послаблюють необхідного впливу, або з речовинами, що доповнюють необхідний вплив, або мають інший ефект. Сполуки можуть бути приготовлені у вигляді ком-

позиції з єдиним фармацевтично активним інгредієнтом або можуть бути об'єднані з іншими активними інгредієнтами.

Для сполук з недостатньою розчинністю можуть бути використані способи збільшення розчинності. Такі способи відомі і включають, не вичерпуючись переліком, застосування співрозчинників, як-от диметилсульфоксид (ДМСО), застосування поверхнево-активних речовин, як-от Tween®, і розчинення у водному розчині бікарбонату. Для приготування ефективних фармацевтичних композицій також можуть використовуватися похідні сполук, як-от солі або про-ліки.

Концентрація сполуки ефективна для доставки введеної кількості, що приводить до зменшення або поліпшення щонайменше одного симптому розладу, через який вводять сполуку. Звичайно композиції готують для введення разової дози.

Сполуки винаходу можуть бути приготовлені разом із носіями, що захищають їх від швидкого виведення з організму, як, наприклад, рецептури з хронометрованим вивільненням з оболонки. Такі носії включають рецептури з регульованим вивільненням, як-от, не вичерпуючись переліком, мікрокапсульовані системи доставки. Активну сполуку вміщують у фармацевтично прийнятний носій у кількості, достатній для створення терапевтичного впливу без небажаних побічних ефектів у хворого. Для конкретного захворювання терапевтично ефективна концентрація може бути визначена емпірично тестуванням сполук *in vitro* та *in vivo* на відомих модельних системах.

Сполуки або композиції винаходу можуть бути вміщені в упаковки, що містять одну або декілька доз. Упаковані сполуки й композиції можуть бути подані в комплектах, наприклад, що включають складові частини, які можна об'єднувати для використання. Наприклад, сполука-інгібітор у ліпофілізованій формі і придатний розріджувач можуть бути подані як окремі компоненти, що їх слід об'єднати перед використанням. У комплект може входити сполука-інгібітор і ще один терапевтичний агент для спільного введення. Інгібітор і другий терапевтичний агент можуть бути подані як окремі складові частини. В комплект може входити декілька упаковок, кожна з яких містить одну або більше одиниць доз сполуки винаходу. Краще, щоб упаковки були адаптовані для необхідного способу введення і включали, не обмежуючись переліком, таблетки, желатинові капсули, капсули уповільненого вивільнення тощо для перорального введення; продукти пролонгованої дії, попередньо заповнені шприци, ампули, флакони тощо для парентерального введення; а також пластири, медичні прокладки, креми тощо для місцевого застосування. Концентрація активної сполуки в лікарській композиції залежатиме від швидкостей абсорбції, інактивування й екскреції активної сполуки, схеми застосування і введеної кількості, а також від інших чинників, відомих фахівцям.

Активний інгредієнт може бути введений відразу або бути розділений на декілька зменшених доз, призначених для введення з інтервалами в часі. Очевидно, що точне дозування і тривалість лікування залежать від конкретного захворювання і можуть бути визначені емпірично, використовуючи

чи відомі протоколи дослідів, або екстраполяцією тестових даних *in vivo* або *in vitro*. Необхідно відзначити, що концентрації і розміри доз також можуть варіюватися залежно від тяжкості захворювання. Крім того, слід розуміти, що для кожного окремого пацієнта конкретну схему прийому лікарського засобу з часом варто регулювати відповідно до індивідуальної потреби й фахового висновку людини, що вводить або спостерігає за введенням композицій, і що наведені вище інтервали концентрації є лише приблизними і не призначені для обмеження об'єму або практичного застосування патентованих композицій.

При пероральному введенні сполука має бути подана у вигляді композиції, яка б захищала її від кислого середовища шлунка. Наприклад, композиція може бути покрита ентросолюбільною оболонкою, що зберігає цілісність композиції в шлунку і вивільняє активну сполуку в кишечнику. Композиція також може бути приготовлена в поєднанні з антацидом або іншим подібним інгредієнтом.

Композиції для перорального введення включатимуть, головним чином, інертний розріджувач або істинний носій і можуть бути спресовані в таблетки або вкладені в желатинові капсули. Для перорального терапевтичного введення активна сполука або сполуки можуть бути змішані з наповнювачами й використовуватися у формі таблеток, капсул або пастилок. Як частина композиції можуть бути включені фармацевтично сумісні сполучні агенти й ад'юванти.

Таблетки, пілюлі, капсули, коржі тощо можуть містити будь-які з таких інгредієнтів або сполуки подібної природи: сполучний агент, зокрема трагакант, аравійська камедь, кукурудзяний крохмаль або желатин; наповнювач, як-от мікрокристалічна целюлоза, крохмаль, лактоза; подрібнюючий агент, зокрема альгінова кислота й кукурудзяний крохмаль; змащувальна речовина, зокрема стеарат магнію; агент, що перешкоджає злежуванню й грудкуванню, зокрема колоїдний двоокис кремнію; підсолоджувач, як-от сахароза або сахарин; а також ароматичний і смаковий агент, як-от м'ята перцева метилсаліцилат або фруктовий ароматизатор.

Якщо одиниця лікарської форми являє собою капсулу, вона може містити, крім згаданих вище речовин, рідкий носій, як-от нелетка олія. Крім того, до складу одиниці лікарської форми можуть входити деякі інші матеріали, що модифікують фізичну форму одиничної дози, наприклад оболонка з цукру та інших ентросолюбільних агентів. Сполуки також можуть вводитися як компонент еліксиру, суспензії, сиропу, води, жувальної гумки тощо. Сироп, окрім активних сполук, може містити сахарозу як підсолоджувач, певні консерванти, барвники і забарвлювальні речовини, а також ароматичні й смакові агенти.

Крім цього, активні речовини можуть змішуватися з іншими активними речовинами, що не послаблюють необхідний вплив, або з речовинами, що доповнюють необхідний вплив.

Розчини або суспензії, використовувані для парентерального, внутрішньошкірного (інтрадермального), підшкірного або місцевого застосування, можуть включати будь-які з таких компонентів:

стерильний розріджувач, як-от вода для ін'єкцій, фізіологічний розчин, нелетка олія, природна рослинна олія, як-от кунжутна, кокосова, арахісова, бавовняна олія тощо, або синтетичні жирні наповнювачі, як-от етилолеат і подібні до нього, поліетиленгліколь, гліцерин, пропіленгліколь або інші синтетичні розчинники; протимікробні засоби, як-от бензиловий спирт і метилпарабени; антиоксиданти, як-от аскорбінова кислота і бісульфіт натрію; хелатоутворювачі, як-от етилендіамінтетраоцтова кислота (ЕДТА); буферні розчини, як-от ацетатний, цитратний і фосфатний буфер; а також агенти для регулювання тоничності, як-от хлорид натрію і глюкоза. Препарати для парентерального введення можуть бути приготовлені у вигляді ампул, одноразових шприців або флаконів на декілька доз, виготовлених із скла, пластика або іншого придатного матеріалу. За необхідністю можуть бути включені буферні розчини, консерванти, антиоксиданти тощо.

Прийнятні носії для внутрішньовенного введення включають фізіологічний розчин, фосфатно-буферний розчин і розчини, що містять загусники і засоби, що підвищують розчинність, як-от глюкоза, поліетиленгліколь, поліпропіленгліколь, а також їхні суміші. Як придатні фармацевтично прийнятні носії також можуть використовуватися ліпосомні суспензії, що включають ліпосоми мічених тканин. Вони можуть бути приготовлені за відомими методами, наприклад, як описано в патенті США No. 4522811.

Активні сполуки можуть бути приготовлені разом із носіями, що захищають сполуку від швидкого виведення з організму, як, наприклад, рецептури з хронометрованим вивільненням з оболонки. Такі носії включають рецептури з регульованим вивільненням, як, наприклад, не вичерпуючись переліком, імплантанти і мікрокапсульовані системи доставки, а також біорозкладавані, біосумісні полімери, як-от колаген, етиленвінілацетат, поліангідриди, полігліколева кислота, поліортоєфіри, полімолочна кислота тощо. Спеціалістам у даній галузі відомі способи одержання таких рецептур.

Сполуки винаходу можуть уводитися перорально, парентерально (в/в, в/м, депо-в/м, п/к, депо-п/к), сублінгвально, інтраназально (інгаляційно), інтратекально, місцево або ректально. Для доставки сполук винаходу підходять лікарські форми, відомі спеціалістам у даній галузі.

Сполуки винаходу можуть уводитися ентерально або парентерально. При пероральному введенні сполуки винаходу можуть вводитися у вигляді звичайних лікарських форм для перорального застосування, відомих спеціалістам у даній галузі. Такі лікарські форми включають звичайні тверді одиниці лікарської форми, як, наприклад, таблетки і капсули, а також рідкі лікарські форми, як-от розчини, суспензії й еліксири. При використанні твердих лікарських форм бажано, щоб вони були уповільненого вивільнення, що дозволило б уводити сполуки винаходу лише раз або двічі на день.

Лікарські форми для перорального застосування вводять пацієнтові 1, 2, 3 або 4 рази на день. Краще, щоб сполуки винаходу вводилися тричі на день або рідше, більш переважно - раз

або двічі на день. Отже, краще, щоб сполуки винаходу застосовувалися в лікарській формі, призначеній для перорального введення. Поза залежністю від використаної пероральної лікарської форми, бажано, щоб у ній був передбачений захист сполуки винаходу від кислого середовища шлунка. Спеціалістам відомі таблетки, покриті ентросолюбільною оболонкою. Крім того, спеціалістам також відомі капсули, заповнені невеличкими сферами, покритими оболонкою для захисту від кислого середовища шлунка.

При пероральному застосуванні введена кількість, терапевтично ефективна для інгібування активності бета-секретази, для інгібування продукування Б-бета, для інгібування відкладення Б-бета, або для лікування або попередження ХА, складає приблизно від 0,1 мг/день до 1000 мг/день. Краще, щоб пероральна доза складала приблизно від 1 мг/день до 100 мг/день. Ще краще, щоб пероральна доза була приблизно від 5 мг/день до 50 мг/день. Зрозуміло, що оскільки пацієнт може починати з однієї дози, таке дозування може змінитися з часом у міру зміни стану пацієнта.

Як система доставки сполук винаходу може добре використовуватися композиція у вигляді дисперсії наночастинок. Приготування таких композицій описане, наприклад, у патенті США 5145684. Дисперсії, що містять наночастилки інгібіторів протеази ВІЛ, і способи їхнього застосування описані в патенті США 6045829. Рецептури з наночастилками звичайно забезпечують кращу біодоступність лікарських препаратів.

Сполуки винаходу можуть уводитися парентерально, наприклад, в/в, в/м, депо-в/м, п/к, депо-п/к. При парентеральному введенні терапевтично ефективна кількість має складати приблизно від 0,5 до 100 мг/день, переважно, щоб вона складала приблизно від 5 до 50 мг/день. При використанні рецептури пролонгованої дії для ін'єкції раз на місяць або раз на два тижні, доза має складати приблизно від 0,5 мг/день до 50 мг/день або місячна доза - приблизно від 15 мг до 1500 мг. Почасти через безпам'ятність пацієнтів з хворобою Альцгеймера бажано, щоб лікарська форма для парентерального введення була рецептурою пролонгованої дії.

Сполуки винаходу можна застосовувати під'язиково. При під'язиковому введенні сполуки слід приймати від одного до чотирьох разів на день у кількостях, описаних вище для в/м введення.

Сполуки винаходу можна вводити інтраназально. При такому способі застосування придатними лікарськими формами, як відомо фахівцям, є назальний спрей або сухий порошок. Дозування сполук винаходу для інтраназального введення відповідають кількості, описаній вище для в/м введення.

Сполуки винаходу можуть уводитися інтратекально. При такому способі застосування, як відомо спеціалістам, прийнятною лікарською формою може бути лікарська форма для парентерального введення. Дозування сполук винаходу для інтратекального введення відповідають кількості, описаній вище для в/м введення.

Сполуки винаходу можуть застосовуватися місцево. При такому способі використання придат-

ною лікарською формою є крем, мазь або пластр. Через кількість сполуки винаходу, що має вводитися, пластр є кращим. При місцевому застосуванні доза складає приблизно від 0,5 мг/день до 200 мг/день. Оскільки кількість, що її слід нанести на пластр, обмежена, можуть використовуватися два або більше пластрів. Спеціалістам відомо, що кількість і розмір пластрів не мають значення, важливо, щоб була доставлена терапевтично ефективна кількість сполук винаходу. Сполуки винаходу можуть вводитися ректально у вигляді супозиторію, як відомо спеціалістам. При введенні супозиторію терапевтично ефективна кількість складає приблизно від 0,5 до 500 мг.

Як відомо фахівцям у даній галузі, сполуки винаходу можуть застосовуватися у вигляді імплантатів. При введенні сполуки винаходу у вигляді імплантату терапевтично ефективна кількість відповідає кількості, описаній вище для введення препарату пролонгованої дії.

Винахід подає нові сполуки винаходу і нові способи використання сполук винаходу. Якщо задана конкретна сполука винаходу і бажана лікарська форма, спеціаліст у цій галузі зуміє приготувати й увести відповідну лікарську форму.

Сполуку винаходу застосовують таким самим чином, за допомогою тих самих способів введення, використовуючи ті ж фармацевтичні лікарські форми і за тією схемою застосування, як описано вище для попередження захворювання або для лікування пацієнтів із ЛКР (легким когнітивним розладом), включаючи попередження або уповільнення початку хвороби Альцгеймера, якщо існує ризик розвитку хвороби від ЛКР до ХА, для лікування або попередження синдрому Дауна, спадкового внутрішньомозкового крововиливу з голландським амілоїдозом, церебральної амілоїдної ангіопатії, включаючи попередження її можливих наслідків, тобто одиничних і рецидивних лобарних крововиливів, для лікування інших дегенеративних деменцій, включаючи деменції змішаної судинної і дегенеративної природи, деменцію, обумовлену хворобою Паркінсона, деменцію, обумовлену прогресуючим над'ядерним паралічем, деменцію, обумовлену кортикальною базальною дегенерацією, і різновиду хвороби Альцгеймера з дифузійними тельцями Леві.

Сполуки винаходу можуть використовуватися в поєднанні одна з одною або з іншими терапевтичними агентами або методами, використовуваними для лікування або попередження перерахованих вище станів. Такі агенти або методи включають: інгібітори ацетилхолінестерази, як, наприклад, такрин (тетрагідроаміноакридин, маркований як COGNEX®), гідрохлорид донепезилу (маркований як Aricept®) і ривастигмін (маркований як Exelon®); інгібітори гама-секретази; проти-запальні засоби, як-от інгібітори циклооксигенази II; антиоксиданти, як-от вітамін Е і гінколіди; імунологічні методи, як-от, наприклад, імунізація А-бета-пептидом або введення антитіл анти-А-бета-пептиду; статини; а також прямі або непрямі нейротропні агенти, як-от церебролізин (Cerebrolisin®), AIT-082 (Emilieu, 2000, Arch. Neurol. 57:454), та інші нейротропні агенти майбутнього.

Інгібування розщеплення APP

Сполуки даного винаходу інгібують розщеплення APP між Met595 і Asp596, вирахуванням для ізоформи APP695 або його мутантної форми, або у відповідному сайті іншої ізоформи, як-от APP751 або APP770, або його мутантної форми (який іноді називають "бета-секретазним сайтом"). Не бажаючи обмежуватися конкретною теорією, вважають, що інгібування бета-секретазної активності приводить до інгібування продукції амілоїдного бета-пептиду (Б-бета). Інгібувальна активність продемонстрована в одному з множини інгібіторних аналізів, причому розщеплення APP-субстрату за наявності ферменту бета-секретази аналізується за наявності інгібувальної сполуки, за умов, які в нормі призводять до розщеплення по бета-секретазному сайту розщеплення. Зменшення розщеплення APP по бета-секретазному сайту розщеплення, порівняно до необробленого або неактивного контролю, корелює з інгібувальною активністю. Системи аналізу, які можуть використовуватися для демонстрації ефективності сполук-інгібіторів даного винаходу, відомі. Основні системи аналізу описані, наприклад, у патентах US 5942400, 5744346, а також у Прикладах, поданих нижче.

Ферментативна активність бета-секретази і продукція Б-бета можуть аналізуватися *in vitro* або *in vivo*, з використанням природних, мутантних і/або синтетичних APP субстратів, природних, мутантних і/або синтетичних ферментів і аналізованої (тест-) сполуки. Аналіз може включати первинні або вторинні клітини, що експресують нативний, мутантний і/або синтетичний APP і фермент, тваринні моделі, що експресують нативний APP і фермент, або можуть використовуватися трансгенні тваринні моделі, що експресують субстрат і фермент. Визначення ферментативної активності може здійснюватися шляхом аналізу одного або більше продуктів розщеплення, наприклад, за допомогою імуного аналізу, флюориметричного або хромогенного аналізу, ВЕРХ або інших способів визначення. Інгібувальні сполуки визначають як сполуки, що мають здатність зменшувати кількість продукту розщеплення бета-секретазою, одержаного порівняно до контролю, де опосередковане бета-секретазою розщеплення в реакційній системі спостерігають і вимірюють за відсутності інгібувальної сполуки.

Бета-секретаза

Відомі різноманітні форми ферменту бета-секретази, що доступні і використовуються для аналізу ферментативної активності й інгібування ферментативної активності. Вони включають нативні, рекомбінантні й синтетичні форми ферменту. Людська бета-секретаза відома як фермент, що розщеплює бета-сайт APP (Beta Site APP Cleaving Enzyme, BACE), Asp2 і мемапсин 2, й охарактеризована, наприклад, у патенті US 5744346 і опублікованих РСТ заявках WO98/22597, WO00/03819, WO01/23533 і WO00/17369, а також у літературних публікаціях (Hussain et al., 1999, Mol. Cell. Neurosci. 14:419-427; Vassar et al., 1999, Science 286:735-741; Yan et al., 1999, Nature 402:533-537; Sinha et al., 1999, Nature 40:537-540; i Lin et al., 2000, PNAS USA 97:1456-1460). Також описані синтетичні форми ферменту (WO98/22597

i WO00/17369). Бета-секретаза може бути виділена й очищена з мозкової тканини людини і може бути одержана в клітинах, наприклад, тваринних клітинах, що експресують рекомбінантний фермент.

Придатні інгібувальні сполуки є ефективними, коли інгібують 50% ферментативної активності бета-секретази при концентрації меншій за 50 мкмоль, краще - при концентрації 10 мкмоль або меншій, більш бажано - 1 мкмоль або меншій, і ще бажаніше - 10 нмоль або меншій.

APP-субстрат

Для аналізів, що демонструють інгібування опосередкованого бета-секретазою розщеплення APP, можна використовувати будь-яку з відомих форм APP, включаючи "нормальну" ізоформу з 695 амінокислот, описану Кангом із співавт. (Kang et al., 1987, Nature 325:733-6), ізоформу з 770 амінокислот, описану Кітагучі із співавт. (Kitaguchi et al., 1981, Nature 331:530-532), і варіанти, як-от "шведська мутантна форма" (Swedish Mutation, KM670-1NL, APP-SW), "лондонська мутантна форма" (London Mutation, V7176F) та інші. Див., наприклад, патент US 5766846, а також Hardy, 1992, Nature Genet. 1:233-234, для огляду відомих різноманітних мутантних форм. Додаткові корисні субстрати включають модифіковану двома основними амінокислотами форму APP-KK, розкриту, наприклад, у WO00/17369, фрагменти APP і синтетичні пептиди, що містять бета-секретазний сайт розщеплення, білок дикого типу (WT, wild type) або мутантну форму, наприклад SW, як описано, наприклад, у патенті US 5942400 і WO00/03819.

APP-субстрат містить бета-секретазний сайт розщеплення APP (KM-DA або NL-DA), наприклад цілий APP-пептид або варіант, APP-фрагмент, рекомбінантний або синтетичний APP або злитий пептид. Бажано, щоб злитий пептид включав бета-секретазний сайт розщеплення, злитий із пептидом, що має ділянку, використовувану для ферментативного аналізу, наприклад, що має властивості, необхідні для виділення і/або детекції. Корисна ділянка може бути антигенним епітопом для зв'язування антитіл, міткою або іншою визначеною ділянкою, яка зв'язує субстратом тощо.

Антитіла

Продукти, що характеризують розщеплення APP, можуть бути виміряні за допомогою імунного аналізу з використанням різноманітних антитіл, як описано, наприклад, у Pirttila et al., 1999, Neuro Lett 249:21-4, і в патенті US 5612486. Корисні антитіла для визначення А-бета включають, наприклад, моноклональні антитіла 6E10 (Senetek, St. Louis, MO), які специфічно розпізнають епітоп на амінокислотах 1-16 А-бета-пептиду; антитіла 162 і 164 (Нью-Йоркський державний інститут фундаментальних досліджень, Staten Island, NY), специфічні для людських А-бета 1-40 і 1-42, відповідно; і антитіла, які розпізнають ділянку зчленування амілоїдного бета-пептиду, сайт між залишками 16 і 17, як описано в патенті US5593846. Антитіла, одержані проти синтетичного пептиду із залишків 591-596 білка APP, і антитіла SW192, одержані проти залишків 590-596 "шведської мутантної форми", також використовуються в імунному аналізі APP і продуктів його розщеплення, як описано в патен-

тах US 5604102 і 5721130.

Системи аналізу

Аналізи для визначення розщеплення APP по бета-секретазному сайту розщеплення добре відомі в даній галузі. Примірні аналізи, описані, наприклад, у патентах US 5744346 і 5942400 і описані в Прикладах, поданих нижче.

Безклітинні системи аналізу

Примірні аналізи, що можуть використовуватися для демонстрації інгібувальної активності сполук даного винаходу, описані, наприклад, у WO00/17369, WO00/03819 і патентах US 5942400 і 5744346. Такі аналізи можуть виконуватися в безклітинних інкубаційних системах або в клітинних інкубаційних системах з використанням клітин, що експресують бета-секретазу і APP-субстрат, що має бета-секретазний сайт розщеплення.

APP-субстрат, що містить бета-секретазний сайт розщеплення APP, наприклад, цілий APP або варіант, фрагмент APP або рекомбінантний або синтетичний APP-субстрат, що містить амінокислотну послідовність: KM-DA або NL-DA, інкубують за наявності ферменту бета-секретази, його фрагмента або синтетичного або рекомбінантного поліпептидного варіанта, що має бета-секретазну активність і здатний розщеплювати бета-секретазний сайт розщеплення APP, за умов інкубації, придатних для гідролізої активності ферменту. Придатні субстрати можуть включати похідні, які можуть бути злитими білками або пептидами, що містять субстратний пептид і модифікацію, корисну для полегшення очищення або визначення пептиду або продуктів його розщеплення бета-секретазою. Корисні модифікації включають вставку відомого антигенного епітопу для зв'язування антитіл; сполуки мітки або визначуваної частини, сполуки зв'язуючого субстрату тощо.

Придатні інкубаційні умови для безклітинного аналізу *in vitro* включають, наприклад: приблизно від 200 нмоль до 10 мкмоль субстрату, приблизно від 10 до 200 пкмоль ферменту і приблизно від 0,1 нмоль до 10 мкмоль інгібувальної сполуки, у водному розчині приблизно при рН 4-7, при температурі приблизно 37°C, протягом часового періоду приблизно від 10 хвилин до 3 годин. Ці інкубаційні умови є лише приблизними і, за необхідністю, можуть змінюватися для конкретних складових аналізу і/або необхідної системи вимірювання. Оптимізацію інкубаційних умов для конкретних складових аналізу слід відносити за рахунок конкретного використовуваного ферменту бета-секретази і його оптимального рН, будь-яких додаткових ферментів і/або маркерів, що можуть використовуватися в аналізі, тощо. Така оптимізація є рутинною й не потребує надмірного експериментування.

В одному корисному аналізі використовують злитий пептид, що має мальтозо-зв'язуючий білок (MBP), злитий з С-кінцевою ділянкою з 125 амінокислот APP-SW. MBP ділянка захоплюється на аналізованому субстраті антитілами проти MBP. Інкубація "захопленого" злитого білка за наявності бета-секретази призводить до розщеплення цього субстрату по бета-секретазному сайту розщеплення. Аналіз гідролізої активності може являти собою, наприклад, імунний аналіз розщеплених

продуктів. Один з таких аналізів визначає унікальний епітоп, експонований на карбоксильному кінці розщепленого злитого білка, наприклад, з використанням антитіл SW192. Цей аналіз описується, наприклад, у патенті US 5942400.

Клітинний аналіз

Численні, засновані на використанні клітинних систем, аналізи можуть застосовуватися для аналізу бета-секретазної активності і/або процесингу APP, що призводить до вивільнення Б-бета. Контактуюння APP-субстрату з ферментом бета-секретазою всередині клітини й за наявності або відсутності сполуки-інгібітору даного винаходу може використовуватися для демонстрації бета-секретазної інгібувальної активності цієї сполуки. Краще, щоб аналіз за наявності корисної інгібувальної сполуки забезпечував принаймні приблизно 30%, більш бажано - принаймні приблизно 50% інгібування ферментативної активності, порівняно до неінгібованого контролю.

В одній реалізації використовуються клітини, що в нормі експресують бета-секретазу. З іншого боку, клітини модифікують для експресії рекомбінантної бета-секретазы або синтетичного ферменту, як описано вище. APP-субстрат може додаватися в культуральне середовище і переважно експресується в клітинах. Можуть використовуватися клітини, що в нормі експресують APP, варіантну або мутантну форми APP, або клітини, трансформовані для експресії ізоформи APP, мутантного або варіантного APP, рекомбінантного або синтетичного APP, фрагмента APP або синтетичного пептиду APP, або злитого білка, що містить бета-секретазний сайт розщеплення APP, за умови, що APP, що експресується, сприяє контакту з ферментом, і може бути проаналізована гідролізна активність ферменту.

Клітинні лінії людини, що в нормі утворюють Б-бета з APP, є корисними системами для аналізу інгібувальної активності сполук даного винаходу. Продукція і вивільнення А-бета і/або інших продуктів розщеплення в культуральне середовище можуть бути виміряні, наприклад, за допомогою імунного аналізу, як-от Вестерн-блот, або імуноферментного аналізу (EIA), як-от ELISA.

Клітини, що експресують APP-субстрат і активну бета-секретазу, можна інкубувати за наявності сполуки-інгібітору для демонстрації інгібування ферментативної активності порівняно до контролю. Активність бета-секретазы може бути виміряна шляхом аналізу одного або більше продуктів розщеплення APP-субстрату. Наприклад, очікується, що інгібування бета-секретазної активності проти субстрату APP зменшить вивільнення специфічної бета-секретазы, що індукує вироблення продуктів розщеплення APP, як-от А-бета.

Попри те, що і нервові, й не нервові клітини утворюють і вивільняють Б-бета, рівні ендогенної бета-секретазної активності є низькими, що ускладнює їхнє визначення за допомогою EIA. Тому бажаніше використовувати деякі типи клітин, що, як відомо, мають підвищену бета-секретазну активність, збільшений процесинг APP до Б-бета і/або підвищену продукцію Б-бета. Наприклад, трансфекція клітин "шведською мутантною формою" APP (APP-SW), APP-KK або APP-SW-KK забезпечує

клітини, що мають підвищену бета-секретазу активність і продукують такі кількості Б-бета, які можуть бути легко виміряні.

В таких аналізах, наприклад, клітини, що експресують APP і бета-секретазу, інкубують у культуральному середовищі за умов, що підходять для прояву бета-секретазної ферментативної активності по її сайту розщеплення на APP-субстраті. При експозиції клітин зі сполукою-інгібітором, кількість Б-бета, вивільненого в середовище, і/або кількість STF99 фрагментів APP у клітинних лізатах зменшується, порівняно до контролю. Продукти розщеплення APP можуть бути проаналізовані, наприклад, за допомогою імунних реакцій зі специфічними антитілами, як обговорювалося вище.

Кращими клітинами для аналізу бета-секретазної активності є первинні нервові клітини людини, первинні нервові клітини трансгенних тварин, де трансген являє собою APP, та інші клітини, як-от стабільна клітинна лінія 293, що експресує APP, наприклад APP-SW.

Аналізи in vivo: тваринні моделі

Для аналізу бета-секретазної активності і/або процесингу APP із вивільненням А-бета, описаних вище, можуть застосовуватися різноманітні тваринні моделі. Наприклад, трансгенні тварини, що експресують APP-субстрат і фермент бета-секретазу, можуть застосовуватися для демонстрації інгібувальної активності сполук даного винаходу. Деякі трансгенні тваринні моделі були описані, наприклад, у патентах US 5877399, 5612486, 5387742, 5720936, 5850003, 5877015 і 5811633, і в Гейнса із співавт. (Ganes et al., 1995, Nature 373:523). Кращими є тварини, що виявляють ознаки, асоційовані з патофізіологією ХА. Застосування сполук-інгібіторів даного винаходу до трансгенних мишей, описане тут, є альтернативним способом для демонстрації інгібувальної активності сполук. Кращим є також застосування сполук у фармацевтично ефективному носії і введення їх таким шляхом, у результаті якого вони досягають тканини-мішені у відповідній терапевтичній кількості.

Інгібування опосередкованого бета-секретазою розщеплення APP по бета-секретазному сайту розщеплення і вивільнення Б-бета можуть бути проаналізовані в цих тварин за допомогою вимірювання фрагментів розщеплення в рідинах тіла тварин, як-от церебральна або тканинна рідини. Кращим є аналіз мозкових тканин на відкладення або бляшки А-бета.

При контактуванні APP-субстрату з ферментом бета-секретазою за наявності інгібувальної сполуки даного винаходу й за умов, достатніх для здійснення опосередкованого ферментом розщеплення APP і/або вивільнення Б-бета із субстрату, сполуки даного винаходу ефективно зменшують опосередковане бета-секретазою розщеплення APP по бета-секретазному сайту розщеплення і/або ефективно зменшують кількість вивільненого Б-бета. В тих випадках, коли таке контактування полягає у введенні інгібувальної сполуки даного винаходу у тваринну модель, наприклад, як описано вище, ці сполуки ефективно зменшують відкладення Б-бета в мозкових тканинах тварини, а

також зменшують кількість і/або розмір бета-амілоїдних бляшок. У тих випадках, коли таке введення здійснюється людині, ці сполуки ефективно інгібують або уповільнюють прогресування хвороби, що характеризується підвищеними кількостями А-бета, уповільнюють прогресування ХА і/або попереджують початок або розвиток ХА в пацієнтів, що належать до групи ризику за даним захворюванням.

Якщо в даному описі не визначено інакше, всі наукові й технічні терміни мають значення, узвичаєні в даній галузі. Всі патенти і публікації, на які є посилання, включені в опис для будь-яких цілей.

Визначення

"Алкіл" і "C₁-C₆-алкіл" у контексті даного винаходу означають прямі або розгалужені ланцюгові алкільні групи, що включають 1-6 атомів вуглецю, як-от метил, етил, пропіл, ізопропіл, н-бутил, вторбутл, трет-бутил, пентил, 2-пентил, ізопентил, неопентил, гексил, 2-гексил, 3-гексил і 3-метилпентил. Передбачається, що у випадках, коли алкільний ланцюг замісника (наприклад, алкільна, алкокси- або алкенільна група) містить менше або більше за 6 атомів вуглецю, це буде зазначено індексом біля другого атома С, наприклад "C₁-C₁₀" вказує на максимальну кількість 10 атомів вуглецю.

"Алкокси" і "C₁-C₆-алкокси" в контексті даного винаходу означають прямі або розгалужені ланцюгові алкільні групи, що містять 1-6 атомів вуглецю, приєднані через принаймні один двовалентний атом кисню, як-от, наприклад, метокси, етокси, пропокси, ізопропокси, н-бутокси, втор-бутокси, трет-бутокси, пентокси, ізопентокси, неопентокси, гексокси і 3-метилпентокси.

Термін "галоген" у контексті даного винаходу означає фтор, бром, хлор або йод.

"Алкеніл" і "C₂-C₆-алкеніл" означають прямі або розгалужені вуглеводневі радикали, що містять від 2 до 6 атомів вуглецю і від 1 до 3 подвійних зв'язків, і включають, наприклад, етеніл, пропеніл, 1-бут-3-еніл, 1-пент-3-еніл, і-гекс-5-еніл тощо.

"Алкініл" і "C₂-C₆-алкініл" означають прямі або розгалужені вуглеводневі радикали, що містять від 2 до 6 атомів вуглецю й 1 або 2 потрійні зв'язки, і включають, наприклад, етиніл, пропініл, бутиніл, пентин-2-іл тощо.

У даному контексті термін "циклоалкіл" стосується карбоциклічних радикалів, що містять від трьох до дванадцятих атомів вуглецю. Циклоалкіл може являти собою моноциклічну або поліциклічну конденсовану систему й може необов'язково містити подвійний зв'язок. Приклади таких радикалів включають циклопропіл, циклобутил, циклопентил, циклогексил і циклогептил. У даному випадку циклоалкільні групи є незаміщеними або, якщо вказано, заміщені по одному або більше підлягаючих заміщенню положеннях різноманітними групами. Наприклад, такі циклоалкільні групи можуть бути необов'язково заміщені C₁-C₆-алкілом, C₁-C₆-алкокси, галогеном, гідрокси-, ціано-, нітро-, аміно-, моно(C₁-C₆)-алкіламіно-, ди(C₁-C₆)-алкіламіногрупою, C₂-C₆-алкенілом, C₂-C₆-алкінілом, C₁-C₆-галогеналкілом, C₁-C₆-галогеналкокси, аміно(C₁-C₆)-алкілом, моно(C₁-

C₆)алкіламіно(C₁-C₆)алкілом або ди(C₁-C₆)алкіламіно(C₁-C₆)алкілом.

"Арил" означає ароматичну карбоциклічну групу, що містить одне кільце (наприклад, феніл), декілька кілець (наприклад, біфеніл) або декілька конденсованих кілець, серед яких принаймні одне є ароматичним (наприклад, 1,2,3,4-тетрагідронафтил, нафтил), що необов'язково містить один, два або три замісники. Кращими арильними групами даного винаходу є феніл, 1-нафтил, 2-нафтил, інданіл, інденіл, дигідронафтил, тетралініл або 6,7,8,9-тетрагідро-5Н-бензоациклогептеніл. В даному випадку арильні групи не заміщені або, якщо вказано, заміщені по одному або більше підлягаючих заміщенню положеннях різноманітними групами. Наприклад, такі арильні групи можуть бути необов'язково заміщені C₁-C₆-алкілом, C₁-C₆-алкокси, галогеном, гідрокси-, ціано-, нітро-, аміно-, моно(C₁-C₆)-алкіламіно-, ди(C₁-C₆)-алкіламіногрупою, C₂-C₆-алкенілом, C₂-C₆-алкінілом, C₁-C₆-галогеналкілом, C₁-C₆-галогеналкокси, аміно(C₁-C₆)-алкілом, моно(C₁-C₆)алкіламіно(C₁-C₆)алкілом, ди(C₁-C₆)алкіламіно(C₁-C₆)алкілом, -COOH, -C(=O)O(C₁-C₆-алкілом), C(=O)NH₂, -C(=O)N(моно- або ди-C₁-C₆-алкілом), -S(C₁-C₆-алкілом), -SO₂(C₁-C₆-алкілом), -O-C(=O)(C₁-C₆-алкілом), -NH-C(=O)-(C₁-C₆-алкілом), -NH(C₁-C₆-алкіл)-C(=O)-(C₁-C₆-алкілом), -NH-SO₂(C₁-C₆-алкілом), -N(C₁-C₆-алкіл)-SO₂(C₁-C₆-алкілом), -NH-C(=O)NH₂, -NH-C(=O)N(моно-або ди-C₁-C₆-алкілом), -NH(C₁-C₆-алкіл)-C(=O)-NH₂ або -NH(C₁-C₆-алкіл)-C(=O)-N(моно-або ди-C₁-C₆-алкілом).

"Гетероарил" означає одну або більше ароматичних циклічних систем з 5-, 6- або 7-членних кілець, що включають конденсовані циклічні системи, які складаються з 9-11 атомів і містять принаймні від 1 до 4 гетероатомів, вибраних з азоту, кисню або сірки. Кращі гетероарильні групи даного винаходу включають піридиніл, піримідиніл, хінолініл, бензотієніл, індоліл, індолініл, піридазиніл, піразиніл, ізоіндоліл, ізохіноліл, хіназолініл, хіноксалініл, фталазиніл, імідазоліл, ізоксазоліл, піразоліл, оксазоліл, тіазоліл, індолізиніл, індазоліл, бензотіазоліл, бензімідазоліл, бензофураніл, фураніл, тієніл, піроліл, оксадіазоліл, тіадіазоліл, триазоліл, тетразоліл, оксазоліпиридиніл, імідазоліпиридиніл, ізотіазоліл, нафтиридиніл, цинолініл, карбазоліл, бета-карболініл, ізохроманіл, хроманіл, тетрагідроізохінолініл, ізоіндолініл, ізобензотетрагідрофураніл, ізобензотетрагідротієніл, ізобензотієніл, бензоксазоліл, піридопиридиніл, бензотетрагідрофураніл, бензотетрагідротієніл, пуриніл, бензодіоксоліл, триазиніл, феноксазиніл, фенотіазиніл, птеридиніл, бензотіазоліл, імідазоліпиридиніл, імідазотіазоліл, дигідробензизоксазиніл, бензизоксазиніл, бензоксазиніл, дигідробензотіазиніл, бензопіраніл, бензотіопіраніл, кумариніл, ізокумариніл, хромоніл, хроманоніл, піридиніл-N-оксид, тетрагідрохінолініл, дигідрохінолініл, дигідрохіноліноніл, дигідроізохіноліноніл, дигідрокумариніл, дигідроізокумариніл, ізоіндоліноніл, бензодіоксаніл, бензоксазоліноніл, піроліл N-оксид, піримідиніл N-оксид, піридазиніл N-оксид, піразиніл N-оксид, хінолініл N-оксид, індоліл N-оксид, індолініл N-оксид, ізохіноліл N-оксид, хіназолініл N-

оксид, хіноксалініл N-оксид, фталазиніл N-оксид, імідазоліл N-оксид, ізоксазоліл N-оксид, оксазоліл N-оксид, тіазоліл N-оксид, індолізиніл N-оксид, індазоліл N-оксид, бензотіазоліл N-оксид, бензімідазоліл N-оксид, піроліл N-оксид, оксадіазоліл N-оксид, тіадіазоліл N-оксид, триазоліл N-оксид, тетразоліл N-оксид, бензотіопіраніл S-оксид, бензотіопіраніл S,S-діоксид. У даному контексті гетероарильні групи є незаміщеними або, якщо вказано, заміщені по одному або більше підлягаючих заміщенню положення різноманітними групами. Наприклад, такі гетероарильні групи можуть бути необов'язково заміщені C₁-C₆-алкілом, C₁-C₆-алкокси, галогеном, гідрокси-, піано-, нітро-, аміно-, моно(C₁-C₆)-алкіламіно-, ди(C₁-C₆)-алкіламіногрупою, C₂-C₆-алкенілом, C₂-C₆-алкінілом, C₁-C₆-галогеналкілом, C₁-C₆-галогеналкокси, аміно(C₁-C₆)-алкілом, моно(C₁-C₆)-алкіламіно(C₁-C₆)-алкілом, ди(C₁-C₆)-алкіламіно(C₁-C₆)-алкілом, -COOH, -C(=O)O(C₁-C₆-алкілом), C(=O)NH₂, -C(=O)N(моно- або ди-C₁-C₆-алкілом), S(C₁-C₆-алкілом), -SO₂(C₁-C₆-алкілом), -O-C(=O)(C₁-C₆-алкілом), -NH-C(=O)-(C₁-C₆-алкілом), -N(C₁-C₆-алкіл)-C(=O)-(C₁-C₆-алкілом), -NH-SO₂(C₁-C₆-алкілом), -N(C₁-C₆-алкіл)-SO₂(C₁-C₆-алкілом), -NH-C(=O)NH₂, -NH-C(=O)N(моно- або ди-C₁-C₆-алкілом), -NH(C₁-C₆-адкіл)-C(=O)-NH₂ або -NH(C₁-C₆-алкіл)-C(=O)-N(моно- або ди-C₁-C₆-алкілом).

"Гетероцикл", "гетероциклоалкіл" або "гетероциклі" означають одну або більше карбоциклічних кільцевих систем з 4-, 5-, 6- або 7-членних кілець, що включаються з конденсованими циклічними системами, які складаються з 9-11 атомів і містять принаймні від одного до чотирьох гетероатомів, вибраних з азоту, кисню або сірки. Гетероцикл може необов'язково містити подвійний зв'язок. Кращі гетероцикли даного винаходу включають морфолініл, тіоморфолініл, тіоморфолініл S-оксид, тіоморфолініл S,S-діоксид, піперазиніл, гомопіперазиніл, піролідініл, піролініл, тетрагідропіраніл, піперидиніл, тетрагідрофураніл, тетрагідротієніл, гомопіперидиніл, гомоморфолініл, гомотіоморфолініл, гомотіоморфолініл S,S-діоксид, оксазолідіноніл, дигідропіразоліл, дигідропіроліл, дигідропіразиніл, дигідропіридиніл, дигідропіримідиніл, дигідрофурил, дигідропіраніл, тетрагідротієніл S-оксид, тетрагідротієніл S,S-діоксид і гомотіоморфолініл S-оксид. У даному контексті гетероциклічні групи є незаміщеними, або, якщо вказано, заміщені по одному або більше підлягаючих заміщенню положеннях різноманітними групами. Наприклад, такі гетероциклічні групи можуть бути необов'язково заміщені C₁-C₆-алкілом, C₁-C₆-алкокси, галогеном, гідрокси-, ціано-, нітро-, аміно-, моно(C₁-C₆)-алкіламіно-, ди(C₁-C₆)-алкіламіногрупою, C₂-C₆-алкенілом, C₂-C₆-алкінілом, C₁-C₆-галогеналкілом, C₁-C₆-галогеналкокси, аміно(C₁-C₆)-алкілом, моно(C₁-C₆)-алкіламіно(C₁-C₆)-алкілом, ди(C₁-C₆)-алкіламіно(C₁-C₆)-алкілом або =O.

Всі значення температури наведені в градусах Цельсія (°).

TLC (ТШХ) означає тонкошарову хроматографію.

Psi (Псі) означає фунти/дюйм².
год. означає годину.

HPLC (ВЕРХ) означає високоефективну рідину хроматографію.

THF (ТГФ) означає тетрагідрофуран.

DMF (ДМФ) означає диметилформамід.

EDC означає етил-1-(3-диметиламінопропіл)карбодіімід або гідрохлорид 1-(3-диметиламінопропіл)-3-етилкарбодіімиду.

HOBt означає 1-гідроксибензотіазол.

NMM означає N-метилморфолін.

NBS означає N-бромсукцинімід.

TEA (TEA) означає триетиламін.

BOC означає 1,1-диметилетоксикарбоніл або t-бутоксикарбоніл, -CO-O-C(CH₃)₃.

CBz означає бензилоксикарбоніл, -CO-O-CH₂-феніл.

Fmoc означає 9-флуоренілметилкарбонат.

TFA (ТФО) означає трифтороцтову кислоту.

CDI (КДІ) означає 1,1'-карбонілдіімідазол.

Соляний розчин означає насичений водний розчин хлориду натрію.

Хроматографія (колонкова й флеш-хроматографія) означає очищення/розділення сполук у міру проходження (носіїв, елюент). Очевидно, що для одержання необхідної сполуки відповідні фракції об'єднують і концентрують.

CMR (СМР) означає C-13 магнітну резонансну спектроскопію, хімічні зсуви подані в м.д. (д) низького поля щодо TMS.

NMR (ЯМР) означає ядерну (протонну) резонансну магнітну спектроскопію, хімічні зсуви подані в м.д. (д) низького поля щодо TMS.

IR (ІЧ) означає інфрачервону спектроскопію.

-феніл означає феніл (C₆H₅).

MS (МС) означає мас-спектрометрію і виражається як m/e, m/z або маса/одичинний заряд. MH⁺ означає позитивний іон вихідної сполуки плюс атом водню. EI означає електронний удар. CI означає хімічну іонізацію. FAB означає бомбардування швидкими атомами.

HRMS (МСВРЗ) означає мас-спектрометрію високої роздільної здатності.

Ефір означає діетиловий ефір.

Фармацевтично прийнятний означає властивості і/або речовини, прийнятні для хворого з фармакологічного/токсикологічного погляду, і для виробництва фармацевтичного препарату з фізичного/хімічного погляду щодо складу, рецептури, стабільності, стерпності для пацієнта й біодоступності.

При використанні пари розчинників їх беруть у відношенні об'єм/об'єм (о./о.). При використанні розчинності твердої речовини в розчиннику відношення твердої речовини до розчинника виражають як вагу/об'єм (вага./о.).

BOP означає гексафторфосфат бензотриазол-1-ілокси-трис-(диметиламіно)фосфонію.

TBDMSCl означає трет-бутилдиметилсилілхлорид.

TBDSOTf означає ефір трет-бутилдиметилсилілтрифторсульфонової кислоти. Трисомія 21 означає хворобу Дауна.

Такі терміни використовуються (у ПРИКЛАДАХ 321 і вище) для амідотвірного агента (ІХ):

"СЗФЗ" означає (CH₃-CH₂-CH₂)₂N-CO-феніл-CO-OH, де приєднання до фенільного кільця здійснюється в 1,3-положеннях;

"5-Ме-РНТН" означає $(\text{CH}_3\text{-CH}_2\text{-CH}_2)_2\text{N-CO-}(\text{CH}_3)\text{-феніл-CO-OH}$, де приєднання до фенільного кільця здійснюється в 1,3-положеннях для карбонільних груп і в 5-положенні для метильної групи;

"3,5-піридиніл" означає $(\text{CH}_3\text{-CH}_2\text{-CH}_2)_2\text{N-CO-}(\text{піридиніл})\text{-CO-OH}$, де приєднання до піридинільного кільця здійснюється в 3,5-положеннях для карбонільних груп;

"-SO₂-" означає $(\text{CH}_3\text{-CH}_2\text{-CH}_2)_2\text{CH-SO}_2\text{-феніл-CO-OH}$, де приєднання до фенільного кільця здійснюється в 1,3-положеннях;

"5-ОМе-РНТН" означає $(\text{CH}_3\text{-CH}_2\text{-CH}_2)_2\text{N-CO-}(\text{CH}_3\text{-O})\text{-феніл-CO-OH}$, де приєднання до фенільного кільця здійснюється в 1,3-положеннях для карбонільних груп і в 5-положенні для метоксигрупи;

"5-Cl-РНТН" означає $(\text{CH}_3\text{-CH}_2\text{-CH}_2)_2\text{N-CO-(Cl-феніл-CO-OH)}$, де приєднання до фенільного кільця здійснюється в 1,3-положеннях для карбонільних груп і в 5-положенні для атома хлору;

"5-F-РНТН" означає $(\text{CH}_3\text{-CH}_2\text{-CH}_2)_2\text{N-CO-(F-феніл-CO-OH)}$, де приєднання до фенільного кільця здійснюється в 1,3-положеннях для карбонільних груп і в 5-положенні для атома фтору;

"тієніл" означає $(\text{CH}_3\text{-CH}_2\text{-CH}_2)_2\text{N-CO-тієніл-CO-OH}$, де приєднання до тіофенового кільця здійснюється в 2,5-положеннях;

"2,4-піридиніл" означає $(\text{CH}_3\text{-CH}_2\text{-CH}_2)_2\text{N-CO-(піридиніл})\text{-CO-OH}$, де приєднання до піридинільного кільця здійснюється в 2,4-положеннях для карбонільних груп;

"4,6-піримідиніл" означає $(\text{CH}_3\text{-CH}_2\text{-CH}_2)_2\text{N-CO-(піримідиніл})\text{-феніл-CO-OH}$, де приєднання до піримідинільного кільця здійснюється в 4,6-положеннях для карбонільних груп;

"морфолініл" означає морфолініл-CO-феніл-CO-OH, де приєднання до фенільного кільця здійснюється в 1,3-положеннях для карбонільних груп;

APP, білок-попередник амілоїду, визначається як будь-який APP-поліпептид, включаючи варіанти APP, мутантні форми й ізоформи, наприклад, розкриті в патенті US 5766846.

Б-бета, амілоїдний бета-пептид, визначається як будь-який пептид, одержаний у результаті опосередкованого бета-секретазою розщеплення APP, включаючи пептиди з 39, 40, 41, 42 і 43 амінокислот, і віддалений від бета-секретазного сайту розщеплення на 39, 40, 41, 42 або 43 амінокислоти.

Бета-секретаза (BACE1, Asp2, мемапсин 2) являє собою аспартилпротеазу, що опосередковує розщеплення APP по амінотермінальному кінці Б-бета. Людська бета-секретаза описана, наприклад, у міжнародній заявці WO00/17369.

"Фармацевтично прийнятний" означає такі властивості і/або речовини, що є прийнятними для пацієнта з фармакологічного/токсикологічного погляду і для фармацевта з погляду фізичної/хімічної природи композиції, складу, стабільності композиції, стерпності її для пацієнта й біодоступності.

Терапевтично ефективна кількість визначається як кількість, ефективна для ослаблення або зменшення прояву одного симптому вибіркової хвороби або для ослаблення або уповільнення початку прояву однієї або більше клінічних ознак або симптомів цієї хвороби.

Даний винахід подає сполуки, композиції і спо-

соби інгібування ферментативної активності бета-секретази і продукції А-бета-пептиду. Інгібування ферментативної активності бета-секретази зупиняє або зменшує продукцію А-бета-пептиду з APP і зменшує або ліквідує утворення бета-амілоїдних депозитів у мозку.

ПРИКЛАДИ

Нижченаведені приклади описують процедури приготування різноманітних сполук і/або реалізації різноманітних процесів, використовуваних у винаході. Ці приклади слід розглядати тільки як ілюстрації, а не як обмеження описаного вище. Спеціалісти швидко знайдуть відповідні варіації цих процедур, як за допомогою добору реагентів, так і шляхом зміни методів і умов здійснення реакції. СИНТЕЗ 1 3-аміно-5-(метоксикарбоніл)-бензойна кислота (XVII)

Завись монометил-5-нітроізофталату (22.5 г, 100 ммоль) і паладію на вугіллі (5%, 2.0г) у метанолі (100 мл) струшують у гідрогенізаційній установці в атмосфері водню (3.4 атм) протягом 3 годин. Отриману суміш потім фільтрують через інфузорну (діатомову) землю і концентрують для одержання вищевказаної сполуки. Методи аналізу: ЯМР (300МГц, CDCl₃) δ 7.67, 7.41, 7.40 і 3.83; МС (ESI⁺): C₉H₉NO₄, m/z (M-H)⁺=194.

СИНТЕЗ 2 3-бром-5-(метоксикарбоніл)-бензойна кислота (XIX)

Суміш броміду міді (II) (1.85 г, 8.30 ммоль) з п-бутилнітрином (1.07 г, 10.4 ммоль) і ацетонітрилом (30 мл) перемішують у круглодонній колбі у водяній бані, у яку додано декілька шматків льоду. 3-аміно-5-(метоксикарбоніл)-бензойну кислоту (XVII, СИНТЕЗ 1, 1.35 г, 6.92 ммоль) додають у вигляді суспензії в теплий ацетонітрил (70 мл) протягом 15 хвилин, потім цю суміш перемішують при температурі 20-25°C протягом двох годин, після чого розділяють між дихлорметаном і соляною кислотою (3N). Органічну фракцію цієї суміші відокремлюють, сушать над безводним сульфатом натрію досуха й концентрують. У результаті розділення фракцій за допомогою хроматографічної колонки (силікагель, 125 мл; метанол/дихлорметан, 15/85) і концентрації відповідних фракцій одержують речовину у твердому стані, яка кристалізується з метанолу й утворює вищевказану сполуку. Метод аналізу: ЯМР (диметилсульфоксид (DMSO) – d₆) δ 3.9, 8.26 і 8.65.

СИНТЕЗ 3 Метил-3-бром-5-[(дипропіламіно)карбоніл]-бензоат (XXI)

Карбонілдіімідазол (3.0 г, 18 ммоль) додають у розчин 3-бром-5-(метоксикарбоніл)-бензойної кислоти (XIX, СИНТЕЗ 2, 3.9 г, 15 ммоль) у ТГФ (30 мл). Отриману суміш перемішують протягом 30 хв. Після цього, у цю суміш додають дипропіламін (AMH, 4.2 мл, 30 ммоль), отриману суміш перемішують протягом 24 годин. Розчинник потім видаляють при зниженому тиску, а суміш розділяють між етилацетатом і водою. Після чого органічну фракцію промивають соляним розчином, сушать над безводним сульфатом магнію, фільтрують і концентрують. У результаті розділення фракцій за допомогою хроматографічної колонки (силікагель, 125 мл; етилацетат/гексан, 15/85) одержують вищевказану сполуку. Методи аналізу: ІЧ-спектроскопія (коефіцієнт дифузійного відбиття)

2968, 2958, 1714, 1637, 1479, 1440, 1422, 1321, 1310, 1288, 1273, 1252, 889, 772 і 718 cm^{-1} ; ЯМР (300 МГц, CDCl_3) д 8.21, 7.96, 7.70, 3.95, 3.46, 3.15, 1.69, 1.57, 1.0 і 0.78; МС (ESI⁺): $\text{C}_{15}\text{H}_{20}\text{BrNO}_3$, m/z (M-H)⁺=344.1.

СИНТЕЗ 4 3-бром-5-[(дипропіламіно)карбоніл]-бензойна кислота

У розчин метил-3-бром-5-[(дипропіламіно)карбоніл]-бензоату (XXI, СИНТЕЗ 3, 1.4 г, 4.1 ммоль) у суміші ТГФ/вода/метанол/ (4/2/2, 8 мл) додають моногідрат гідроксиду літію (0.17 г, 4.05 ммоль). Отриману суміш перемішують при температурі 20-25°C протягом однієї год., потім розчинник видаляють при зниженому тиску. Осад розчиняють у воді (50 мл) і додають соляну кислоту (1N) у такій кількості, щоб значення рН дорівнювало 3. Водну суміш екстрагують за допомогою етилацетату, органічну фракцію відокремлюють і сушать над сульфатом магнію для одержання вищевказаної сполуки. Теоретичні значення для $\text{C}_{14}\text{H}_{18}\text{BrNO}_3$: С, 51.23; В, 5.53; Н, 4.27; Br, 24.35. Експериментальні дані: С, 51.37; В, 5.56; Н, 4.28.

СИНТЕЗ 5 Метил-3-(амінокарбоніл)-5-[(дипропіламіно)карбоніл]-бензоат (XXII)

У суміш метил-3-бром-5-[(дипропіламіно)карбоніл]-бензоату (XXI, СИНТЕЗ 3, 0.5 г, 1.47 ммоль) у сухому N-метилпіролідіноні в атмосфері монооксиду вуглецю (CO) додають: ацетат паладію (II) (0.017 г, 0.074 ммоль), 1,3-біс(дифенілфосфін)пропан (0.045 г, 0.11 ммоль), гексаметилдисилазан (1.0 мл, 4.7 ммоль) і діізопропілетиламін (0.38 г, 2.94 ммоль). Отриману суміш нагрівають при температурі 100°C протягом 24 годин. Потім цю суміш охолоджують до 20-25°C і розділяють між водою й етилацетатом. Прошарки розділяють, водну фракцію промивають за допомогою етилацетату. Органічні фракції об'єднують, промивають тричі соляним розчином, сушать над безводним сульфатом магнію, фільтрують і концентрують. У результаті розділення фракцій за допомогою хроматографічної колонки (силікагель, 75 мл; метанол/метилхлорид, 2.5/97.5) одержують вищевказану сполуку. Метод аналізу: ЯМР (CDCl_3) д 0.77, 1.02, 1.57, 1.71, 3.17, 3.49, 3.98, 5.78, 6.34, 8.07, 8.2 і 8.48.

СИНТЕЗ 6 3-(амінокарбоніл)-5-[(дипропіламіно)карбоніл]-бензойна кислота (XXIII)

У суміш метил-3-(амінокарбоніл)-5-[(дипропіламіно)карбоніл]-бензоату (XXII, СИНТЕЗ 5, 0.197 г, 0.64 ммоль) з метанолом (5 мл) додають гідроксид натрію (1N, 3 мл). Отриману суміш перемішують при температурі 20-25°C протягом 24 годин. Потім цю суміш підкислюють до значення рН, рівного 5, шляхом додавання соляної кислоти (10%). Після чого додають воду (50 мл) і промивають суміш двічі за допомогою етилацетату (2 x 50 мл). Органічні екстракти об'єднують, сушать над безводним сульфатом магнію й концентрують для одержання вищевказаної сполуки. Метод аналізу: ЯМР (диметилсульфоксид ($\text{DMSO}-d_6$) д 0.66, 0.930, 1.48, 1.62, 3.12, 3.35, 7.54, 7.98, 8.22 і 8.51.

СИНТЕЗ 7 3-ціано-5-[(дипропіламіно)карбоніл]-бензойна кислота (IX/XXXII)

Суміш 3-бром-5-[(дипропіламіно)карбоніл]-бензойної кислоти (СИНТЕЗ 4, 0.596 г, 1.82 ммоль)

з нітрилом міді (0.325 г, 3.63 ммоль) у N-метилпіролідіноні (1,5 мл) перемішують при температурі 175°C протягом 2,5 год., після чого суміш охолоджують і розділяють між етилацетатом і соляною кислотою (3N). Органічний прошарок промивають двічі соляною кислотою (3N), а потім двічі соляним розчином, що був підкислений додаванням невеличкої кількості соляної кислоти (3N). Органічну фракцію сушать над сульфатом магнію і концентрують при високому вакуумі для одержання вищевказаної сполуки. Методи аналізу: ЯМР (CDCl_3) д 0.8, 1.02, 1.6, 1.73, 3.17, 3.51, 7.9, 8.31 і 8.41; аліквоту кристалізують із суміші етилового ефіру/дихлорметану/гексану - ІЧ-спектроскопія (коефіцієнт дифузійного відбиття) 3017, 2970, 2937, 2898, 2877, 2473, 2432, 2350, 2318, 2236, 1721, 1608, 1588, 1206 і 1196 cm^{-1} .

СИНТЕЗ 8 3-(амінокарбоніл)-5-[(дипропіламіно)карбоніл]-бензойна кислота (XXXIII)

Суміш 3-ціано-5-[(дипропіламіно)карбоніл]-бензойної кислоти (IX/XXXII, СИНТЕЗ 7, 0.602 г, 2.19 ммоль) з карбонатом калію (0.212 г, 1.53 ммоль) і ацетоном (2.5 мл) перемішують при температурі 20-25°C. Додають воду (2.5 мл), адукт пероксиду водню й сечовини (0.825 г, 8.78 ммоль) і перемішують отриману суміш при температурі 20-25°C протягом 15 годин. Після чого додають таку порцію адукта пероксиду водню й сечовини (0.204 г), перемішують протягом 3 годин і додають чергову порцію адукта. Через 39 годин, після додавання відповідної кількості порцій адукта пероксиду водню й сечовини, ацетон видаляють при зниженому тиску, а осад підкислюють додаванням такої кількості соляної кислоти, щоб значення рН було в діапазоні 2-4. Отриману суміш екстрагують за допомогою дихлорметану, органічний прошарок відокремлюють і промивають соляною кислотою (0.5N), органічну фракцію сушать над безводним сульфатом магнію досуха. Вищевказану речовину у твердому стані одержують кристалізацією із суміші дихлорметану/гексану/ метанолу. Метод аналізу: МС (ESI⁺): $\text{C}_{15}\text{H}_{20}\text{N}_2\text{O}_4$, m/z (M+H)⁺=293.2.

СИНТЕЗ 9 Метил-3-[(дипропіламіно)карбоніл]-5-нітробензоат (XXX)

Карбонілдіімідазол (3.90 г, 24 ммоль) додають у суміш монометил 5-нітроізопталату (XXVIII, 4.5 г, 20.0 ммоль) із сухим ТГФ (50 мл). Отриману суміш перемішують протягом 30 хвилин. Потім у суміш повільно додають дипропіламін (3.28 мл, 24.0 ммоль). Отриману суміш перемішують протягом 4 годин. Після цього розчинник видаляють при зниженому тиску, а суміш розділяють між етилацетатом і водою. Органічну фракцію відокремлюють і промивають соляним розчином, сушать над безводним сульфатом натрію, фільтрують і концентрують. У результаті розділення фракцій за допомогою хроматографічної колонки (силікагель, 125 мл; етилацетат/гексан, 15/85) одержують вищевказану сполуку. Методи аналізу: ЯМР (300 МГц, CDCl_3) д 8.88, 8.41, 8.35, 4.00, 3.48, 3.15, 1.72, 1.57, 1.0 і 0.77; МС (ESI⁺): $\text{C}_{15}\text{H}_{20}\text{N}_2\text{O}_5$, m/z (M+H)⁺=309.2.

СИНТЕЗ 10 Метил-3-аміно-5-[(дипропіламіно)карбоніл]-бензоат (XXXI)

Суспензію 3 метил-3-

[(дипропіламіно)карбоніл]-5-нітробензоату (XXX, СИНТЕЗ 9, 6.0 г, 20.0 ммоль) і паладію на вугіллі (5%, 0.6 г) у метанолі (40 мл) струшують у гідрогенізаційній установці в атмосфері водню (3.0 атм) протягом 3 годин. Отриману суміш потім фільтрують через інфузорну (діатомову) землю і концентрують для одержання вищевказаної сполуки. Метод аналізу: ЯМР (300 МГц, CDCl_3) д 7.27, 6.77, 4.10, 3.82, 3.38, 3.10, 1.62, 1.46, 0.91 і 0.68.

СИНТЕЗ 11 Метил-3-(хлорсульфоніл)-5-[(дипропіламіно)карбоніл]-бензоат (XXXVII)

Метил-3-аміно-5-[(дипропіламіно)карбоніл]-бензоат (XXXI, СИНТЕЗ 10, 1.11 г, 4 ммоль) додають у суміш води (5 мл) з концентрованою соляною кислотою (1 мл). У отриману суміш при температурі 0°C повільно додають нітрит натрію (0.276 г, 4 ммоль). Потім цю суміш додають у розчин $\text{CuCl}_2 \cdot 2\text{H}_2\text{O}$ в оцтовій кислоті (5 мл), насичений діоксидом сірки. Отриману суміш перемішують протягом 30 хвилин, після чого виливають у крижану воду. Суміш екстрагують за допомогою етилацетату. Органічну фракцію відокремлюють і промивають насиченим бікарбонатом натрію, водою, соляним розчином, сушать над безводним сульфатом натрію, фільтрують і концентрують для одержання вищевказаної сполуки. Метод аналізу: ЯМР (300 МГц, CDCl_3) д 8.69, 8.38, 8.20, 4.01, 3.49, 3.14, 1.72, 1.59, 1.01 і 0.79. МС (ESI^+): $\text{C}_{15}\text{H}_{20}\text{ClNO}_5\text{S}$, m/z ($\text{M}+\text{H}$) $^+$ =362.2.

СИНТЕЗ 12 Метил-3-(аміноссульфоніл)-5-[(дипропіламіно)карбоніл]-бензоат (XXXVIII)

У розчин метил-3-(хлорсульфоніл)-5-[(дипропіламіно)карбоніл]-бензоату (XXXVII, СИНТЕЗ 11, 0.1 г, 0.3 ммоль) у сухому ТГФ (3 мл) додають аміак (7 N розчин у метанолі, 0.214 мл, 1.5 ммоль). Отриману суміш перемішують протягом 18 годин, потім видаляють розчинник. Осад розділяють між етилацетатом і водою. Органічну фракцію відокремлюють і промивають соляним розчином, сушать над безводним сульфатом натрію, фільтрують і концентрують для одержання вищевказаної сполуки. Метод аналізу: ЯМР (300 МГц, CDCl_3) д 8.45, 8.07, 8.01, 6.05, 3.93, 3.44, 3.09, 1.67, 1.52, 0.96 і 0.73. МС (ESI^+): $\text{C}_{12}\text{H}_{22}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}$, m/z ($\text{M}+\text{H}$) $^+$ =343.3.

СИНТЕЗ 13 3-(аміноссульфоніл)-5-[(дипропіламіно)карбоніл]-бензойна кислота (XXXVIII)

Моногідрат гідроксиду літію (0.011 г, 0.263 ммоль) додають у розчин метил-3-(аміноссульфоніл)-5-[(дипропіламіно)карбоніл]-бензоату (XXXVIII, СИНТЕЗ 12, 0.09 г, 0.263 ммоль) у суміші ТГФ/метанол/вода (2/1/1, 2 мл). Отриману суміш перемішують при температурі 20-25°C протягом 3 годин. Потім цю суміш розбавляють водою, після цього додають соляну кислоту в такій кількості, щоб значення рН було меншим за 3. Водний розчин екстрагують за допомогою етилацетату. Органічну фракцію відокремлюють і промивають соляним розчином, сушать над безводним сульфатом натрію, фільтрують і концентрують для одержання вищевказаної сполуки. Методи аналізу: 3 ЯМР (300 МГц, CDCl_3) д 10.36 (s, 1 H), 8.39 (s, 1 H), 8.09 (s, 2 H), 6.06 (s, 2 H), 3.48 (t, $j=7$ Гц, 2 H), 3.15 (t, $j=7$ Гц, 2 H), 1.71 (m, 2 H), 1.55 (m, 2 H), 0.97 (t, $J=7$ Гц, 3 H) і 0.74 (t, $J=7$ Гц, 3 H). МС (ESI^+):

$\text{C}_{11}\text{H}_{20}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}$, m/z ($\text{M}+\text{H}$) $^+$ =329.2.

СИНТЕЗ

14

Метил-3-

[(дипропіламіно)карбоніл]-5-(1-піролідинсульфоніл)-бензоат (XXXVIII) Для одержання вищевказаної сполуки використовують піролі дин (0.347 мл, 4.16 ммоль) і дотримуються загальної процедури СИНТЕЗУ 12 з незначними змінами. Метод аналізу: МС (ESI^+): $\text{C}_{19}\text{H}_{28}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}$, m/z ($\text{M}+\text{H}$) $^+$ =397.1.

СИНТЕЗ 15 3-[(дипропіламіно)карбоніл]-5-(1-піролідинсульфоніл)-бензойна кислота (XXXIX)

Для одержання вищевказаної сполуки дотримуються загальної процедури СИНТЕЗУ 13 з незначними змінами. Метод аналізу: МС (ESI^+): $\text{C}_{18}\text{H}_{26}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}$, m/z ($\text{M}+\text{H}$) $^+$ =383.3.

СИНТЕЗ

16

Метил-3-

[(дипропіламіно)карбоніл]-5-[(метиламіно)-сульфоніл]-бензоат (XXXVIII)

Для одержання вищевказаної сполуки використовують метиламін (2 N розчин у ТГФ, 0.692 мл, 1.38 ммоль) і дотримуються загальної процедури СИНТЕЗУ 12 з незначними змінами. Метод аналізу: МС (ESI^+): $\text{C}_{16}\text{H}_{24}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}$, m/z ($\text{M}+\text{H}$) $^+$ =357.1.

СИНТЕЗ 17 3-[(дипропіламіно)карбоніл]-5-[(метиламіно)-сульфоніл]-бензойна кислота (XXXVIII)

Для одержання вищевказаної сполуки дотримуються загальної процедури СИНТЕЗУ 13 з незначними змінами. Метод аналізу: МС (ESI^+): $\text{C}_{15}\text{H}_{22}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}$, m/z ($\text{M}+\text{H}$) $^+$ =343.1.

СИНТЕЗ

18

Метил-3-

[(диметиламіно)сульфоніл]-5-[(дипропіламіно)-карбоніл]-бензоат (XXXVIII)

Для одержання вищевказаної сполуки використовують диметиламін (2 N розчин у ТГФ, 0.692 мл, 1.38 ммоль) і дотримуються загальної процедури СИНТЕЗУ 12 з незначними змінами. Метод аналізу: МС (ESI^+): $\text{C}_{17}\text{H}_{26}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}$, m/z ($\text{M}+\text{H}$) $^+$ =371.1.

СИНТЕЗ 19 3-[(диметиламіно)сульфоніл]-5-[(дипропіламіно)-карбоніл]-бензойна кислота (XXXIX)

Для одержання вищевказаної сполуки дотримуються загальної процедури СИНТЕЗУ 13 з незначними змінами. Метод аналізу: МС (ESI^+): $\text{C}_{16}\text{H}_{24}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}$, m/z ($\text{M}+\text{H}$) $^+$ =357.1.

СИНТЕЗ

20

Метил 3-

[(дипропіламіно)карбоніл]-5-етилбензоат (IX)

У суміш метил-3-бром-5-[(дипропіламіно)-карбоніл]-бензоату (1.23 г, 3.6 ммоль) у сухому DMF (20 мл) додають: етилборонову кислоту (0.8 г, 10.8 ммоль), дихлорбіс(трифеніл-фосфін)-паладій (II) (0.252 г, 0.36 ммоль), карбонат калію (2.5 г, 18.0 ммоль) і хлорид літію (0.151 г, 3.6 ммоль). Отриману суміш нагрівають при температурі 100°C протягом 18 годин. Потім цю суміш розділяють між етилацетатом і водою. Фракції розділяють; етилацетатну фракцію промивають соляним розчином, сушать над безводним сульфатом натрію і концентрують. Отриманий концентрат розділяють за допомогою хроматографічної колонки (силікагель; етилацетат/гексан, 15/85) для виділення вищевказаної сполуки. Метод аналізу: МС (ESI^+): $\text{C}_{17}\text{H}_{25}\text{NO}_3$, m/z ($\text{M}+\text{H}$) $^+$ =292.2.

СИНТЕЗ 21 3-[(дипропіламіно)карбоніл]-5-етилбензойна кислота (IX)

Моногідрат гідроксиду літію (0.068 г, 1.6

ммоль) додають у суміш метил-3-[(дипропіламіно)карбоніл]-5-етилбензоату (СИН-ТЕЗ 20, 0.45 г, 1.6 ммоль) із ТГФ/метанол/вода (2/1/1, 8 мл). Отриману суміш перемішують при температурі 20-25°C протягом 3 годин. Потім цю суміш розбавляють водою, після цього додають соляну кислоту в такій кількості, щоб значення рН було меншим за 3. Водний розчин екстрагують за допомогою етилацетату. Органічну фракцію відокремлюють і промивають соляним розчином, сушать над безводним сульфатом магнію, фільтрують і концентрують для одержання вищевказаної сполуки. Метод аналізу: МС (ESI⁺): C₁₆H₂₃NO₃, m/z (M+H)⁺=278.2.

ПРИКЛАД 1 Трет-бутил-(1S)-бром-1-(3,5-дифторбензил)-2-оксопропілкарбамат (III)

N-метил-морфолін (5.83 мл, 53 ммоль, 1.05 екв.) додають у суміш (2S)-2-[(трет-бутоксикарбоніл)аміно]-3-(3,5-дифторфеніл)пропіонової кислоти (II, 15 г, 50 ммоль) із ТГФ (100 мл) і знижують температуру реакції до -78°C. Потім швидко додають ізобутил хлорформіат (6.87 мл, 53 ммоль, 1.05 екв.). Після цього прибирають охолодну ванну і перемішують суміш протягом 1 год. За реакцією спостерігають за допомогою апарата тонкошарової хроматографії (ТШХ), щоб гарантувати завершення реакції. Потім цю суміш фільтрують, промивають сухим ТГФ (50 мл) і зберігають при температурі -20°C у фільтрувальній колбі.

Мірний циліндр з об'ємом 500 мл, що містить ефір (200 мл) і водний розчин гідроксиду калію (40%, 60 мл) розміщують у льодосоляній ванні. При температурі нижчій за 0°C, перемішуючи, повільно додають 1-метил-3-нітро-1-нітрозоганідин (5.6 г, 106 ммоль, 2.1 екв.). Суміш набуває жовтого кольору, а газовиділення з утворенням бульбашок триває протягом 10 хвилин. Перемішування припиняють і, не змішуючи прошарки, верхній діазометановий ефірний прошарок переносять за допомогою піпетки в перемішувачу змішану ангідридну суміш при температурі -20°C. За реакцією спостерігають за допомогою ТШХ (етилацетат/гексан, 50/50; R_f = 0.69). Потім, після закінчення однієї год., через суміш пробулькують азот. Розчинник видаляють при зниженому тиску (з нагріванням), а суміш розділяють між ефіром і водою. Фракції розділяють, органічну фракцію промивають бікарбонатом, соляним розчином, сушать над безводним сульфатом натрію, а розчинник видаляють при зниженому тиску (з нагріванням). Осад розчиняють в ефірі (100 мл) і додають при температурі -20°C бромистоводневу кислоту (48%, 15 мл, 135 ммоль, 2.7 екв.), охолодну ванну прибирають, а суміш перемішують протягом наступних 30 хвилин. За реакцією спостерігають за допомогою ТШХ (етилацетат/гексан, 50/50; R_f = 0.88). Отриману суміш розділяють між ефіром і водою, промивають бікарбонатом, соляним розчином, сушать над безводним сульфатом натрію, а розчинник видаляють. Осад рекристалізують з етанолу для одержання вищевказаної сполуки. Методи аналізу: ТШХ (етилацетат/гексан, 50/50) R_f = 0.88; МС (M⁺)=379.3.

ПРИКЛАД 2 Трет-бутил-(1S,2S)-3-бром-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропілкарбамат (IV)

В трет-бутил-(1S)-бром-1-(3,5-дифторбензил)-

2-оксопропілкарбамат (III, ПРИКЛАД 1, 12 г, 31.75 ммоль), розчинений в абсолютному спирті (500 мл) при температурі -78°C додають борогідрид натрію (1.32 г, 34.9 ммоль, 1.1 екв.). Отриману суміш перемішують протягом 30 хвилин, спостерігаючи за реакцією за допомогою ТШХ (етилацетат/гексан, 20/80; R_f = 0.2). Суміш заливають водою (10 мл), а розчинник видаляють при зниженому тиску з нагріванням (що не перевищує 30°C) до сухого залишку. Сухий залишок розділяють між дихлорметаном і водою, промивають соляним розчином і сушать над безводним сульфатом натрію. Для одержання вищевказаної сполуки розчинник видаляють при зниженому тиску. Методи аналізу: ТШХ (етилацетат/гексан, 20/80) R_f = 0.2; МС (M⁺)=381.2.

ПРИКЛАД 3 Трет-бутил-(1S)-2-(3,5-дифторфеніл)-1-[(2S)-оксираніл]-етилкарбамат (V)

Трет-бутил-(1S,2S)-3-бром-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропілкарбамат (IV, ПРИКЛАД 2) розчиняють в абсолютному спирті (150 мл), додають при температурі -20°C етилацетат (100 мл) і гідроксид калію (2.3 г, 34.9 ммоль, 1.1 екв.) в етиловому спирті (85%, 5мл). Охолодну ванну прибирають, а суміш перемішують протягом наступних 30 хвилин. За реакцією спостерігають за допомогою ТШХ (етилацетат/гексан, 20/80). Після завершення реакції суміш розбавляють дихлорметаном і екстрагують, промивають водою, соляним розчином, сушать над безводним сульфатом натрію, а розчинник видаляють при зниженому тиску. Неочищений продукт очищують методом флеш-хроматографії (силікагель) для одержання вищевказаної сполуки. Методи аналізу: ТШХ (етилацетат/гексан, 20/80) R_f = 0.3; МС (M⁺)=300.4.

ПРИКЛАД 4 Трет-бутил-(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропілкарбамат (VII)

Трет-бутил-(1S)-2-(3,5-дифторфеніл)-1-[(2S)-оксираніл]-етилкарбамат (V, ПРИКЛАД 3, 245 мг, 0.82 ммоль) суспендують у ізопропіловому спирті (6 мл), додають при температурі 20-25°C, перемішуючи, 3-метоксибензиламін (160 мкл, 1.22 ммоль). Отриману суміш нагрівають до слабого кипіння (температура нагрівання 85 °C) в атмосфері азоту протягом 2 годин, після чого отриману суміш концентрують при зниженому тиску для одержання вищевказаної сполуки. Для одержання вищевказаної сполуки в чистому вигляді отриману речовину очищують методом флеш-хроматографії (2-5% метанол/метиленхлорид; градієнтне елювання).

ПРИКЛАД 5 (2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-1-[(3-метоксибензил)аміно]-2-бутанол-трифторацетат (VIII)

Трет-бутил-(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропілкарбамат (VII, ПРИКЛАД 4, 258 мг, 0.59 ммоль) розчиняють при температурі 20-25°C у метиленхлориді (1 мл) і додають, перемішуючи, трифтороцтову кислоту (1 мл) в атмосфері азоту. Отриману суміш перемішують при температурі 20-25°C протягом однієї год., після чого цю суміш концентрують при зниженому тиску для одержання вищевказаної сполуки. Отриману речовину вико-

ристовують у наступній процедурі синтезу без додаткового очищення.

ПРИКЛАД 6 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)-аміно]пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід (X)

Сіль (2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-1-[(3-метоксибензил)аміно]-2-бутанол-трифторацетат (VIII, ПРИКЛАД 5) розчиняють у безводному DMF (3 мл) і охолоджують суміш до температури 0°C. Тоді додають, перемішуючи, триетиламін (500 мкл, 3.6 ммоль) і 5-метил-N,N-дипропілізофталеву кислоту (156 мг, 0.59 ммоль). Отриману суміш протягом короткого часу нагрівають до температури 20-25°C, щоб цілком розчинилася карбонова кислота, перед тим, як охолодити до температури 0°C. Перемішуючи, додають 1-гідроксибензотриазол (157 мг, 1.2 ммоль), потім 1-(3-диметиламінопропіл)-3-етил-карбодіімід гідрохлорид (229 мг, 1.2 ммоль). Отриману суміш перемішують при температурі 0°C протягом 5 хвилин,

потім нагрівають до температури 20-25°C протягом 15 годин. Потім отриману суміш заливають водним розчином лимонної кислоти (10%) і тричі здійснюють екстрагування за допомогою етилацетату. Об'єднані органічні екстракти промивають насиченим бікарбонатом натрію, соляним розчином, сушать над безводним сульфатом натрію, фільтрують і концентрують при зниженому тиску для одержання вищевказаної речовини в неочищеному вигляді. Для одержання вищевказаної сполуки в чистому вигляді отриману речовину очищують методом флеш-хроматографії (2-5% метанол/метиленхлорид; градієнтне елювання). Метод аналізу: МС (ЕС) МН⁺=582.3.

ПРИКЛАДИ 7-9

Для одержання захищеної сполуки (III) зі стовпчика С використовують захисну групу зі стовпчика А, кислоту зі стовпчика В і дотримуються загальної процедури ПРИКЛАДА 1 з незначними змінами:

ПРИКЛАД	Стовпчик А	Стовпчик В	Стовпчик С
7	ВОС	Соляна	Трет-бутил-(1S)-3-хлор-1-(3,5-дифторбензил)-2-оксопропілкарбамат
8	CBZ	Бромистоводнева	Бензил-(1S)-3-бром-1-(3,5-дифторбензил)-2-оксопропілкарбамат
9	CBZ	Соляна	Бензил-(1S)-3-хлор-1-(3,5-дифторбензил)-2-оксопропілкарбамат

ПРИКЛАДИ 10-12

Для одержання спирту (IV) зі стовпчика В використовують захищену сполуку (III) зі стовпчика А

й дотримуються загальної процедури ПРИКЛАДА 2 з незначними змінами:

ПРИКЛАД	Стовпчик А	Стовпчик В
10	7	трет-бутил-(1S,2S)-3-хлор-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл карбамат
11	8	бензил-(1S,2S)-3-бром-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропілкарбамат
12	9	бензил-(1S,2S)-3-хлор-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропілкарбамат

ПРИКЛАД 13

Бензил-(1S)-2-(3,5-дифторфеніл)-1-[(2S)-оксираніл]-етилкарбамат (V)

Для одержання вищевказаної сполуки використовують спирт (IV) з ПРИКЛАДА 12 і дотримуються загальної процедури ПРИКЛАДА 3 з незначними змінами.

ПРИКЛАДИ 14-107

Для одержання захищеного спирту (VII) зі стовпчика В використовують реакцію трет-бутил-(1S,2S)-1-(2-оксираніл)-2-фенілетилкарбамату (V, є в продажу) з С-кінцевою аміногрупою зі стовпчика А і дотримуються загальної процедури ПРИКЛАДА 4 з незначними змінами.

ПРИК- ЛАД	Стовпчик А С-кінцева аміногрупа	Стовпчик В Захищений спирт (VII)
14	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2\text{CH}_3$	трет-бутил-(1S,2R)-1-бензил-3-етиламіно-2-гідроксипропіл карбамат
15	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2$ -феніл	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-3-(бензиламіно)-2-гідроксипропілкарбамат
16	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-3-(ізопропіламіно)-2-гідроксипропілкарбамат
17	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2$ -феніл-4- CH_3	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(4-метилбензил)аміно]пропілкарбамат
18	$\text{H}_2\text{N}-(\text{CH}_2)_2$ -феніл-4- OCH_3	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[[2-(4-метоксифеніл)етил]аміно}пропілкарбамат
19	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2$ -феніл-3- OCH_3	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропілкарбамат
20	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}(\text{-феніл})-\text{CO}-\text{OC}_2\text{H}_5$	етил({(2R,3S)-3-[(трет-бутоксикарбоніл)аміно]-2-гідрокси-4-фенілбутил}аміно)(феніл)ацетат
21	$\text{H}_2\text{N}-(\text{CH}_2)_2$ -феніл	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(2-фенілетил)аміно]пропілкарбамат
22	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}(\text{-CH}_2\text{OH})-\text{CH}(\text{OH})$ -феніл-4- NO_2	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[[{(1S)-2-гідрокси-1-(гідроксиметил)-2-(4-нітрофеніл)етил]аміно}пропілкарбамат
23	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2$ -феніл-2-Cl	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-3-[(2-хлорбензил)аміно]-2-гідроксипропілкарбамат
24	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2$ -феніл-4-Cl	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-3-[(4-хлорбензил)аміно]-2-гідроксипропілкарбамат
25	$\text{H}_2\text{N}-(\text{CH}_2)_2-\text{O}-(\text{CH}_2)_2-\text{OH}$	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[[2-(2-гідроксіетокси)етил]аміно}пропілкарбамат
26	H_2N -1-інданіл	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-3-(2,3-дигідро-1H-інден-1-іламіно)-2-гідроксипропілкарбамат
27	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{OH})-\text{CH}_3$	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(2-гідроксипропіл)аміно]пропілкарбамат
28	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2$ -тетрагідрофураніл	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[[тетрагідро-2-фуранілметил]аміно]пропілкарбамат

29	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{OCH}_2\text{CH}_3)$	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-3-[(2,2-діетоксіетил)аміно]-2-гідроксипропілкарбамат
30	$\text{H}_2\text{N}-(\text{CH}_2)_4-\text{CH}_3$	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-(пентиламіно)пропілкарбамат
31	H_2N -циклогексил	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-3-(циклогексиламіно)-2-гідроксипропілкарбамат
32	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2$ -піридин-2-іл	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(2-піридинілметил)аміно]пропілкарбамат
33	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2$ -феніл-2- NH_2	трет-бутил(1S,2R)-3-[(2-амінобензил)аміно]-1-бензил-2-гідроксипропілкарбамат
34	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2$ -піридин-3-іл	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-піридинілметил)аміно]пропілкарбамат
35	$\text{H}_2\text{N}-(\text{CH}_2)_2$ -піролідін-1-іл	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[[2-(1-піролідиніл)етил]аміно]пропілкарбамат
36	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{OH})$ -феніл	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(2-гідрокси-2-фенілетил)аміно]пропілкарбамат
37	$\text{H}_2\text{N}-(\text{CH}_2)_3-\text{O}-(\text{CH}_2)_3-\text{CH}_3$	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-3-[(3-бутоксипропіл)аміно]-2-гідроксипропілкарбамат
38	$\text{H}_2\text{N}-(\text{CH}_2)_3-\text{O}-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-ізопропоксипропіл)аміно]пропілкарбамат
39	$\text{H}_2\text{N}-(\text{CH}_2)_2-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)пропілкарбамат
40	$\text{H}_2\text{N}-(\text{CH}_2)_3$ -феніл	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-фенілпропіл)аміно]пропілкарбамат
41	$\text{H}_2\text{N}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_3$	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(2-метоксіетил)аміно]пропілкарбамат
42	$\text{H}_2\text{N}-(\text{CH}_2)_2-\text{O}$ -феніл	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(2-феноксіетил)аміно]пропілкарбамат
43	$\text{H}_2\text{N}-(\text{CH}_2)_2-\text{O}-(\text{CH}_2)_2-\text{CH}_3$	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(2-пропоксіетил)аміно]пропілкарбамат
44	$\text{H}_2\text{N}-(\text{CH}_2)_2-\text{C}(\text{CH}_3)_3$	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-3-[(3,3-диметилбутил)аміно]-2-гідроксипропілкарбамат

45	$\text{H}_2\text{N}-(\text{CH}_2)_4$ -феніл	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(4-фенілбутил)аміно]пропілкарбамат
46	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2$ -феніл-3-I	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-йодбензил)аміно]пропілкарбамат
47	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2$ -феніл-4- NO_2	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(4-нітробензил)аміно]пропілкарбамат
48	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2$ -феніл-3-Cl	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-3-[(3-хлорбензил)аміно]-2-гідроксипропілкарбамат
49	$\text{H}_2\text{N}-(\text{CH}_2)_2$ -феніл-4-Cl	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-3-{[2-(4-хлорфеніл)етил]аміно}-2-гідроксипропілкарбамат
50	$\text{H}_2\text{N}-(\text{CH}_2)_2$ -піридин-2-іл	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-{[2-(2-піридиніл)етил]аміно}пропілкарбамат
51	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2$ -піридин-4-іл	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(4-піридинілметил)аміно]пропілкарбамат
52	$\text{H}_2\text{N}-(\text{CH}_2)_2$ -(N-метилпіролідін-2-іл)	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-{[2-(1-метил-2-піролідиніл)етил]аміно}-пропілкарбамат
53	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2$ -феніл-2,3-диметил	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-3-[(2,3-диметилбензил)аміно]-2-гідроксипропілкарбамат
54	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2$ -феніл-2- OCF_3	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-{[2-(трифторметокси)бензил]аміно}пропілкарбамат
55	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2$ -феніл-2- $\text{C}_{10}\text{H}_7\text{O}$ -феніл	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-3-[(2-хлор-6-феноксibenзил)аміно]-2-гідроксипропілкарбамат
56	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2$ -феніл-4- CF_3	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-{[4-(трифторметил)бензил]аміно}пропілкарбамат
57	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2$ -феніл-2,3-дихлор	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-3-[(2,3-дихлорбензил)аміно]-2-гідроксипропілкарбамат
58	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2$ -феніл-3,5-дихлор	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-3-[(3,5-дихлорбензил)аміно]-2-гідроксипропілкарбамат
59	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2$ -феніл-3,5-дифтор	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-3-[(3,5-дифторбензил)аміно]-2-гідроксипропілкарбамат
60	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2$ -феніл-4- OCF_3	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-{[4-(трифторметокси)бензил]аміно}пропілкарбамат

61	$\text{H}_2\text{N}-(\text{CH}_2)_2$ -феніл-4- $\text{SO}_2\text{-NH}_2$	трет-бутил(1S,2R)-3-{[4-(аміносультфоніл)бензил]аміно}-1-бензил-2-гідроксипропілкарбамат
62	$\text{H}_2\text{N-CH}_2$ -феніл-4- OCH_3	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-{[4-метоксибензил]аміно}пропілкарбамат
63	$\text{H}_2\text{N-CH}_2$ -феніл-4- CH_3	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-{[4-метилбензил]аміно}пропілкарбамат
64	$\text{H}_2\text{N-CH}_2$ -Ph-3,4,5-триметокси	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-{[3,4,5-триметоксибензил]аміно}пропілкарбамат
65	$\text{H}_2\text{N-CH}_2$ -феніл-3- OCF_3	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-{[3-(трифторметокси)бензил]аміно}пропілкарбамат
66	$\text{H}_2\text{N-CH}_2$ -феніл-3,5-диметокси	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-3-{[3,5-диметоксибензил]аміно}-2-гідроксипропілкарбамат
67	$\text{H}_2\text{N-CH}_2$ -феніл-2,4-диметокси	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-3-{[2,4-диметоксибензил]аміно}-2-гідроксипропілкарбамат
68	$\text{H}_2\text{N-CH}_2$ -феніл-феніл	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-3-{[1,1'-біфеніл]-3-іл-метил]аміно}-2-гідроксипропілкарбамат
69	$\text{H}_2\text{N-CH}_2$ -феніл-3,4-дихлор	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-3-{[3,4-дихлорбензил]аміно}-2-гідроксипропілкарбамат
70	$\text{H}_2\text{N-CH}_2$ -феніл-4-F	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-3-{[4-фторбензил]аміно}-2-гідроксипропілкарбамат
71	$\text{H}_2\text{N-CH}_2$ -феніл-3- CF_3	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-{[3-(трифторметил)бензил]аміно}пропілкарбамат
72	$\text{H}_2\text{N-CH}_2$ -феніл-2- CH_3	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-{[2-метилбензил]аміно}пропілкарбамат
73	$\text{H}_2\text{N-CH}((\text{R})-\text{CH}_3)$ -феніл	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-{[(1R)-1-фенілетил]аміно}пропілкарбамат
74	$\text{H}_2\text{N-CH}((\text{S})-\text{CH}_3)$ -феніл	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-{[(1S)-1-фенілетил]аміно}пропілкарбамат
75	$\text{H}_2\text{N-CH}_2$ -феніл-3,5-(біс)трифторметил	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-3-{[3,5-біс(трифторметил)бензил]аміно}-2-гідроксипропілкарбамат
76	$\text{H}_2\text{N-CH}_2$ -феніл-2- CF_3	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-{[2-(трифторметил)бензил]аміно}пропілкарбамат
77	$\text{H}_2\text{N-CH}((\text{S})-\text{CH}_3)$ -(нафт-1-іл)	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-{[(1S)-1-(1-нафтил)етил]аміно}-пропілкарбамат

78	$\text{-NH}_2\text{-CH}((\text{R})\text{-CH}_3)\text{-}$ (нафт-1-іл)	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3- $\{[(1\text{R})\text{-1-}$ (1-нафтил)етил]аміно $\}$ пропілкарбамат
79	$\text{H}_2\text{N-CH}_2\text{-феніл-3-}$ $\text{OCH}_3\text{-4-OH}$	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3- $\{[(4\text{-}$ гідрокси-3-метоксибензил)аміно $\}$ пропілкарбамат
80	$\text{H}_2\text{N-CH}_2\text{-феніл-3,4-}$ дигідрокси	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-3- $\{[(3,4\text{-}$ дигідроксибензил)аміно $\}$ -2-гідроксипропілкарбамат
81	$\text{H}_2\text{N-}(\text{CH}_2)_3\text{-OCH}_3$	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3- $\{[(3\text{-}$ метоксипропіл)аміно $\}$ пропілкарбамат
82	$\text{H}_2\text{N-CH}((\text{S})\text{-CH}_3)\text{-CH}_2\text{-}$ OH	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3- $\{[\text{E}(1\text{S})\text{-2-}$ гідрокси-1-метилетил]аміно $\}$ пропілкарбамат
83	$\text{H}_2\text{N-CH}((\text{R})\text{-CH}_3)\text{-CH}_2\text{-}$ OH	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3- $\{[(1\text{R})\text{-2-}$ гідрокси-1-метилетил]аміно $\}$ пропілкарбамат
84	$\text{H}_2\text{N-CH}_2\text{-C=CH}$	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-(2- пропініламіно)пропілкарбамат
85	$\text{H}_2\text{N-}(\text{CH}_2)_2\text{-феніл-2-F}$	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-3- $\{[2\text{-(2-}$ фторфеніл)етил]аміно $\}$ -2-гідроксипропілкарбамат
86	$\text{H}_2\text{N-}(\text{CH}_2)_2\text{-феніл-3-F}$	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-3- $\{[2\text{-(3-}$ фторфеніл)етил]аміно $\}$ -2-гідроксипропілкарбамат
87	$\text{H}_2\text{N-}(\text{CH}_2)_2\text{-феніл-4-F}$	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-3- $\{[2\text{-(4-}$ фторфеніл)етил]аміно $\}$ -2-гідроксипропілкарбамат
88	$\text{H}_2\text{N-}(\text{CH}_2)_2\text{-феніл-4-Br}$	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-3- $\{[2\text{-(4-}$ бромфеніл)етил]аміно $\}$ -2-гідроксипропілкарбамат
89	$\text{H}_2\text{N-}(\text{CH}_2)_2\text{-феніл-3-}$ OCH_3	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3- $\{[2\text{-(3-}$ метоксифеніл)етил]аміно $\}$ пропілкарбамат
90	$\text{H}_2\text{N-}(\text{CH}_2)_2\text{-феніл-2,4-}$ дихлор	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-3- $\{[2\text{-(2,4-}$ дихлорфеніл)етил]аміно $\}$ -2-гідроксипропілкарбамат
91	$\text{H}_2\text{N-}(\text{CH}_2)_2\text{-феніл-3-Cl}$	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-3- $\{[2\text{-(3-}$ хлорфеніл)етил]аміно $\}$ -2-гідроксипропілкарбамат
92	$\text{H}_2\text{N-}(\text{CH}_2)_2\text{-феніл-2,5-}$ диметокси	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-3- $\{[2\text{-(2,5-}$ диметоксифеніл)етил]аміно $\}$ -2- гідроксипропілкарбамат
93	$\text{H}_2\text{N-}(\text{CH}_2)_2\text{-феніл-4-}$ CH_3	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3- $\{[2\text{-(4-}$ метилфеніл)етил]аміно $\}$ пропілкарбамат
94	$\text{H}_2\text{N-CH}((\text{R})\text{-CH}_2\text{-OH})\text{-}$ $\text{CH}_2\text{-феніл}$	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-3- $\{[(1\text{R})\text{-1-бензил-2-}$ гідроксietил]аміно $\}$ -2-гідроксипропілкарбамат

95	$\text{H}_2\text{N}-(\text{CH}_2)_3-(1\text{-морфолініл})$	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-{[3-(4-морфолініл)пропіл]аміно}пропілкарбамат
96	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2-\text{C}(\text{CH}_3)_2$	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-3-{[3,3-диметилбутил]аміно}-2-гідроксипропілкарбамат
97	$\text{H}_2\text{N}-(\text{CH}_2)_2-(1\text{-морфолініл})$	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-{[2-(4-морфолініл)етил]аміно}пропілкарбамат
98	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}(\text{OH})-\text{CH}_2-\text{CH}_3$	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-{[1-гідроксипропіл]аміно}пропілкарбамат
99	$\text{H}_2\text{N}-(\text{CH}_2)_2-(\text{тієн-2-іл})$	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-{[2-тієнілметил]аміно}пропілкарбамат
100	$\text{H}_2\text{N}-(\text{CH}_2)_4-\text{OH}$	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-{[4-гідроксибутил]аміно}пропілкарбамат
101	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}(-(\text{S})\text{CH}_2-\text{OH})\text{-феніл}$	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-{[(1S)-2-гідрокси-1-фенілетил]аміно}пропілкарбамат
102	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2\text{-феніл-2,4-дихлор}$	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-3-{[2,4-дихлорбензил]аміно}-2-гідроксипропілкарбамат
103	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}(-(\text{R})\text{CH}_2-\text{OH})\text{-феніл}$	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-{[(1R)-2-гідрокси-1-фенілетил]аміно}пропілкарбамат
104	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2\text{-феніл-4-C}(\text{CH}_3)_3$	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-3-{[4-трет-бутилбензил]аміно}-2-гідроксипропілкарбамат
105	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-феніл}$	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-{[1-фенілетил]аміно}пропілкарбамат
106	$\text{H}_2\text{N}-(1\text{R},2\text{S})\text{-2-гідроксіінден-1-іл}$	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-{[(1R,2S)-2-гідрокси-2,3-дигідро-1H-інден-1-іл]аміно}пропілкарбамат
107	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2\text{-феніл-3,4-диметил}$	трет-бутил(1S,2R)-1-бензил-3-{[3,4-диметилбензил]аміно}-2-гідроксипропілкарбамат

ПРИКЛАДИ 108-164

Відповідно до методики ПРИКЛАДА 4 і здійснюючи незначні зміни, виконували реакцію трет-

бутил-(1S)-2-(3,5-дифторфеніл)-1-[(2S)-оксираніл]-етилкарбамату (V, ПРИКЛАД 3) з С-кінцевим аміном (VI) зі стовпчика А й одержали захищений спирт (VII) зі стовпчика В.

Приклад	Стовпчик А С-кінцевий амін (VI)	Стовпчик В захищений спирт (VII)
108	$\text{H}_2\text{N}-(\text{CH}_2)_6-\text{CO}-\text{O}-\text{CH}_3$	Метил-7-{[(2R,3S)-3-[(трет-бутоксикарбоніл)аміно]-4-(3,5-дифторфеніл)-2-гідроксибутил]аміно}гептаоат
109	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CO}-\text{NH}-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ r/s	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-{[2-(ізобутиламіно)-1-метил-2-оксоетил]аміно}пропілкарбамат
110	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}((\text{S})-\text{CH}_3)-\text{CO}-\text{NH}-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-{[(1S)-2-(ізобутиламіно)-1-метил-2-оксоетил]аміно}пропілкарбамат
111	$\text{H}_2\text{N}-\text{C}(\text{CH}_3)_2-\text{CO}-\text{NH}-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-{[2-(ізобутиламіно)-1,1-диметил-2-оксоетил]аміно}пропілкарбамат
112	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{NH}-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-{[2-(ізобутиламіно)-2-оксоетил]аміно}пропілкарбамат
113	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}((\text{S})-\text{CH}_2\text{CH}_3)-\text{CO}-\text{NH}-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-{[(1S)-1-[(ізобутиламіно)карбоніл]-пропіл]аміно}пропілкарбамат
114	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}((\text{R})-\text{CH}_2\text{CH}_3)-\text{CO}-\text{NH}-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-{[(1R)-1-[(ізобутиламіно)карбоніл]-пропіл]аміно}пропілкарбамат
115	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2$ -феніл	трет-бутил(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропілкарбамат
116	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2-\text{CH}_3$	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-(етиламіно)-2-гідроксипропілкарбамат
117	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(ізобутиламіно)пропілкарбамат
118	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CONH}-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-{[3-(ізобутиламіно)-2-метил-3-оксопропіл]аміно}пропілкарбамат
119	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2$ -феніл-4-N(CH ₃) ₂	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-{[4-(диметиламіно)бензил]аміно}-2-гідроксипропілкарбамат
120	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}((\text{S})-\text{CH}_2\text{-феніл})-\text{CO}-\text{NH}-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	трет-бутил(1S,2R)-3-{[(1S)-1-(3,5-дифторбензил)-2-{ізобутиламіно}-2-оксоетил]аміно}-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропілкарбамат
121	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}((\text{S})-\text{CH}(\text{CH}_3)_2)-\text{CO}-\text{NH}-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-{[(1S)-1-[(ізобутиламіно)карбоніл]-3-метилбутил]аміно}пропілкарбамат
122	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2\sim\text{CH}_2-\text{N}(\text{CH}_3)_2$	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-{[2-(диметиламіно)етил]аміно}-2-

123	$H_2N-CH_2-(\text{піридин-3-іл})$	гідроксипропілкарбамат-трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-піридинілметил)аміно]пропілкарбамат
124	$H_2N-CH((S)-CH_2-O-CH_2-\text{феніл})-CO-NH-CH_2-CH(CH_3)_2$	трет-бутил(1S,2R)-3-{[(1S)-1-[(бензилокси)метил]-2-(ізобутиламіно)-2-оксоетил]аміно}-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропілкарбамат
125	$H_2N-C(-CH_3)_2-\text{феніл}$	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(1-метил-1-фенілетил)аміно]пропілкарбамат
126	$H_2N-CH((R)-CH(CH_3)_2)-CO-NH-CH_2-CH(CH_3)_2$	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-{(1R)-1-[(ізобутиламіно)карбоніл]-3-метилбутил}амінопропілкарбамат
127	$H_2N-CH((S)-CH_2-CH_2-CH_3)-CO-NH-CH_2-CH(CH_3)_2$	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-{(1S)-1-[(ізобутиламіно)карбоніл]бутил}амінопропіл карбамат
128	$H_2N-CH((S)-CH_2-OH)-CO-NH-CH_2-CH(CH_3)_2$	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-{[(1S)-1-(гідроксиметил)-2-(ізобутиламіно)-2-оксоетил]аміно}пропілкарбамат
129	$H_2N-CH_2-CH_2-\text{феніл}$	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(2-фенілетил)аміно]пропілкарбамат
130	$H_2N-CH((S)-CH_3)-CO-NH-CH_2-\text{феніл}$	трет-бутил(1S,2R)-3-{[2-(бензиламіно)-1-метил-2-оксоетил]аміно}-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропілкарбамат
131	$H_2N-CH((S)-CH_2-CH_3)-\text{феніл}$	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-{[(1S)-2-(бензиламіно)-1-метил-2-оксоетил]аміно}-2-гідроксипропілкарбамат
132	$H_2N-CH_2-\text{феніл-3-OCH}_3$	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропілкарбамат
133	$H_2N-CH((S)-\text{феніл})CO-NHCH_2CH(CH_3)_2$	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-{[(1S)-2-(ізобутиламіно)-2-оксо-1-
134	$H_2N-CH_2-CH_2-CH(CH_3)_2$	фенілетил]аміно}пропілкарбаматтрет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)пропілкарбамат
135	$H_2N-\text{циклогексил}$	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-(циклогексиламіно)-2-гідроксипропілкарбамат
136	$H_2N-(CH_2)_3-CH_3$	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-(бутиламіно)-2-гідроксипропілкарбамат
137	$H_2N-(CH_2)_3-O-CH_3$	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксипропіл)аміно]пропілкарбамат

138	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{OH})$ -феніл	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(2-гідрокси-2-фенілетил)аміно]пропілкарбамат
139	H_2N -циклогексил-3,5-диметокси	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[{(3R,5S)-3,5-диметоксициклогексил]аміно}-2-гідроксипропілкарбамат
140	H_2N -циклогексил-3,5-ди-(-CO-OCH ₃)	диметил(1R,3S)-5-({(2R,3S)-3-[(трет-бутоксикарбоніл)аміно]-2-гідрокси-4-фенілбутил}аміно)-1,3-циклогександикарбоксилат
141	H_2N -циклогексил-3,5-ди-(-COOH)	{1R,3S}-5-({(2R,3S)-3-[(трет-бутоксикарбоніл)аміно]-2-гідрокси-4-фенілбутил}аміно)-1,3-циклогександикарбонова кислота
142	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}((\text{R})-\text{CH}_2-\text{CH}_3)$ -феніл	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[[{(1R)-1-фенілпропіл]аміно}пропілкарбамат
143	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2$ -феніл-3-Cl	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-хлорбензил)аміно]-2-гідроксипропілкарбамат
144	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2$ -феніл-3-OCH ₃	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропілкарбамат
145	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2$ -феніл-феніл	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[[{1,1'-біфеніл]-3-ілметил]аміно]-2-гідроксипропілкарбамат
146	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2$ -феніл-3-1	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-йодбензил)аміно]-пропілкарбамат
147	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2$ -феніл-3-CH ₃	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метилбензил)аміно]пропілкарбамат
148	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2-\text{CH}(-\text{CH}_3)$ -феніл	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(2-фенілпропіл)аміно]пропілкарбамат
149	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2$ -(тіазол-5-іл)	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(1,3-тіазол-5-ілметил)аміно]пропілкарбамат
150	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2$ -(тієн-2-іл)	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(2-тієнілметил)аміно]пропілкарбамат
151	H_2N -4-метокситетралін-1-іл	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(5-метокси-1,2,3,4-тетрагідро-1-нафталеніл)аміно]пропілкарбамат
152	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2$ -піразин-2-іл	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(2-піразинілметил)аміно]пропілкарбамат
153	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2$ -феніл-3,5-дифтор	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3,5-дифторбензил)аміно]-2-гідроксипропілкарбамат
154	$\text{H}_2\text{N}-\text{CH}_2$ -феніл-3,4-метилендіокси	трет-бутил(1S,2R)-3-[(1,3-бензодіоксол-5-ілметил)аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропілкарбамат

155	H ₂ N-CH ₂ -феніл-3,5-диметокси	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3,5-диметоксибензил)аміно]-2-гідроксипропілкарбамат
156	H ₂ N-CH ₂ -феніл-3-CF ₃	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-{[3-(трифторметил)бензил]аміно}пропілкарбамат
157	H ₂ N-CH ₂ -(фуран-2-іл)	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(2-фурилметил)аміно]-2-гідроксипропілкарбамат
158	H ₂ N-(7-метокситетралін-1-іл)	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(7-метокси-1,2,3,4-тетрагідро-1-нафталеніл)аміно]пропілкарбамат
159	H ₂ N-CH ₂ -феніл-3-O-CF ₃	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-{[3-(трифторметокси)бензил]аміно}пропілкарбамат
160	H ₂ N-CH ₂ -феніл-3-F	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-фторбензил)аміно]-2-гідроксипропілкарбамат
161	H ₂ N-CH ₂ -феніл-3-O-CH(CH ₃) ₂	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-ізопропоксибензил)аміно]пропілкарбамат
162	H ₂ N-CH ₂ -феніл-3-Br	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-бромбензил)аміно]-2-гідроксипропілкарбамат
163	H ₂ N-CH ₂ -(5-метилфуран-2-іл)	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-{[(5-метил-2-фурил)метил]аміно}пропілкарбамат
164	H ₂ N-(5-метокситетралін-1-іл)	трет-бутил(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(5-метокси-1,2,3,4-тетрагідро-1-нафталеніл)аміно]пропілкарбамат

ПРИКЛАД 165 Трет-бутил-(1S,2R)-3-азидо-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропілкарбамат (XII)

Азид натрію (0.22 г, 4 ммоль) і хлорид амонію (2 екв.) додають до трет-бутил-(1S)-2-(3,5-дифторфеніл)-1-[(2S)-оксираніл]етилкарбамату (V, ПРИКЛАД 3, 0.6 г, 2 ммоль). Реакційну суміш нагрівають до 75-80°C і перемішують 16 годин. Завершення реакції перевіряють ТШХ. Розчинник видаляють при зниженому тиску. Залишок розділяють між етилацетатом і водою, фази розділяють, органічну фазу промивають бікарбонатом і соляним розчином і концентрують для одержання названої сполуки, ТШХ (етилацетат/гексан) R_f = 0.45; MS (M⁺) = 343.

ПРИКЛАД 166 (2R, 3S)-3-аміно-1-азидо-4-(3,5-дифторфеніл)-2-бутанол (XIV)

Трет-бутил-(1S,2R)-3-азидо-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропілкарбамат (XII, ПРИКЛАД 165, 0.48 г, 1.41 ммоль) розчиняють у дихлорметані (20 мл), потім додають трифтороцтову кислоту (5 мл). Реакційну суміш перемішують при 20-25°C 16 годин, і розчинник видаляють при зниженому тиску і нагріванні. Етилацетат додають двічі і двічі випарюють для одержання названої сполуки у вигляді солі трифтороцтової кислоти, що використовується в наступній реакції без додаткового очищення. MS (M⁺) = 242.

ПРИКЛАД 167 N¹-[(1S,2R)-3-азидо-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід (XV)

До (2R,3S)-3-аміно-1-азидо-4-(3,5-дифторфеніл)-2-бутанолу (XIV, ПРИКЛАД 166,

0.34 г, 1.4 ммоль) у дихлорметані (20 мл) додають Н,Н-дипропіламідоізофталеву кислоту (IX, 0.53 г, 2 ммоль), трет-бутанол (0.27 г, 2 ммоль) і триетиламін (0.84 мл, 6 ммоль) і етил -1-(3-диметиламінопропіл)карбодіамід (0.58 г, 3 ммоль). Суміш перемішують при 20-25°C 16 годин. Закінчення реакції перевіряють ТШХ (метанол/дихлорметан, 20/80 + етилацетат/гексан, 50/50; R_f = 0.76). Після закінчення реакції за даними ТШХ реакційну суміш розділяють між дихлорметаном і водою, промивають соляною кислотою (0.5 Н), бікарбонатом, соляним розчином, сушать безводним сульфатом натрію і розчинник видаляють при зниженому тиску при нагріванні. Одержаний концентрат хроматографують на силікагелі для одержання названої сполуки; MS (M⁺) = 488.

ПРИКЛАД 168 N¹-[(1S,2R)-3-аміно-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталаміду ацетат (XVI)

N¹-[(1S,2R)-3-азидо-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід (XV, ПРИКЛАД 167, 0.3 г, 0.62 ммоль) у етилацетаті (20 мл) і оцтову кислоту (5 мл) вміщують в апарат Парра. Додають паладій на вугіллі (10%, 5 г) і струшують суміш в атмосфері водню при тиску 50 фунт/кв. дюйм 2 години. Суміш фільтрують через дифузорну землю і концентрують фільтрат для одержання названої сполуки; MS (M⁺) = 462.

ПРИКЛАД 169 N¹-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(2-фурилметил)аміно]-2-гідрокси-пропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід (X)

Ацетат N¹-[(1S,2R)-3-аміно-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N³,N³-дипропілізофталаміду (XVI, ПРИКЛАД 168, 76 мг, 0.146 ммоль) розчиняють в абсолютному етанолі (2 мл). 3-Фуральдегід (20 мкл, 0.231 ммоль) і триетиламін (30 мкл, 0.215 ммоль) додають через шприц при перемішуванні при 20-25°C. Через 10 хвилин додають паладій на вугіллі (122 мг, 5 ваг. %) і струшують суміш в атмосфері водню (50 фунт/кв. дюйм) 20 хвилин. Одержану суміш фільтрують через дифузорну землю і промивають етанолом. Фільтрат очищують флеш-хроматографією (2-10% метанол/метиленхлорид) для отримання очищеної цільової сполуки, MS (MН⁺) = 542.2.

ПРИКЛАД 169a Трет-бутил-(1S,2R)-1-(3,5-

дифторбензил)-3-[[[(1S)-2-(етиламіно)-1-метил-2-оксоетил]аміно]-2-гідроксипропілкарбамат (VII)

Відповідно до методики ПРИКЛАДІВ 4 і 14-164 і здійснюючи незначні зміни одержують цільову сполуку реакцією трет-бутил-(1S)-2-(3,5-дифторфеніл)-1-[(2S)-оксираніл]етилкарбамату (V, ПРИКЛАД 3) з (2S)-2-аміно-N-етилпропанаміду (VI).

ПРИКЛАДИ 170-320

Відповідно до методики ПРИКЛАДА 5 і здійснюючи незначні зміни з захищеного спирту (VII) стовпчика А одержують амін (VIII) зі стовпчика В.

У стовпчику А вказані захищені спирти (VII) шляхом посилання на відповідний номер ПРИКЛАДА.

Приклад	А	Стовпчик В Амін (VIII)
170	14	(2R,3S)-3-аміно-1-(етиламіно)-4-феніл-2-бутанол
171	15	(2R,3S)-3-аміно-1-(бензиламіно)-4-феніл-2-бутанол
172	16	(2R,3S)-3-аміно-1-(ізопропіламіно)-4-феніл-2-бутанол
173	17	(2R,3S)-3-аміно-1-[(4-метилбензил)аміно]-4-феніл-2-бутанол
174	18	(2R,3S)-3-аміно-1-{[2-(4-метоксифеніл)етил]аміно}-4-феніл-2-бутанол
175	19	(2R,3S)-3-аміно-1-[(3-метоксибензил)аміно]-4-феніл-2-бутанол
176	20	Етил{[(2R,3S)-3-аміно-2-гідрокси-4-фенілбутил]аміно}(феніл)ацетат
177	21	(2R,3S)-3-аміно-4-феніл-1-[(2-фенілетил)аміно]-2-бутанол
178	22	(2S)-2-{[(2R,3S)-3-аміно-2-гідрокси-4-фенілбутил]аміно}-1-(4-нітрофеніл)-1,3-пропандіол
179	23	(2R,3S)-3-аміно-1-[(2-хлорбензил)аміно]-4-феніл-2-бутанол
180	24	(2R,3S)-3-аміно-1-[(4-хлорбензил)аміно]-4-феніл-2-бутанол
181	25	(2R,3S)-3-аміно-1-{[2-(2-гідроксіетокси)етил]аміно}-4-феніл-2-бутанол

182	26	(2R,3S)-3-аміно-1-(2,3-дигідро-1H-інден-1-іламіно)-4-феніл-2-бутанол
183	27	(2R,3S)-3-аміно-1-[(2-гідроксипропіл)аміно]-4-феніл-2-бутанол
184	28	(2R,3S)-3-аміно-4-феніл-1-[(тетрагідро-2-фуранілметил)аміно]-2-бутанол
185	29	(2R,3S)-3-аміно-1-[(2,2-діетоксіетил)аміно]-4-феніл-2-бутанол
186	30	(2R,3S)-3-аміно-1-(бутиламіно)-4-феніл-2-бутанол
187	31	(2R,3S)-3-аміно-1-(циклогексиламіно)-4-феніл-2-бутанол
188	32	(2R,3S)-3-аміно-4-феніл-1-[(2-піридинілметил)аміно]-2-бутанол
189	33	(2R,3S)-3-аміно-1-[(2-амінобензил)аміно]-4-феніл-2-бутанол
190	34	(2R,3S)-3-аміно-4-феніл-1-[(3-піридинілметил)аміно]-2-бутанол
191	35	(2R,3S)-3-аміно-4-феніл-1-{[2-(1-піролідиніл)етил]аміно}-2-бутанол
192	36	(2R,3S)-3-аміно-1-[(2-гідрокси-2-фенілетил)аміно]-4-феніл-2-бутанол
193	37	(2R,3S)-3-аміно-1-[(3-бутоксипропіл)аміно]-4-феніл-2-бутанол
194	38	(2R,3S)-3-аміно-1-[(3-ізопропоксипропіл)аміно]-4-феніл-2-бутанол
195	39	(2R,3S)-3-аміно-1-(ізопентиламіно)-4-феніл-2-бутанол
196	40	(2R,3S)-3-аміно-4-феніл-1-[(3-фенілпропіл)аміно]-2-бутанол
197	41	(2R,3S)-3-аміно-1-[(2-метоксіетил)аміно]-4-феніл-2-бутанол
198	42	(2R,3S)-3-аміно-1-[(2-феноксіетил)аміно]-4-феніл-2-бутанол
199	43	(2R,3S)-3-аміно-4-феніл-1-[(2-пропоксиетил)аміно]-2-бутанол
200	44	(2R,3S)-3-аміно-1-[(3,3-диметилбутил)аміно]-4-феніл-2-бутанол
201	45	(2R,3S)-3-аміно-4-феніл-1-[(4-фенілбутил)аміно]-2-бутанол
202	46	(2R,3S)-3-аміно-1-[(3-йодбензил)аміно]-4-феніл-2-бутанол
203	47	(2R,3S)-3-аміно-1-[(4-нітробензил)аміно]-4-феніл-2-бутанол
204	48	(2R,3S)-3-аміно-1-[(3-хлорбензил)аміно]-4-феніл-2-бутанол
205	49	(2R,3S)-3-аміно-1-{[2-(4-хлорфеніл)етил]аміно}-4-феніл-2-бутанол
206	50	(2R,3S)-3-аміно-4-феніл-1-{[2-(2-піридиніл)етил]аміно}-2-бутанол

207	51	(2R,3S)-3-аміно-4-феніл-1-[(4-піридинілметил)аміно]-2-бутанол
208	52	(2R,3S)-3-аміно-1-{[2-(1-метил-2-піролідиніл)етил]аміно}-4-феніл-2-бутанол
209	53	(2R,3S)-3-аміно-1-[(2,3-диметилбензил)аміно]-4-феніл-2-бутанол
210	54	(2R,3S)-3-аміно-4-феніл-1-{[2-(трифторметокси)бензил]аміно}-2-бутанол
211	55	(2R,3S)-3-аміно-1-[(2-хлор-6-феноксibenзил)аміно]-4-феніл-2-бутанол
212	56	(2R,3S)-3-аміно-4-феніл-1-{[4-(трифторметил)бензил]аміно}-2-бутанол
213	57	(2R,3S)-3-аміно-1-[(2,3-дихлорбензил)аміно]-4-феніл-2-бутанол
214	58	(2R,3S)-3-аміно-1-[(3,5-дихлорбензил)аміно]-4-феніл-2-бутанол
215	59	(2R,3S)-3-аміно-1-[(3,5-дифторбензил)аміно]-4-феніл-2-бутанол
216	60	(2R,3S)-3-аміно-4-феніл-1-{[4-(трифторметокси)бензил]аміно}-2-бутанол
217	61	4-({[(2R,3S)-3-аміно-2-гідрокси-4-фенілбутил]аміно}метил)бензолсульфонамід
218	62	(2R,3S)-3-аміно-1-[(4-метоксибензил)аміно]-4-феніл-2-бутанол
219	63	(2R,3S)-3-аміно-1-[(4-метилбензил)аміно]-4-феніл-2-бутанол
220	64	(2R,3S)-3-аміно-4-феніл-1-[(3,4,5-триметоксибензил)аміно]-2-бутанол
221	65	(2R,3S)-3-аміно-4-феніл-1-{[3-(трифторметокси)бензил]аміно}-2-бутанол
222	66	(2R,3S)-3-аміно-1-[(3,5-диметоксибензил)аміно]-4-феніл-2-бутанол
223	67	(2R,3S)-3-аміно-1-[(2,4-диметоксибензил)аміно]-4-феніл-2-бутанол
224	68	(2R,3S)-3-аміно-1-[{[1,1'-біфеніл]-3-ілметил]аміно}-4-феніл-2-бутанол
225	69	(2R,3S)-3-аміно-1-[(3,4-дихлорбензил)аміно]-4-феніл-2-бутанол
226	70	(2R,3S)-3-аміно-1-[(2-фторбензил)аміно]-4-феніл-2-бутанол
227	71	(2R,3S)-3-аміно-4-феніл-1-{[3-(трифторметил)бензил]аміно}-2-бутанол
228	72	(2R,3S)-3-аміно-1-[(2-метилбензил)аміно]-4-феніл-2-бутанол
229	73	(2R,3S)-3-аміно-4-феніл-1-{[(1R)-1-фенілетил]аміно}-2-бутанол

230	74	(2R,3S)-3-аміно-4-феніл-1-{[(1S)-1-фенілетил]аміно}-2-бутанол
231	75	(2R,3S)-3-аміно-1-{[3,5-біс(трифторметил)бензил]аміно}-4-феніл-2-бутанол
232	76	(2R,3S)-3-аміно-4-феніл-1-{[2-(трифторметил)бензил]аміно}-2-бутанол
233	77	(2R,3S)-3-аміно-1-{[(1S)-1-(1-нафтил)етил]аміно}-4-феніл-2-бутанол
234	78	(2R,3S)-3-аміно-1-{[(1R)-1-(1-нафтил)етил]аміно}-4-феніл-2-бутанол
235	79	4-({[(2R,3S)-3-аміно-2-гідрокси-4-фенілбутил]аміно}метил)-2-метоксифенол
236	80	4-({[(2R,3S)-3-аміно-2-гідрокси-4-фенілбутил]аміно}метил)-1,2-бензолдіол
237	81	(2R,3S)-3-аміно-1-[(3-метоксипропіл)аміно]-4-феніл-2-бутанол
238	82	(2R,3S)-3-аміно-1-{[(1S)-2-гідрокси-1-метилетил]аміно}-4-феніл-2-бутанол
239	83	(2R,3S)-3-аміно-1-{[(1R)-2-гідрокси-1-метилетил]аміно}-4-феніл-2-бутанол
240	84	(2R,3S)-3-аміно-4-феніл-1-(2-пропініламіно)-2-бутанол
241	85	(2R,3S)-3-аміно-1-{[2-(2-фторфеніл)етил]аміно}-4-феніл-2-бутанол
242	86	(2R,3S)-3-аміно-1-{[2-(3-фторфеніл)етил]аміно}-4-феніл-2-бутанол
243	87	(2R,3S)-3-аміно-1-{[2-(4-фторфеніл)етил]аміно}-4-феніл-2-бутанол
244	88	(2R,3S)-3-аміно-1-{[2-(4-бромфеніл)етил]аміно}-4-феніл-2-бутанол
245	89	(2R,3S)-3-аміно-1-{[2-(3-метоксифеніл)етил]аміно}-4-феніл-2-бутанол
246	90	(2R,3S)-3-аміно-1-{[2-(2,4-дихлорфеніл)етил]аміно}-4-феніл-2-бутанол
247	91	(2R,3S)-3-аміно-1-{[2-(3-хлорфеніл)етил]аміно}-4-феніл-2-бутанол
248	92	(2R,3S)-3-аміно-1-{[2-(2,5-диметоксифеніл)етил]аміно}-4-феніл-2-бутанол
249	93	(2R,3S)-3-аміно-1-{[2-(4-метилфеніл)етил]аміно}-4-феніл-2-бутанол
250	94	(2R,3S)-3-аміно-1-{[(1R)-1-бензил-2-гідроксietил]аміно}-4-феніл-2-бутанол
251	95	(2R,3S)-3-аміно-1-{[3-(4-морфолініл)пропіл]аміно}-4-феніл-2-бутанол
252	96	(2R,3S)-3-аміно-1-(ізобутиламіно)-4-феніл-2-бутанол

253	97	(2R,3S)-3-аміно-1-{[2-(4-морфолініл)етил]аміно}-4-феніл-2-бутанол
254	98	(2R,3S)-3-аміно-4-феніл-1-[(2-гідроксибутил)аміно]-2-бутанол
255	99	(2R,3S)-3-аміно-4-феніл-1-{[2-(2-тієніл)етил]аміно}-2-бутанол
256	100	4-{[(2R,3S)-3-аміно-2-гідрокси-4-фенілбутил]аміно}-1-бутанол
257	101	(2R,3S)-3-аміно-1-{[(1S)-2-гідрокси-1-фенілетил]аміно}-4-феніл-2-бутанол
258	102	(2R,3S)-3-аміно-1-[(2,4-дихлорбензил)аміно]-4-феніл-2-бутанол
259	103	(2R,3S)-3-аміно-1-{[(1R)-2-гідрокси-1-фенілетил]аміно}-4-феніл-2-бутанол
260	104	(2R,3S)-3-аміно-1-[(4-трет-бутилбензил)аміно]-4-феніл-2-бутанол
261	105	(2R,3S)-3-аміно-4-феніл-1-[(1-фенілетил)аміно]-2-бутанол
262	106	(1R,2S)-1-{[(2R,3S)-3-аміно-2-гідрокси-4-фенілбутил]аміно}-2,3-дигідро-1H-інден-2-ол
263	107	(2R,3S)-3-аміно-1-[(3,4-диметилбензил)аміно]-4-феніл-2-бутанол
264	108	метил 7-{[(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-2-гідроксибутил]аміно}гептаноат
265	109	2-{[(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-2-гідроксибутил]аміно}-N-ізобутилпропанамід
266	110	(2S)-2-{[(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-2-гідроксибутил]аміно}-N-ізобутилпропанамід
267	111	2-{[(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-2-гідроксибутил]аміно}-N-ізобутил-2-метилпропанамід
268	112	2-{[(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-2-гідроксибутил]аміно}-N-ізобутилацетамід
269	113	(2S)-2-{[(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-2-гідроксибутил]аміно}-N-ізобутилбутанамід
270	114	(2R)-2-{[(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-2-гідроксибутил]аміно}-N-ізобутилбутанамід
271	115	(2R,3S)-3-аміно-1-(бензиламіно)-4-(3,5-дифторфеніл)-2-бутанол
272	116	(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-1-(етиламіно)-2-бутанол
273	117	(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-1-(ізобутиламіно)-2-бутанол
274	118	3-{[(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-2-гідроксибутил]аміно}-N-ізобутил-2-метилпропанамід
275	119	(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-1-{[4-(диметиламіно)бензил]аміно}-2-бутанол

276	120	(2S)-2-{{[(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-2-гідроксибутил]аміно}-N-ізобутил-3-фенілпропанамід
277	121	(2S)-2-{{[(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-2-гідроксибутил]аміно}-N-ізобутил-3-метилбутанамід
278	122	(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-1-{{[2-(диметиламіно)етил]аміно}-2-бутанол
279	123	(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-1-{{[3-піридинілметил]аміно}-2-бутанол
280	124	(2S)-2-{{[(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-2-гідроксибутил]аміно}-3-(бензилокси)-N-ізобутилпропанамід
281	125	(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-1-{{[1-метил-1-фенілетил]аміно}-2-бутанол
282	126	(2R)-2-{{[(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-2-гідроксибутил]аміно}-N-ізобутил-3-метилбутанамід
283	127	(2S)-2-{{[(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-2-гідроксибутил]аміно}-N-ізобутилпентанамід
284	128	(2S)-2-{{[(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-2-гідроксибутил]аміно}-3-гідрокси-N-ізобутилпропанамід
285	129	(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-1-{{[2-фенілетил]аміно}-2-бутанол
286	130	(2S)-2-{{[(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-2-гідроксибутил]аміно}-N-бензилпропанамід
287	131	(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-1-{{[(1S)-1-фенілпропіл]аміно}-2-бутанол
287a	169a	(2S)-2-{{[(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-2-гідроксибутил]аміно}-N-етилпропанамід
288	132	(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-1-{{[3-метоксибензил]аміно}-2-бутанол
289	133	(2S)-2-{{[(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-2-гідроксибутил]аміно}-N-ізобутил-2-фенілетанамід
290	134	(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-1-(ізопентиламіно)-2-бутанол
291	135	(2R,3S)-3-аміно-1-(циклогексиламіно)-4-(3,5-дифторфеніл)-2-бутанол
292	136	(2R,3S)-3-аміно-1-(бутиламіно)-4-(3,5-дифторфеніл)-2-бутанол
293	137	(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-1-{{[3-метоксипропіл]аміно}-2-бутанол
294	138	(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-1-{{[2-гідрокси-2-фенілетил]аміно}-2-бутанол
295	139	(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-1-{{[(3R,5S)-3,5-диметоксициклогексил]аміно}-2-бутанол
296	140	диметил(1R,3S)-5-{{[(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-2-гідроксибутил]аміно}-1,3-циклогександикарбоксилат

297	141	(1R,3S)-5-{{[(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-2-гідроксибутил]аміно}-1,3-циклогександикарбонова кислота
298	142	(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-1-{{[(1R)-1-фенілпропіл]аміно}-2-бутанол
299	143	(2R,3S)-3-аміно-1-[(3-хлорбензил)аміно]-4-(3,5-дифторфеніл)-2-бутанол
300	144	(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-1-[(3-метоксибензил)аміно]-2-бутанол
301	145	(2R,3S)-3-аміно-1-[[1,1'-біфеніл]-3-ілметил]аміно]-4-(3,5-дифторфеніл)-2-бутанол
302	146	(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-1-[(3-йодбензил)аміно]-2-бутанол
303	147	(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-1-[(3-метилбензил)аміно]-2-бутанол
304	148	(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-1-[(2-фенілпропіл)аміно]-2-бутанол
305	149	(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-1-[(1,3-тіазол-5-ілметил)аміно]-2-бутанол
306	150	(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-1-[(2-тієнілметил)аміно]-2-бутанол
307	151	(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-1-[(5-метокси-1,2,3,4-тетрагідро-1-нафталеніл)аміно]-2-бутанол
308	152	(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-1-[(2-піразинілметил)аміно]-2-бутанол
309	153	(2R,3S)-3-аміно-1-[(3,5-дифторбензил)аміно]-4-(3,5-дифторфеніл)-2-бутанол
310	154	(2R,3S)-3-аміно-1-[(1,3-бензодіоксол-5-ілметил)аміно]-4-(3,5-дифторфеніл)-2-бутанол
311	155	(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-1-[(3,5-диметоксибензил)аміно]-2-бутанол
312	156	(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-1-{{[3-(трифторметил)бензил]аміно}-2-бутанол
313	157	(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-1-[(2-фурілметил)аміно]-2-бутанол
314	158	(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-1-[(7-метокси-1,2,3,4-тетрагідро-1-нафталеніл)аміно]-2-бутанол
315	159	(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-1-{{[3-(трифторметокси)бензил]аміно}-2-бутанол
316	160	(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-1-[(3-фторбензил)аміно]-2-бутанол
317	161	(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-1-[(3-ізопропоксибензил)аміно]-2-бутанол

318	162	(2R,3S)-3-аміно-1-[(3-бромбензил)аміно]-4-(3,5-дифторфеніл)-2-бутанол
319	163	(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-1-[(5-метил-2-фурилметил)аміно]-2-бутанол
320	164	(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-1-[(5-метокси-1,2,3,4-тетрагідро-1-нафталеніл)аміно]-2-бутанол

ПРИКЛАД 587 N¹-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]-пропіл}-N³,N³-дипропіл-1,3,5-бензолтрикарбоксамід (X)

У суміш 3-(амінокарбоніл)-5-[(дипропіламіно)карбоніл]-бензойної кислоти (IX, СИНТЕЗ 6, 0.18 г, 0.616 ммоль) в сухому DMF (16 мл) додають: EDC (0.182 г, 0.9 ммоль), НОВТ (0.127 г, 0.9 ммоль), триетиламін (0.062 г, 0.616 ммоль) і (2R,3S)-3-аміно-1-[(3-метоксибензил)аміно]-4-феніл-2-бутанол (VIII, ПРИКЛАД 175, 0.185 г, 0.616 ммоль). Одержану суміш перемішують при температурі 20-25°C протягом 3 днів. Потім цю суміш розділяють між етилацетатом і водою. Фракції розділяють; органічну фракцію три рази промивають водою, сушать над безводним сульфатом магнію, фільтрують і концентрують. В результаті розділення фракцій за допомогою хроматографічної колонки (силікагель, 75 мл; метанол/метилгексаноїд, 10/90) одержують вищезгадану сполуку. Методи аналізу: ІК-спектроскопія (коефіцієнт дифузного відбиття) 3306, 3301, 3270, 2962, 1676, 1667, 1663, 1645, 1638, 1627, 1615, 1537, 1450 і 1439 см⁻¹; ЯМР(CDCl₃) дельта 0.645, 0.968, 1.20, 1.43, 1.67, 2.8, 2.97, 3.38, 3.47, 3.73, 3.87, 4.31, 6.78, 6.91, 7.23, 7.72, 7.87, 8.22 і 8.43.

ПРИКЛАД 588 1-трет-бутил-(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-йодбензил)аміно]-пропілкарбамат (VII)

Трет-бутил-(1S)-2-[(3,5-дифторфеніл)-1-[(2S)-оксираніл]-етилкарбамат (V, ПРИКЛАД 3, 1.75 г, 5.8 ммоль) змішують з ізопропанолом (30 мл). У цю суміш додають 3-йодбензиламін (VI). Одержану суміш доводять до кипіння протягом 45 хвилин, за допомогою методу ВЕРХ перевіряють повне зникнення епоксисполуки (V). Одержану суміш концентрують при зниженому тиску, а осад розділяють між етилацетатом (150 мл) і водним розчином соляної кислоти (3%, 35 мл). Органічну фракцію виділяють, промивають водним розчином соляної кислоти (3%, 20 мл), бікарбонатом, соляним розчином, сушать над сульфатом натрію і концентрують при зниженому тиску для отримання вищезгаданої сполуки. M+N=535.

ПРИКЛАД 589 1-9Н-флуорен-9-ілметил-(2R,3S)-3-(3-трет-бутилокси-карбоніл)аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-2-гідроксибутил-(3'-йодбензил)-карбамату гідрохлорид (XXXIV)

1-трет-бутил-(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-йодбензил)аміно]-пропілкарбамат (VII, ПРИКЛАД 588, 2.5 г, 4.7 ммоль) змішують з триетиламіном (0.72 мл, 5.1 ммоль) в ТГФ (10 мл). Температуру реакції знижують до 0°C і додають суміш FMOС-Cl (1.2 г, 4.7 ммоль) в ТГФ (2 мл) че-

рез додаткову воронку. Через 15 хвилин, за допомогою методу ВЕРХ перевіряють повну відсутність початкових речовин. Суміш розбавляють етилацетатом, промивають водним розчином бісульфату калію, насиченим водним розчином бікарбонату, соляним розчином і сушать над сульфатом натрію. Потім концентрують при зниженому тиску для отримання вищезгаданої речовини в неочищеному вигляді, яку очищають методом флеш-хроматографії, в якості елюента спочатку використовують суміш етилацетат/гексан (20/80), потім етилацетат для отримання вищезгаданої сполуки в чистому вигляді. M+N=757.

ПРИКЛАД 590 1-9Н-флуорен-9-ілметил-(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-2-гідроксибутил-(3-йодбензил)карбамату гідрохлорид (XXXV)

1-9Н-флуорен-9-ілметил-(2R,3S)-3-(3-т-бутилоксикарбоніл)аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-2-гідроксибутил-(3'-йодбензил)карбамату гідрохлорид (XXXV, ПРИКЛАД 589, 2.9 г) в суміші соляна кислота/діоксан (4N, 10 мл) перемішують протягом 1 години, потім повільно виливають в швидко перемішуваний ефір (200 мл). Одержаний продукт фільтрують і сушать для отримання вищезгаданої сполуки. M+N=657.

ПРИКЛАД 591 1-9Н-флуорен-9-ілметил-(2R,3S)-4-(3,5-дифторфеніл)-2-гідрокси-3-[[5-оксо-5-(1-піперидиніл)пентаноіл]аміно]бутил-(3-йодбензил)карбамат (XXXVI)

НОВТ (81 мг, 0.6 ммоль) і EDC (105 мг, 0.55 ммоль) додають в суміш 1-карбокси-5-піперидинілглютараміда (IX, 100 мг, 0.5 ммоль) в DMF (2 мл). Кислота активна протягом однієї години, потім в суміш додають 1-9Н-флуорен-9-ілметил-(2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-2-гідроксибутил-(3-йодбензил)карбамату гідрохлорид (XXXV, ПРИКЛАД 590, 300 мг, 0.43 ммоль) і NMM (0.19 мл, 1.72 ммоль). Одержану суміш перемішують протягом 3 годин, потім концентрують при зниженому тиску. Осад розділяють між етилацетатом і насиченим водним розчином бікарбонату. Органічні фракції промивають водним розчином бісульфату калію, соляним розчином і сушать над сульфатом натрію. Потім концентрують при зниженому тиску для отримання вищезгаданої речовини в неочищеному вигляді, яку очищають методом флеш-хроматографії, в якості елюента спочатку використовують суміш етилацетат/гексан (50/50), потім метанол/етилацетат (10/90) для отримання вищезгаданої сполуки в чистому вигляді. M+N=838.

ПРИКЛАД 592 1-N-((1S,2R)-1-(3,5-

дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-йодбензил)аміно]пропіл]-5-оксо-5-(1-піперидиніл)пентанамід трифторацетат (X)

(1-9Н-флуорен-9-ілметил-(2R,3S)-4-(3,5-дифторфеніл)-2-гідрокси-3-[[5-оксо-5-(1-піперидиніл)пентаноіл]аміно]бутилу(3-йодбензил)карбамат (XXXVI, ПРИКЛАД 591, 240 мг, 0.29 ммоль) розчиняють в суміші диетиламіну (10%, 9 мл) в метиленхлориді. Суміш перемішують при температурі 20-25°C протягом ночі. Вранці одержану суміш концентрують при зниженому тиску, осад знову розчиняють в метиленхлориді і очищають методом оберненофазної препаративної ВЕРХ. Відповідні фракції об'єднують, концентрують при зниженому тиску і розділяють між етилацетатом і соляним розчином. Органічну фракцію виділяють, сушать над сульфатом натрію і концентрують для отримання вищезгаданої сполуки. $M+H=614$.

ПРИКЛАД 593 5-(аміносультфоніл)-N¹-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-N³,N'-дипропілізофталамід (X)

O-(7-азабензотриазол-1-іл)-N,N,N',N'-тетраметилуроній гексафторфосфат (НАТУ, 0.0928 г, 0.244 ммоль) додають в суміш із 3-(аміносультфоніл)-5-[(дипропіламіно)карбоніл]бензойної кислоти (XXXIX, СИНТЕЗ 13, 0.08 г, 0.244 ммоль) і (2R,3S)-3-аміно-1-[(3-метоксибензил)-аміно]-4-феніл-2-бутанолу (VIII, ПРИКЛАД 175, 0.0732 г, 0.244 ммоль) в сухому DMF (3 мл). Одержану суміш перемішують при температурі 20-25°C протягом 18 годин, потім розділяють між етилацетатом і водою. Органічну фракцію виділяють, промивають соляним розчином, сушать над безводним сульфатом натрію, фільтрують і концентрують. В результаті розділення концентрату за допомогою хроматографічної колонки (силікагель, метанол/дихлорметан, 5/95) одержують вищезгадану сполуку. Методи аналізу: МС (ESI⁺): C₃₂H₄₂N₄O₆S, m/z (M+H)⁺=611.5; МС високої роздільної здатності (FAB): теоретичний розрахунок для C₃₂H₄₂N₄O₆S+H₁=611.2903; експериментальні дані 611.2904.

ПРИКЛАД 620 N¹-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)-аміно]пропіл]-5-етил-N³,N³-дипропілізофталамід (X)

Диетилціанофосфонат (0.132 мл, 0.87 ммоль) додають в суміш із 3-[(дипропіламіно)карбоніл]-5-етилбензойної кислоти (IX, СИНТЕЗ 21, 0.2 г, 0.72 ммоль), (2R,3S)-3-аміно-1-[(3-метоксибензил)аміно]-4-феніл-2-бутанолу (VIII, ПРИКЛАД 175, 0.216 мг, 0.72 ммоль) і триетиламіну (0.121 мл, 0.87 моль) в дихлорметані (3 мл). Цю суміш перемішують при температурі 20-25°C протягом 1 години. Дихлорметан потім видаляють при зниженому тиску. Осад розділяють між етилацетатом і водою. Органічну фракцію виділяють, промивають соляним розчином, сушать над безводним сульфатом натрію, фільтрують і концентрують. В результаті розділення концентрату за допомогою хроматографічної колонки (силікагель, метанол/дихлорметан, 5/95) одержують вищезгадану сполуку. Методи аналізу: МС (ESI⁺): C₃₄H₄₅N₃O₄, m/z (M+H)⁺=560.4; МС високої роздільної здатності (FAB): теоретичний розрахунок для

C₃₄H₄₅N₃O₄+H=560.3488; експериментальні дані 560.3487.

ПРИКЛАД 629 N-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-3-[бутирил-(пропіл)аміно]-5-метилбензамід (X)

Слідують процедурі Прикладу 570 з незначними змінами, диетилціанофосфонат (0.076 мл, 0.55 ммоль) додають в суміш із 3-[бутирил(пропіл)аміно]-5-метилбензойної кислоти (IX, 0.12 г, 0.46 ммоль), (2R,3S)-3-аміно-1-[(3-метоксибензил)аміно]-4-феніл-2-бутанолу (VIII, 0.137 г, 0.46 ммоль) і триетиламіну (0.076 мл, 0.55 ммоль) в дихлорметані (5 мл). Цю суміш перемішують при температурі 20-25°C протягом 1 години. Дихлорметан потім видаляють при зниженому тиску. Осад розділяють між етилацетатом і водою. Органічну фракцію виділяють, промивають соляним розчином, сушать над безводним сульфатом натрію, фільтрують і концентрують. В результаті розділення концентрату за допомогою хроматографічної колонки (силікагель, метанол/дихлорметан, 5/95) одержують вищезгадану сполуку. Методи аналізу: ЯМР (400 МГц, CDCl₃) дельта 7.09, 4.15, 3.80, 3.79, 3.60, 3.02, 2.84, 2.36, 1.94, 1.56, 1.49, 0.87 і 0.81. МС (ESI⁺): C₃₃H₄₃N₃O₄, m/z (M+H)⁺=546.3; МС високої роздільної здатності (FAB): теоретичний розрахунок для C₃₃H₄₃N₃O₄+H=546.3331; експериментальні дані 546.3331.

ПРИКЛАД 631 N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-1-пропіл-1H-індол-6-карбоксамід (X)

ПРИКЛАД 682 N¹-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-етиніл-N³,N³-дипропілізофталамід (M+H)⁺=590

ПРИКЛАД 739 N¹-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)-аміно]пропіл]-5-(ціанометил)-N³,N³-дипропілізофталамід (X)

Стадія 1. Суміш диетил-1,3,5-бензолтрикарбоксилату (5.2 г) з комплексом метилсульфіда борана (6.1 г) перемішують в ТГФ (150 мл) при температурі 20-25°C протягом ночі. Потім в цю суміш додають метанол і концентрують насухо. Концентрат розділяють за допомогою хроматографічної колонки (силікагель) для отримання диетил-5-(гідроксиметил)ізофталату. Потім, диетил-5-(гідроксиметил)ізофталат гідролізують в етанолі і воді за допомогою моногідрату гідроксида літію (0.57 г) при температурі 20-25°C протягом 3.5 годин, після чого розчинники видаляють при зниженому тиску. Додають воду (100 мл) і підкисляють цю суміш до значення pH=4 за допомогою концентрованої соляної кислоти. Одержану суміш екстрагують етилацетатом, сушать над сульфатом магнію, фільтрують і концентрують для отримання 3-(етоксикарбоніл)-5-(гідроксиметил)-бензойної кислоти. Метод аналізу: МС високої роздільної здатності МН =225.0769. 3-(етоксикарбоніл)-5-(гідроксиметил)-бензойну кислоту (2.3 г), EDC (3 г), 1-HOBT (2.1 г), діізопропілетиламін (2.7 мл), дипропіламін (2.8 мл) і DMF (50 мл) перемішують при температурі 20-25°C протягом ночі. Потім, одержану суміш розділяють між етилацетатом, водою і соляним розчином. Органічну фракцію виділяють,

сушать над сульфатом магнію, фільтрують і концентрують. В результаті розділення концентрату за допомогою хроматографічної колонки (силікагель) одержують етил-3-[(дипропіламіно)карбоніл]-5-(гідроксиметил)-бензоат. Метод аналізу: ЯМР (300 МГц, CDCl_3) дельта 0.77, 1.0, 1.4, 1.6, 1.7, 3.2, 3.5, 4.4, 4.8, 7.6, 8.0 і 8.1.

Стадія 2. Суміш етил-3-[(дипропіламіно)карбоніл]-5-(гідроксиметил)-бензоату (1.5 г) з трибромідом фосфору (0.95 мл) перемішують в дихлорметані (10 мл), гріють при температурі 50°C протягом 4 годин, потім охолоджують і розділяють між дихлорметаном і водою. Органічну фракцію виділяють, промивають водним розчином бікарбонату натрію, потім сушать над сульфатом магнію і насухо концентрують для отримання етил-3-(бромметил)-5-[(дипропіламіно)карбоніл]-бензоату. Метод аналізу: МС високою роздільною здатністю $\text{MH}^+=370.1020$. Етил-3-(бромметил)-5-[(дипропіламіно)карбоніл]-бензоат (1.4 г) і ціанід натрію (0.2 г) перемішують в сухому диметилсульфоксиді (25 мл) при температурі 20-25°C протягом 3.5 годин, потім цю суміш розділяють між етилацетатом, водою і соляним розчином. Органічний шар виділяють, сушать над сульфатом магнію і насухо концентрують при зниженому тиску для отримання етил-3-(ціанометил)-5-[(дипропіламіно)карбоніл]бензоату. Етил-3-(ціанометил)-5-[(дипропіламіно)карбоніл]бензоат (0.6 г) гідролізують в етанолі і воді за допомогою моногідрату гідроксида літію (0.1 г) при температурі 20-25°C протягом ночі, потім додають воду (50 мл). Одержану суміш підкисляють до значення $\text{pH}=4$ за допомогою концентрованої соляної кислоти і розділяють між етилацетатом, водою і соляним розчином. Органічну фракцію виділяють, сушать над сульфатом магнію і насухо концентрують при зниженому тиску для отримання 3-(ціанометил)-5-[(дипропіламіно)карбоніл]бензойної кислоти. Метод аналізу: МС $\text{M}+\text{H}=287.2$.

Стадія 3. Суміш із 3-(ціанометил)-5-[(дипропіламіно)карбоніл]бензойної кислоти (IX, 0.13 г), (2R,3S)-3-аміно-1-[(3-метоксибензил)аміно]-4-феніл-2-бутанол (VIII, 0.14 г), НАТУ (0.17 г) і дихлорметану (10 мл) перемішують при температурі 40°C протягом ночі. Після охолодження, цю суміш промивають водою, органічну фракцію виділяють, сушать над сульфатом магнію і насухо концентрують при зниженому тиску. В результаті розділення одержаного продукту за допомогою хроматографічної колонки (силікагель) одержують вищезгадану сполуку. $\text{M}+\text{H}=571.2$.

ПРИКЛАД 740 N^1 -(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл}-5-(гідроксиметил)- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід (X)

Для отримання вищезгаданої сполуки використовують 3-[(дипропіламіно)карбоніл]-5-(гідроксиметил)бензойну кислоту (IX), (2R,3S)-3-аміно-1-[(3-метоксибензил)аміно]-4-феніл-2-бутанол (VIII) і слідуєть процедурі Таблиці С і Прикладу 739 з незначними змінами. Метод аналізу: МС високої роздільної здатності (FAB), 615.3571.

ПРИКЛАД 741 N^1 -{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-

3-[(3-метоксибензил)аміно]-пропіл}-5-етиніл- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід (X)

Стадія 1. Суміш із метил-3-бром-5-[(дипропіламіно)карбоніл]бензоату (XXI, 200 мг, 0.58 ммоль), $\text{PdCl}_2(\text{Ph}_3\text{P})_2$ (16 мг, 0.03 моль %) і йодиду міді (I) (6 мг, 0.05 моль %) в триетиламіні (1.2 мл) доводять до кипіння. Додають (триметилсिलил)ацетилен (0.1 мл, 0.7 ммоль) і перемішують суміш протягом 3 годин, потім охолоджують до температури 20-25°C, розбавляють водою (20 мл) і екстрагують хлороформом (3 x 15 мл). Органічні екстракти об'єднують, промивають соляним розчином (20 мл), сушать над сульфатом натрію і концентрують при зниженому тиску для отримання метил-3-[(дипропіламіно)карбоніл]-5-етинілбензоату (XXXII, 185.5 мг). Метод аналізу: ЯМР (300 МГц, CDCl_3) дельта 7.95, 7.75, 7.43, 3.74, 3.25, 2.95, 1.49, 1.34, 0.79, 0.56 і 0.06.

Стадія 2. У суміш, що перемішується захищеного метил-3-[(дипропіламіно)карбоніл]-5-етинілбензоату (XXXII, Стадія 1, 185.3 мг, 0.49 ммоль) з метанолом (2.5 мл) додають суміш гідроксиду калію (2.9 мл із 1М суміші з водою, 2.9 ммоль). Одержану суміш перемішують протягом 4 годин, розбавляють хлороформом (40 мл), фракції розділяють, органічну фракцію концентрують при зниженому тиску для отримання 3-[(дипропіламіно)карбоніл]-5-етинілбензойної кислоти. Метод аналізу: ЯМР (300 МГц, CDCl_3) дельта 8.22, 8.05, 7.71, 3.48, 3.17, 3.16, 1.71, 1.55, 1.0 і 0.78.

Стадія 3. У суміш, що перемішується 3-[(дипропіламіно)карбоніл]-5-етинілбензойної кислоти (70 мг, 0.24 ммоль) в DMF (2.5 мл) додають: (2R,3S)-3-аміно-1-[(3-метоксибензил)аміно]-4-феніл-2-бутанол дигідрохлорид (VIII, 81 мг, 0.24 ммоль), НОВТ (36 мг, 0.26 ммоль) і діізопропілетиламін (0.17 мл, 0.96 ммоль). Потім в цю суміш додають EDC (51 мг, 0.26 ммоль) і перемішують протягом ночі. Одержану суміш розбавляють етилацетатом (30 мл), промивають водою (3 x 50 мл), соляною кислотою (1 Н, 30 мл), насиченим бікарбонатом натрію (30 мл), соляним розчином (30 мл), сушать над сульфатом натрію і концентрують при зниженому тиску. Для отримання вищезгаданої сполуки одержаний продукт очищають методом флеш-хроматографії (силікагель, етилацетат, метанол/хлороформ, 1/10). Методи аналізу: ІК-спектроскопія (KBr) 3276, 2956, 2921, 1610, 1450 і 1264 cm^{-1} ; МС (ESI): $\text{m/z}(\text{M}+\text{H})^+=556$.

ПРИКЛАД 742 N^1 -(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-йодбензил)аміно]-пропіл}- N^3 , N^3 -дипропіл-5-проп-1-інілізофталамід (X)

Для отримання вищезгаданої сполуки використовують пропін замість (триметилсиліл)ацетилену; (2R,3S)-3-аміно-1-[(3-йодбензил)аміно]-4-феніл-2-бутанола дигідрохлорид (VIII) замість (2R,3S)-3-аміно-1-[(3-метоксибензил)аміно]-4-феніл-2-бутанола дигідрохлориду (VIII) і слідуєть загальній процедурі Прикладу 741 з незначними змінами. Методи аналізу: ІК-спектроскопія (ATR) 3305, 2930, 2872, 1613 і 1537 cm^{-1} ; МС (ESI): $\text{m/z}(\text{M}+\text{H})^+=666$.

ПРИКЛАД 743 N^1 -{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-(трифторметил) бензил)-аміно] пропіл}-5-етиніл- N^3 , N^3 -дипропілізофталамід (X)

Стадія 1. Суміш трет-бутил-(1S)-1-[(2S)-

оксираніл]-2-фенілетилкарбамату (V, 2.3 г, 8.7 ммоль) з 3-(трифторметил)бензиламіном (VI, 1.9 мл, 13.1 ммоль) в 2-пропанолі (70 мл) кип'ятять протягом 4 годин. Одержану суміш охолоджують до температури 20-25°C і концентрують при зниженому тиску для отримання трет-бутил-(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[[3-(трифторметил)бензил]аміно]-пропілкарбамату (VII, 3.1 г) в твердому стані. Метод аналізу: МС (ESI), m/z (M+H)⁺=439.

Стадія 2. Суміш трет-бутил-(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[[3-(трифторметил)бензил]аміно]-пропілкарбамату (VII, Стадія 1, 2.5 г, 5.7 ммоль) з соляною кислотою (29 мл з 4.0 М суміші в диоксані, 114 ммоль) перемішують при температурі 20-25°C. Осад, що утворився, фільтрують, промивають ефіром і сушать при зниженому тиску для отримання (2R,3S)-3-аміно-4-феніл-1-[[3-(трифторметил)бензил]аміно]-2-бутанолу дигідрохлориду (VIII, 2.13 г). Метод аналізу: МС (ESI), m/z (M+H)⁺=339.

Стадія 3. Суміш із 3-[[дипропіламіно]карбоніл]-5-етинілбензойної кислоти (IX, 231 мг, 0.8 ммоль), (2R,3S)-3-аміно-4-феніл-1-[[3-(трифторметил)бензил]аміно]-2-бутанолу дигідрохлориду (VIII, Стадія 2, 493.5 мг, 1.2 ммоль), НОВТ (162 мг, 1.2 ммоль) і діізопропілетиламіна (0.832 мл, 4.8 ммоль) перемішують в метиленхлориді (4 мл) протягом 15 хвилин. Додають EDC (206 мг, 1.2 ммоль) і одержану суміш перемішують протягом ночі. Потім цю суміш розбавляють водою і проводять екстракцію метиленхлоридом (3 x 25 мл). Органічну фракцію промивають соляною кислотою (1N, 25 мл), насиченим бікарбонатом натрію (25 мл), соляним розчином, сушать над сульфатом натрію і концентрують при зниженому тиску. Для отримання вищезгаданої сполуки одержаний продукт очищають методом флеш-хроматографії (силікагель, 100% етилацетат, метанол/хлороформ, 1/9). Методи аналізу: ІК-спектроскопія (ATR) 3302, 2963, 2932 і 1615 см⁻¹; МС m/z (M+H)⁺=549.

ПРИКЛАД 744 N¹-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[[3-йодбензил]аміно]-пропіл}-5-етиніл-N³, N³-дипропілізофталамід (X)

Для отримання вищезгаданої сполуки використовують сіль 3-йодбензиламін гідрохлорид (VI) і слідує загальній процедурі Прикладу 744 з незначними змінами. Методи аналізу: ІК-спектроскопія (ATR) 3295, 2960, 2927 і 1616 см⁻¹; МС (APCI), m/z (M+H)⁺=652.

ПРИКЛАД 745 N¹-{(1S,2R)-1-бензил-3-[[3-фторбензил]аміно]-2-гідрокси-пропіл}-5-етиніл-N³, N³-дипропілізофталамід (X)

Для отримання вищезгаданої сполуки використовують 3-фторбензиламін (VI) і слідує загальній процедурі Прикладу 744 з незначними змінами. Методи аналізу: ІК-спектроскопія (ATR) 3217, 2961, 2918 і 1615 см⁻¹; МС (APCI), m/z (M+H)⁺=544.

ПРИКЛАД 746 N¹-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[[3-метоксибензил]аміно]-пропіл}-N³, N³-дипропіл-5-(8-хінолініл)ізофталамід (X)

Стадія 1. Суміш із метил-3-бром-5-[[дипропіламіно]карбоніл]бензоату (XLVIII, 200 мг, 0.58 ммоль), 8-хінолінборонової кислоти (200.6 мг, 1.2 ммоль), карбонату натрію (0.87 мл з 2 М суміші

у воді, 1.74 ммоль) в толуолі (6 мл) дегазують при зниженому тиску протягом 15 хвилин, потім продувають аргонном. Додають паладій тетра-кис(трифенілфосфін) (139 мг, 0.12 ммоль), суміш знову дегазують при зниженому тиску протягом 15 хвилин, потім продувають аргонном. Одержану суміш кип'ятять протягом ночі, потім охолоджують до температури 20-25°C і розбавляють хлороформом. Органічну фракцію виділяють, промивають водою (3 x 50 мл), соляним розчином, сушать над сульфатом натрію і концентрують при зниженому тиску. Потім очищають методом флеш-хроматографії (силікагель, етилацетат/гексан, 1.3/1) для отримання метил-3-[[дипропіламіно]карбоніл]-5-(8-хінолініл) бензоату (XLIX, 176 мг). Метод аналізу: ЯМР (300 Мгц, CDCl₃) дельта 8.91, 8.42, 8.21, 8.09, 7.95, 7.86, 7.77, 7.64, 3.94, 3.49, 3.34, 1.64, 0.99 і 0.84.

Стадія 2. У суміш метил-3-[[дипропіламіно]карбоніл]-5-(8-хінолініл) бензоату (XLIX, Стадія 1, 175.5 мг, 0.45 ммоль) з метанолом (2 мл) додають гідроксид літію (32.3 мг, 1.4 ммоль) і воду (0.5 мл). Одержану суміш перемішують протягом ночі, потім розділяють між етилацетатом (10 мл) і водою (10 мл). Водну фракцію виділяють, підкислюють соляною кислотою (1 N) і екстрагують хлороформом (3 x 40 мл). Органічну фракцію промивають соляним розчином, сушать (сульфатом натрію) і концентрують при зниженому тиску для отримання 3-[[дипропіламіно]карбоніл]-5-(8-хінолініл)бензойної кислоти (IX-L, 130 мг). Метод аналізу: ЯМР (300 Мгц, CDCl₃) дельта 8.84, 8.39, 8.35, 8.05, 7.96, 7.9, 7.87, 7.79, 7.68, 3.5, 3.37, 1.76-1.61, 0.99 і 0.84.

Стадія 3. Суміш із 3-[[дипропіламіно]карбоніл]-5-(8-хінолініл)бензойної кислоти (IX-L, Стадія 2, 130 мг, 0.35 ммоль), (2R,3S)-3-аміно-1-[[3-метоксибензил]аміно]-4-феніл-2-бутанол дигідрохлориду (VIII, 117 мг, 0.35 ммоль), НОВТ (70 мг, 0.52 ммоль) і діізопропілетиламіна (0.241 мл, 1.4 ммоль) в метиленхлориді (2 мл) перемішують протягом 15 хвилин. Додають EDC (89 мг, 0.52 ммоль) і одержану суміш перемішують протягом ночі. Потім цю суміш розбавляють водою, проводять екстракцію метиленхлоридом (3 x 25 мл). Органічну фракцію промивають соляною кислотою (1N, 25 мл), насиченим бікарбонатом натрію (25 мл), соляним розчином, сушать (сульфатом натрію) і концентрують при зниженому тиску. Для отримання вищезгаданої сполуки одержаний продукт очищають методом флеш-хроматографії (силікагель, метанол/хлороформ, 1/9). Методи аналізу: ІК-спектроскопія (NaCl) 3301, 2916, 2365 і 1613 см⁻¹; МС (APCI) m/z (M+H)⁺=659.

ПРИКЛАД 747

N³- {(1S,2R)-1 -бензил-2-гідрокси-3 - [[3 - метоксибензил]аміно] -пропіл} -4' -метокси-N⁵, N⁵-дипропіл[1,1'-біфеніл]-3,5-дикарбоксамід гідрохлорид (X)

Стадія 1. Суміш із 4-метоксифеніл боронової кислоти (463 мг, 3.05 ммоль), 3-бром-5-[[дипропіламіно]карбоніл]бензойної кислоти (XLVIII, 1.02 г, 3.05 ммоль) і фосфату калію (1.29 г, 6.1 ммоль) в 1,2-диметоксиетані (10 мл) і воді (5 мл) дегазують аргонном протягом 15 хвилин. Додають біс(трифенілфосфін)паладій(II) хлорид (21 мг,

0.03 ммоль) і знову дегазують аргонном, потім гріють при температурі 85°C протягом ночі. Одержану суміш охолоджують до температури 20-25°C і фільтрують через інфузорну (діатомову) землю.

Одержаний фільтрат підкисляють соляною кислотою (1N) до значення pH=4 і екстрагують етилацетатом. Органічну фракцію промивають водою, соляним розчином і сушать (сульфатом магнію). Одержаний продукт очищають методом колонкової флеш-хроматографії (силікагель, етилацетат/оцтова кислота, 99/1) для отримання 5-[(дипропіламіно)карбоніл]-4'-метокси[1,1'-біфеніл]-3-карбонової кислоти (IX-L, 667 мг). Метод аналізу: MS (ESI), m/z (M+H)⁺=356.

Стадія 2. Суміш із 5-[(дипропіламіно)карбоніл]-4'-метокси[1,1'-біфеніл]-3-карбонової кислоти (IX-L, Стадія 1, 316 мг, 0.89 ммоль), (2R,3S)-3-аміно-1-[(3-метоксибензил)аміно]-4-феніл-2-бутанол дигідрохлориду (VIII, 332 мг, 0.89 ммоль), НОBT (181 мг, 1.34 ммоль) і N-метилморфоліну (0.37 г, 3.56 ммоль) в метиленхлориді (8 мл) і диметилформаміді (2 мл) перемішують при температурі 20-25°C протягом 15 хвилин. У цю суміш додають EDC (257 мг, 1.34 ммоль) і перемішують протягом 4.5 годин. Одержану суміш розділяють між метиленхлоридом і водою. Органічну фракцію промивають соляною кислотою (1N), водою, соляним розчином, сушать (сульфатом магнію) і концентрують. Концентрат розчиняють у мінімальній кількості метанолу, додають соляну кислоту (3 мл з 1.0 M суміші в ефірі, 3 ммоль) і перемішують протягом 10 хвилин. Потім додають ефір для осадження решти продукту. Осад фільтрують, сушать у вакуумній печі при температурі 50°C для отримання вищезгаданої сполуки. Температура плавлення 205-209°C. Методи аналізу: ІК-спектроскопія (ATR) 2964 і 1649 см⁻¹; MS (APCI), m/z (M+H)⁺=638.

ПРИКЛАД 748 N³-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-бензил(аміно)пропіл]-N⁵,N⁵-дипропіл[1,1'-біфеніл]-3,5-дикарбоксаміда гідрохлорид (X)

Стадія 1. Суміш трет-бутил-(1S)-2-(3,5-дифторфеніл)-1-[(2S)-оксираніл]-етилкарбамату (V, 500 мг, 1.67 ммоль) з 3-метоксибензиламіном (VI, 0.34 г, 2.51 ммоль) в 2-пропанолі (3 мл) кип'ятять протягом ночі, потім дають охолонути до температури 20-25°C і концентрують при зниженому тиску. Осад кристалізують із суміші етилацетат/гексан і фільтрують для отримання трет-бутил-(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл-карбамату (VII, 575 мг) в твердому стані. Метод аналізу: MS (ESI), m/z (M+H)⁺=437.

Стадія 2. У суміш трет-бутил-(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропілкарбамату (VII, Стадія 1, 535 мг, 1.23 ммоль) в метанолі (2 мл) додають соляну кислоту (3.2 мл з 1.0 M суміші в ефірі, 3.2 ммоль) і перемішують при температурі 20-25°C протягом 30 хвилин. Потім додають ефір доти, поки не випаде осад. Осад фільтрують для отримання (2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-1-[(3-метоксибензил)аміно]-2-бутанолу дигідрохлориду (VIII).

Стадія 3. Суміш із 5-[(дипропіламіно)карбоніл]-

[1,1'-біфеніл]-3-карбонової кислоти (IX, 188 мг, 0.56 ммоль), (2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-1-[(3-метоксибензил)аміно]-2-бутанол дигідрохлориду (VIII, Стадія 2, 230 мг, 0.56 ммоль), НОBT (114 мг, 0.84 ммоль) і N-метилморфоліну (0.23 г, 2.24 ммоль) в метиленхлориді (6 мл) і диметилформаміді (1 мл) перемішують при температурі 20-25°C протягом 15 хвилин. У цю суміш додають EDC (161 мг, 0.84 ммоль) і перемішують при температурі 20-25°C протягом ночі. Одержану суміш промивають водою, соляною кислотою (1N), водою, соляним розчином, сушать (сульфатом натрію) і концентрують при зниженому тиску для отримання вищезгаданої сполуки. Температура плавлення 230-233°C. Методи аналізу: ІК-спектроскопія (ATR) 2965, 1651, 1596 і 1267 см⁻¹; MS (ESI), m/z (M+H)⁺=644.

ПРИКЛАД 749 N³-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]-пропіл]-N⁵,N⁵-дипропіл[1,1'-біфеніл]-3,5-дикарбоксамід гідрохлорид (X)

Для отримання вищезгаданої сполуки використовують (2R,3S)-3-аміно-1-[(3-метоксибензил)аміно]-4-феніл-2-бутанол дигідрохлорид (VIII) замість (2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-1-[(3-метоксибензил)аміно]-2-бутанолу дигідрохлориду (VIII) і слідує загальній процедурі Прикладу 748 з незначними змінами. Температура плавлення 214-219°C. Методи аналізу: ІК-спектроскопія (KBr) 3227, 2961, 1632 і 1605 см⁻¹; MS (ESI), m/z (M+H)⁺=608.

ПРИКЛАД 750 N³-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]-пропіл]-N⁵,N⁵-дипропіл[1,1'-біфеніл]-3,5-дикарбоксамід (X)

Стадія 1. Суміш із 1:1 комплексу 1,1'-біс(дифенілфосфіно)фероцен-дихлорпаладій (37 мг, 0.05 ммоль), ацетату калію (492 мг, 4.5 ммоль) і біс(пінаколато)дибора (408 мг, 1.6 ммоль) дегазують при зниженому тиску протягом 15 хвилин, потім продувають аргонном. У цю суміш додають суміш з метил-3-бром-5-[(дипропіламіно)карбоніл]-бензоату (XXI, 500 мг, 1.5 ммоль) у безводному диметилсульфоксиді (9 мл). Одержану суміш перемішують при температурі 80°C протягом 4 годин. Потім цю суміш охолоджують до температури 20-25°C, розбавляють толуолом (50 мл), промивають водою (3 x 150 мл), соляним розчином, сушать (сульфатом магнію) і концентрують при зниженому тиску для отримання метил-3-[(дипропіламіно)карбоніл]-5-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил) бензоату. Метод аналізу: MS (ESI), m/z (M+H)⁺=390.

Стадія 2. Суміш із метил-3-[(дипропіламіно)карбоніл]-5-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-діоксаборолан-2-ил) бензоату (Стадія 1, 534 мг, 1.4 ммоль), 4-бромбензолдиметилсульфонамід (363 мг, 1.4 ммоль) і карбонату натрію (2 мл з суміші 2 M з водою, 4.1 ммоль) в толуолі (10 мл) дегазують при зниженому тиску протягом 15 хвилин, потім продувають аргонном. Додають тетракіспаладій (трифенілфосфін) (40 мг, 0.025 ммоль), суміш знову дегазують при зниженому тиску протягом 15 хвилин, потім продувають аргонном. Одержану суміш кип'ятять протягом 4 годин, потім охолоджують до температури 20-

25°C, фільтрують через інфузорну землю з сульфатом натрію. Одержаний фільтрат концентрують при зниженому тиску. Для отримання метил-4'-[(диметиламіно)сульфоніл]-5-[(дипропіламіно)карбоніл]-[1,1'-біфеніл]-3-карбоксилата (XXXVIII) продукт очищають методом флеш-хроматографії (силікагель, етилацетат/гексан, 1/1). Метод аналізу: МС (ESI), m/z (M+H)⁺=447.

Стадія 3. Суміш із метил-4'-[(диметиламіно)сульфоніл]-5-[(дипропіламіно)карбоніл]-[1,1'-біфеніл]-3-карбоксилату (XXXVIII, Стадія 2, 555 мг, 1.24 ммоль) в метанолі (6 мл) і гідроксида натрію (2 мл з суміші 6.0 М з водою, 12 ммоль) перемішують при температурі 20-25°C протягом 4 годин. Одержану суміш розділяють між етилацетатом (40 мл) і водою (40 мл). Водну фракцію підкисляють соляною кислотою до значення pH=4 і проводять екстракцію ефіром (3 х 100 мл). Органічні фракції об'єднують і концентрують при зниженому тиску для отримання метил-4'-[(диметиламіно)сульфоніл]-5-[(дипропіламіно)карбоніл]-[1,1'-біфеніл]-3-карбонової кислоти (IX-XXXIX). Метод аналізу: ЯМР (300 МГц, CDCl₃) дельта 8.37, 8.12, 7.89, 7.8, 3.51, 3.22, 2.76, 1.74, 1.59, 1.02 і 0.79.

Стадія 4. Суміш із кислоти (IX-XXXIX, Стадія 3, 150 мг, 0.35 ммоль), (2R,3S)-3-аміно-1-[(3-метоксибензил)аміно]-4-феніл-2-бутанол дигідрохлориду (VIII, 129 мг, 0.35 ммоль), НОВТ (47 мг, 0.35 ммоль) і N-метилморфоліну (122 мл, 1.1 ммоль) перемішують в метиленхлориді (4 мл) протягом 15 хвилин. У цю суміш додають EDC (107 мг, 0.62 ммоль) і перемішують протягом ночі. Одержану суміш розбавляють водою і проводять екстракцію метиленхлоридом (3 х 25 мл). Органічну фракцію промивають соляною кислотою (1N, 25 мл), насиченим бікарбонатом натрію (25 мл), соляним розчином, сушать (сульфатом натрію) і концентрують при зниженому тиску. Для отримання вищезгаданої сполуки продукт очищають методом колонкової флеш-хроматографії (силікагель, 100% етилацетат, метанол/хлороформ, 1/9). Методи аналізу: ІК-спектроскопія (ATR) 2932, 2837 і 1593 см⁻¹; МС (APCI), m/z (M+H)⁺=715.

ПРИКЛАД 751 N³-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-йодбензил)аміно]-пропіл}-4'-[(диметиламіно)сульфоніл]-N⁵,N⁵-дипропіл-1,1'-біфеніл-3,5-дикарбоксамід (X)

Для отримання вищезгаданої сполуки використовують (2R,3S)-3-аміно-1-[(3-йодбензил)аміно]-4-феніл-2-бутанола дигідрохлориду (VIII) і слідує загальній процедурі Прикладу 750 з незначними змінами. Методи аналізу: ІК-спектроскопія (ATR) 3303, 2930, 2872 і 1614 см⁻¹; МС (APCI), m/z (M+H)⁺=811.

ПРИКЛАД 752 N¹-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]-пропіл}-N³,N³-дипропіл-5-(3-тієніл)ізофталаміда гідрохлорид (X)

Стадія 1. У крижану суміш метил-3-аміно-5-[(дипропіл-аміно)карбоніл]бензоату (XLVIII, 1.0 г, 3.6 ммоль) і водної тетрафторборної кислоти (48% вага в H₂O, 12 ммоль) додають по краплях холодну суміш водного нітриту натрію (0.25 г, 3.6 ммоль). Суміш перемішують протягом 10 хвилин

потім екстрагують етилацетатом. Органічну фракцію промивають водою, сушать над сульфатом магнію, фільтрують і концентрують при зниженому тиску для отримання діазонієвої солі, яку використовують далі без додаткового очищення. Метод аналізу: ЯМР (500 МГц, CD₃OD) дельта 9.26, 8.86, 8.71, 4.03, 3.5, 3.22, 1.75, 1.6, 1.01 і 0.79.

Стадія 2. У суміш тіофен-3-боронової кислоти (1 г, 7.82 ммоль) в метанолі додають, крапля за краплею, концентровану водну суміш дифториду калію-водню (2.01 г, 25.8 ммоль). Одержану суміш перемішують протягом 10 хвилин і концентрують при зниженому тиску. Після екстрагування ацетоном і концентрації при зниженому тиску одержують кінцевий неочищений продукт в твердому стані, який рекристалізують із суміші ацетон/ефір для отримання солі калій трифтор(3-тієніл) борату. Метод аналізу: МС (ESI), m/z (M+H)⁺=151.

Стадія 3. Суміш солі трифтор(3-тієніл) борату калію (Стадія 2, 0.69 г, 1.82 ммоль), діазонієвої солі із (XLVIII, Стадія 1, 0.42 г, 2.19 ммоль) і ацетатом свинцю (0.02 г, 0.09 ммоль) продувають аргонном протягом 15 хвилин в темряві. Додають диоксан (8 мл), суміш дегазують аргонном і перемішують при температурі 20-25°C протягом ночі. Одержану суміш розбавляють ефіром, промивають соляним розчином, сушать над сульфатом магнію і концентрують при зниженому тиску для отримання метил-3-[(дипропіламіно)карбоніл]-5-(3-тієніл)бензоату (XLIX), який очищають методом флеш-хроматографії (силікагель, етилацетат/гексан, 1/1). Метод аналізу: МС (ESI), m/z (M+H)⁺=346.

Стадія 4. Суміш із метил-3-[(дипропіламіно)карбоніл]-5-(3-тієніл) бензоату (XLIX, Стадія 3, 0.31 г, 0.88 ммоль) в суміші ТГФ/метанолу/гідроксиду натрію (3/1/1, 5 мл) перемішують при температурі 40°C протягом 2 годин. Потім суміш охолоджують до температури 20-25°C, розбавляють водою і екстрагують етилацетатом. Водну фракцію підкисляють до значення pH=4 і екстрагують етилацетатом. Органічну фракцію промивають водою, соляним розчином, сушать над сульфатом магнію, фільтрують і концентрують при зниженому тиску для отримання 3-[(дипропіламіно)карбоніл]-5-(3-тієніл) бензойної кислоти (IX-L). Метод аналізу: МС (ESI), m/z (M+H)⁺=332.

Стадія 5. Суміш із 3-[(дипропіламіно)карбоніл]-5-(3-тієніл) бензойної кислоти (IX-L, Стадія 4, 0.26 г, 0.79 ммоль), (2R,3S)-3-аміно-1-[(3-метоксибензил)аміно]-4-феніл-2-бутанола дигідрохлориду (VIII, 0.26 г, 0.71 ммоль), НОВТ (0.16 г, 1.18 ммоль) і триетиламіну (0.44 мл, 3.15 ммоль) в DMF (4 мл) перемішують при температурі 20-25°C протягом 10 хвилин. У цю суміш додають EDC (0.23 г, 1.18 ммоль) і перемішують протягом 4 годин. Одержану суміш розбавляють водою і проводять екстракцію етилацетатом. Органічну фракцію промивають соляною кислотою (1N), водою, соляним розчином, сушать над сульфатом магнію і концентрують при зниженому тиску. Для отримання вищезгаданої сполуки одержаний продукт рекристалізують (метиленхлорид/гексан, 1/1). Температура плавлення 199-201°C. Методи аналізу: ІК-спектроскопія (KBr) 3278, 2961, 2874 і 2837 см⁻¹; МС

(ESI), m/z (M+H)⁺=614.

ПРИКЛАД 753 N-((1R,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-бензил)аміно]пропіл]-3-метил-5-пентаноїлбензамід (X)

Стадія 1. У крижану перемішувану суміш оксалілхлориду (733 мг, 5.77 ммоль) в метиленхлориді (5 мл) додають три краплі диметилформаміду. Через 10 хвилин в цю суміш додають 3-(метоксикарбоніл)-5-метилбензойну кислоту (LXXIII, 560 мг, 2.89 ммоль). Одержану суміш перемішують протягом 1 години і концентрують при зниженому тиску для отримання хлорангідриду кислоти (LXXIV), який використовують далі без додаткового очищення.

Стадія 2. При температурі -78°C, в суміш, що перемішується галогенангідрида кислоти (LXXIV, Стадія 1, 612 мг, 2.89 ммоль) і броміду міді(I) (415 мг, 2.89 ммоль) в ТГФ (5 мл) додають хлорид бутилмагнію (1.44 мл з суміші 2.0 М в ТГФ, 2.89 ммоль). Одержану суміш нагрівають до 20-25°C, заливають насиченим хлоридом амонію (нашатир) і розбавляють ефіром. Органічну фракцію виділяють, промивають соляним розчином, сушать (сульфатом натрію), фільтрують і концентрують при зниженому тиску. Для отримання метил-3-метил-5-пентаноїлбензоату (LXXVI) одержаний продукт очищають методом колонкової флеш-хроматографії (силікагель, гексан/ етилацетат, 6.5/1). Метод аналізу: ЯМР (300 МГц, CD₃OD) дельта 8.43, 8.05, 3.96, 3.01, 1.77, 1.55 і 1.22.

Стадія 3. Суміш метил-3-метил-5-пентаноїлбензоата (LXXVI, Стадія 2, 133 мг, 0.605 ммоль) в метанолі (1 мл) перемішують із сумішшю ТГФ/метанолу/гідроксиду натрію (2Н) (3/1/1, 3 мл) протягом 3 днів. Одержану суміш розбавляють етилацетатом і промивають водою. Водну фракцію виділяють, підкисляють соляною кислотою (1Н) і екстрагують метиленхлоридом. Органічну фракцію сушать (сульфатом натрію), фільтрують і концентрують при зниженому тиску для отримання 3-метил-5-пентаноїлбензойної кислоти (IX-LXXVII). Метод аналізу: ЯМР (300 МГц, CD₃OD) дельта 8.44, 8.03, 3.10, 2.33, 1.78, 1.64 і 1.34.

Стадія 4. У суміш із 3-метил-5-пентаноїлбензойної кислоти (IX-LXXVII, 112 мг, 0.589 ммоль), (2R,3S)-3-аміно-4-(3,5-дифторфеніл)-1-[(3-метоксибензил)аміно]-2-бутанолу дигідрохлориду (VIII, 239 мг, 0.589 ммоль), НОВТ (80 мг, 0.589 ммоль) і N-метилморфоліну (250 мг, 2.47 ммоль) в метиленхлориді (3 мл) додають EDC (203 мг, 1.06 ммоль). Одержану суміш перемішують протягом ночі, потім розділяють між етилацетатом і водою. Органічну фракцію промивають соляною кислотою (1Н), насиченим бікарбонатом натрію, соляним розчином, сушать (сульфатом натрію), фільтрують і концентрують при зниженому тиску. Для отримання вищезгаданої сполуки одержаний продукт очищають методом колонкової флеш-хроматографії (силікагель, метиленхлорид/метанол, 12/1). Методи аналізу: ІК-спектроскопія (ATR) 3297, 2957, 1687 і 1628 см⁻¹; МС (APCI), m/z (M+H)⁺=539.

ПРИКЛАД 754 N¹-(4-гідроксибутил)-N³-((1S)-2-гідрокси-1-(4-гідроксибензил)-3-[(3-бензил)аміно]пропіл]-5-метил-N¹-

пропілізофталамід (X)

Стадія 1. У суміш метил-(2S)-3-[4-(бензилокси)феніл]-2-(трет-бутоксикарбоніл)амінопропіонату (1.79 г, 4.65 ммоль) з сумішшю ТГФ/метанолу/води (1/2/1, 16 мл) додають гідроксид літію (340 мг, 13.9 ммоль) і перемішують при температурі 20-25°C протягом 12 годин. Потім цю суміш заливають лимонною кислотою (10%). Одержану суміш екстрагують етилацетатом (3 x 15 мл). Органічні екстракти об'єднують, промивають три рази водою, сушать над сульфатом натрію, фільтрують і концентрують при зниженому тиску для отримання (2S)-3-[4-(бензилокси)феніл]-2-[(трет-бутоксикарбоніл)аміно]-пропіонової кислоти, яку використовують далі без додаткового очищення. При температурі -78°C, в суміш, що перемішується (2S)-3-[4-(бензилокси)феніл]-2-[(трет-бутоксикарбоніл)аміно]кислоти (10 г, 27 ммоль) пропіона в ТГФ (200 мл) додають NMM (3.2 мл, 29 ммоль) і ізобутилхлороформіату (3.8 мл, 29 ммоль). Охолоджуючу ванну прибирають і перемішують одержану суміш протягом 1 години, потім фільтрують. Одержаний фільтрат зберігають при низькій температурі і використовують далі. У холодну як лід суміш ефіру (110 мл), що перемішується і гідроксиду калію (40%, 35 мл) поволи додають 1-метил-3-нітро-1-нітрозогунанідін (8.4 г, 57 ммоль). Цю суміш перемішують до тих пір, поки не припиниться процес газовиділення. Органічну фракцію виділяють і поволи додають в перемішувану, холодну як лід суміш одержаного раніше фільтрату ангідриду. Після перемішування протягом 1 години, через цю суміш пробують азотом протягом 10 хвилин. Одержану суміш концентрують при зниженому тиску, розбавляють етилацетатом (200 мл) і промивають водою (100 мл). Органічну фракцію промивають насиченим бікарбонатом натрію, соляним розчином, сушать над сульфатом натрію, фільтрують і концентрують при зниженому тиску для отримання діазокетона, який використовують без додаткового очищення або характеристики. У крижану перемішувану суміш діазокетона в ефірі (100 мл) додають бромистоводневу кислоту (48%, 4 мл, 73 ммоль). Охолоджуючу ванну прибирають, суміш перемішують протягом 30 хвилин потім розділяють між ефіром і водою. Органічну фракцію виділяють, промивають насиченим бікарбонатом натрію, соляним розчином, сушать над сульфатом натрію, фільтрують і концентрують при зниженому тиску для отримання трет-бутил-(1S)-1-[4-(бензилокси) бензил]-3-бром-2-оксопропілкарбамата (IV), який використовують без додаткового очищення або характеристики. При температурі -78°C, в перемішувану суміш трет-бутил-(1S)-1-[4-(бензилокси)бензил]-3-бром-2-оксопропілкарбамата (IV) в суміші ізопропанол/ТГФ (2/1, 150 мл) поволи додають борогідрид натрію (1.15 г, 30 ммоль). Цю суміш перемішують протягом 30 хвилин, потім додають воду (30 мл). Одержану суміш нагрівають до температури 20-25°C і концентрують при зниженому тиску у водяній бані при температурі не вище 30°C. Неочищену суху речовину розчиняють в етилацетаті, промивають водою і соляним розчином. Органічну фракцію сушать над сульфатом магнію, фільтрують і концентрують при зниженому тиску для отримання

бромгідрин в твердому стані. У холодну як лід перемішувану суміш бромгідрин в етанолі (150 мл) і етилацетаті (100 мл) додають суміш гідроксид калію (1 N) з етанолом (36 мл, 36 ммоль). Охолоджуючу ванну прибирають, суміш перемішують протягом 30 хвилин потім розділяють між етилацетатом і водою. Органічну фракцію виділяють, промивають соляним розчином, сушать над сульфатом магнію, фільтрують і концентрують при зниженому тиску. Одержаний продукт очищають методом флеш-хроматографії (силікагель, гексан/етилацетат, 5/1) для отримання трет-бутил-(1S)-2-[4-(бензилокси)феніл]-1-[(2S)-оксираніл]етилкарбамату (V, як суміш 8/1 диастеріомерів). Метод аналізу: ЯМР (500 МГц, CD Cl₃) дельта 7.44-7.32, 7.14, 6.93, 5.07, 4.45, 3.61, 3.0-2.6 і 1.39.

Стадія 2. Суміш із 4-бензилоксимасляної кислоти (2.69 г, 13.8 ммоль), пропіламіну (0.82 г, 13.8 ммоль), НОВТ (2.05 г, 15.2 ммоль), N-метилморфоліну (1.68 г, 16.6 ммоль) і EDC (2.91 г, 15.2 ммоль) в DMF (6 мл) перемішують при температурі 20-25°C протягом 18 годин. Потім цю суміш розбавляють етилацетатом (40 мл), промивають водою (10 мл), соляною кислотою (1 N, 10 мл), насиченим бікарбонатом натрію (10 мл) і соляним розчином (10 мл). Органічну фракцію виділяють, сушать над сульфатом магнію, фільтрують і концентрують при зниженому тиску для отримання 4-(бензилокси)-N-пропілбутанаміду (2.59 г). Метод аналізу: МС (APCI), m/z (M+H)⁺=236.

Стадія 3. У холодну як лід перемішувану суміш 4-(бензилокси)-N-пропілбутанаміду (2.59 г, 11 ммоль) в ТГФ (8 мл) додають алюмогідрид літію (0.54 г, 14.3 ммоль). Цю суміш нагрівають до температури 40-50°C протягом 5 годин. Охолоджену суміш заливають водою (0.5 мл), гідроксидом натрію (2 N, 1.0 мл), соляним розчином (0.5 мл), потім розбавляють ефіром (30 мл). Осад, що утворився, фільтрують, ефірну фракцію сушать над сульфатом магнію, фільтрують і концентрують при зниженому тиску для отримання N-[4-(бензилокси)бутил]-N-пропіламіну (2.41 г). Метод аналізу: МС (APCI), m/z (M+H)⁺=222.

Стадія 4. Суміш з N-[4-(бензилокси)бутил]-N-пропіламіну (2.31 г, 10.44 ммоль), 3-(етоксикарбоніл)-5-метилбензойної кислоти (2.18 г, 10.44 ммоль), НОВТ (1.56 г, 11.49 ммоль), N-метилморфоліну (1.37 мл, 12.52 ммоль) і EDC (2.2 г, 11.49 ммоль) в DMF (12 мл) перемішують при температурі 20-25°C протягом 18 годин. Потім цю суміш розбавляють етилацетатом (80 мл), промивають водою (2 x 20 мл), соляною кислотою (1 N, 20 мл), насиченим бікарбонатом натрію (20 мл), соляним розчином (20 мл), сушать над сульфатом магнію, фільтрують і концентрують при зниженому тиску. Одержаний продукт очищають методом флеш-хроматографії (силікагель, гексан/етилацетат, 1/1) для отримання етил-3-[[[4-(бензилокси)бутил](пропіл)аміно]карбоніл]-5-метилбензоату (1.79 г). Методи аналізу: ЯМР (500 МГц, диметилсульфоксид (DMSO) - d₆) дельта 7.80, 7.64, 7.40, 7.38-7.16, 4.5-4.43, 4.34-4.29, 3.53-3.3, 3.2-3.06, 2.41-2.36, 1.7-1.4, 1.36-1.29, 0.94-0.84 і 0.82-0.72; МС (APCI), m/z (M+H)⁺=412.

Стадія 5. У суміш із етил-3-[[[4-

(бензилокси)бутил](пропіл)аміно]-карбоніл]-5-метилбензоату (1.75 г, 4.25 ммоль) в суміші ТГФ/етанолу/води (1/2/1, 30 мл) додають гідроксид літію (0.31 г, 12.76 ммоль). Цю суміш перемішують протягом 2 годин, потім підкисляють концентрованою соляною кислотою (0.5 мл) до значення pH=3. Одержану суміш екстрагують етилацетатом (2 x 30 мл), сушать над сульфатом магнію, фільтрують і концентрують при зниженому тиску для отримання 3-[[[4-(бензилокси)бутил](пропіл)аміно]карбоніл]-5-метилбензойної кислоти (IX, 1.63 г). Метод аналізу: МС (ESI), m/z (M+H)⁺=384.

Стадія 6. Суміш із трет-бутил-(1S)-2-[4-(бензилокси)феніл]-1-[(2S)-оксираніл]етилкарбамату (V, 1.58 г, 4.28 ммоль) і 3-метоксибензиламіну (VI, 0.825 мл, 6.42 ммоль) в ізопропанолі (45 мл) нагрівають до температури 90°C протягом 4 годин. Після охолодження до температури 20-25°C, суміш концентрують при зниженому тиску. Одержаний продукт очищають методом флеш-хроматографії (силікагель, метиленхлорид/метанол/гідроксид амонію, від 98/1/1 до 95/4/1) для отримання трет-бутил-(1S,2R)-1-[4-(бензилокси)бензил]-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]-пропілкарбаміту (VII, 1.97 г). Методи аналізу: ЯМР (300 МГц, MeOH- d₄) дельта 7.41-6.79, 5.05, 4.33-3.33, 3.74, 3.54, 3.03-2.46 і 1.29; МС (ESI), m/z (M+H)⁺=507.

Стадія 7. Трет-бутил-(1S,2R)-1-[4-(бензилокси)бензил]-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]-пропілкарбамат (VII, Стадія 6, 2.34 г, 4.62 ммоль) в діоксані (10 мл) піддають дії соляної кислоти (12 мл з суміші 4M в діоксану, 48 ммоль) протягом 2 годин. Осад, що утворився, фільтрують, промивають ефіром, сушать при зниженому тиску протягом ночі для отримання (2R,3S)-3-аміно-4-[4-(бензилокси)феніл]-1-[(3-метоксибензил)аміно]-2-бутанола гідрохлориду (VIII). Методи аналізу: ЯМР (300 МГц, MeOH- d₄) дельта 7.44-6.96, 5.05, 4.21, 3.83, 3.65 і 3.21-2.77; МС (ESI), m/z (M+H)⁺=407.

Стадія 8. У холодну як лід перемішувану суміш із 3-[[[4-(бензилокси)бутил](пропіл)аміно]карбоніл]-5-метилбензойної кислоти (IX, 310 мг, 0.809 ммоль), (2R,3S)-3-аміно-4-[4-(бензилокси)феніл]-1-[(3-метоксибензил)аміно]-2-бутанол гідрохлориду (VIII, 359 мг, 0.809 ммоль) і бромтрипролідифосфонієвого гексафторфосфату (415 мг, 0.89 ммоль) в метиленхлориді (10 мл) додають, краплю за краплею, діізопропілетиламін (0.285 мл, 1.62 ммоль). Одержану суміш перемішують при температурі 0°C протягом 30 хвилин, потім нагрівають до температури 20-25°C. Через 4 години суміш концентрують при зниженому тиску і розділяють між етилацетатом і водою.

Водну фракцію відділяють і екстрагують етилацетатом (3 x 15 мл). Органічні фракції об'єднують, сушать над сульфатом магнію і концентрують при зниженому тиску. Одержаний концентрат очищають методом флеш-хроматографії (силікагель, метиленхлорид/метанол/гідроксид амонію, 96/3/0.5) для отримання N¹-{(1S,2R)-1-[4-(бензилокси)бензил]-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл}-N³-[4-(бензилокси)бутил]-5-метил-N³-пропіл-

ізофталаміду (X). Методи аналізу: ЯМР (300 Мгц, Ацетон - d₆) дельта 7.99-6.74, 5.01, 4.51-4.29, 4.36, 4.01, 3.8, 3.55-3.16, 2.98-2.82, 2.65-2.62, 2.36, 1.85-1.29, 1.01 і 0.68; МС (ESI), m/z (M+H)⁺=772.

Стадія 9. Суміш N¹-{(1S,2R)-1-[4-(бензилокси)бензил]-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)-аміно]пропіл]-N³-[4-(бензилокси)бутил]-5-метил-N³-пропілізофталаміду (X, 100 мг, 0.13 ммоль) і паладію на вугіллі (10%, 100 мг) в абсолютній крижаній (кристалічній) оцтовій кислоті (5 мл) струшують в атмосфері водню (при тиску 2.4 атм) протягом 5 годин. Одержану суміш фільтрують через інфузорну (діатомову) землю і промивають метанолом. Одержані фільтрати об'єднують і концентрують при зниженому тиску. Концентрат очищають методом колонкової флеш-хроматографії (силікагель, дихлорметан/метанол/гідроксид амонію, градієнтне елювання від 97/3/0.05 до 93/7/0.05) для отримання вищезгаданої сполуки. Методи аналізу: ЯМР (300 Мгц, CD₃OD) дельта 7.55-6.64, 4.19, 3.99-3.72, 3.63-3.36, 3.21-3.09, 2.79-2.69, 2.39, 1.9-1.4, 1.29 і 1.02-0.6; МС (ESI), m/z (M+H)⁺=592.

ПРИКЛАД 756 N¹-{(1S,2R)-2-гідрокси-1-(4-гідроксибензил)-3-[(3-метоксибензил)аміно]-пропіл]-5-метил-N₃,N₃-дипропілізофталамід (X)

Стадія 1. У перемішувану суміш з 3-[(дипропіламіно)-карбоніл]-5-метилбензойної кислоти (IX, 150 мг, 0.57 ммоль), (2R,3S) -3-аміно-4-[4-(бензилокси) феніл]-1-[(3-метоксибензил)аміно]-2-бутанола гідрохлориду (VIII, 274 мг, 0.571 ммоль), НОВТ (116 мг, 0.857 ммоль) і N,N-діізопропілетиламіна (0.4 мл, 2.28 ммоль) в дихлорметані (10 мл) додають EDC (165 мг, 0.857 ммоль). Одержану суміш перемішують при температурі 20-25°C протягом 16 годин. Потім суміш розділяють між дихлорметаном і водою. Водну фракцію відділяють і екстрагують дихлорметаном (3x15 мл). Органічні фракції об'єднують, промивають водою, сушать (сульфатом магнію) і концентрують при зниженому тиску. Одержаний продукт очищають методом колонкової флеш-хроматографії (силікагель, дихлорметан/метанол/гідроксид амонію, 97/3/0.05) для отримання N¹-{(1S,2R)-1-[4-(бензилокси) бензил]-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-5-метил-N₃,N₃-дипропілізофталаміда. Метод аналізу: МС (ESI), m/z (M+H)⁺=652.

Стадія 2. Суміш з N¹-{(1S,2R)-1-[4-(бензилокси) бензил]-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)-аміно]пропіл]-5-метил-N₃,N₃-дипропілізофталаміда (140 мг, 0.215 ммоль) і паладію на вугіллі (10%, 140 мг) в абсолютній крижаній (кристалічній) оцтовій кислоті (5 мл) струшують в атмосфері водню (при тиску 2.4 атм) протягом 5 годин. Одержану суміш фільтрують через землю інфузора (діатомову) і промивають метанолом. Одержані фільтрати об'єднують і концентрують при зниженому тиску. Концентрат очищають методом колонкової флеш-хроматографії (силікагель, метиленхлорид/ метанол/гідроксид амонію, градієнт від 97/3/0.05 до 93/7/0.05) для отримання вищезгаданої сполуки. Методи аналізу: ІК-спектроскопія (KBr) 2962, 2931, 1611, 1594 і 1263 см⁻¹; МС (ESI), m/z (M+H)⁺=562.

ПРИКЛАД 757 N¹-{(1S,2R)-1-бензил-3-[(3-(2,4-

диметилфеніл) пропіл]аміно}-2-гідроксипропіл)-5-метил-N₃,N₃-дипропілізофталамід (X)

Стадія 1. Перемішувану суміш трет-бутил-(1S)-1-[(2S)-оксираніл]-2-фенілетилкарбамата (V, 247 мг, 0.939 ммоль), карбонату натрію (299 мг, 2.82 ммоль) і 3-(2,4-диметилфеніл) пропіламіна (VI, 628 мг, 2.82 ммоль) кип'ятять протягом ночі. Потім цю суміш охолоджують до температури 20-25°C і концентрують при зниженому тиску. Одержаний продукт очищають методом колонкової флеш-хроматографії (силікагель, метиленхлорид/метанол/гідроксид амонію, 98/2/1) для отримання трет-бутил-(1S,2R) -1-бензил-3-[(3-(2,4-диметилфеніл) пропіл]аміно)-2-гідроксипропілкарбамата (VII). Метод аналізу: ЯМР (300 Мгц, CD₃OD) дельта 7.22-7.16, 3.81, 3.18, 2.77, 2.54, 2.15, 2.13, 1.89 і 1.23.

Стадія 2. У перемішувану суміш трет-бутил -(1S,2R) -1-бензил-3-[(3-(2,4-диметилфеніл) пропіл]аміно)-2-гідроксипропілкарбамата (VII, 180 мг, 0.423 ммоль) в диоксані (2 мл) додають соляну кислоту (0.32 мл з суміші 4 N в диоксані, 1.27 ммоль). Одержану суміш перемішують протягом ночі і концентрують при зниженому тиску для отримання (2R,3S) -3-аміно-1-[(3-(2,4-диметилфеніл) пропіл]аміно)-4-феніл-2-бутанол гідрохлориду (VIII). Метод аналізу: ЯМР (300 Мгц, CD₃OD) дельта 7.14, 3.73, 2.70, 2.32 і 1.86.

Стадія 3. У перемішувану суміш з (2R,3S) -3-аміно-1-[(3-(2,4-диметилфеніл) -пропіл]аміно)-4-феніл-2-бутанол гідрохлориду (VIII, 163 мг, 0.411 ммоль), 3-[(дипропіламіно)-карбоніл]-5-метилбензойної кислоти (IX, 108 мг, 0.411 ммоль), НОВТ (55 мг, 0.411 ммоль) і N-метилморфоліна (133 мг, 1.32 ммоль) в метиленхлориді (5 мл) додають EDC (142 мг, 0.74 ммоль). Одержану суміш перемішують протягом ночі, потім розділяють між етилацетатом і водою. Органічну фракцію промивають соляною кислотою (1 N), насиченим бікарбонатом натрію, соляним розчином, сушать (сульфатом натрію), фільтрують і концентрують при зниженому тиску. Одержаний продукт очищають методом флеш-хроматографії (силікагель, метиленхлорид/метанол/гідроксид амонію, 95/5/1) для отримання вищезгаданої сполуки. Методи аналізу: ІК-спектроскопія (ATR) 3299, 2930 і 1614 см⁻¹; МС (APCI), m/z (M+H)⁺=572.

ПРИКЛАД 765 N₃-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]-пропіл]-4-метил-N₁,N₁-дипропілізофталамід (X)

3-бром-4-метилбензойну кислот (10.94 г, 43.25 ммоль), ціанід міді (I) (7.75 г, 86.5 ммоль) і 1-метил-2-піролідінон (75 мл) нагрівають до температури 160°C протягом ночі. Потім суміш охолоджують і переганяють у вакуумі для отримання осаду, який перемішують в соляній кислоті (6 N, 60 мл) протягом 10 хвилин. Тверду фазу одержаного розчину фільтрують, промивають водою, ефіром і сушать. Суху речовину нагрівають до температури 90°C в гідроксиді натрію (2 N, 250 мл) протягом 3 годин, потім цю суміш охолоджують і перемішують протягом ночі при температурі 20-25°C. Одержану суміш підкисляють концентрованою соляною кислотою до значення pH=3, внаслідок чого утворюється осад. Тверду фазу розчину фільтрують, промивають водою, потім розтирають в порошок в

киплячій воді, фільтрують і сушать у вакуумній печі при температурі 60°C. Суху речовину розчиняють в метанолі (75 мл), додають концентровану соляну кислоту (5 мл) і кип'ятять одержану суміш протягом ночі. Потім суміш охолоджують і концентрують при зниженому тиску. В результаті розділення фракцій за допомогою хроматографічної колонки (силікагель, метанол/метиленхлорид, 8/92) одержують 5-(метоксикарбоніл)-2-метилбензойну кислоту.

У суміш 5-(метоксикарбоніл)-2-метилбензойної кислоти (250 мг, 1.3 ммоль) і триетиламіна (0.72 мл, 5.2 ммоль) в метиленхлориді (14 мл) додають, перемішуючи, диетилціанопіровуглець (90%, 0.24 мл, 1.4 ммоль). Через 1 хвилину додають (2R,3S)-3-аміно-1-[(3-метоксибензил)аміно]-4-феніл-2-бутанол дигідрохлорид (VIII, 0.485 г, 1.3 ммоль) і перемішують суміш протягом ночі, потім суміш концентрують. В результаті розділення фракцій за допомогою хроматографічної колонки (силікагель, метанол/метиленхлорид, 8/92) одержують 3-[[[(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]аміно)-карбоніл]-4-метилбензоат.

3 - [[[(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3 - [(3-метоксибензил)аміно]пропіл]аміно)-карбоніл]-4-метилбензоат (200 мг, 0.42 ммоль) піддають дії гідроксида літію (39 мг, 0.96 ммоль) в суміші ТГФ/метанол/вода (2/1/1, 2 мл). Одержану суміш перемішують при температурі 20-25°C протягом ночі. Потім суміш зціджують, надосадову рідину концентрують для отримання 3-[[[(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]аміно)карбоніл]-4-метилбензойної кислоти.

3-[[[(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-аміно)карбоніл]-4-метилбензойну кислоту (124 мг, 0.27 ммоль) розчиняють в триетиламіні (0.07 мл, 0.54 ммоль) і метиленхлориді (3 мл), піддають дії, перемішуючи протягом 2 хвилин, диетилціанопіровуглеця (90%, 0.06 мл, 0.32 ммоль). Потім додають дипропіламін (0.04 мл, 0.32 ммоль) і продовжують перемішувати протягом ночі. Органічну фракцію розбавляють метиленхлоридом, промивають насиченим бікарбонатом натрію (2 x 50 мл), соляним розчином (50 мл), сушать над безводним сульфатом натрію, фільтрують і концентрують. В результаті розділення фракцій за допомогою хроматографічної колонки (силікагель, метанол/метиленхлорид, 8/92) одержують вищезгадану сполуку. Метод аналізу: МС, m/z (M+H)⁺=546.3

ПРИКЛАД 766 N-[(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-3-(2-фуріл)-5-метилбензамід (X)

Суміш з N-[(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-3-бром-5-метилбензаміда (X, ПРИКЛАД 761, 295 мг, 0.59 ммоль), 2-фуранілборонової кислоти (133 мг, 1.19 ммоль) і карбонату натрію (366 мг, 2.95 ммоль) в діметилформаміді (5 мл) продувають азотом протягом 15 хвилин. Потім додають тетракис(трифенілфосфіно) паладій (136 мг, 0.12 ммоль) і нагрівають суміш до температури 100°C протягом ночі. Потім суміш охолоджують до тем-

ператури 20-25°C, розбавляють хлороформом (50 мл) і екстрагують водою (3 x 100 мл). Органічну фракцію відділяють, промивають насиченим бікарбонатом натрію (2 x 100 мл), соляним розчином (100 мл), сушать над безводним сульфатом натрію, фільтрують і концентрують при зниженому тиску. В результаті розділення фракцій за допомогою хроматографічної колонки (силікагель, метанол/метиленхлорид, 8/92) одержують вищезгадану сполуку. Метод аналізу: МС, m/z (M+H)⁺=485.3.

ПРИКЛАД 792 2-бутилциклопропіламін гідрохлорид (VI)

Розчин триетилфосфоноацетата (22.4 г, 0.1 моль) в 13 мл дигліма додають в суміш з 13 мл дигліма і гідриду натрію (60%, 5.7 г, 0.12 моль) в мінеральному маслі. Після припинення виділення водню, додають суміш 1,2-епоксигексана (12 г, 0.12 моль) в диглімі (12 мл). Одержану суміш перемішують при температурі 25°C протягом 1 дня, потім при температурі 140°C протягом 3 годин. Суміш охолоджують і додають розчин гідроксида натрію (15 г в 25 мл води). Одержану суміш кип'ятять протягом 15 годин, потім розбавляють холодною водою (100 мл) і промивають ефіром (3 x 50 мл). Суміш підкисляють сірчаною кислотою (25%) до значення pH=2, екстрагують ефіром (5 x 25 мл), сушать ефірну фракцію над безводним сульфатом натрію, фільтрують і концентрують для отримання 2-бутилциклопропанкарбонової кислоти. Суміш цієї кислоти (5 г, 0.035 ммоль) з дихлорметаном (15 мл) гріють у присутності тіонілхлориду (5.1 г, 3.1 мл) при температурі 60°C протягом 15 годин. Одержану суміш перегоняють при температурі 76-80°C для отримання хлорангідрида кислоти, який розчиняють в ацетоні (15 мл), охолоджують до температури -10°C і піддають дії розчину азиду натрію (2.2 г, 33.8 ммоль) у воді (5 мл). Одержану суміш перемішують при температурі -10°C протягом наступної години, потім виливають в крижану воду, екстрагують ефіром (3 x 10 мл), сушать і обережно упарюють насухо при температурі 20-25°C при зниженому тиску. Одержаний сухий залишок розбавляють толуолом (15 мл) і обережно нагрівають до температури 100°C протягом однієї години енергійно перемішуючи. Потім додають концентровану соляну кислоту (7 мл) і суміш кип'ятять протягом 15 хвилин. Кислотний розчин упарюють насухо для отримання вищезгаданої сполуки. МН⁺=114.2.

ПРИКЛАД 793 2-амінометил-3-метилфуран (VI)

3-метилфуранкарбонову кислоту (4 г, 32 ммоль) розчиняють в DMF (10 мл) при температурі 20-25°C і додають 1,1-карбонілдіїмідазол (5.7 г, 35 ммоль). Після закінчення 15 хвилин, через цю суміш пробують амоній протягом приблизно 2 хвилин. Суміш перемішують при температурі 20-25°C протягом 2 годин, потім концентрують при зниженому тиску. Сухий залишок розділяють між етилацетатом і 10% водним розчином лимонної кислоти. Фракції розділяють, водну фракцію екстрагують додатковою кількістю етилацетата (2 x). Органічні фракції об'єднують, промивають насиченим бікарбонатом натрію, соляним розчином, сушать над безводним сульфатом магнію, фільтрують і концентрують. Кристалічну речовину, що

утворилася, фільтрують і промивають невеликою кількістю суміші етилацетат/гексан (80/20). Метод аналізу: МС (ESI), $MH^+ = 126.1$. 3-метилфуранкарбоамід (317 мг, 2.5 ммоль) розчиняють в сухому ТГФ (5 мл). Однією порцією додають алюмогідрид літію (230 мг, 6 ммоль) і доводять суміш до кипіння протягом ночі. Потім суміш охолоджують до температури 0°C і заливають сумішшю ТГФ/вода (50/50). Після цього суміш розбавляють ТГФ і фільтрують через інфузорну (діатомову) землю. Одержаний фільтрат концентрують для отримання вищезгаданої сполуки. Метод аналізу: МС (ESI), $MH^+ = 109.1$.

ПРИКЛАД 794 4-амінометил-3,5-диметилізоксазол (VI)

4-хлорметил-3,5-диметилізоксазол (700 мг, 4.8 ммоль) суспендують в концентрованому водному розчині аміаку при температурі 20-25°C і енергійно перемішують протягом ночі. Одержану суміш екстрагують сумішшю ізопропіловий спирт/хлороформ (10/90, 2 х). Органічні фракції об'єднують і концентрують в атмосфері азоту. Суху речовину очищають методом флеш-хроматографії метанол/метиленхлорид (5-20%, 1% триетиламін) для отримання вищезгаданої сполуки. Метод аналізу: ЯМР (300 МГц, $CDCl_3$) дельта 3.62, 2.37, 2.29 і 1.44.

ПРИКЛАД 795 5-гідроксиметил-2-(2-метилпропіл) тіазол (VI)

Ізовалеротіоамід синтезують відповідно до процедури, описаної в J. Med. Chem., 41, стор. 602-617, 1998. Ізовалерамід (10 г, 9.9 ммоль) суспендують в сухому ефірі (400 мл), потім порціями додають сульфід фосфору (V) (4.4 г, 0.99 ммоль). Цю суміш енергійно перемішують при температурі 20-25°C протягом 2 годин, потім фільтрують. Одержаний фільтрат концентрують при зниженому тиску. Суху речовину використовують без додаткового очищення. Метод аналізу: МС (ESI), $MH^+ = 118.1$.

Ізовалеротіоамід (6 г, 51 ммоль) і етилформілхлорацетат (5 г, 33 ммоль) («Гетероциклічні сполуки» 32 (4), стор. 693-701, 1991) розчиняють в сухому DMF (20 мл) і нагрівають до температури 95°C протягом 4 годин. Потім суміш охолоджують до температури 0°C і додають холодну воду (50 мл). Водневий показник (pH) цієї суміші підстроюють до значення 8 додаванням бікарбонату натрію в твердому стані, потім суміш екстрагують ефіром (3 x 35 мл). Органічні фракції об'єднують і промивають водою, соляним розчином, сушать над сульфатом магнію, фільтрують і концентрують. Суху речовину очищають методом флеш-хроматографії (елювання 4-10% етилацетат/гексан) для отримання необхідного продукту. Метод аналізу: ЯМР (300 МГц, $CDCl_3$) дельта 8.27, 4.45-4.3, 3.7-3.5, 3-2.8, 2.3-2.1, 1.4-1.2 і 1.1-0.9.

Розчин Етил-2-(2-метилпропіл) тіазол-5-карбоксилата (2.05 г, 9.6 ммоль) в ТГФ (10 мл) додають, перемішуючи, по краплях в суспензію алюмогідрида літію (730 мг, 19 ммоль) в сухому ТГФ (50 мл) при температурі 0°C. Одержану суміш перемішують при температурі 20-25°C, потім охолоджують до температури 0°C. Послідовно додають: воду (0.75 мл), водний розчин гідроксида натрію (15%, 0.75 мл) і знову воду (2.25 мл). Одержану суміш перемішують при температурі

0°C протягом однієї години, потім фільтрують через інфузорну (діатомову) землю (ТГФ і хлороформ). Фільтрат концентрують для отримання 5-гідроксиметил-2-(2-метилпропіл)-тіазола. Метод аналізу: МС (ESI), $MH^+ = 172.1$.

ПРИКЛАД 796 3-(2-метилпропіл) -5-амінометилізоксазол (VI)

Ізовалеральдегід (5.4 мл, 50 ммоль) і гідроксиламін гідрохлорид (3.5 г, 50.4 ммоль) енергійно перемішують у воді (6 мл). У цю суміш додають розчин карбонату натрію (2.65г, 25 ммоль) у воді (15 мл). Одержану суміш енергійно перемішують протягом ночі, потім екстрагують ефіром. Органічну фракцію промивають водою, сушать над сульфатом натрію, фільтрують і концентрують. Суху речовину використовують в подальших реакціях без додаткового очищення. Метод аналізу: МС (ESI), $MH^+ = 102.1$.

Пропаргіламін (8 мл, 117 ммоль) розчиняють в метиленхлориді (60 мл) і додають ди-трет-бутилдикарбонат (25 г, 114 ммоль). Цю суміш перемішують протягом ночі і концентрують для отримання ВОС-захищеного пропаргіламіна, який використовують без додаткового очищення. Метод аналізу: МС (ESI), $MNa^+ = 178$.

ВОС-пропаргіламін (6.2 г, 39.7 ммоль) і ізовалероксим (3.97 г, 39.3 ммоль) розчиняють в метиленхлориді (60 мл), потім додають триетиламін (0.55 мл, 3.95 ммоль). Суміш охолоджують до температури 0°C і додають, енергійно перемішуючи, по краплях хлорне вапно (відбілювач) (5% водний розчин, 59.1 г). Після цього, суміші дають нагрітися до температури 20-25°C протягом 22 годин. Шари розділяють, водний розчин екстрагують метиленхлоридом (2 х). Органічні екстракти об'єднують, промивають соляним розчином, сушать над сульфатом магнію, фільтрують і концентрують. Суху речовину очищають хроматографічним методом (силікагель, етилацетат/гексан 5-10%) для отримання ВОС-захищеного вищезгаданої сполуки. Метод аналізу: МС (ESI), $MH^+ = 255.3$.

ВОС-захищений 3-(2-метилпропіл) -5-амінометилізоксазол (2.4 г, 9.3 ммоль) розчиняють в метиленхлориді (10 мл) і піддають дії трифтороцтової кислоти (10 мл) при температурі 20-25°C. Цю суміш перемішують при температурі 20-25°C протягом 70 хвилин, потім концентрують. Одержаний продукт розчиняють в метиленхлориді, промивають водним розчином карбонату калія (1 М), поки значення водневого показника pH не стане рівне 11 (суміш з властивостями основи). Органічну фракцію виділяють, сушать над сульфатом натрію, фільтрують і концентрують для отримання вищезгаданої сполуки. Метод аналізу: МС (ESI), $MH^+ = 155.2$.

ПРИКЛАД 797 Трет-бутил-(3R) -2-оксо-і-пропілазепанілкарбамат (VI)

У суміш N-t-ВОС-D-Лиз-ОН (10 г, 41.4 ммоль) в DMF (4 літри) додають бензотріазол-1-ілокситрипіролідіно-фосфоній гексафторфосфат (BOP, 18.3 г, 41.4 ммоль) і бікарбонат натрію (17.4 г, 206.8 ммоль). Одержану суміш перемішують при температурі 20-25°C протягом 12 годин. Потім суміш концентрують до об'єму 50 мл і розбавляють етилацетатом, промивають бікарбонатом натрію (3 х), водою, сумішшю 1 М бісульфату калія з розсо-

лом, сушать і концентрують. Одержаний продукт очищають хроматографічним методом (силікагель) для отримання 5.05 г трет-бутил-(3R)-2-оксоазепанілкарбамата в твердому стані. Використовують процедуру, аналогічну тієї, яка описана в J. Med. Chem., стор. 4193, 1999. Метод аналізу: MC M+H-(t-BOC), m/z=129.2, M+Na, m/z=251.1.

У суміш одержаного лактаму (2 г, 8.77 ммоль) з сухим ТГФ (20 мл) додають суміш n-бутилїтії/гексан (2.5 М, 5.3 мл, 13.2 ммоль) при температурі -78°C. Одержану суміш перемішують протягом 1 години і додають 1-бромпропан (3.2 мл, 35.1 ммоль). Суміш перемішують протягом ще однієї години, потім прибирають охолоджуючу ванну і продовжують перемішування протягом наступних 16 годин. Додають йодид тетрабутиламонія (0.49 г, 2.63 ммоль) і перемішують суміш протягом наступних 16 годин. Потім суміш розділяють між етилацетатом/соляною кислотою з додаванням льоду і води. Суміш промивають водою, соляним розчином і концентрують. Одержаний продукт очищають хроматографічним методом (силікагель) для отримання вищезгаданої сполуки. Метод аналізу: MC, M+Na=293.3.

ПРИКЛАД 798 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід (X)

Слідують процедурі, описаній в J. Am. Chem. Soc, стор. 3150, 1986. Сіль трифтороцтової кислоти N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-йодобензил)аміно]пропіл)-5-метил-N³,N³-дипропілізофталамід (92.9 мг, 0.117 ммоль) розчиняють в триетиламіні (0.2 М, 0.6 мл), потім додають PdCl₂(PPh₃)₂ (3.3 мг, 0.005 ммоль) і йодид міді (I) (1.1 мг, 0.006 ммоль). Одержану суміш доводять до кипіння. В процесі кипіння додають, за допомогою шприца, триметилсилілацетилен (0.02 мл, 0.14 ммоль). Цю суміш кип'ятять протягом 3 годин в атмосфері азоту, потім охолоджують до температури 20-25°C. Після цього суміш розділяють між водним розчином бікарбонату натрію і етилацетатом. Одержаний продукт екстрагують етилацетатом (3 х), промивають соляним розчином, сушать над сульфатом натрію, фільтрують і концентрують (видаляють розчинник) при зниженому тиску.

TMS-захисений ацетилен (0.117 ммоль) розчиняють в метанолі (0.2 М, 0.5 мл), потім додають гідроксид калія (1 М, 0.7 мл, 0.7 ммоль). Суміш перемішують при температурі 20-25°C протягом 6 годин, після чого розділяють між бікарбонатом натрію і етилацетатом. Одержаний продукт екстрагують етилацетатом (3 х), промивають соляним розчином, сушать над сульфатом натрію, фільтрують і концентрують (видаляють розчинник) при зниженому тиску. В результаті розділення фракцій за допомогою хроматографічної колонки (силікагель, 1.5-2% ізопропанол/хлороформ в основних умовах, декілька крапель гідроксида амоніа на 100 мл розчинника для еліювання) одержують вищезгадану сполуку. Метод аналізу: MC, m/z (M+H)⁺=576.3.

ПРИКЛАД 799 1-фенілциклопропіламін (VI)

Слідують процедурі описаної в статті N.W. Werner і ін., в J. Org. Syn. Coll., т. 5, стор. 273-276. Азід натрію (0.915 г, 14.1 ммоль) повільно додають

в розчин 1-фенілциклопропанкарбонової кислоти (1 г, 6.1 ммоль) в концентрованій сірчаній кислоті (5 мл) і дихлорметані (10 мл). Сульфат натрію випадає в осад з розчину. Суміш нагрівають до температури 50°C протягом 17 годин, потім охолоджують до 0°C. Суміш підлідують до pH=11 за допомогою гідроксида натрію (1N) і екстрагують дихлорметаном (2 х). Органічні фракції об'єднують, сушать над сульфатом натрію, фільтрують і концентрують. Суху речовину очищають хроматографічним методом (силікагель, ізопропіловий спирт/хлороформ/гідроксид амоніа 4/95/1) для отримання вищезгаданої сполуки. Метод аналізу: MC (ESI), C₉H¹¹N m/z (M+H)⁺=134.

ПРИКЛАД 800 7-метокси-1,2,3,4-тетрагідро-1-нафталінамін (VI)

7-метокси-1-тетралон (2 г, 11.3 ммоль), гідроксид амоніа (1.56 г, 22.6 ммоль) і ацетат натрію (1.8 г, 22.6 ммоль) суспендують в суміші етанол/вода (3/1, 40 мл). Суміш гріють при температурі 100°C протягом 45 хвилин. Потім суміш остигає протягом ночі, осад, що після чого утворився, фільтрують і промивають водою для отримання проміжного оксима. Метод аналізу: MC (ESI), m/z (M+H)⁺=192.1. Одержаний оксим розчиняють в крижаній (кристалічній) оцтовій кислоті (25 мл), додають паладій на вугіллі (500 мг) і суміш гідрогенізують при тиску 3.4 атм і температурі 20-25°C протягом ночі. Каталізатор фільтрують через землю інфузора (діатомову) і промивають метанолом. Одержані фільтрати об'єднують і концентрують. Концентрат розтирають в порошок, змішують з ефіром для отримання вищезгаданої сполуки. Метод аналізу: MC (C₁), m/z (M+H)⁺=178.2.

ПРИКЛАДИ 1208-1214 і 1226

1208 N¹-(трет-бутил)-N³-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-метилізофталамід

1209 5-бром-N¹-(трет-бутил)-N³-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)ізофталамід

1210 3-(трет-бутокс)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)бензамід

1211 3-(трет-бутокс)-N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-метилбензамід

1212 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-[[трифторметил]сульфоніл]аміно]бензамід

1213 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-(трифторметокси) бензамід

1214 N-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-3-метил-5-(трифторметокси) бензамід

1226 N¹-((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл)-5-(4-метил-1,3-оксазол-2-іл)-N³,N³-дипропілізофталамід (M+H)⁺=647.5

Сполуки, приведені в нижченаведеній таблиці, були синтезовані із застосуванням тільки викладених вище методів, які проілюстровані далі на схемах.

Назви сполук в цьому розділі згенерували за допомогою програм Chemdraw Ultra версія 6.0.2,

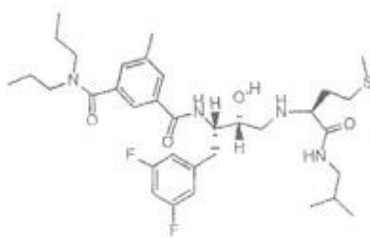
327

яку можна придбати в компанії Cambridgesoft.Co,
100 Cambridge Park Drive, Cambridge, MA 02140 і
Namepro версія 5.09, яку можна придбати в ком-

85994

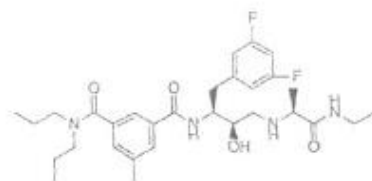
панії ACD labs, 90 Adelaide Street West, Toronto,
Ontario, M5H, 3V9, Canada або були утворені з
назв, що згенеровані обома програмами.

328



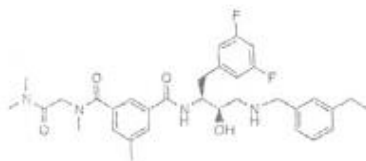
1260

N-[1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(1-ізобутилкарбамоіл-3-метилсульфанілпропіламіно)пропіл]-5-метил-N',N'-дипропілізофталамід



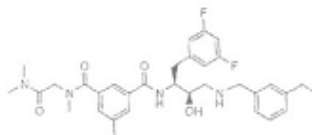
1261

N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(1-етилкарбамоїлетиламіно)-2-гідроксипропіл-3,5-метил-N',N'-дипропілізофталамід



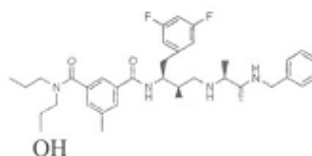
1262

N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропіл]-N'-диметилкарбамоїлметил-5,N'-диметил-ізофталамід



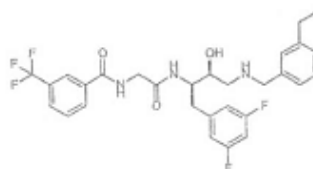
1263

N-[1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(1-метилкарбамоїл-3-метилсульфанілпропіламіно)-пропіл]-5-метил-N,N'-дипропілізофталат



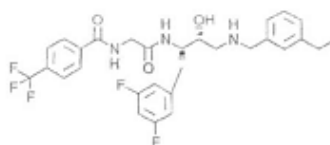
1264

N-[3-(1-бензилкарбамоїл-етиламіно)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N,N'-дипропілізофталамід



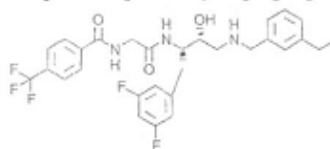
1265

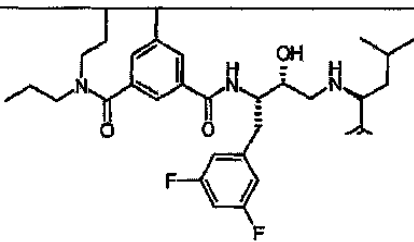
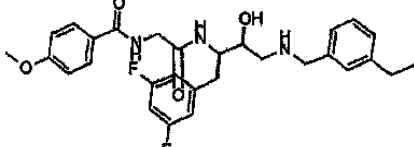
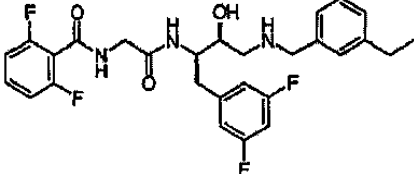
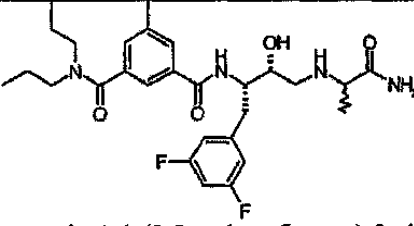
N-{[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропілкарбамоїл]-метил} 3-трифторметилбензамід

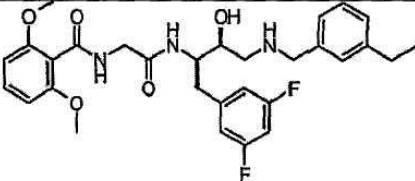
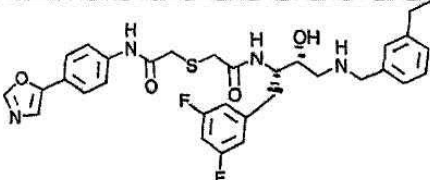
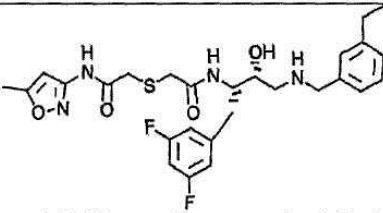
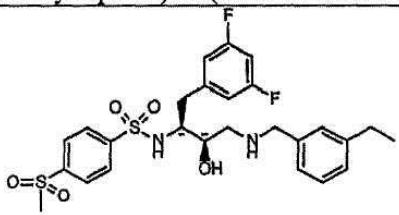
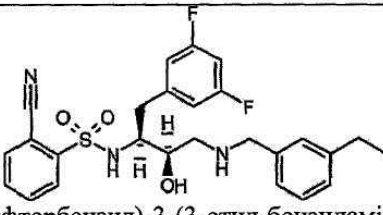


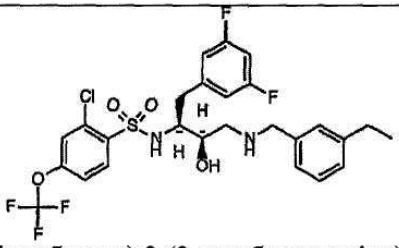
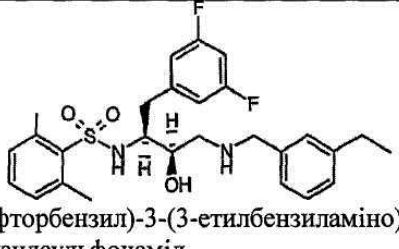
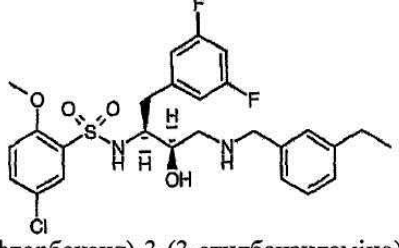
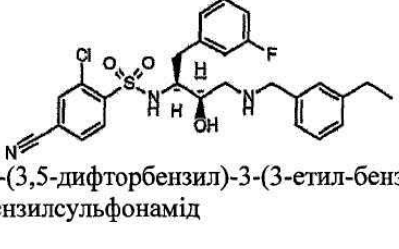
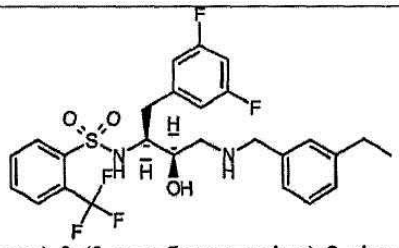
1266

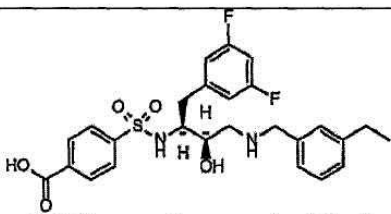

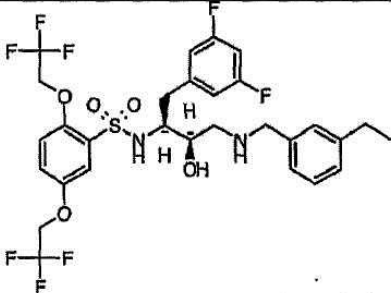
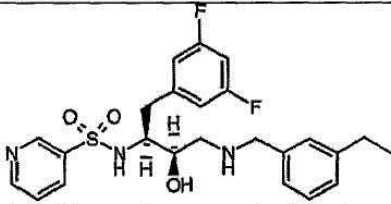
N-{[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідроксипропілкарбамоїл]-метил} 4-трифторметил-бензамід

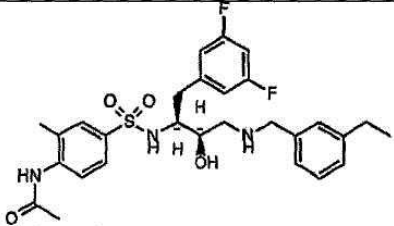
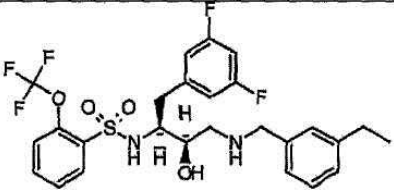
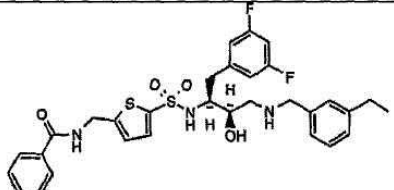
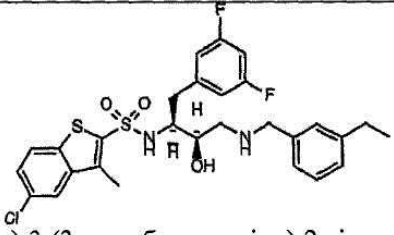


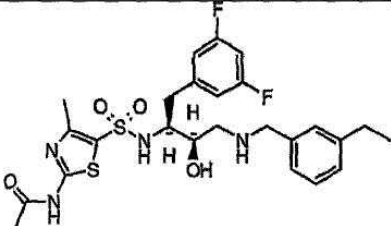
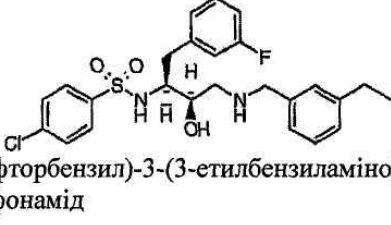
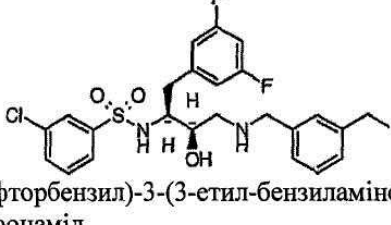


1268	 <p>N-[3-(1-Карбаміл-3-метил-бутиламіно)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-пропіл]-5-метил-N',N'-дипропіл-ізофталамід</p>
1269	 <p>N-[[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропілкарбаміл]-метил}-4-метокси-бензамід</p>
1270	 <p>N-[[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропілкарбаміл]-метил}-2,6-дифтор-бензамід</p>
1271	 <p>N-[3-(1-Карбаміл-етиламіно)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-пропіл]-5-метил-N',N'-дипропіл-ізофталамід</p>

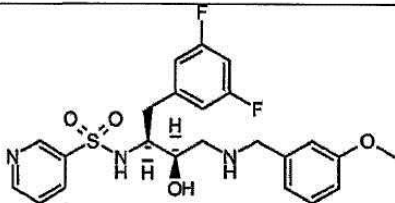
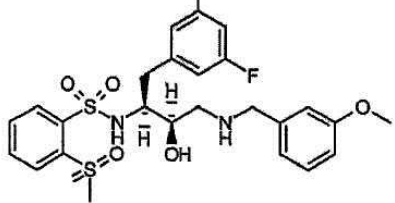
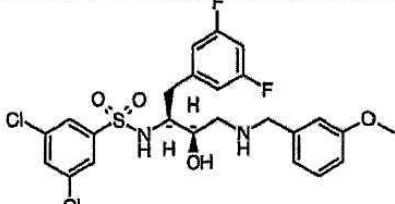
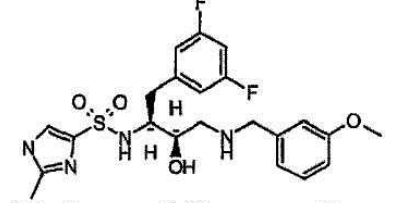
1272	 <p>N-{[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропілкарбаміл]-метил}-2,6-диметокси-бензамід</p>
1273	 <p>2-{[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропілкарбаміл]-метилсульфоніл}-N-(4-оксазол-5-іл-феніл)-ацетамід</p>
1274	 <p>2-{[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропілкарбаміл]-метилсульфоніл}-N-(5-метил-ізоксазол-3-іл)ацетамід</p>
1275	 <p>N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-4-метилсульфоніл-бензилсульфонамід</p>
1276	 <p>2-Ціано-N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-бензилсульфонамід</p>

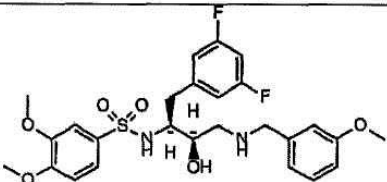
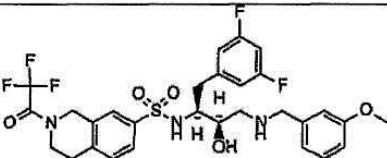
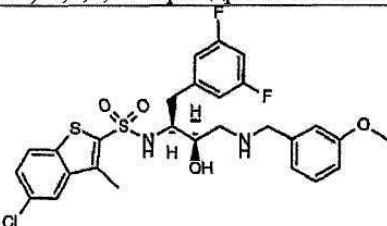
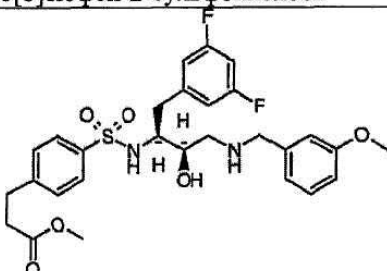
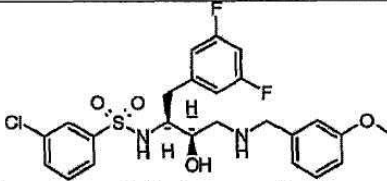
1277	 <p>2-хлор-N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-4-трифторметокси-бензилсульфонамід</p>
1278	 <p>2-хлор-N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-6-метил-бензилсульфонамід</p>
1279	 <p>5-хлор-N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-2-метокси-бензилсульфонамід</p>
1280	 <p>2-хлор-4-ціано-N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-бензилсульфонамід</p>
1281	 <p>N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-2-трифторметил-бензилсульфонамід</p>

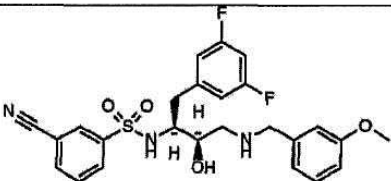
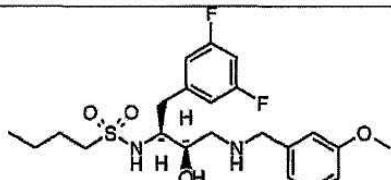
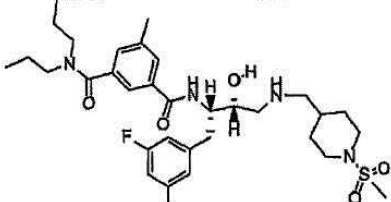
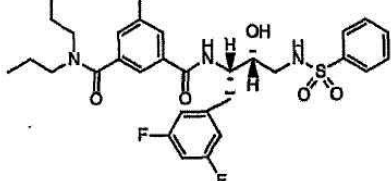
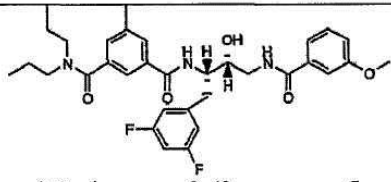
1282	 <p>4-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропілсульфамід]-бензойна кислота</p>
1283	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід-6-хлорпіридин-3-сульфонової кислоти</p>
1284	 <p>N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-2,5-біс-(2,2,2-трифтор-етокси)-бензилсульфонамід</p>
1285	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід піридин-3-сульфонової кислоти</p>

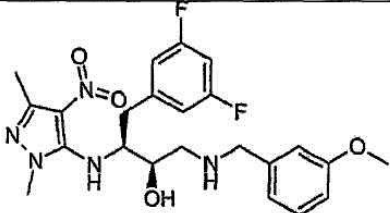
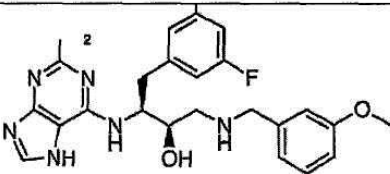
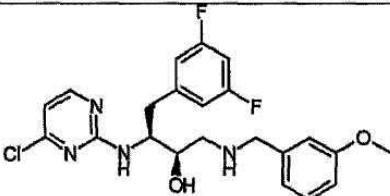
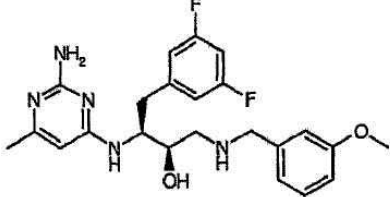
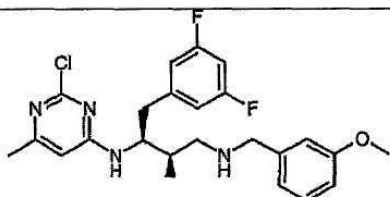
1286	 <p>N-{2-хлор-4-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропілсульфаміл]феніл}-ацетамід</p>
1287	 <p>N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-2-трифторметокси-бензилсульфонамід</p>
1288	 <p>N-{5-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропілсульфаміл]-тіофен-2-ілметил}-бензамід</p>
1289	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]амід 5-хлор-3-метил-бензо[b]тіофен-2-сульфонової кислоти</p>

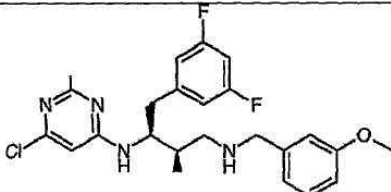
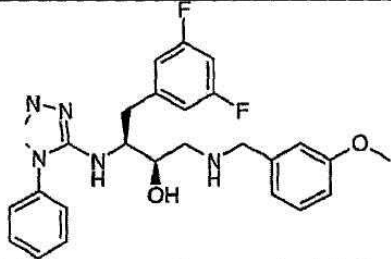
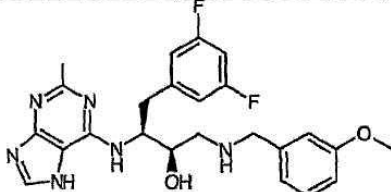
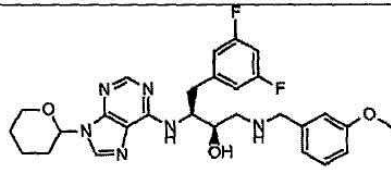
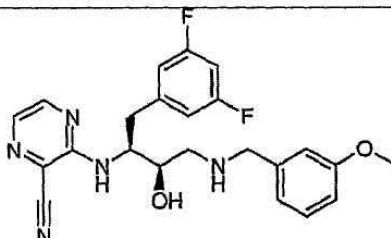
1290	 <p>N-{5-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропілсульфаміл]-4-метил-тіазол-2-іл}-ацетамід</p>
1291	 <p>4-хлор-N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етилбензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-бензилсульфонамід</p>
1292	 <p>3-хлор-N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-бензилсульфонамід</p>
1293	 <p>N-[1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(3-метокси-бензиламіно)-пропіл]-2-трифторметил-бензилсульфонамід</p>
1294	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(3-метокси-бензиламіно)-пропіл]-амід 6-хлор-піридин-3-сульфо кислоти</p>

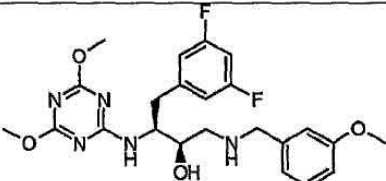
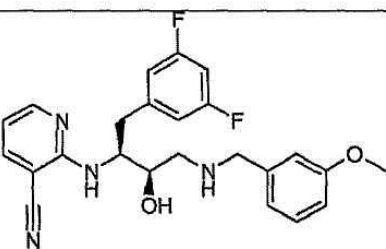
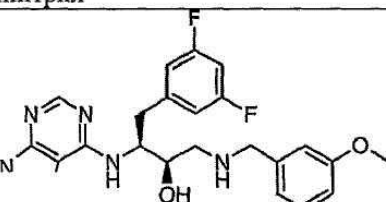
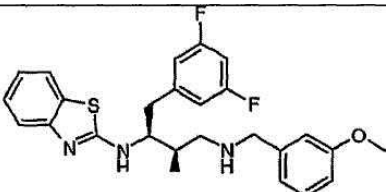
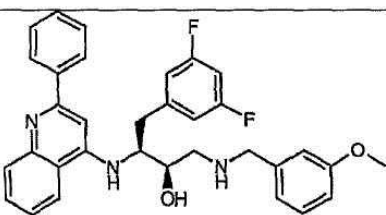
1295	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(3-метокси-бензиламіно)пропіл]-амід піридин-3-сульфоїкислоти</p>
1296	 <p>N-[1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(3-метокси-бензиламіно)-пропіл]-2-метилсульфоніл-бензилсульфонамід</p>
1297	 <p>3,5-Дихлор-N-[1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(3-метокси-бензиламіно)-пропіл]-бензилсульфонамід</p>
1298	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(3-метокси-бензиламіно)-пропіл]-амід 1,2-диметил-1Н-імідазол-4-сульфоїкислоти</p>

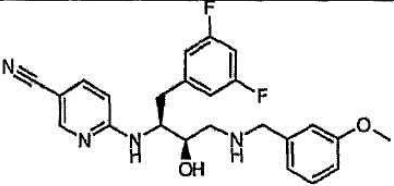
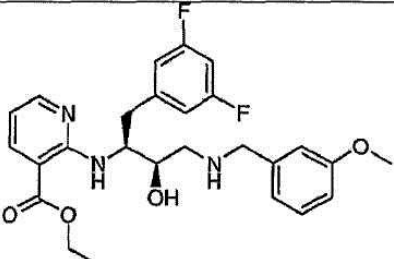
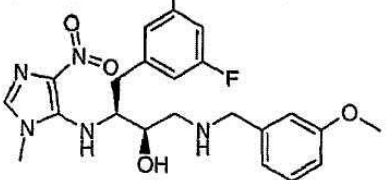
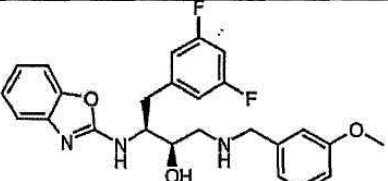
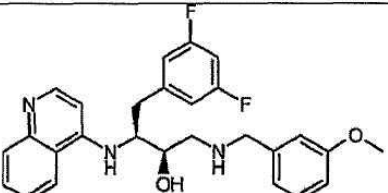
1299	 <p>N-[1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(3-метокси-бензиламіно)-пропіл]-3,4-диметокси-бензилсульфонамід</p>
1300	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(3-метокси-бензиламіно)-пропіл]-амід 2-(2,2,2-трифторацетил)-1,2,3,4-тетрагідро-ізохінолін-7-сульфокислоти</p>
1301	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(3-метокси-бензиламіно)-пропіл]-амід 5-хлор-3-метил-бензо[b]тіофен-2-сульфокислоти</p>
1302	 <p>метилловий ефір 3-{4-[1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(3-метокси-бензиламіно)-пропілсульфаміл]-феніл}-пропіонової кислоти</p>
1303	 <p>3-хлор-N-[1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(3-метокси-бензиламіно)-пропіл]-бензилсульфонамід</p>

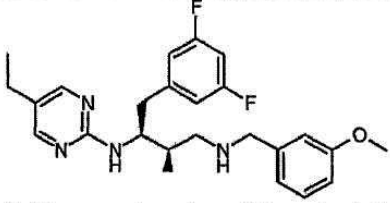

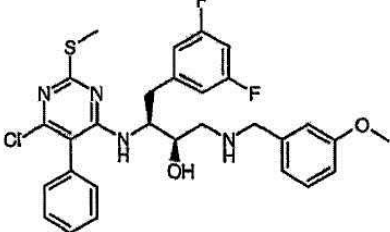
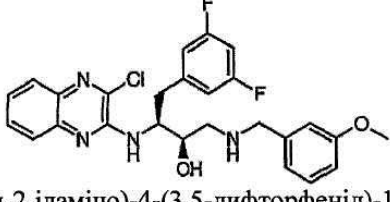
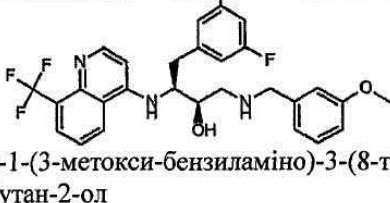
1304	 <p>3-ціано-N-[1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(3-метокси-бензиламіно)-пропіл]-бензилсульфонамід</p>
1305	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(3-метокси-бензиламіно)-пропіл]-амід бутан-1-сульфокислоти</p>
1306	 <p>N-{1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(1-метилсульфоніл-піперидин-4-іл-метил)-аміно]-пропіл}-5-метил-N',N'-дипропіл-ізофталамід</p>
1307	 <p>N-[3-бензилсульфоніламіно-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-пропіл]-5-метил-N',N'-дипропіл-ізофталамід</p>
1308	 <p>N-[1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(3-метокси-бензоїламіно)-пропіл]-5-метил-N',N'-дипропіл-ізофталамід</p>

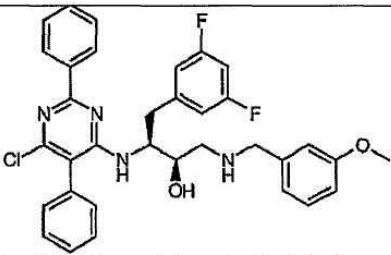
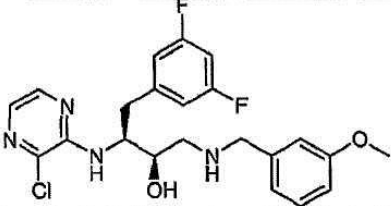
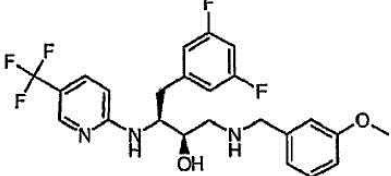
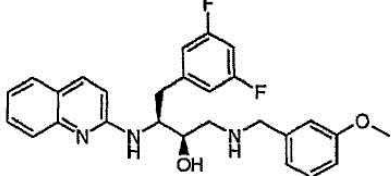
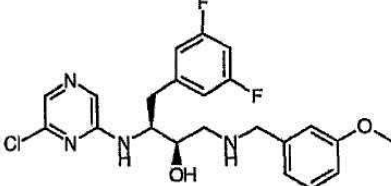
1309	 <p>4-(3,5-дифторфеніл)-3-(2,5-диметил-4-нітро-2Н-піразол-3-іламіно)-1-(3-метокси-бензиламіно)-бутан-2-ол</p>
1310	 <p>3-(2-Аміно-7Н-пурин-6-іламіно)-4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метокси-бензиламіно)-бутан-2-ол</p>
1311	 <p>3-(4-хлор-піримідин-2-іламіно)-4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метокси-бензиламіно)-бутан-2-ол</p>
1312	 <p>3-(2-Аміно-6-метил-піримідин-4-іламіно)-4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метокси-бензиламіно)-бутан-2-ол</p>
1313	 <p>3-(2-хлор-6-метил-піримідин-4-іламіно)-4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метокси-бензиламіно)-бутан-2-ол</p>

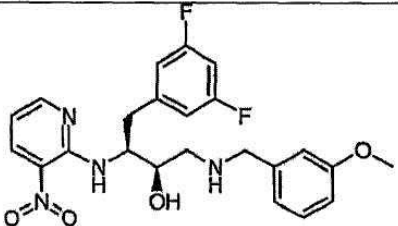
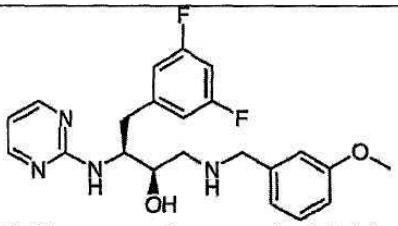
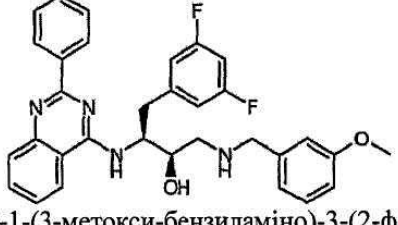
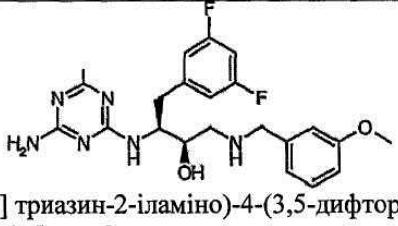
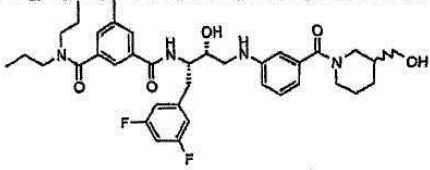
1314	 <p>3-(2-Аміно-6-хлор-піримідин-4-іламіно)-4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метокси-бензиламіно)-бутан-2-ол</p>
1315	 <p>4-(3,5-Дифторфеніл)-1-(3-метокси-бензиламіно)-3-(1-феніл-1Н-тетразол-5-іламіно)-бутан-2-ол</p>
1316	 <p>3-(2-хлор-7Н-пурин-6-іламіно)-4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метокси-бензиламіно)-бутан-2-ол</p>
1317	 <p>4-(3,5-Дифторфеніл)-1-(3-метокси-бензиламіно)-3-[9-(тетрагідропіран-2-іл)-9Н-пурин-6-іламіно]-бутан-2-ол</p>
1318	 <p>3-[1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(3-метокси-бензиламіно)-пропіламіно]-піразин-2-карбонітрил</p>

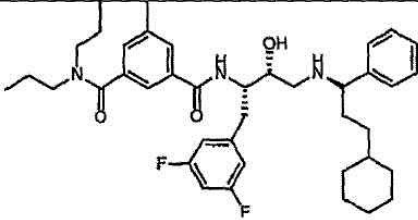
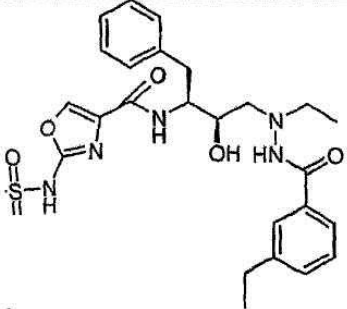
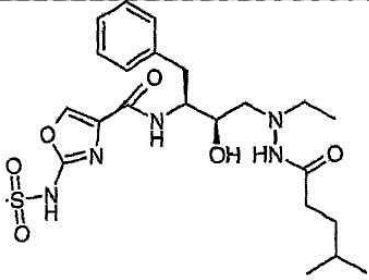
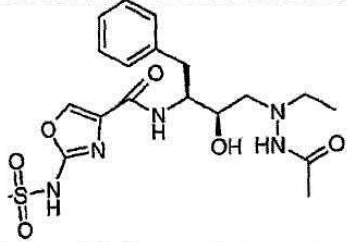
1319	 <p>4-(3,5-дифторфеніл)-3-(4,6-диметокси-[1,3,5]триазин-2-іламіно)-1-(3-метокси-бензиламіно)-бутан-2-ол</p>
1320	 <p>2-[1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(3-метокси-бензиламіно)-пропіламіно]-нікотиннітрил</p>
1321	 <p>4-(3,5-Дифторфеніл)-1-(3-метокси-бензиламіно)-3-(7Н-пурин-6-іламіно)-бутан-2-ол</p>
1322	 <p>3-(бензотіазол-2-іламіно)-4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метокси-бензиламіно)-бутан-2-ол</p>
1323	 <p>4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метокси-бензиламіно)-3-(2-феніл-хінолін-4-іламіно)-бутан-2-ол</p>

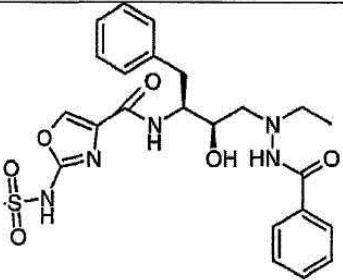
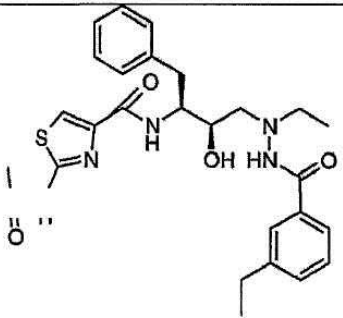
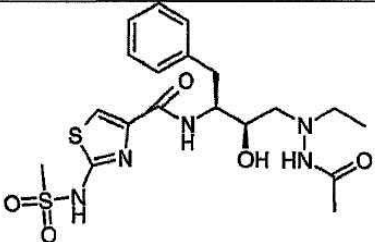
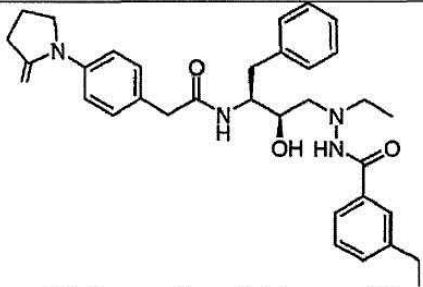
1324	 <p>6-[1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(3-метокси-бензиламіно)-пропіламіно]-нікотиннітрил</p>
1325	 <p>Етиловий ефір 2-[1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(3-метокси-бензиламіно)-пропіламіно]-нікотинової кислоти</p>
1326	 <p>4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метокси-бензиламіно)-3-(3-метил-5-нітро-3Н-імідазол-4-іл аміно)-бутан-2-ол</p>
1327	 <p>3-(бензооксазол-2-іламіно)-4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метокси-бензиламіно)-бутан-2-ол</p>
1328	 <p>4-(3,5-Дифторфеніл)-1-(3-метокси-бензиламіно)-3-(хінолін-4-іламіно)-бутан-2-ол</p>

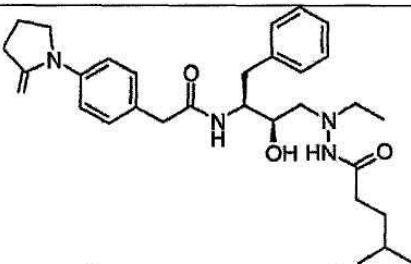
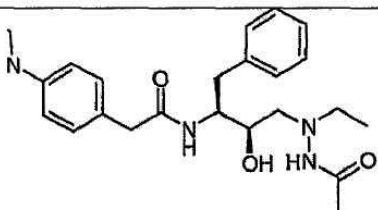
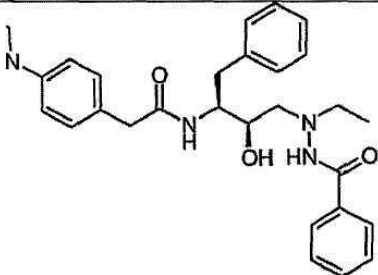
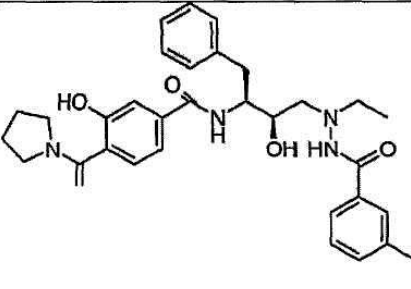
1329	 <p>4-(3,5-дифторфеніл)-3-(5-етил-піримідин-2-іламіно)-1-(3-метокси-бензиламіно)-бутан-2-ол</p>
1330	 <p>4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метокси-бензиламіно)-3-(4-трифторметил-піримідин-2-іламіно)-бутан-2-ол</p>
1331	 <p>3-(6-хлор-2-метилсульфоніл-5-феніл-піримідин-4-іламіно)-4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метокси-бензиламіно)-бутан-2-ол</p>
1332	 <p>3-(3-хлор-хіноксалін-2-іламіно)-4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метокси-бензиламіно)-бутан-2-ол</p>
1333	 <p>4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метокси-бензиламіно)-3-(8-трифторметил-хінолін-4-іламіно)-бутан-2-ол</p>

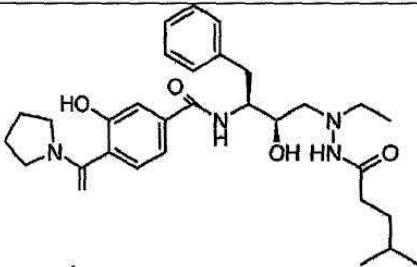
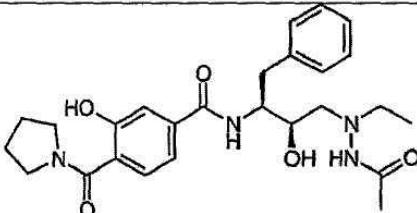
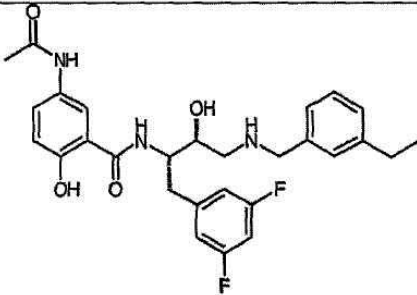
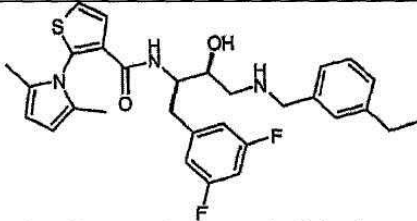
1334	 <p>3-(6-хлор-2,5-дифеніл-піримідин-4-іламіно)-4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метокси-бензиламіно)-бутан-2-ол</p>
1335	 <p>3-(3-хлор-піразин-2-іламіно)-4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метокси-бензиламіно)-бутан-2-ол</p>
1336	 <p>4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метокси-бензиламіно)-3-(5-трифторметил-піридин-2-іламіно)-бутан-2-ол</p>
1337	 <p>4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метокси-бензиламіно)-3-(хінолін-2-іламіно)-бутан-2-ол</p>
1338	 <p>3-(6-хлорпіразин-2-іламіно)-4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метокси-бензиламіно)-бутан-2-ол</p>

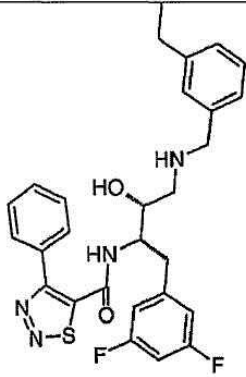
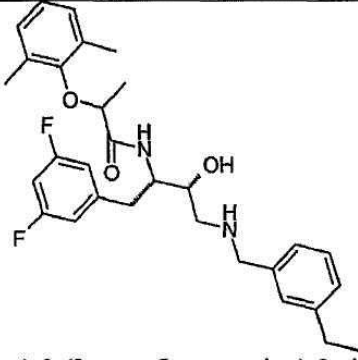
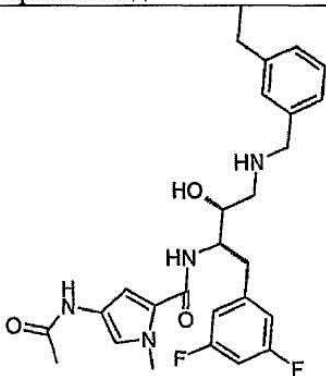
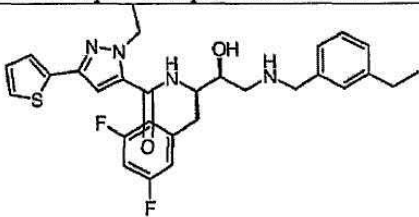
1339	 <p>4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метокси-бензиламіно)-3-(3-нітро-піридин-2-іламіно)бутан-2-ол</p>
1340	 <p>4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метокси-бензиламіно)-3-(піримідин-2-іламіно)-бутан-2-ол</p>
1341	 <p>4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метокси-бензиламіно)-3-(2-феніл-хіназолін-4-іламіно)-бутан-2-ол</p>
1342	 <p>3-(4,6-діаміно-[1,3,5] триазин-2-іламіно)-4-(3,5-дифторфеніл)-1-(3-метокси-бензиламіно)-бутан-2-ол</p>
1343	 <p>N-{1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[3-(3-гідроксиметил-піперидин-1-карбо)-феніламіно]-пропіл}-5-метил-N',N'-дипропіл-ізофталамід</p>

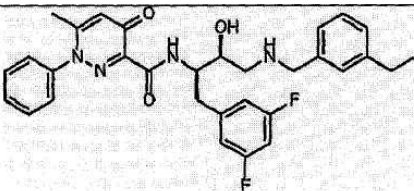
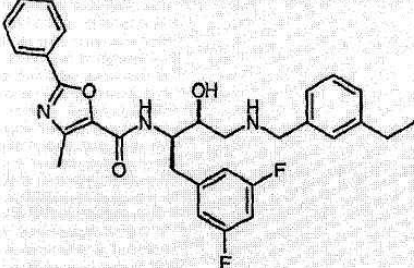
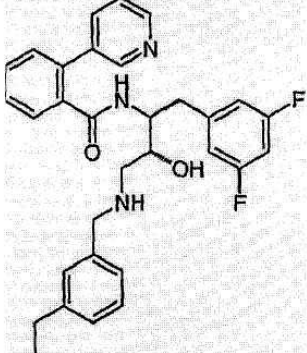
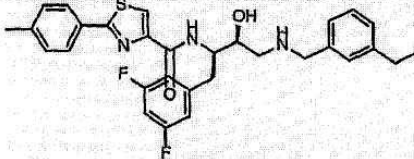
1344	 <p>N-[3-(3-циклогексил-1-феніл-пропіламіно)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-пропіл]-5-метил-N',N'-дипропіл-ізофталамід</p>
1345	 <p>{1-бензил-3-[N-етил-N'-(3-етил-бензол)-гідразин]-2-гідрокси-пропіл}-амід 2-метилсульфоніламіно-оксазол-4-карбоксикислоти</p>
1346	 <p>{1-бензил-3-[N-етил-N'-(4-метил-пентаніл)-гідразин]-2-гідрокси-пропіл}-амід 2-метилсульфоніламіно-оксазол-4-карбоксикислоти</p>
1347	 <p>[3-(N'-ацетил-N-етилгідразин)-1-бензил-2-гідрокси-пропіл]-амід 2-метилсульфоніламіно-оксазол-4-карбоксикислоти</p>

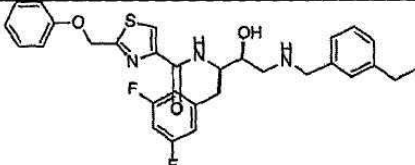
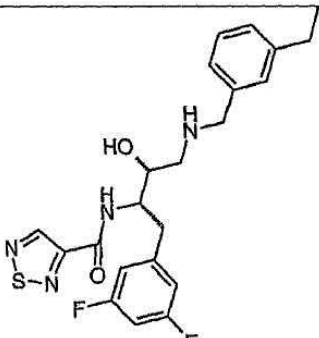
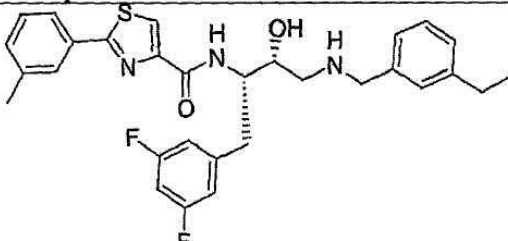
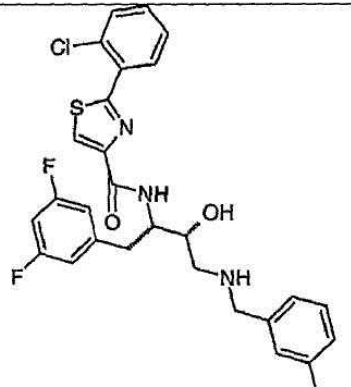
1348	 <p>[3-(N'-бензоїл-N-етилгідразин)-1-бензил-2-гідрокси-пропіл]-амід 2-метилсульфоніламіно-оксазол-4-карбоксикислоти</p>
1349	 <p>{1-бензил-3-[N-етил-N'-(3-етилбензол)гідразин]-2-гідрокси-пропіл}-амід 2-метилсульфоніламіно-тіазол-4-карбоксикислоти</p>
1350	 <p>[3-(N'-ацетил-N-етилгідразин)-1-бензил-2-гідрокси-пропіл]-амід 2-метилсульфоніламіно-тіазол-4-карбоксикислоти</p>
1351	 <p>N-{1-бензил-3-[N-етил-N'-(3-етил-бензоїл)гідразин]-2-гідрокси-пропіл}-2-[4-(2-оксо-піролідин-1-іл)-феніл]-ацетамід</p>

1352	 <p>N-{1-бензил-3-[N-етил-N'-(4-метил-пентаноїл)-гїдразин]-2-гїдрокси-пропіл}-2-[4-(2-оксо-піролідин-1-іл)-феніл]-ацетамід</p>
1353	 <p>N-[3-(N'-ацетил-N-етил-гїдразин)-1-бензил-2-гїдрокси-пропіл]-2-[4-(2-оксо-піролідин-1-іл)-феніл]-ацетамід</p>
1354	 <p>N-[3-(N'-бензоїл-N-етил-гїдразин)-1-бензил-2-гїдрокси-пропіл]-2-[4-(2-оксо-піролідин-1-іл)-феніл]-ацетамід</p>
1355	 <p>N-{1-бензил-3-[N-етил-N'-(3-етил-бензоїл)-гїдразин]-2-гїдрокси-пропіл}-3-гїдрокси-4-(піролідин-1-карбо)-бензамід</p>

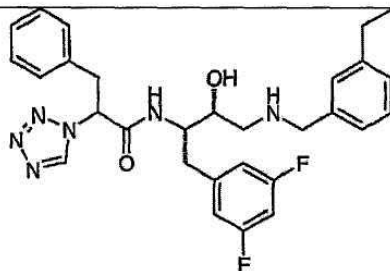
1356	 <p>N-{1-бензил-3-[N-етил-N¹-(4-метил-пентаніл)гидразин]-2-гідрокси-пропіл}-3-гідрокси-4-(піролідин-1-карбо)-бензамід</p>
1341	 <p>N-[3-(N'-ацетил-N-етил-гидразин)-1-бензил-2-гідрокси-пропіл]-3-гідрокси-4-(піролідин-1-карбо)-бензамід</p>
1342	 <p>5-ацетиламіно-N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-2-гідрокси-бензамід</p>
1343	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід 2-(2,5-диметил-пірол-1-іл)-тіофен-3-карбоксикислоти</p>

1344	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід 4-феніл-[1,2,3]тіадіазол-5-карбоксикислоти</p>
1345	 <p>N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-2-(2,6-диметил-фенокси)-пропіонамід</p>
1346	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід 4-ацетиламіно-1-метил-1Н-пірол-2-карбоксикислоти</p>
1347	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід 2-етил-5-тіофен-2-іл-2Н-піразол-3-карбоксикислоти</p>

1348	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід 6-метил-4-оксо-1-феніл-1,4-дигідро-піридазин-3-карбоксикислоти</p>
1349	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід 4-метил-2-феніл-оксазол-5-карбоксикислоти</p>
1350	 <p>N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-2-піридин-3-іл-бензамід</p>
1351	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід 2-р-толіл-тіазол-4-карбоксикислоти</p>

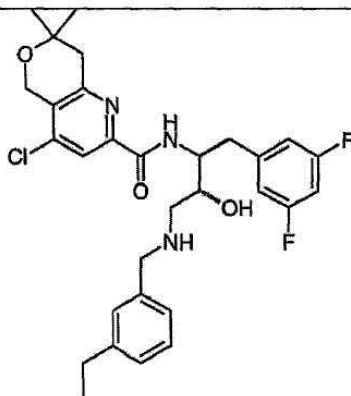
1352	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід 2-феноксиметил-тіазол-4-карбоксикислоти</p>
1353	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід [1,2,5]-тіадіазол-3-карбоксикислоти</p>
1354	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід 2-м-толіл-тіазол-4-карбоксикислоти</p>
1355	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід 2-(2-хлорфеніл)-тіазол-4-карбоксикислоти</p>

1356



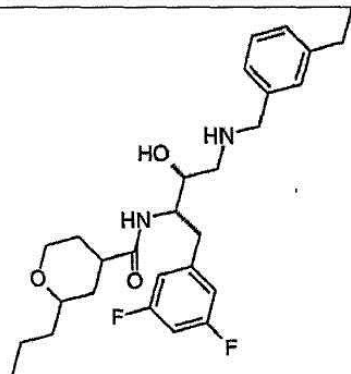
N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-3-феніл-2-тетразол-1-іл-пропіонамід

1357



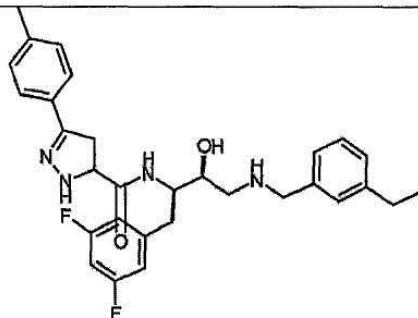
[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід 4-хлор-7,7-диметил-7,8-дигідро-5Н-пірано[4,3-*b*]піридин-2-карбоксикислоти

1358



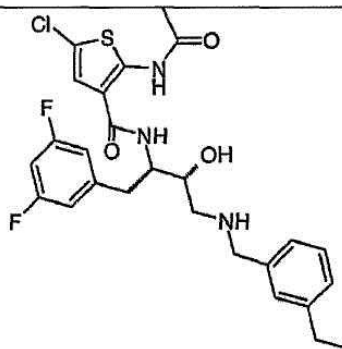
[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід 2-пропіл-тетрагідро-піран-4-карбоксикислоти

1359



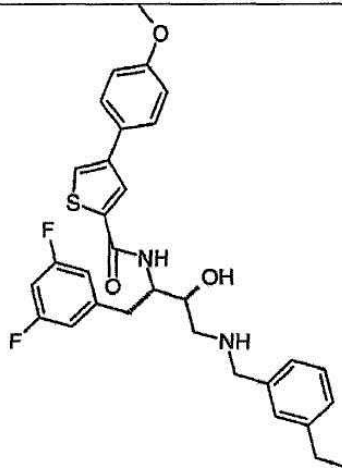
[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід 5-р-толіл-3,4-дигідро-2Н-піразол-3-карбоксикислоти

1360

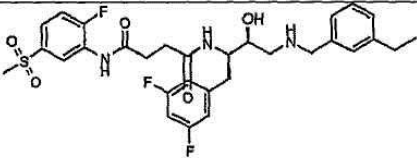

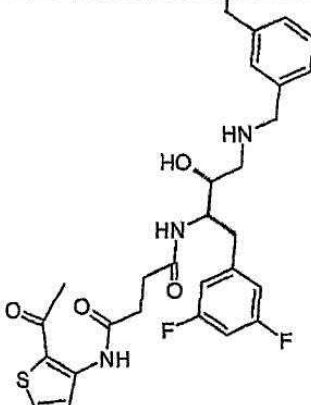


[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід 2-ацетиламіно-5-хлор-тіофен-3-карбоксикислоти

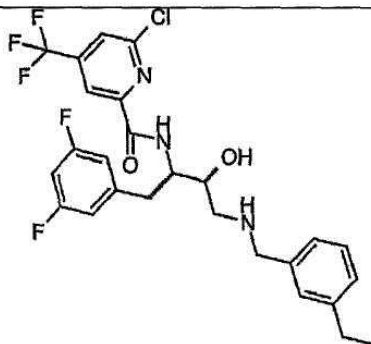
1361



[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід 4-(4-метокси-феніл)-тіофен-2-карбоксикислоти

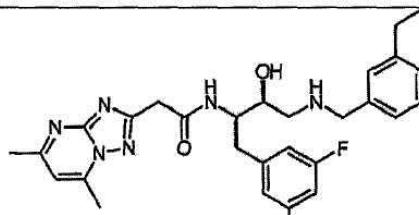
1362	 <p>N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-N'-(2-фтор-5-метилсульфоніл-феніл)-сукцинамід</p>
1363	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід 1-(4-фторфеніл)-5-метил-1H-[1,2,4]триазол-3-карбоксикислоти</p>
1364	 <p>N-(2-ацетил-тіофен-3-іл)-N'-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-сукцинамід</p>

1365



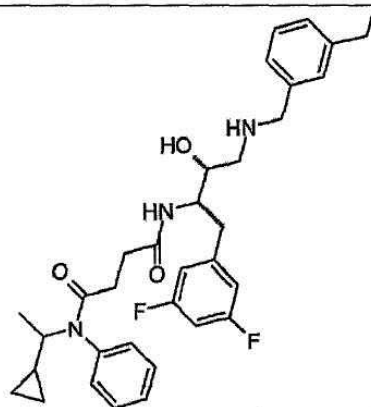
[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід 6-хлор-4-трифторметил-піридин-2-карбоксикислоти

1366

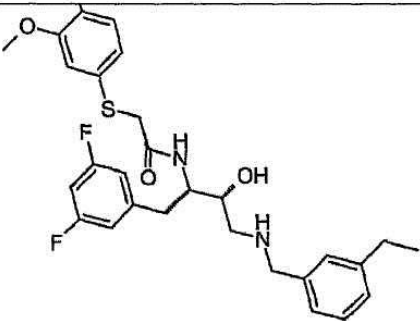
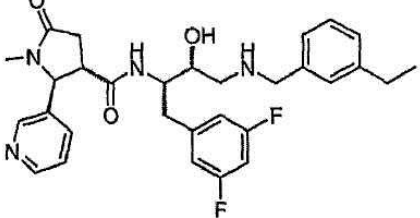
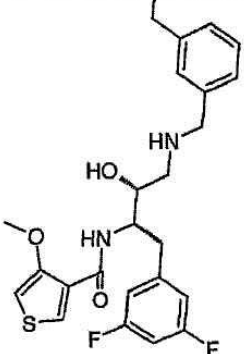
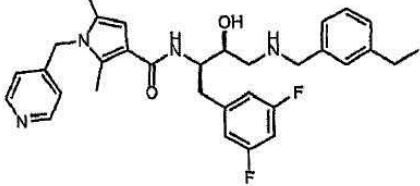


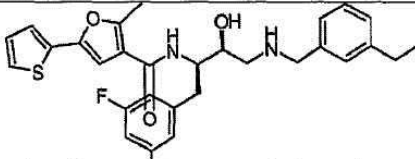
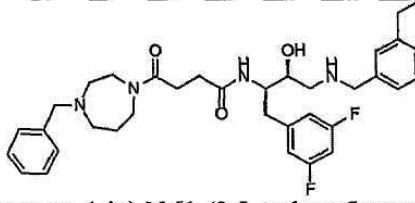
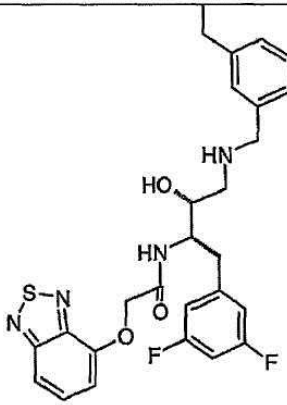
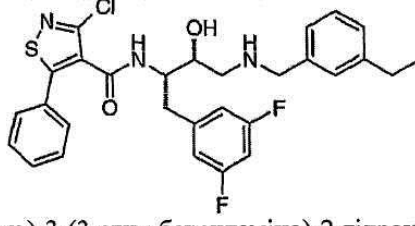
N-[1-{3,5-дифторбензил}-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-2-(5,7-диметил-[1,2,4]триазол-[1,5-а]піримідин-2-іл)-ацетамід

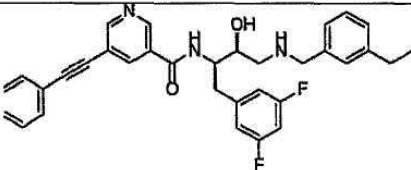
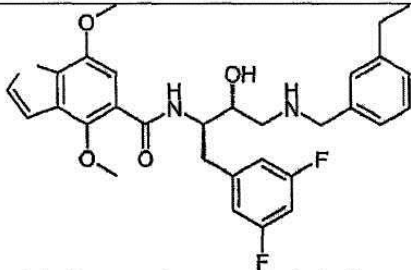
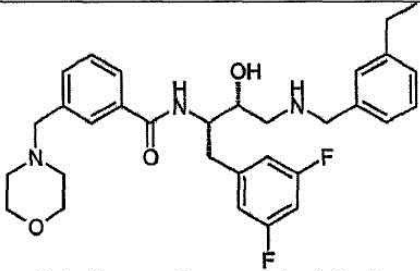
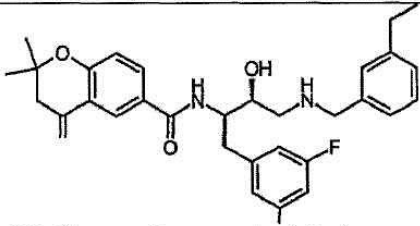
1367

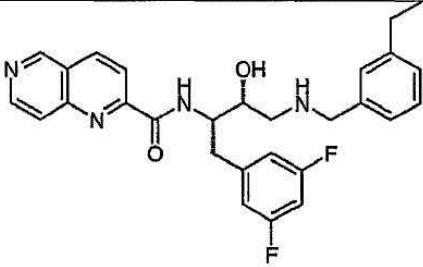
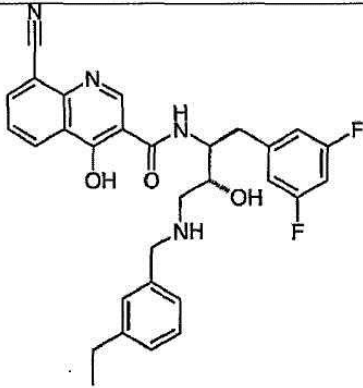
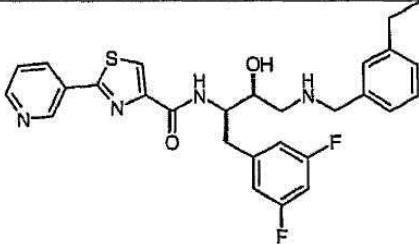
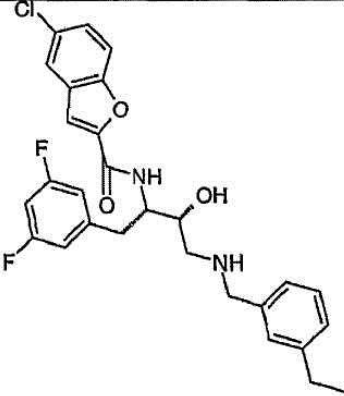


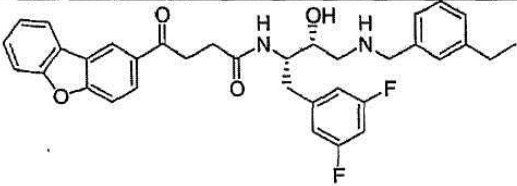
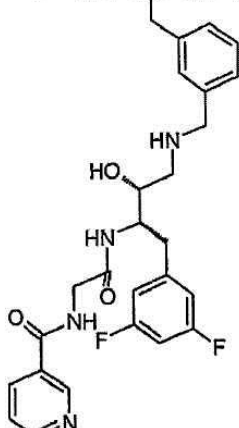
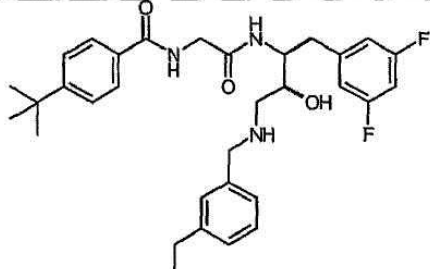
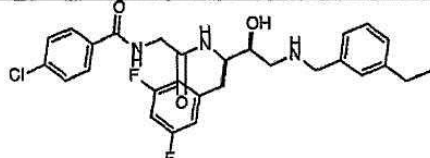
N-(1-циклопропіл-етил)-N'-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-N-феніл-сукцинамід

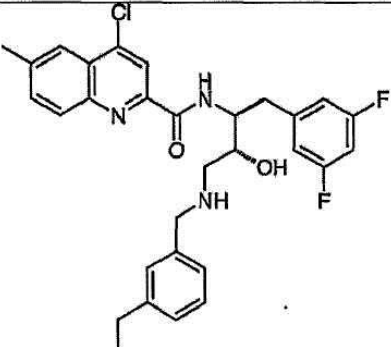
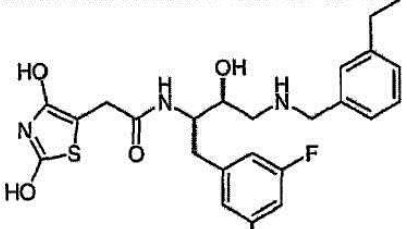
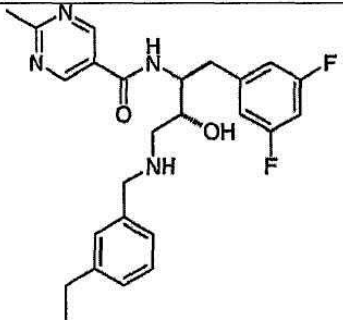
1368	 <p>N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-2-(3,4-диметокси-фенілсульфоніл)-ацетамід</p>
1369	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід 1-метил-5-оксо-2-піридин-3-іл-піролідін-3-карбоксикислоти</p>
1370	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід 4-метокси-тіофен-3-карбоксикислоти</p>
1371	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід 2,5-диметил-1-піридин-4-ілметил-1Н-пірол-3-карбоксикислоти</p>

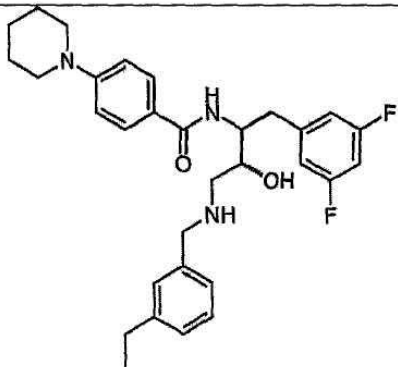
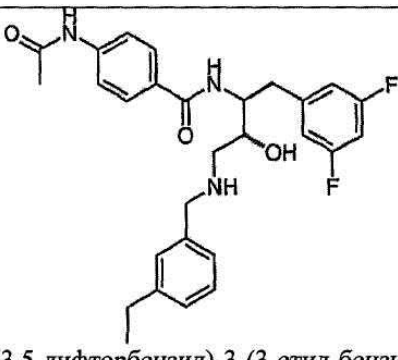
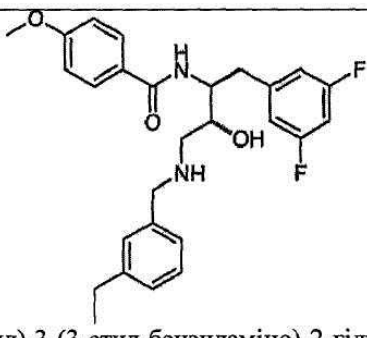
1372	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід 2-метил-5-тіофен-2-іл-фуран-3-карбоксикислоти</p>
1373	 <p>4-(4-бензил-[1,4] діазепан-1-іл)-N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-4-оксо-бутирамід</p>
1374	 <p>2-(бензо-[1,2,5]тіадіазол-4-ілокси)-N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-ацетамід</p>
1375	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід 3-хлор-5-феніл-ізотіазол-4-карбоксикислоти</p>

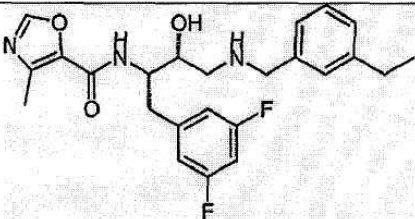
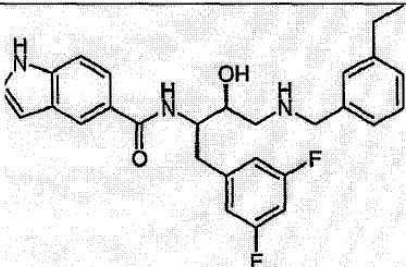
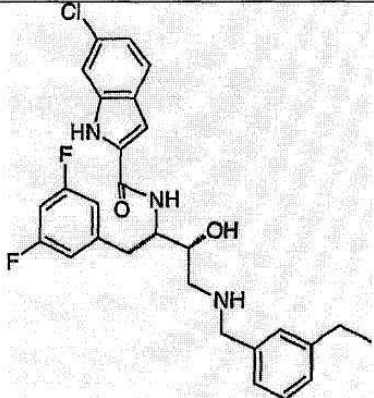
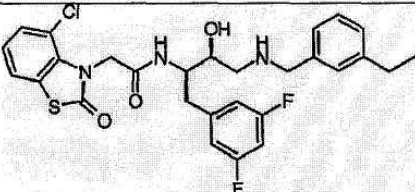
1376	 <p>N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-5-фенілетиніл-нікотинамід</p>
1377	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід 4,7-диметокси-бензофуран-5-карбоксикислоти</p>
1378	 <p>N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-3-морфолін-4-ілметил-бензамід</p>
1379	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід 2,2-диметил-4-оксо-хроман-6-карбоксикислоти</p>

1380	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід [1,6]нафтиридин-2-карбоксикислоти</p>
1381	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід 8- ціано-4-гідрокси-хінолін-3-карбоксикислоти</p>
1382	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід 2- піридин-3-іл-тіазол-4-карбоксикислоти</p>
1383	 <p>5-хлор-бензофуран-2-карбоксикислоти [1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-</p>

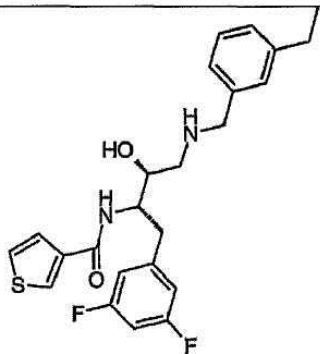
	бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід
1384	 <p>4-дибензофуран-2-іл-N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-4-оксо-бутирамід</p>
1385	 <p>N-{[1-[3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропілкарбаміл]-метил}нікотинамід</p>
1386	 <p>4-трет-бутил-N-{[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропілкарбаміл]-метил}-бензамід</p>
1387	 <p>4-хлор-N-{[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропілкарбаміл]-метил}-бензамід</p>

1388	 <p>4-хлор-6-метил-хінолін-2-карбоксикислоти[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід</p>
1389	 <p>N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-2-(2,4-дигідрокси-тіазол-5-іл)-ацетамід</p>
1390	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід 2-метил-піримідин-5-карбоксикислоти</p>

1391	 <p data-bbox="451 600 1276 667">N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-4-піперидин-1-іл-бензамід</p>
1392	 <p data-bbox="451 1120 1332 1187">4-ацетиламіно-N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-бензамід</p>
1393	 <p data-bbox="451 1568 1276 1635">N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-4-метокси-бензамід</p>

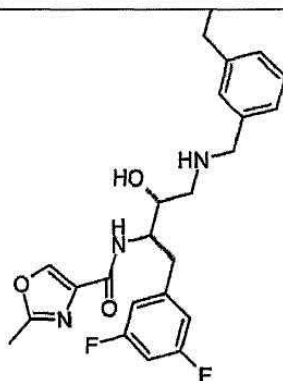
1394	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід 4-метил-оксазол-5-карбоксикислоти</p>
1395	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід 1H-індол-5-карбоксикислоти</p>
1396	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід 6-хлор-1H-індол-2-карбоксикислоти</p>
1397	 <p>2-(4-хлор-2-оксо-бензотіазол-3-іл)-N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-ацетамід</p>

1398



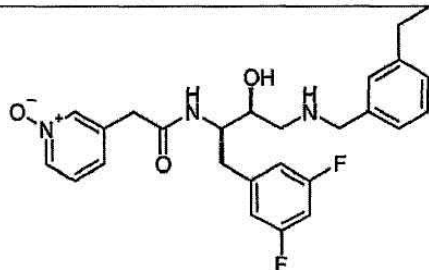
[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід
тіофен-3-карбоксикислоти

1399

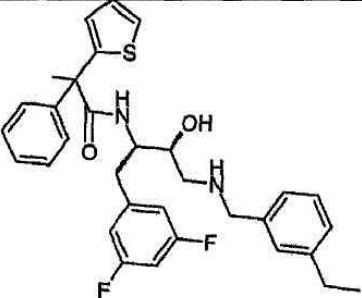
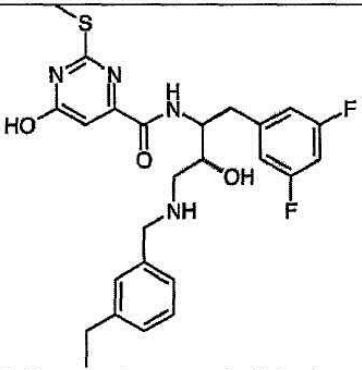
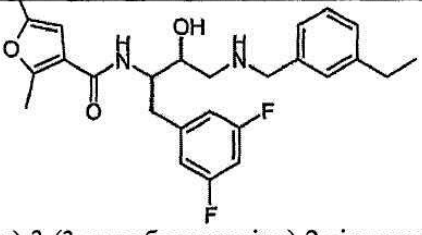


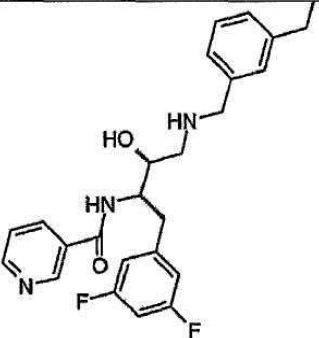
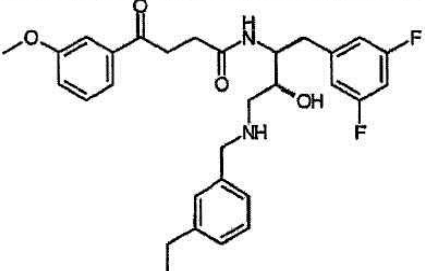
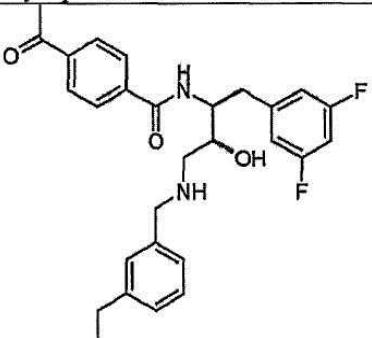
[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід 2-
метил-оксазол-4-карбоксикислоти

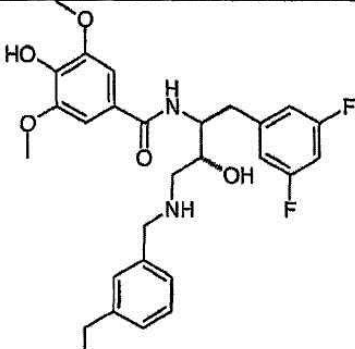
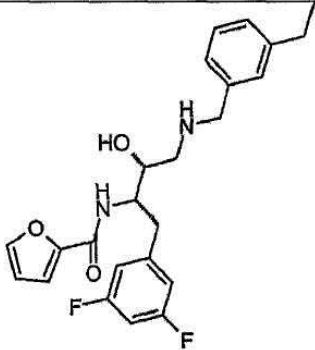
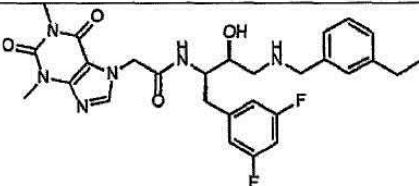
1400

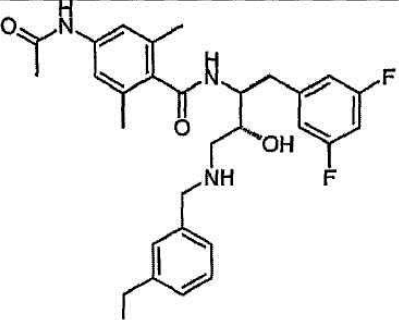
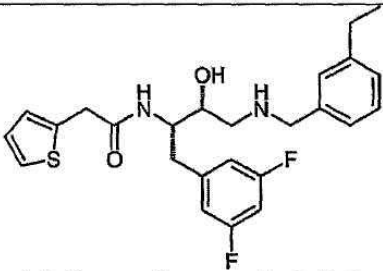
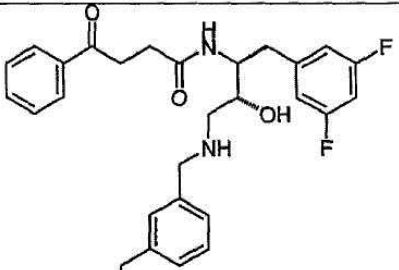
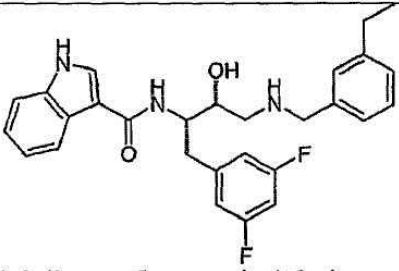


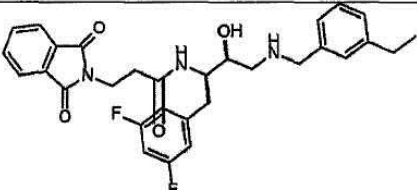
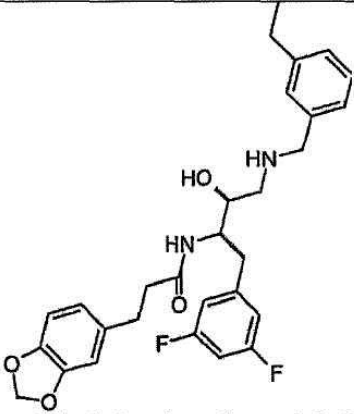
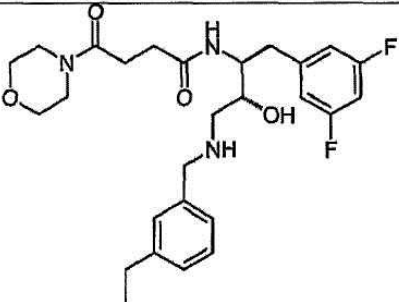
N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-2-(1-
окси-піридин-3-іл)-ацетамід

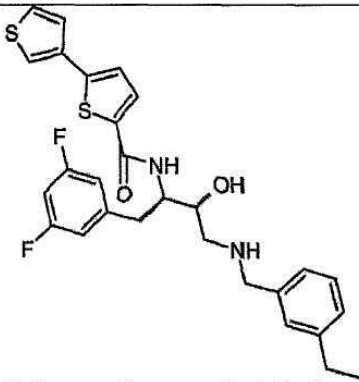
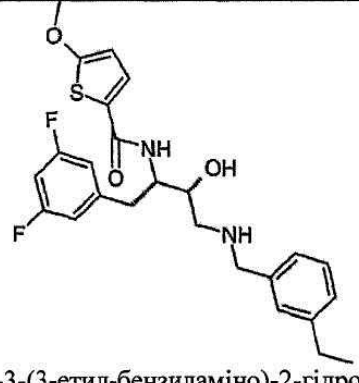

1401	 <p>N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-2-гідрокси-2-феніл-2-тіофен-2-іл-ацетамід</p>
1402	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід 6-гідрокси-2-метилсульфоніл-піримідин-4-карбоксикислоти</p>
1403	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід 2,5-диметил-фуран-3-карбоксикислоти</p>

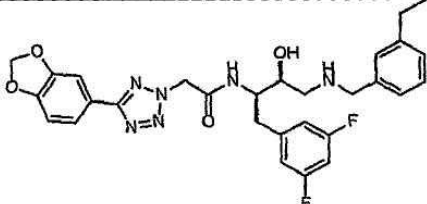
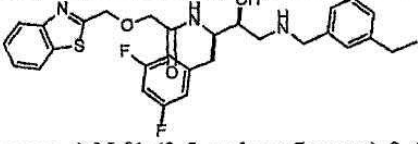
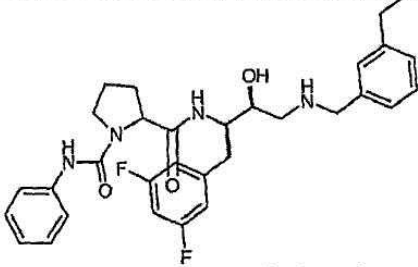
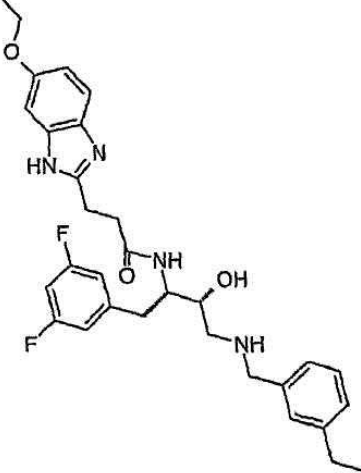
1404	 <p>N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-нікотинамід</p>
1405	 <p>N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-4-(3-метокси-феніл)-4-оксо-бутирамід</p>
1406	 <p>4-ацетил-N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-бензамід</p>

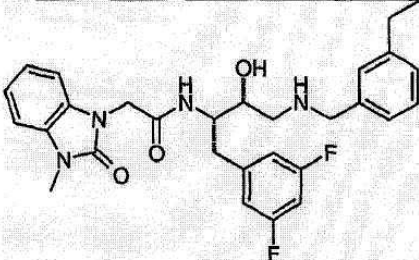
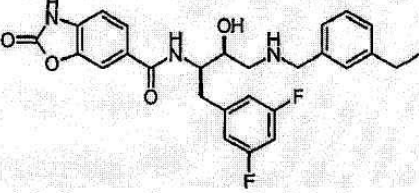
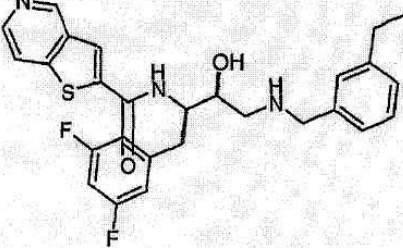
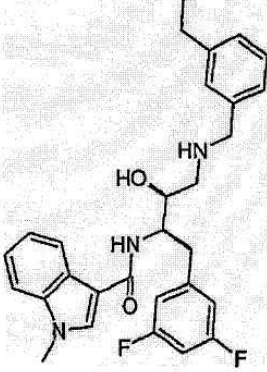
1407	 <p>N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-4-гідрокси-3,5-диметокси-бензамід</p>
1408	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід фуран-2-карбоксикислоти</p>
1409	 <p>N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-2-(1,3-диметил-2,6-діоксо-1,2,3,6-тетрагідро-пурин-7-іл)-ацетамід</p>

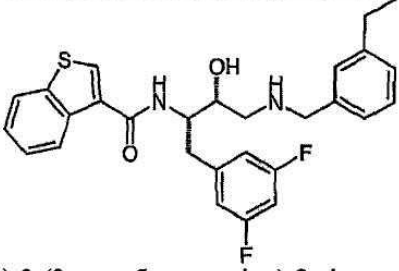
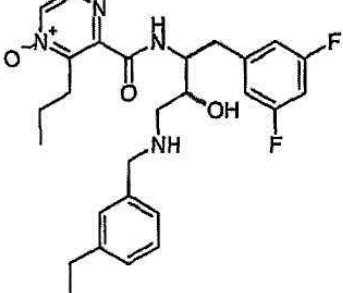
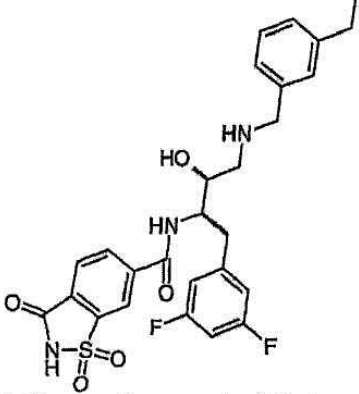
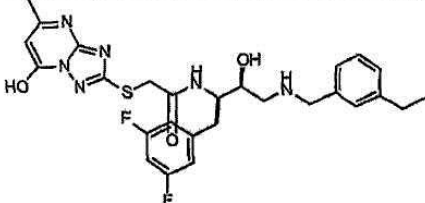
1410	 <p>4-ацетиламіно-N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-2,6-диметил-бензамід</p>
1411	 <p>N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-2-тіофен-2-іл-ацетамід</p>
1412	 <p>N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-4-оксо-4-феніл-бутирамід</p>
1413	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід 1H-Індол-3-карбоксикислоти</p>

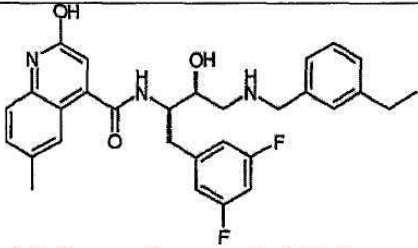
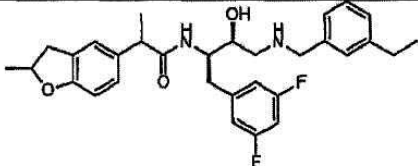
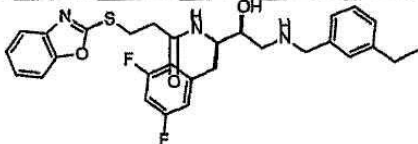
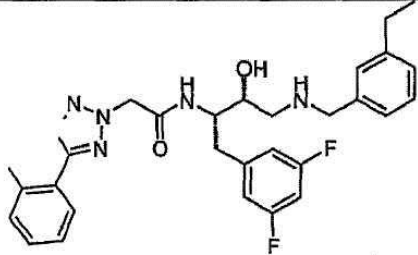
1414	 <p>N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-3-(1,3-діоксо-1,3-дигідро-ізоіндол-2-іл)-пропіонамід</p>
1415	 <p>3-бензо[1,3]діоксол-5-іл-N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-пропіонамід</p>
1416	 <p>N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-4-морфолін-4-іл-4-оксо-бутирамід</p>

1417	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід [2,3']бітіофеніл-5-карбоксикислоти</p>
1418	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід 5-метокси-тіофен-2-карбоксикислоти</p>
1419	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід 4-феніл-тіофен-2-карбоксикислоти</p>

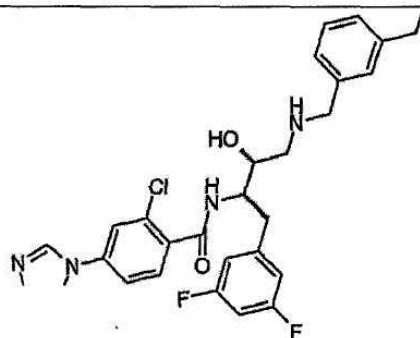
1420	 <p>2-(5-бензо[1,3]діоксол-5-іл-тетразол-2-іл)-N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-ацетамід</p>
1421	 <p>2-(бензотіазол-2-ілметокси)-N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-ацетамід</p>
1422	 <p>{[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід} 2-феніламід піролідин-1,2-дикарбоксикислоти</p>
1423	 <p>N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-3-(6-етокси-1H-бензоімідазол-2-іл)-пропіонамід</p>

1424	 <p>N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-2-(3-метил-2-оксо-2,3-дигідро-бензоімідазол-1-іл)-ацетамід</p>
1425	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід 2-оксо-2,3-дигідро-бензооксазол-6-карбоксикислоти</p>
1426	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід тієно-[3,2-с]піридин-2-карбоксикислоти</p>
1427	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід 1-метил-1Н-індол-3-карбоксикислоти</p>

1428	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід бензо[<i>b</i>]тіофен-3-карбоксикислоти</p>
1429	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід 4-окси-3-пропілпіразин-2-карбоксикислоти</p>
1430	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід 1,1,3-триоксо-2,3-дигідро-1Н-116-бензо[<i>d</i>]ізотіазол-6-карбоксикислоти</p>
1431	 <p>N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-2-(7-гідрокси-5-метил-[1,2,4]тріазоло-[1,5-а]піримідин-2-ілсульфоніл)-ацетамід</p>

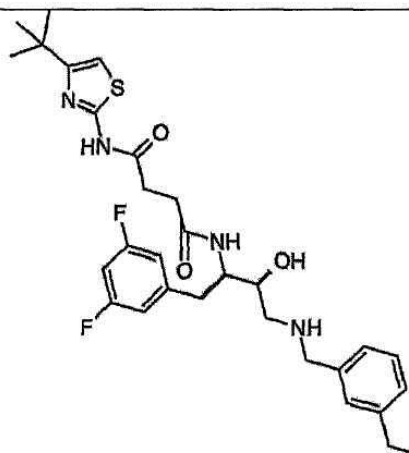
1432	 <p>[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-амід 2-гідрокси-6-метил-хінолін-4-карбоксикислоти</p>
1433	 <p>N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-2-(2-метил-2,3-дигідро-бензофуран-5-іл)-пропіонамід</p>
1434	 <p>3-(бензооксазол-2-ілсульфоніл)-N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-пропіонамід</p>
1435	 <p>N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-2-(5-о-толіл-тетразол-2-іл)-ацетамід</p>

1436



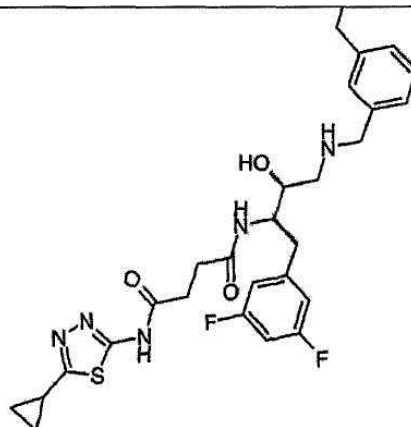
2-хлор-N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-4-тетразол-1-іл-бензамід

1437

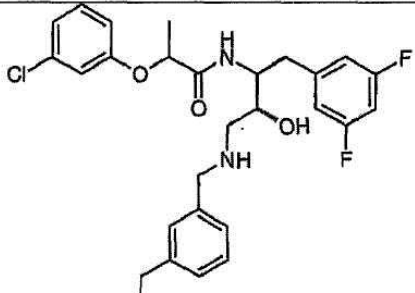
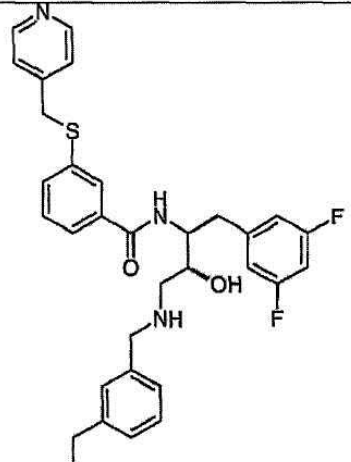


N-(4-трет-бутил-тіазол-2-іл)-N'-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-сукцинамід

1438



N-(5-циклопропіл-[1,3,4]тіадіазол-2-іл)-N'-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-сукцинамід

1439	 <p>2-(3-хлор-фенокси)-N-[1-(3,5-дифторбензил)3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-пропіонамід</p>
1440	 <p>N-[1-(3,5-дифторбензил)-3-(3-етил-бензиламіно)-2-гідрокси-пропіл]-3-(піридин-4-ілметилсульфоніл)-бензамід</p>

WO 03/040096 278 PCT/US/36072

Сполуки в наступній Таблиці були одержані з використанням способів, описаних вище і проілюстрованих далі на схемах.

Наступні сполуки були названі з використан-

ням програми номенклатур Advanced Chemistry Development Inc. (ACD), версії IUPAC Name Batch Version 4.5. ACD можна знайти на сайті www.acdlabs.com.

	Назва сполуки (номенклатура IUPAC)
1441	N ¹ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-5-{[(2-гідроксіетил)аміно]сульфоніл}-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1442	N ¹ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-{[(2-ізобутил-1,3-тіазол-5-іл)метил]аміно}пропіл}-5-етиніл-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1443	N ¹ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-ізопропілбензил)аміно]пропіл}-5-етиніл-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1444	N ¹ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-ізопропілбензил)аміно]пропіл}-5-(1,3-оксазол-2-іл)-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1445	N ¹ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-5-{[(2-гідрокси-1,1-диметилетил)аміно]сульфоніл}-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1446	N ¹ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-5-(4-метил-1,3-оксазол-2-іл)-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1447	N ¹ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-{[(2-ізобутил-1,3-тіазол-5-іл)метил]аміно}пропіл}-5-(1,3-оксазол-2-іл)-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1448	N ¹ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-5-{[(3-гідроксипропіл)аміно]сульфоніл}-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1449	N ¹ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-пропілбензил)аміно]пропіл}-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1451	N ¹ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етинілбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-5-етиніл-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1452	N ¹ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-{[(3-ізобутилізоксазол-5-іл)метил]аміно}пропіл}-5-етиніл-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1453	N ¹ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-5-[(диметиламіно)сульфоніл]-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1454	N ¹ -(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-5-(1,3-оксазол-2-іл)-N ³ ,N ³ -дипропілізофталаміду хлоргідрат
1455	N ¹ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-{[3-(5-формілгієн-2-іл)бензил]аміно}-2-гідроксипропіл}-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід

1456	5-бром-N ¹ -(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-йодбензил)аміно]пропіл}-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1457	N ¹ -(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-5-([1R]-2-гідрокси-1-метилетил)аміно)сульфоніл)-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1458	N ¹ -(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-ізобутилбензил)аміно]пропіл}-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1459	N ¹ -(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-{[3-(трифторметил)бензил]аміно}пропіл}-5-етиніл-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1460	N ¹ -(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-3-{[(2R)-2-(метоксиметил)піролідін-1-іл]карбоніл}-5-метилбензаміду хлоргідрат
1461	N ¹ -(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-5-([1S]-2-гідрокси-1-метилетил)аміно)сульфоніл)-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1462	N ¹ -бутил-N ³ -(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-5-метил-N ¹ -пропілізофталамід
1463	N ¹ ,N ¹ -дибутил-N ³ -(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-5-метилізофталамід
1464	N ¹ -(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-{[3-(3-гідроксипроп-1-ініл)бензил]аміно}пропіл}-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1465	N ¹ -(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-5-[(2S)-2-(гідроксиметил)піролідін-1-іл]сульфоніл)-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1467	N ¹ -(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етинілбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-5-(1,3-оксазол-2-іл)-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1469	N ¹ -(1S,2R)-3-{[3-(циклопропіламіно)бензил]аміно}-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл}-5-етиніл-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1470	N ¹ -(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-тієн-3-ілбензил)аміно]пропіл}-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1471	N ¹ -(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-{[3-(трифторметил)бензил]аміно}пропіл}-5-(1,3-оксазол-2-іл)-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1472	N ¹ -(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-5-(піперазин-1-ілсульфоніл)-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1473	N ¹ -(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-{[1-(3-йодфеніл)циклопропіл]аміно}пропіл}-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1474	N ¹ -(1S,2R)-3-[(3-втор-бутилбензил)аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл}-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1475	N ¹ -(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-5-(3-метилізоксазол-4-іл)-N ³ ,N ³ -дипропілізофталаміду хлоргідрат
1476	N ¹ -(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-{[1-(3-ізобутилізоксазол-5-іл)циклопропіл]аміно}пропіл}-5-(1,3-оксазол-2-іл)-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід

1477	N ¹ -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-{[1-(3-етилфеніл)циклопропіл]аміно}-2-гідроксипропіл)-5-(1,3-оксазол-2-іл)-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1478	N ⁴ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-6-метил-N ² ,N ² -дипропілпіридин-2,4-дикарбоксамід
1480	N ¹ -(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл}-5-(1,3-оксазол-2-іл)-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1481	N ¹ -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-{[1-(3-етинілфеніл)циклопропіл]аміно}-2-гідроксипропіл)-5-(1,3-оксазол-2-іл)-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1482	5-(аміносульфоніл)-N ¹ -1(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1483	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-({3-[(1Z)-проп-1-еніл]бензил}аміно)пропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1484	N ¹ -(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-N ³ ,N ³ -дипропіл-5-(1H-піразол-4-іл)ізофталамід
1485	N ¹ -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-{[1-(3-етилфеніл)-1-метилетил]аміно}-2-гідроксипропіл)-5-етиніл-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1487	N ¹ -(1S,2R)-3-[(3-алілбензил)аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1488	N ¹ -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-{[1-(3-етилфеніл)циклопропіл]аміно}-2-гідроксипропіл)-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1489	N ¹ -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-{[1-(3-етилфеніл)-1-метилетил]аміно}-2-гідроксипропіл)-5-(1,3-оксазол-2-іл)-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1490	N ¹ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-N ³ -етил-5-метил-N ³ -пропілізофталамід
1491	N ¹ -[(1S,2R)-3-{[3-(циклопропіламіно)бензил]аміно}-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1492	N ¹ -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-{[1-(3-етинілфеніл)циклопропіл]аміно}-2-гідроксипропіл)-5-етиніл-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1493	N ¹ -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-{[1-(3-ізобутилізоксазол-5-іл)циклопропіл]аміно}пропіл)-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1494	N ¹ -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-{[3-(5-форміл-4-метилтієн-2-іл)бензил]аміно}-2-гідроксипропіл)-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1496	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-({3-[(метилсульфоніл)аміно]бензил}аміно)пропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1498	N ¹ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-ізопентилбензил)аміно]пропіл}-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід

1500	N ¹ -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-{[1-(3-етинілфеніл)циклопропіл]аміно}-2-гідроксипропіл)-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1501	N ¹ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-5-({[2-(метиламіно)етил]аміно}сульфоніл)-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід дихлоргідрат
1502	N ¹ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-{[1-(3-ізобутилізоксазол-5-іл)циклопропіл]аміно}пропіл)-5-етиніл-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1504	N ¹ -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-{[1-(2-ізобутил-1,3-тіазол-5-іл)циклопропіл]аміно}пропіл)-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1505	N ¹ -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-{[1-(3-етилфеніл)-1-метилетил]аміно}-2-гідроксипропіл)-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1506	N ¹ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-5-{{[2-гідроксіетил]аміно}сульфоніл}-N ³ -пропілізофталамід
1507	N ¹ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-N ³ ,5-диметил-N ³ -пропілізофталамід
1508	N ¹ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-N ² -(фенілсульфоніл)-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]аланінамід
1509	N ¹ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-N ³ ,N ³ -діетил-5-(1,3-оксазол-2-іл)ізофталамід
1510	N ² -[(бензиламіно)карбоніл]-N ¹ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]аланінамід
1511	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-піридин-3-ілбензил)аміно]пропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1512	N ³ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-N ⁵ ,N ⁵ -дипропілпіридин-3,5-дикарбоксамід-1-оксид
1513	N ¹ -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-{[3-(3-форміл-2-фурил)бензил]аміно}-2-гідроксипропіл)-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1514	N ¹ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-5-(1-метил-1H-імідазол-2-іл)-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1515	N ¹ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-N ³ ,N ³ -діетил-5-метилізофталамід
1516	N ¹ -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-{[3-етилсульфініл)бензил]аміно}-2-гідроксипропіл)-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1517	3-{[бутил(етил)аміно]сульфоніл}-N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}пропанамід

1519	N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]пропанаміду хлоргідрат
1520	N ¹ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-N ³ -ізобутил-N ³ ,5-диметилізофталамід
1521	N ¹ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-піридин-2-ілбензил)аміно]пропіл}-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1523	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-[метил(метилсульфоніл)аміно]бензил)аміно]пропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1524	N ¹ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-N ² -(3-фенілпропанойл)-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]аланінамід
1525	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилсульфоніл)бензил]аміно]-2-гідроксипропіл)-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1526	N ² -[(5-хлортієн-2-іл)сульфоніл]-N ¹ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]аланінамід
1527	N ¹ -[(1S,2R)-3-[(3-(5-ацетилтієн-2-іл)бензил)аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1529	N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-3-(1,3-оксазол-2-іл)бензаміду хлоргідрат
1530	N ¹ -[1(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N ³ ,5-диметил-N ³ -(2-фенілетил)ізофталамід
1531	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-{3,5-диметилізоксазол-4-іл)бензил]аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1532	N ¹ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-N ³ ,5-диметил-N ³ -проп-2-інілізофталамід
1533	N ¹ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-N ³ -етил-N ³ ,5-диметилізофталамід
1535	N ¹ -бензил-N ³ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-N ¹ ,5-диметилізофталамід
1536	N ¹ -(втор-бутил)-N ³ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-5-метил-N ¹ -пропілізофталамід
1537	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-(4-метилтієн-2-іл)бензил)аміно]пропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1538	Метил-3-[(2R,3S)-4-(3,5-дифторфеніл)-3-[(3-[(дипропіламіно)карбоніл]-5-метилбензоїл)аміно]-2-гідроксибутил]аміно}метилфеніл(метил)карбамат
1539	NM(1S,2R)-2-гідрокси-1-(2,3,5-трифторбензил)-3-[(3-(трифторметил)бензил)аміно]пропіл)-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1540	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N ³ ,N ³ -діізобутил-5-метилізофталамід
1541	N ¹ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-N ³ ,5-диметил-N ³ -(2-піридин-2-ілетил)ізофталамід

1542	N ¹ -{(1S,2R)-1-(3-фтор-5-гідроксибензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл}-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталаміду хлоргідрат
1544	N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-йодбензил)аміно]пропіл}-4-гідрокси-3-(піролідин-1-ілкарбоніл)бензамід
1545	5-оксо-D-проліл-N ¹ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]аланінамід хлоргідрат
1546	N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-4-[(трифторметил)сульфоніл]аміно}бензамід
1547	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-піридин-4-ілбензил)аміно]пропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1549	N ¹ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(6-метокси-1,2,3,4-тетрагідронафтален-1-іл)аміно]пропіл}-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1550	N ¹ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-N ² -(фенілацетил)-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]аланінамід
1552	метил3-({[(2R,3S)-4-(3,5-дифторфеніл)-3-({3-[(дипропіламіно)карбоніл]-5-метилбензоїл}аміно)-2-гідроксибутил]аміно}метил)фенілкарбамат
1553	5-оксо-1-проліл-N ¹ -1-(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]аланінамід хлоргідрат
1554	N ¹ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-N ³ -ізобутил-5-метилізофталамід
1555	4-({(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}аміно)-4-оксо-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]метил}бутанової кислоти трифторацетат
1556	N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-3-[метил(метилсульфоніл)аміно]бензамід
1557	N ¹ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-N ² -етил-N ³ -ізопропіл-5-метилізофталамід
1558	N ¹ -[(1S,2R)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]-1-(тієн-2-ілметил)пропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1559	N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-3-[(2-гідроксіетил)(пропіл)аміно]сульфоніл}пропанамід
1560	Nx-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-N ³ -ізопропіл-N ³ ,5-диметилізофталамід
1561	N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-2-[(метилсульфоніл)аміно]-1,3-тіазол-4-карбоксамід
1562	N ¹ -аліл-N ¹ -циклопентил-N ³ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-5-метилізофталамід
1563	N-3-({(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}аміно)-3-оксо-2-[(1-пропілбутил)сульфоніл]метил}пропілбензамід
1564	N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-3-(ізопентилсульфоніл)пропанамід

1565	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-{[3-(5-метилтієн-2-іл)бензил]аміно}пропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1567	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-{[1-метилгексил]аміно}пропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1568	N ¹ -[(1S,2R)-3-{[1-(амінокарбоніл)циклогексил]аміно}-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1569	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-{(2E)-гекс-2-еніламіно}-2-гідроксипропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1571	N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-{(3-етилбензил)аміно}-2-гідроксипропіл]-3-гідроксіізоксазол-5-карбоксамід
1572	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-{[3-{(1E)-гекс-1-еніл]бензил}аміно}-2-гідроксипропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1573	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-{(3-етилбензил)аміно}-2-гідроксипропіл]-N ³ -ізопропіл-5-метилізофталамід
1574	N ¹ -[(1S,2R)-2-гідрокси-3-{(3-метоксибензил)аміно}-1-(тієн-2-ілметил)пропіл]-N ³ ,N ³ -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід
1575	2-[3-(2-аміно-2-оксоетокси)феніл]-N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-{(3-йодбензил)аміно}пропіл}ацетамід
1576	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3-бромбензил)-2-гідрокси-3-{(3-метоксибензил)аміно}пропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1577	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-{(2-етилгексил)аміно}-2-гідроксипропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1578	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-{[3-(6-метоксипіридин-3-іл)бензил]аміно}пропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1579	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-{[3-(2,4-диметоксипіримідин-5-іл)бензил]аміно}-2-гідроксипропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1580	N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-{(3-етилбензил)аміно}-2-гідроксипропіл}-3-(2-етилбутаноїл)бензамід
1581	N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-{(3-етилбензил)аміно}-2-гідроксипропіл}-3-{[4-гідроксипіперидин-1-іл]карбоніл}-5-метилбензамід
1582	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3-бромбензил)-2-гідрокси-3-{(3-метоксибензил)аміно}пропіл]-N ³ ,N ³ -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід
1583	4'-[4-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-{(3-йодбензил)аміно}пропіл}аміно]-4-оксобутаноїл]-1,1'-біфеніл-2-карбоксамід
1585	N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-{(3-етилбензил)аміно}-2-гідроксипропіл}-3-{(3-гідроксипіперидин-1-іл)карбоніл}-5-метилбензамід
1586	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-{(3-гідрокси-1-фенілпропіл)аміно}пропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1587	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-{(3-етилбензил)аміно}-2-гідроксипропіл]-N ³ -[2-(диметиламіно)етил]-N ³ -етил-5-метилізофталамід
1588	N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-{(3-етилбензил)аміно}-2-гідроксипропіл}-4-метил-4H,6H-пірол[1,2-a][4,1]бензоксазепін-4-карбоксамід

1589	2-(5-ацетилтієн-2-іл)-N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}ацетамід
1591	N ¹ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-N ³ ,N ³ -діізопропіл-5-метилізофаламід
1592	N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-3-[(метилсульфоніл)аміно]бензамід
1594	N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-йодбензил)аміно]пропіл}-2-[4-(2-оксопіролідін-1-іл)феніл]ацетамід
1595	N-{(1S,2R)-1-(3-хлор-5-фторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл}-3-[(дипропіламіно)сульфоніл]пропанамід
1596	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3-хлор-5-фторбензил)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)пропіл]-N ³ ,N ³ -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід
1597	N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-3-[(1-метил-1H-імідазол-4-іл)сульфоніл]аміно}бензамідтрихлоргідрат
1598	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-(пентиламіно)пропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофаламід
1599	N ¹ -{(1S,2R)-1-(4-фторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл}-N ³ ,N ³ -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід
1600	N ¹ -[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(3-хлор-5-фторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофаламід
1601	N ¹ -циклогексил-N ³ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-N ¹ -етил-5-метилізофаламід
1602	2-{[(2R,3S)-4-(3,5-дифторфеніл)-3-[(3-[(дипропіламіно)карбоніл]-5-метилбензоїл)аміно]-2-гідроксибутил]аміно}етил-2,4-дифторфенілкарбамат
1603	N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-3-[(2S)-2-(метоксиметил)піролідін-1-іл]карбоніл}-5-метилбензаміду хлоргідрат
1605	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3-бромбензил)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)пропіл]-N ³ ,N ³ -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід
1606	N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-2,8-диметилхінолін-3-карбоксамід
1607	N ¹ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(6-гідроксигексил)аміно]пропіл}-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофаламід
1608	N ¹ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(2R)-2-гідроксипропіл]аміно}пропіл}-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофаламід
1609	N-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл}-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]пропанамід
1610	N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-3-[(2-гідрокси-1,1-диметилетил)аміно]сульфоніл}бензамід
1611	N ¹ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(4-фенілбутил)аміно]пропіл}-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофаламід
1612	N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-йодбензил)аміно]пропіл}-7-(1H-імідазол-1-іл)-5,6-дигідронафтален-2-карбоксамід

1613	3-(ацетиламіно)-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-метилбензамід
1614	N ¹ -[(1S,2R)-3-{[2-(аміносультфоніл)етил]аміно}-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1615	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-{[2-(етилтіо)етил]аміно}-2-гідроксипропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1617	N ¹ -[(1S,2R)-3-[бензил(ціанометил)аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1618	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(2-гідроксипропіл)аміно]пропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1619	N ¹ -[(1S,2R)-3-[(3-бутоксипропіл)аміно]-1-{3,5-дифторбензил}-2-гідроксипропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1620	N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-{[2-(2-гідроксіетил)піперидин-1-іл]карбоніл}-5-метилбензамід
1621	Метил-N-[(2R,3S)-4-(3,5-дифторфеніл)-3-({3-[(дипропіламіно)карбоніл]-5-метилбензоїл}аміно)-2-гідроксибутил]-бета-аланінат
1622	N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-(1-гідрокси-2-пропілпентил)бензамід
1623	N ¹ -[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(3-хлор-5-фторбензил)-2-гідроксипропіл]-N ³ ,N ³ -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід
1624	N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-[(метилсультфоніл)аміно]бутанамід
1625	N ¹ -[(1S,2R)-3-{[3-(1-бензотіен-2-іл)бензил]аміно}-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1626	3-(бензилокси)-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]ізоксазол-5-карбоксамід
1627	2-{[(бензилокси)карбоніл]аміно}-7-{[циклопропілметил]аміно}-1,2,4,5,7-пентадеокси-5-(3,5-дифторбензил)-1-[(1-пропілбутил)сультфоніл]-D-трео-гепт-3-улози трифторацетат
1629	N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-(1H-піразол-1-іл)пентанамід
1630	N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-1-(2-фурилметил)-5-оксопіролідін-3-карбоксамід
1632	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(5-гідроксіпентил)аміно]пропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1633	3-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(1-метил-1-фенілетил)аміно]пропіл]аміно]сультфоніл]-N,N-дипропілбензамід
1634	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-N ³ ,N ³ -дипропілпіперидин-1,3-дикарбоксамід
1635	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-N ³ ,N ³ -діетилпіперидин-1,3-дикарбоксамід
1636	5-бром-N ¹ -[(1S,2R)-2-гідрокси-1-(пентафторбензил)-3-[(3-(трифторметил)бензил)аміно]пропіл]-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1637	N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-[(метилсультфоніл)аміно]бензамід

1638	N-[(1S,2R)-1-(3-бромбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-3-[(дипропіламіно)сульфоніл]пропанамід
1639	3-[(дипропіламіно)сульфоніл]-N-[(1S,2R)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]-1-(тієн-2-ілметил)пропіл]пропанамід
1640	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етоксипропіл)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1641	N ¹ -[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-2-гідрокси-1-(тієн-2-ілметил)пропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1642	N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-гідрокси-4-(фенілсульфоніл)бутанамід
1643	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3,5-дихлорбензил)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)пропіл]-N ³ ,N ³ -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід
1645	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3,3-диметилбутил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1646	N ¹ -[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(3-бромбензил)-2-гідроксипропіл]-N ³ ,N ³ -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід
1647	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3-хлор-5-фторбензил)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)пропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1648	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(1,3-дифенілпропіл)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1649	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(1S)-1-(гідроксиметил)пропіл]аміно]пропіл]-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1650	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3S)-2-оксоазепан-3-іл]аміно]пропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1651	N ¹ -циклогексил-N ⁵ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]пентандіамід
1652	N ¹ -[(1S,2R)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]-1-(3-метилбензил)пропіл]-N ³ ,N ³ -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід
1653	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N ³ -(2-пропілпентил)сульфоніл]-бета-аланінамід
1654	N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-(1,3-тіазол-2-іл)бензаміду дигідрохлорид
1656	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метил(феніл)аміно)пропіл]аміно]пропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1657	N ¹ -[(1S,2R)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]-1-(4-метилбензил)пропіл]-N ³ ,N ³ -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід
1658	N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-оксо-1-(тієн-2-ілметил)піролідін-3-карбоксамід
1659	4-[(бутилтіо)метил]-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил-2-фурамід
1660	N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-[(2-гідроксіетил)аміно]сульфоніл]бензамід
1661	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метилциклогексил)аміно]пропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід

1662	N-{{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-4-(2-оксо-1,3-оксазолідин-3-іл)бензамід
1663	N-{{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-4-(1H-пірол-1-іл)бензамід
1665	N-{{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-1,3,4,5-тетрагідротіопропан[4,3-b]індол-8-карбоксамід
1666	N ¹ -{{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-N ⁴ -[2-(трифторметил)феніл]сукцинамід
1667	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3-бромбензил)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)пропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофаламід
1668	N-{{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-4,5-диметил-2-(1H-пірол-1-іл)тіофен-3-карбоксамід
1669	N ¹ -{{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(2,3-дигідроксипропіл)аміно]-2-гідроксипропіл}-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофаламід
1670	N ¹ -{{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(2S)-2-гідроксипропіл]аміно}пропіл}-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофаламід
1671	N ¹ -{{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(1R)-1-метилпропіл]аміно}пропіл}-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофаламід
1672	2-хлор-N-{{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-4-(метилсульфоніл)бензамід
1673	N ¹ -{{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(2-гідроксіетил)аміно]пропіл}-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофаламід
1674	3-[(дипропіламіно)сульфоніл]-N-{{(1S,2R)-2-гідрокси-1-(3-метоксибензил)-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл}пропанамід
1675	N-{{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-3-{метил[(трифторметил)сульфоніл]аміно}бензамід
1676	N-{{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-3-гідрокси-6-(1-гідрокси-2,2-диметилпропіл)піридин-2-карбоксамід
1677	N ¹ -[(1S,2R)-3-[(1,3-дициклогексилпропіл)аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофаламід
1678	N-{{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-2,2'-бітіофен-5-карбоксамід
1679	N-{{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-4-(1H-імідазол-1-іл)бутанамід
1680	N ¹ -{{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-2,3-дигідрокси-N ⁴ -(4-метоксифеніл)сукцинамід
1682	N ¹ -{{(1S,2R)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]-1-[3-(трифторметил)бензил]пропіл}-N ³ ,N ³ -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід
1683	N ¹ -[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-2-гідрокси-1-(тієн-2-ілметил)пропіл]-N ³ ,N ³ -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід
1684	N ¹ -[(1S,2R)-3-[[2-(амінокарбоніл)-1H-індол-6-іл]аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофаламід
1685	N ¹ -[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(3-бромбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофаламід
1686	N-{{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-2-(1-оксо-1,3-дигідро-2H-ізоіндол-2-іл)бутанамід

1687	3-хлор-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-(метилсульфоніл)тіофен-2-карбоксамід
1688	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(1-етилпропіл)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1689	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(5R)-3-етил-2-оксо-1,3-оксазолідин-5-іл]метил]аміно-2-гідроксипропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1690	N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил-7-(трифторметил)піразоло[1,5-a]піримідин-2-карбоксамід
1691	N ¹ -[(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-N ² -[(метилтіо)ацетил]-3-[(1-пропілбутил)сульфоніл]аланінамід хлоргідрат
1692	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(2,3-диметилциклогексил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1693	N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4,5-диметокси-1-бензотіофен-2-карбоксамід
1694	N ¹ -[(1S,2R)-1-[3-фтор-5-(трифторметил)бензил]-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)пропіл]-N ³ ,N ³ -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід
1695	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(5S)-3-етил-2-оксо-1,3-оксазолідин-5-іл]метил]аміно-2-гідроксипропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1696	N ¹ -[(1S,2R)-1-(1,3-бензодіоксол-5-ілметил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-N ³ ,N ³ -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід
1697	N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-(3,5-діоксо-1,2,4-триазолідин-4-іл)бензамід
1698	N-[(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-2-гідрокси-3-[(3-метоксифеніл)сульфоніл]пропанамід хлоргідрат
1699	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(2-метилциклогексил)аміно]пропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1700	N ¹ -[(1S,2R)-3-[(2-{4-[(3-хлорбензил)окси]феніл}етил)аміно]-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1701	N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-гідрокси-4-оксо-4-тієн-3-ілбутанамід
1702	N ¹ -[(1S,2R)-1-[3-(бензилокси)-S-фторбензил]-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-N ³ ,N ³ -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід
1703	N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-гідрокси-4-оксо-4-[3-(трифторметил)феніл]бутанамід
1704	N ¹ -[(1S,2R)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)-1-[3-(трифторметокси)бензил]пропіл]-N ³ ,N ³ -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід
1705	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-{11-(гідроксиметил)-3-(метилтіо)пропіл]аміно}пропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1706	2-(1H-1,2,3-бензотриазол-1-іл)-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]гексанамід
1707	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3-фтор-4-метилбензил)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)пропіл]-N ³ ,N ³ -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід

1708	N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-3-(4,4-диметил-2,5-діоксоімідазолідин-1-іл)-2-{{(1-пропілбутил)сульфоніл]метил}пропанамід
1709	N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-4-{{(трифторметил)сульфоніл]аміно}бутанамід
1710	N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-2-(5-метил-1,3-діоксо-1,3-дигідро-2H-ізоіндол-2-іл)ацетамід
1712	N ¹ -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-{{1-(гідроксиметил)пропіл]аміно}пропіл)-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофаламід
1713	N ¹ -[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(3,5-дихлорбензил)-2-гідроксипропіл]-N ³ ,N ³ -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід
1714	N-{(1S,2R)-1-бензил-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл}-3-{{(2-гідроксіетил)(пропіл)аміно]сульфоніл}пропанаміду хлоргідрат
1715	5-(бензилтіо)-N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}нікотинамід
1716	N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-1H-піразол-5-карбоксамід
1717	6-хлор-N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-3-метил-2-оксо-2,3-дигідро-1,3-бензоксазол-5-карбоксамід
1718	N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-1H-бензімідазол-2-карбоксамід
1719	N ¹ -{(1S,2R)-1-(циклогексилметил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл}-N ³ ,N ³ -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід
1720	N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-6-гідрокси-4,7-диметокси-1-бензофуран-5-карбоксамід
1721	N ¹ -{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(4-метилциклогексил)аміно]пропіл}-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофаламід
1722	N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}[1,2,4]тріазоло [4,3-а]піридин-6-карбоксамід
1723	N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-2-гідрокси-4-оксо-4-тієн-2-ілбутанамід
1724	N ¹ -[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(3,5-дихлорбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофаламід
1725	N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-4-(2-гідрокси-5-метилфеніл)-4-оксобутанамід
1726	N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-3-феноксibenзамід
1727	4-[(амінокарбоніл)амін]-N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}бензамід
1728	N ¹ -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-{{(1S)-1-(гідроксиметил)-3-(метилтіо)пропіл]аміно}пропіл)-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофаламід
1729	N-{(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл}-7-гідрокси-4-оксохроман-2-карбоксамід

1730	N ¹ -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[[1S)-1-(гідроксиметил)-3-метилбутил]аміно]пропіл)-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1731	N ¹ -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[[1R)-1-(гідроксиметил)пропіл]аміно]пропіл)-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1732	N ¹ -1(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[(1-метил-3-фенілпропіл)аміно]пропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1733	N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-(2,3-дигідро-1-бензофуран-5-іл)-1,3-тіазол-4-карбоксамід
1734	N ¹ -[(1S,2R)-1-[3-(бензилокси)бензил]-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1735	N-[(1S,2R)-1-(4-хлорбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-3-[(дипропіламіно)сульфоніл]пропанамід
1736	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N ³ -пентилмалонамід
1737	N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-(трифторметокси)бензамід
1738	3-[(дипропіламіно)сульфоніл]-N-[(1S,2R)-1-(3-фтор-4-метилбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]пропанамід
1739	N-[(1S,2R)-1-(3-хлор-5-фторбензил)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)пропіл]-3-[(дипропіламіно)сульфоніл]пропанамід
1740	N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-(4,4-диметил-2,5-діоксоімідазолідин-1-іл)-2-[[1-пропілбутил)сульфоніл]метил]пропанамід
1741	N ¹ -[4-(ацетиламіно)феніл]-N ⁴ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]сукцинамід
1742	3-(1-ціаноетил)-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]бензамід
1743	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N ⁴ -(5-феніл-1,3,4-тіадіазол-2-іл)сукцинамід
1744	N ¹ -[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-2-гідрокси-1-[3-(трифторметокси)бензил]пропіл]-N ³ ,N ³ -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід
1745	N ¹ -((1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-3-[[2-(2-оксо-2-піролідин-1-ілетокси)феніл]аміно]пропіл)-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1746	N ¹ -[(1S,2R)-1-(4-хлорбензил)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)пропіл]-N ³ ,N ³ -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід
1747	N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-(1,1-діоксидотетрагідротієн-2-іл)ацетамід
1748	N ¹ -[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(4-хлорбензил)-2-гідроксипропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1749	N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-гекс-1-инілнікотинамід
1750	N-[(1S,2R)-1-(3-бромбензил)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)пропіл]-3-[(дипропіламіно)сульфоніл]пропанамід

1751	N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-3-метоксіізоксазол-5-карбоксамід
1752	N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2,3-диметил-1H-індол-7-карбоксамід
1753	4-(3-хлорфеніл)-N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-гідрокси-4-оксобутанамід
1755	N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-(1-метил-1H-індол-3-іл)-2-оксоацетамід
1756	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3-фтор-4-метилбензил)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)пропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1757	3-[(дипропіламіно)сульфоніл]-N-[(1S,2R)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]-1-(4-метилбензил)пропіл]пропанамід
1758	N ¹ -[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(3-фтор-4-метилбензил)-2-гідроксипропіл]-N ³ ,N ³ -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід
1759	N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-[5-(4-метилфеніл)-2H-тетразол-2-іл]ацетамід
1760	N-[(1S,2R)-1-(3,5-дихлорбензил)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]пропіл]-3-[(дипропіламіно)сульфоніл]пропанамід
1761	N ¹ -[(1S,2R)-2-гідрокси-3-(ізопентиламіно)-1-(тієн-2-ілметил)пропіл]-N ³ ,N ³ -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід
1762	N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-5-метил-3-фенілізоксазол-4-карбоксамід
1764	N ¹ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-N ² -[(метилсульфоніл)ацетил]-N ² -пентилгліцинамід
1765	N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-(1H-індол-3-іл)-4-оксобутанамід
1766	N ¹ -(5-бензил-1,3,4-гіадіазол-2-іл)-N ⁴ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]сукцинамід
1767	N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-(3-фтор-4-метоксифеніл)-4-оксобутанамід
1768	Етил-4-[(2R,3S)-4-(3,5-дифторфеніл)-3-[(3-[(дипропіламіно)карбоніл]-5-метилбензоїл)аміно]-2-гідроксибутил]аміно}піперидин-1-карбоксилат
1769	N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-4-(2-фторбензоїл)-1H-пірол-2-карбоксамід
1770	N ¹ -[(1S,2R)-3-(бензиламіно)-1-(4-хлорбензил)-2-гідроксипропіл]-N ³ ,N ³ -дипропілбензол-1,3,5-трикарбоксамід
1772	N ¹ -[(1S,2R)-2-гідрокси-1-(4-гідроксибензил)-3-(ізопентиламіно)пропіл]-5-метил-N ³ ,N ³ -дипропілізофталамід
1773	N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]-2-(4-морфолін-4-ілфеніл)ацетамід
1774	3-[(дипропіламіно)сульфоніл]-N-[(1S,2R)-2-гідрокси-3-[(3-метоксибензил)аміно]-1-[3-(трифторметокси)бензил]пропіл]пропанамід
1775	N ¹ -бензил-N ¹ -(1-циклопропілетил)-N ⁴ -[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-3-[(3-етилбензил)аміно]-2-гідроксипропіл]сукцинамід
1776	N-[(1S,2R)-1-(3,5-дифторбензил)-2-гідрокси-