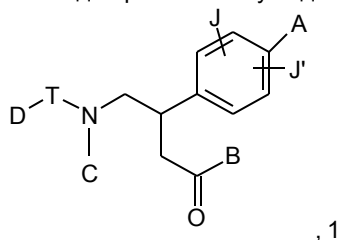
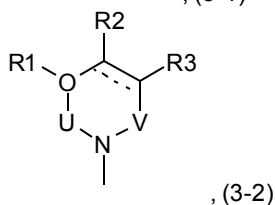
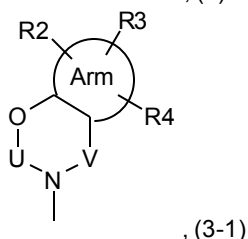
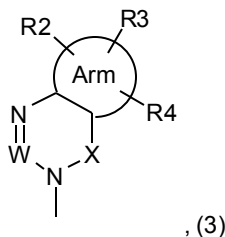
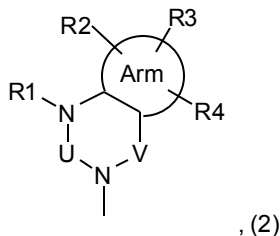


1. Похідні фенілаланіну поданої нижче загальної формули (1) та їхні фармацевтично прийнятні солі:



де А є одна з поданих нижче загальних формул (2), (3), (3-1) або (3-2):



де Arm є циклоалкіл або ароматичний цикл, який містить 0, 1, 2, 3 або 4 гетероатоми, вибрані із групи, до якої входять атоми кисню, сірки та азоту,

подвійна суцільна лінія і штрихова лінія у формулі (3-2) означає одинарний або подвійний зв'язок, U, V та X означають C(=O), S(=O)<sub>2</sub>, C(-R5)(-R6), C=C(-R5)(-R6), C(=S), S(=O), P(=O)(OH) або P(-H)(=O), W означає C(-R7) або атом азоту,

R1, R2, R3, R4, R5, R6 і R7 можуть бути однаковими або відрізнятися один від одного, і кожний з них є атом водню, атом галоїду, гідроксил, нижчий алкіл, заміщений нижчий алкіл, нижчий алкеніл, заміщений нижчий алкеніл, нижчий алкініл, заміщений нижчий алкініл, циклоалкіл, який може містити в циклі гетероатом (гетероатоми), арил, гетероарил, нижчий алкіл, заміщений циклоалкілом (циклоалкілами), який може (які можуть) містити в циклі гетероатом (гетероатоми), нижчий алкіл, заміщений арилом (арилами), нижчий алкіл, заміщений гетероарилом (гетероарилами), нижча алкоксигрупа, нижча алкілтіогрупа, нижча алкоксигрупа та нижча алкілтіогрупа, заміщені циклоалкілом (циклоалкілами), який може (які можуть) містити в циклі гетероатом (гетероатоми), нижча алкоксигрупа та нижча алкілтіогрупа, заміщені арилом (арилами), нижча алкоксигрупа та нижча алкілтіогрупа, заміщені гетероарилом (гетероарилами), циклоалкілоксигрупа, яка може містити в циклі гетероатом (гетероатоми), арилоксигрупа, гетероарилоксигрупа, нижчий гідроксіалкіл, нижчий гідроксіалкеніл, нижча гідроксіалкоксигрупа, нижчий галоїдний алкіл, нижча галоїдалкоксигрупа, нижча галоїдалкілтіогрупа, нижчий галоїдалкеніл, нітрогрупа, ціаногрупа, заміщена або незаміщена аміногрупа, карбоксил, нижчий алкілоксикарбоніл, заміщений або незаміщений карбамоїл, нижчий алканойл, ароїл, нижчий алкілсульфоніл, заміщений чи незаміщений сульфамойл або амонієва група, R5 та R6 можуть бути з'єднані між собою і утворювати цикл, який може містити один або два атоми кисню, азоту або сірки,

V є гідроксил, нижча алкоксигрупа або гідроксиламіногрупа,

S є атом водню, нижчий алкіл, нижчий алкеніл, нижчий алкініл, нижчий алкіл, заміщений циклоалкілом (циклоалкілами), який може (які можуть) містити в циклі гетероатом (гетероатоми), нижчий алкіл, заміщений арилом (арилами), або нижчий алкіл, заміщений гетероарилом (гетероарилами),

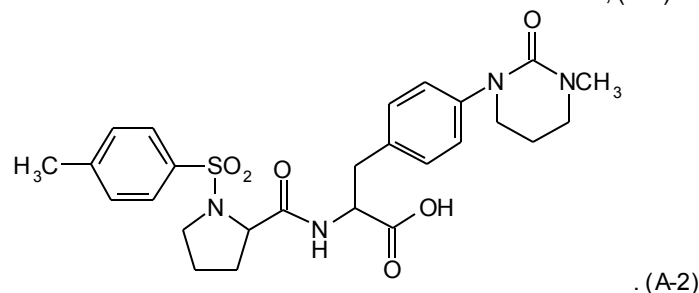
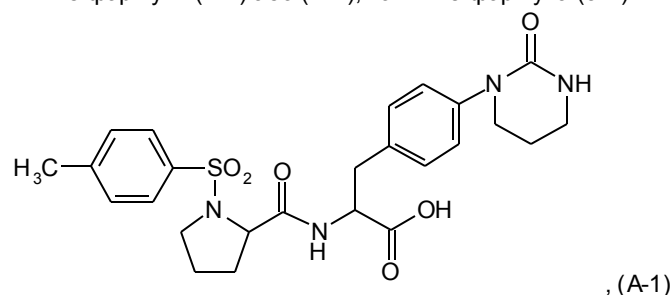
D є нижчий алкіл, нижчий алкеніл, нижчий алкініл, циклоалкіл, який може містити в циклі гетероатом (гетероатоми), арил, гетероарил, нижчий алкіл, заміщений циклоалкілом (циклоалкілами), який може (які можуть) містити в циклі гетероатом (гетероатоми), нижчий алкіл, заміщений арилом (арилами), нижчий алкіл, заміщений гетероарилом (гетероарилами), нижча алкоксигрупа, нижча алкоксигрупа, заміщена циклоалкілом (циклоалкілами), який може (які можуть) містити в циклі гетероатом (гетероатоми), нижча алкоксигрупа, заміщена арилом (арилами), нижча алкоксигрупа, заміщена гетероарилом (гетероарилами), циклоалкілоксигрупа, яка може містити в циклі гетероатом (гетероатоми), арилоксигрупа, гетероарилоксигрупа, нижчий гідроксіалкіл, нижчий гідроксіалкеніл, нижча гідроксіалкоксигрупа, нижчий галоїдний алкіл, нижча галоїдалкоксигрупа, нижчий галоїдалкеніл, нітрогрупа, ціаногрупа, заміщена або незаміщена аміногрупа, карбоксил, нижчий алкілоксикарбоніл, заміщений або незаміщений карбамоїл, нижчий алканоїл, ароїл, нижча алкілтіогрупа, нижчий алкілсульфоніл, або заміщений чи незаміщений сульфамойл,

C та D можуть бути з'єднані між собою і утворювати цикл, який може містити один або два атоми кисню, азоту або сірки,

T означає міжтомний зв'язок, C(=O), C(=S), S(=O), S(=O)<sub>2</sub>, N(H)-C(=O) або N(H)-C(=S),

J і J' можуть бути однаковими або відрізнятися один від одного, і кожний з них є атом водню, атом галоїду, нижчий алкіл, нижча алкілоксигрупа або нітрогрупа,

за умови, що згадані похідні фенілаланіну загальної формули (1) не включають сполуки, які мають подані нижче формули (A-1) або (A-2), коли A є формула (3-2)



2. Похідні фенілаланіну або їхні фармацевтично прийнятні солі за п. 1, де A є одна із груп, що мають загальні формули (2) або (3), а R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub>, R<sub>5</sub>, R<sub>6</sub> і R<sub>7</sub> можуть бути однаковими або відрізнятися один від одного, і кожний із них є атом водню, атом галоїду, гідроксил, нижчий алкіл, заміщений нижчий алкіл, нижчий алкеніл, заміщений нижчий алкеніл, нижчий алкініл, заміщений нижчий алкініл, циклоалкіл, який може містити в циклі гетероатом (гетероатоми), арил, гетероарил, нижчий алкіл, заміщений циклоалкілом (циклоалкілами), який може (які можуть) містити в циклі гетероатом (гетероатоми), нижчий алкіл, заміщений арилом (арилами), нижчий алкіл, заміщений гетероарилом (гетероарилами), нижча алкоксигрупа, нижча алкілтіогрупа, нижча алкоксигрупа та нижча алкілтіогрупа, заміщені циклоалкілом (циклоалкілами), який може (які можуть) містити в циклі гетероатом (гетероатоми), нижча алкоксигрупа та нижча алкілтіогрупа, заміщені арилом (арилами), нижча алкоксигрупа та нижча алкілтіогрупа, заміщені гетероарилом (гетероарилами), циклоалкілоксигрупа, яка може містити в циклі гетероатом (гетероатоми), арилоксигрупа, гетероарилоксигрупа, нижчий гідроксіалкіл, нижчий гідроксіалкеніл, нижча гідроксіалкоксигрупа, нижчий галоїдний алкіл, нижча галоїдалкоксигрупа, нижча галоїдалкілтіогрупа, нижчий галоїдалкеніл, нітрогрупа, ціаногрупа, заміщена або незаміщена аміногрупа, карбоксил, нижчий алкілоксикарбоніл, заміщений або незаміщений карбамоїл, нижчий алканоїл, ароїл, нижчий алкілсульфоніл або заміщений чи незаміщений сульфамойл, R<sub>5</sub> та R<sub>6</sub> можуть бути з'єднані між собою і утворювати цикл, який може містити один або два атоми кисню, азоту або сірки.

3. Похідні фенілаланіну або їхні фармацевтично прийнятні солі за п. 2, де в загальній формулі (1) B є гідроксил або нижча алкоксигрупа,

C є атом водню або нижчий алкіл,

J і J' є атоми водню, і

в загальних формулах (2) та (3)

V та X означають будь-яку із груп C(=O), S(=O)<sub>2</sub> або C(-R<sub>5</sub>)(-R<sub>6</sub>),

U означає будь-яку із груп C(=O), S(=O)<sub>2</sub>, C(-R<sub>5</sub>)(-R<sub>6</sub>), C(=C(-R<sub>5</sub>)(-R<sub>6</sub>)), C(=S), S(=O), P(=O)(OH) або P(-H)(=O).

4. Похідні фенілаланіну або їхні фармацевтично прийнятні солі за п. 2, де в загальній формулі (1) B є гідроксил або нижча алкоксигрупа,

C є атом водню або нижчий алкіл,

J і J' є атоми водню, і в загальних формулах (2) та (3) Arm є бензольний цикл або ароматичний цикл, який містить 1, 2, 3 або 4 гетероатоми, вибрані із групи, до якої входять атоми кисню, сірки та азоту.

5. Похідні фенілаланіну або їхні фармацевтично прийнятні солі за п. 2, де в загальній формулі (1) В є гідроксил або нижча алкоксигрупа,

С є атом водню або нижчий алкіл,

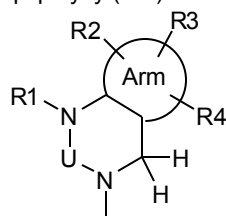
J і J' є атоми водню, і

в загальних формулах (2) та (3) Arm є бензольний цикл або ароматичний цикл, який містить 1, 2, 3 або 4 гетероатоми, вибрані із групи, до якої входять атоми кисню, сірки та азоту,

V та X означають будь-яку із груп C(=O), S(=O)<sub>2</sub> або C(-R5)(-R6),

U означає будь-яку із груп C(=O), S(=O)<sub>2</sub>, C(-R5)(-R6), C(=C(-R5)(-R6)), C(-S), S(=O), P(=O)(OH) або P(-H)(=O).

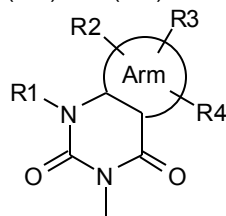
6. Похідні фенілаланіну або їхні фармацевтично прийнятні солі за п. 1, де А означає подану нижче формулу (3-3):



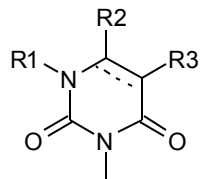
, (3-3)

де Arm, U та R1-R4 відповідають визначенням за п. 1.

7. Похідні фенілаланіну або їхні фармацевтично прийнятні солі за п. 1, де А означає подані нижче формули (3-4) або (3-5):



, (3-4)

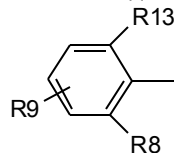


, (3-5)

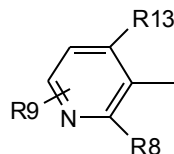
де Arm та R1-R4 відповідають визначенням за п. 1, і подвійна суцільна лінія і штрихова лінія у формулі (3-5) означає одинарний або подвійний зв'язок.

8. Похідні фенілаланіну або їхні фармацевтично прийнятні солі за п. 7, де А означає формулу (3-4), Arm є бензольний цикл, піридиновий цикл, піразоловий цикл або циклогексановий цикл, R1 є нижчий алкіл, R2, R3 та R4 можуть бути однаковими або відрізнятися один від одного, і кожний із них є атом водню, атом галоїду, гідроксил, нижчий алкіл, циклоалкіл, який може містити в циклі гетероатом (гетероатоми), нижчий алкіл, заміщений циклоалкілом (циклоалкілами), який може (які можуть) містити в циклі гетероатом (гетероатоми), нижча алкоксигрупа, нижча алкілтіогрупа, нижчий галоїдний алкіл, нижча галоїдалкоксигрупа, нижча галоїдалкілтіогрупа, нітрогрупа, ціаногрупа, аміногрупа, аміногрупа, заміщена нижчим алкілом (алкілами), або триалкіламонієва група.

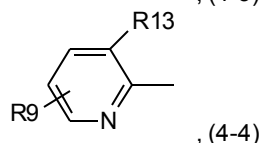
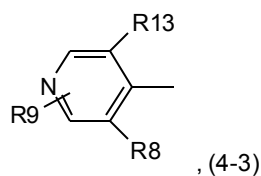
9. Похідні фенілаланіну або їхні фармацевтично прийнятні солі за п. 1, де в загальній формулі (1) D означає подані нижче формули (4-1), (4-2), (4-3) або (4-4)



, (4-1)



, (4-2)



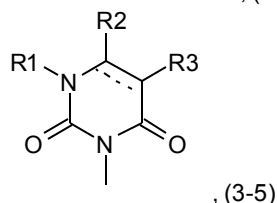
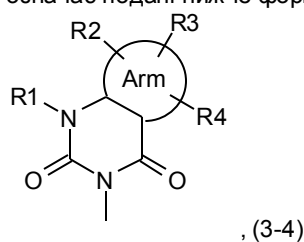
де R13 є атом галоїду або метил, R8 є атом галоїду, метил, трифторметил, метоксигрупа або атом водню, R9 є атом водню, атом галоїду, гідроксил, нижчий алкіл, циклоалкіл, який може містити в циклі гетероатом (гетероатоми), нижчий алкіл, заміщений циклоалкілом (циклоалкілами), який може (які можуть) містити в циклі гетероатом (гетероатоми), нижча алкоксигрупа, нижча алкілтіогрупа, нижчий галоїдний алкіл, нижча галоїдалкоксигрупа, нижча галоїдалкілтіогрупа, нітрогрупа, ціаногрупа, аміногрупа, аміногрупа, заміщена нижчим алкілом (алкілами), триалкіламонієва група, метансульфоніламіногрупа та тетразоліл.

10. Похідні фенілаланіну або їхні фармацевтично прийнятні солі за п. 9, де в загальній формулі (1) D означає формулу (4-1), і

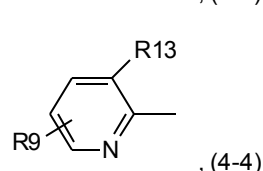
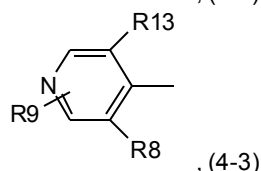
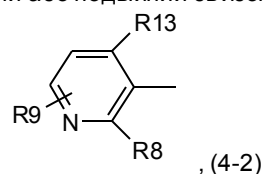
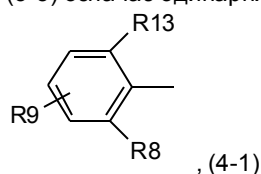
в згаданій формулі (4-1) R13 та R8 є атоми хлору, а R9 є атом водню, атом галоїду, гідроксил, нижчий алкіл, циклоалкіл, який може містити в циклі гетероатом (гетероатоми), нижча алкоксигрупа, нижча алкілтіогрупа, нижчий галоїдний алкіл, нижча галоїдалкоксигрупа, нижча галоїдалкілтіогрупа, нітрогрупа, ціаногрупа, аміногрупа, аміногрупа, заміщена нижчим алкілом (алкілами), або триалкіламонієва група.

11. Похідні фенілаланіну або їхні фармацевтично прийнятні солі за п. 1, де в загальній формулі (1) C є атом водню і T є C(=O).

12. Похідні фенілаланіну або їхні фармацевтично прийнятні солі за п. 1, де в загальній формулі (1) A означає подані нижче формули (3-4) або (3-5):



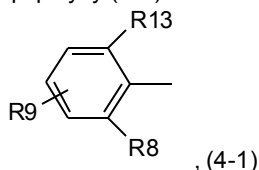
де Arm та R1-R4 відповідають визначенням за п. 1, і подвійна суцільна лінія та штрихова лінія в формулі (3-5) означає одинарний або подвійний зв'язок, D означає подані нижче формули (4-1), (4-2), (4-3) або (4-4):



де R13 є атом галоїду або метил, R8 є атом галоїду, метил, трифторметил, метоксигрупа або атом водню, R9 є атом водню, атом галоїду, гідроксил, нижчий алкіл, циклоалкіл, який може містити в циклі гетероатом (гетероатоми), нижчий алкіл, заміщений циклоалкілом (циклоалкілами), який може (які можуть) містити в циклі гетероатом (гетероатоми), нижча алкоксигрупа, нижча алкілтіогрупа, нижчий галоїдний алкіл, нижча галоїдалкоксигрупа, нижча галоїдалкілтіогрупа, нітрогрупа, ціаногрупа, аміногрупа, аміногрупа, заміщена нижчим алкілом (алкілами), триалкіламонієва група, метансульфоніламіногрупа та тетразоліл, B є гідроксил або нижча алкоксигрупа, C є атом водню, кожний з J і J' є атом водню і T є C(=O).

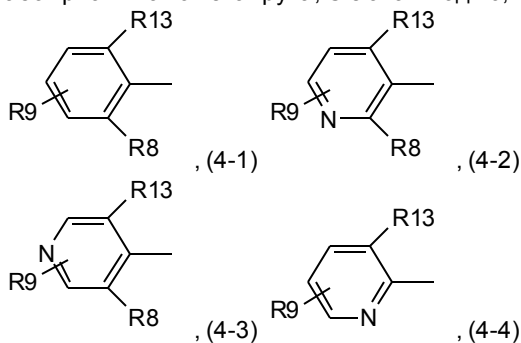
13. Похідні фенілаланіну або їхні фармацевтично прийнятні солі за п. 12, де в загальній формулі (1) A означає формулу (3-4), Arm є бензольний цикл, піридиновий цикл, піразоловий цикл або циклогексановий цикл, R1 є нижчий алкіл, R2, R3 та R4 можуть бути однаковими або відрізнятися один від одного, і кожний із них є атом водню, атом галоїду, гідроксил, нижчий алкіл, циклоалкіл, який може містити в циклі

гетероатом (гетероатоми), нижчий алкіл, заміщений циклоалкілом (циклоалкілами), який може (які можуть) містити в циклі гетероатом (гетероатоми), нижча алкоксигрупа, нижча алкілтіогрупа, нижчий галоїдний алкіл, нижча галоїдалкоксигрупа, нижча галоїдалкілтіогрупа, нітрогрупа, ціаногрупа, аміногрупа, аміногрупа, заміщена нижчим алкілом (алкілами), або триалкіламонієва група, D означає подану нижче формулу (4-1)



в формулі (4-1) R13 та R8 є атоми хлору, а R9 є атом водню, атом галоїду, гідроксил, нижчий алкіл, циклоалкіл, який може містити в циклі гетероатом (гетероатоми), нижча алкоксигрупа, нижча алкілтіогрупа, нижчий галоїдний алкіл, нижча галоїдалкоксигрупа, нижча галоїдалкілтіогрупа, нітрогрупа, ціаногрупа, аміногрупа, аміногрупа, заміщена нижчим алкілом (алкілами) або триалкіламонієва група, В є гідроксил або нижча алкоксигрупа, С є атом водню, кожний з J і J' є атом водню і Т є C(=O).

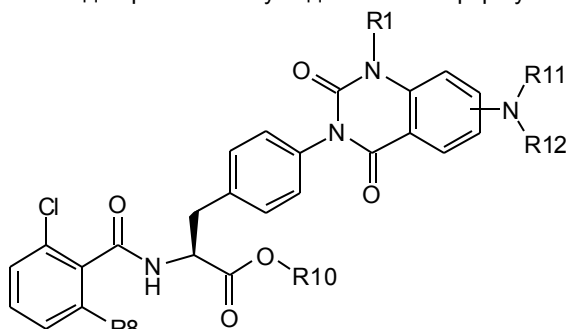
14. Похідні фенілаланіну або їхні фармацевтично прийнятні солі за п. 6, де в загальній формулі (1) А означає формулу (3-3), а в формулі (3-3) U є C(=O) або C(=S), R1 є нижчий алкіл, R2, R3 та R4 можуть бути однаковими або відрізнятися один від одного, і кожний з них є атом водню, атом галоїду, гідроксил, нижчий алкіл, циклоалкіл, який може містити в циклі гетероатом (гетероатоми), нижчий алкіл, заміщений циклоалкілом (циклоалкілами), який може (які можуть) містити в циклі гетероатом (гетероатоми), нижча алкоксигрупа, нижча алкілтіогрупа, нижчий галоїдний алкіл, нижча галоїдалкоксигрупа, нижча галоїдалкілтіогрупа, нітрогрупа, ціаногрупа, аміногрупа, аміногрупа, заміщена нижчим алкілом (алкілами), або триалкіламонієва група, С є атом водню, D означає формулу (4-1), (4-2), (4-3) або (4-4)



де R13 є атом галоїду або метил, R8 є атом галоїду, метил, трифторметил, метоксигрупа або атом водню, R9 є атом водню, атом галоїду, гідроксил, нижчий алкіл, циклоалкіл, який може містити в циклі гетероатом (гетероатоми), нижчий алкіл, заміщений циклоалкілом (циклоалкілами), який може (які можуть) містити в циклі гетероатом (гетероатоми), нижча алкоксигрупа, нижча алкілтіогрупа, нижчий галоїдний алкіл, нижча галоїдалкоксигрупа, нижча галоїдалкілтіогрупа, нітрогрупа, ціаногрупа, аміногрупа, аміногрупа, заміщена нижчим алкілом (алкілами), триалкіламонієва група, метансульфоніламіногрупа та тетразоліл, і Т є C(=O).

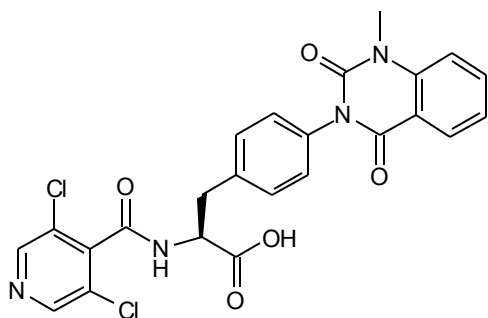
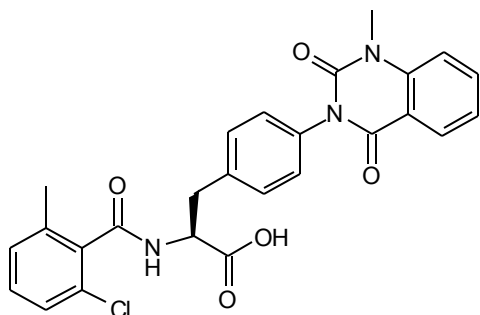
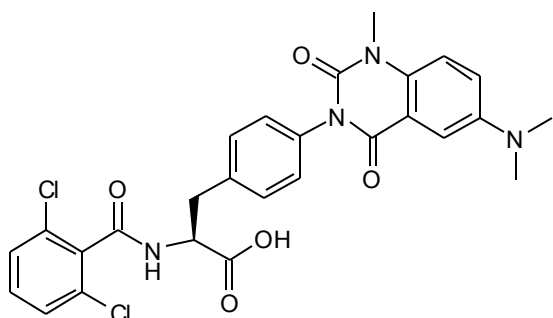
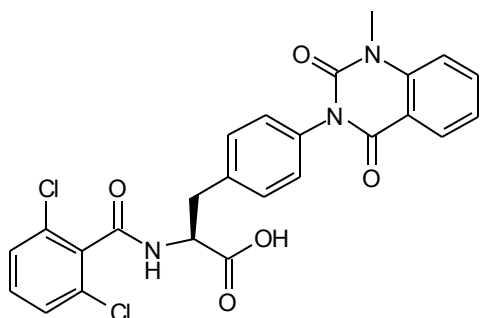
15. Похідні фенілаланіну або їхні фармацевтично прийнятні солі за п. 14, де в загальній формулі (1) А означає формулу (3-3), а в формулі (3-3) U є C(=O) або C(=S), R1 є метил або етил, R2, R3 та R4 можуть бути однаковими або відрізнятися один від одного, і кожний із них є атом водню, атом галоїду, гідроксил, нижчий алкіл, циклоалкіл, який може містити в циклі гетероатом (гетероатоми), нижча алкоксигрупа, нижча алкілтіогрупа, нижчий галоїдний алкіл, нижча галоїдалкоксигрупа, нижча галоїдалкілтіогрупа, нітрогрупа, ціаногрупа, аміногрупа, аміногрупа, заміщена нижчим алкілом (алкілами), або триалкіламонієва група, В є гідроксил або нижча алкоксигрупа, С є атом водню, D означає формулу (4-1), де R13 та R8 є атоми хлору, а R9 є атом водню, атом галоїду, гідроксил, нижчий алкіл, циклоалкіл, який може містити в циклі гетероатом (гетероатоми), нижча алкоксигрупа, нижча алкілтіогрупа, нижчий галоїдний алкіл, нижча галоїдалкоксигрупа, нижча галоїдалкілтіогрупа, нітрогрупа, ціаногрупа, аміногрупа, аміногрупа, заміщена нижчим алкілом (алкілами), або триалкіламонієва група, Т є C(=O) і кожний з J і J' є атом водню.

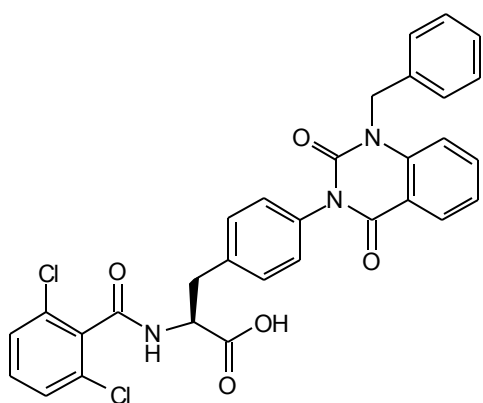
16. Похідні фенілаланіну поданої нижче формули або їхні фармацевтично прийнятні солі за п. 1:



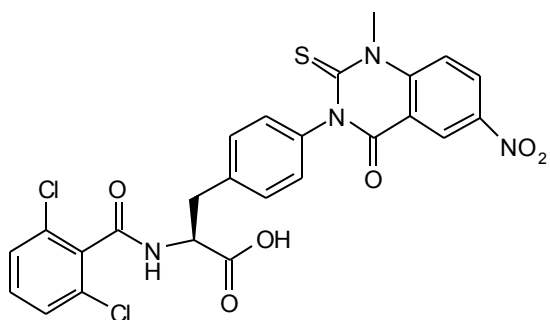
де R1 є метил або етил, R8 є атом галоїду або метил, R10 є атом водню або нижчий алкіл, R11 і R12 можуть бути однаковими або відрізнятися один від одного, і кожний з них є атом водню, метил, етил або пропіл, R11 і R12 можуть бути з'єднані між собою і утворювати цикл, і в цьому разі R11-R12 є триметилен, тетраметилен або пентаметилен.

17. Похідні фенілаланіну поданих нижче формул або їхні фармацевтично прийнятні солі за п. 1:

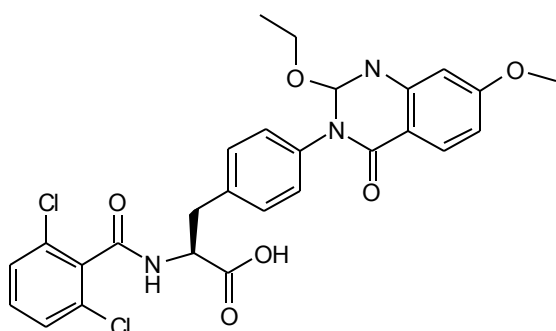




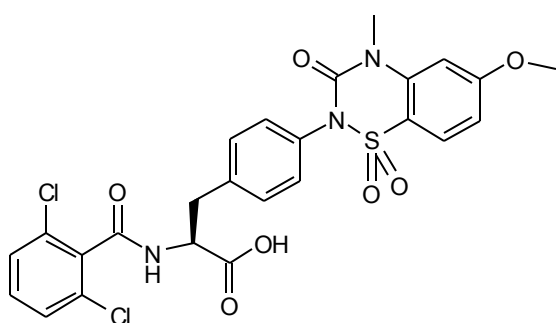
,



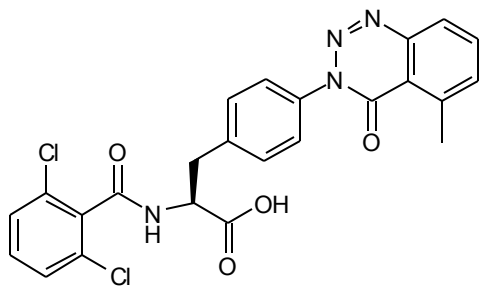
,



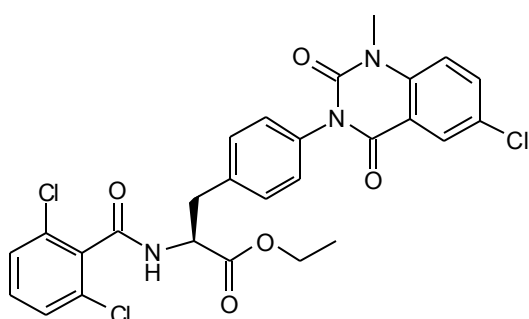
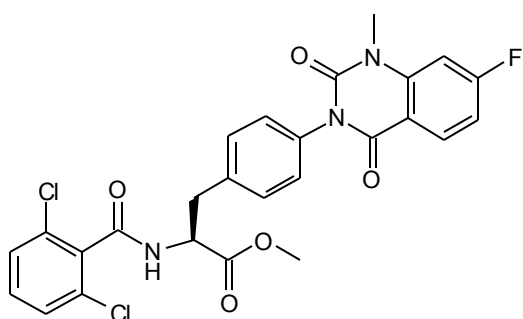
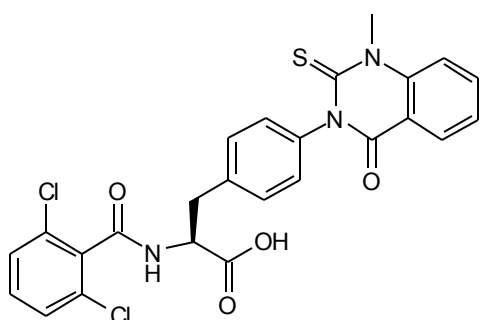
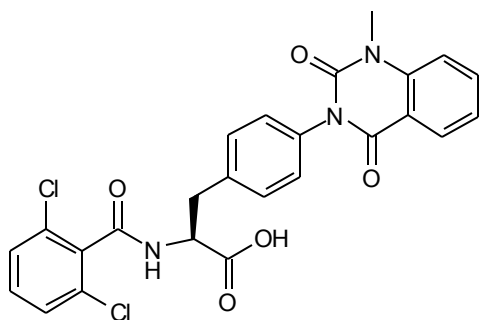
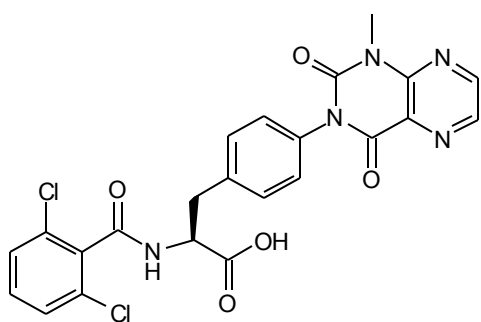
,



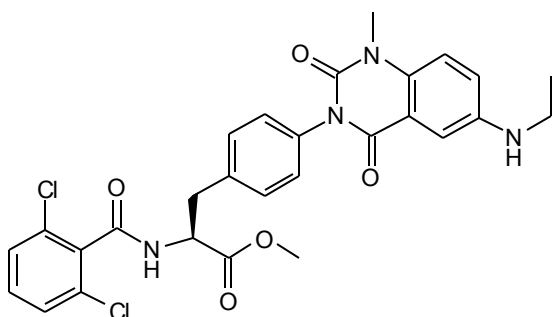
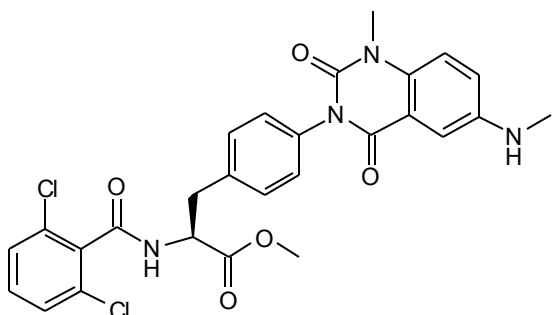
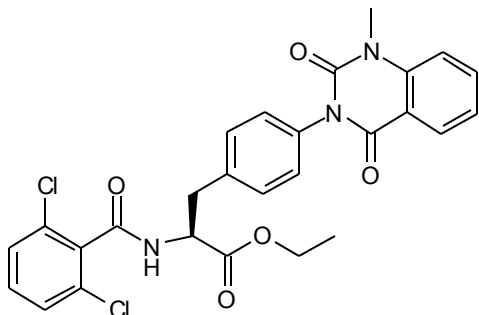
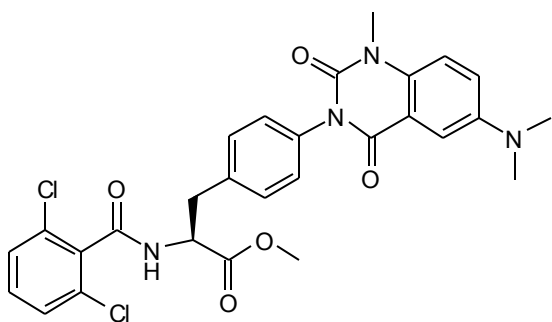
,



,







18. Антагоніст  $\alpha$  -4-інтегрину, який містить похідну фенілаланіну або її фармацевтично прийнятну сіль за будь-яким із пп. 1-17 як активний інгредієнт.

19. Засіб для лікування або профілактики запальних захворювань, патологія яких пов'язана із процесом адгезії, залежним від  $\alpha$  -4-інтегрину, який містить похідну фенілаланіну або її фармацевтично прийнятну сіль за будь-яким із пп. 1-17 як активний інгредієнт.

20. Фармацевтична композиція, яка містить похідну фенілаланіну або її фармацевтично прийнятну сіль за будь-яким із пп. 1-17 як активний інгредієнт.

21. Засіб для лікування або профілактики ревматоїдного артриту, запальних захворювань кишечника, системного червоного вовчак, розсіяного склерозу, синдрому Шегрена, астми, псоріазу, алергії, діабету, захворювань серцево-судинної системи, артеріосклерозу, рестенозу, проліферації пухлин, розвитку метастазів пухлин і відторгнення трансплантатів, який містить похідну фенілаланіну або її фармацевтично прийнятну сіль за будь-яким із пп. 1-17 як активний інгредієнт.