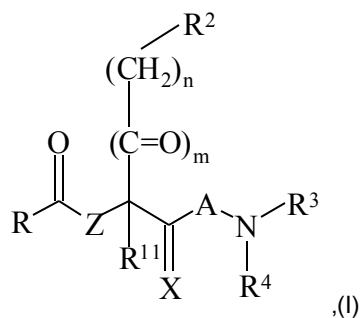


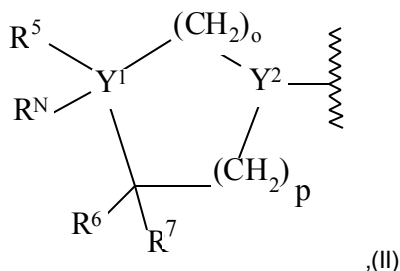
# 1. Модифіковані амінокислоти загальної формули (I)



у якій

R означає нерозгалужений алкіл з 1-3 атомами вуглецю, що на кінці заміщений циклоалкілом з 5-7 атомами вуглецю, однією або двома фенільними групами, 1-нафтилом, 2-нафтилом або 4-біфенілом, причому зазначені ароматичні залишки додатково можуть бути заміщені атомом фтору, хлору або бромом, метилом, метоксигрупою, аміногрупою або ацетиламіногрупою, 2-піролілом, 3-піролілом, піридинілом, 1Н-індол-3-ілом, хінолінілом або ізохінолінілом;

незаміщену або заміщену по атому азоту метилом або етилом нерозгалужену алкіламіногрупу з 1-4 атомами вуглецю, що на кінці заміщена циклоалкілом з 5-7 атомами вуглецю, фенілом, що може бути моно- або дизаміщений атомами фтору, хлору або бромом, метилом, нітрогрупою, метоксигрупою, трифторметилом, гідроксилом, аміногрупою або ацетиламіногрупою, причому замісники можуть бути однаковими або різними, 2-піролілом, 3-піролілом, піридинілом, 1Н-індол-3-ілом, хінолінілом або ізохінолінілом, або залишок формули (II)



де

p означає числа 1 або 2;

o означає число 2 або, якщо Y<sup>1</sup> і Y<sup>2</sup> одночасно не є атомами азоту, також число 1;

Y<sup>1</sup> означає атом азоту, якщо R<sup>5</sup> являє собою вільну електронну пару, або атом вуглецю,

Y<sup>2</sup> означає атом азоту або метинову групу,

R<sup>5</sup> означає вільну електронну пару, якщо Y<sup>1</sup> являє собою атом азоту, або, якщо Y<sup>1</sup> являє собою атом вуглецю,

означає атом водню, алкіл з одним або двома атомами вуглецю, ціаногрупу або феніл,

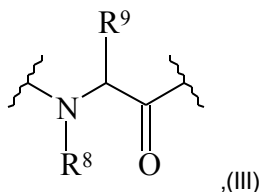
R<sup>6</sup> означає атом водню або, якщо Y не є атомом азоту, також разом з R<sup>5</sup> означає додатковий зв'язок,

R<sup>7</sup> означає атом водню або, якщо Y<sup>1</sup> не є атомом азоту і R<sup>5</sup> і R<sup>6</sup> разом являють собою додатковий зв'язок, також разом з R<sup>N</sup> означає 1,4-бутадієніленову групу,

R<sup>N</sup> означає атом водню, алкіл з 1-3 атомами вуглецю, що на кінці може бути заміщений однією або двома фенільними або піридинільними групами, причому замісники можуть бути однаковим або різними, або гідроксилом або метоксигрупою, феніл, що може бути моно- або дизаміщений атомами фтору, хлору або бромом, метилом, нітрогрупою, метоксигрупою, етоксигрупою, трифторметилом, гідроксилом або ціаногрупою, причому замісники можуть бути однаковими або різними, заміщений метилендіоксигрупою феніл, 2-піридиніл, 4-піридиніл, аміногрупу, бензоїламіногрупу, амінокарбоніл, метиламінокарбоніл, метоксикарбоніл, етоксикарбоніл, амінокарбоніламіногрупу, метиламінокарбоніламіногрупу, N-(амінокарбоніл)-N-метиламіногрупу, N-(метиламінокарбоніл)-N-метиламіногрупу, N-(амінокарбоніл)-N-(4-фторфеніл)аміногрупу, N-(метиламінокарбоніл)-N-феніламіногрупу, феніламінокарбоніламіногрупу, [N-феніл(метиламіно)]карбоніламіногрупу, N-(феніламінокарбоніл)-N-метиламіногрупу, N-(феніламінокарбоніл)-N-феніламіногрупу,

бензоїламінокарбоніламіногрупу, N-(амінокарбоніл)-N-феніламіногрупу, незаміщену або заміщену по фенільному кільцю амінокарбоніламіногрупою або метилсульфоніламіногрупою феніламіногрупу, 1,3-дигідро-4-феніл-2Н-2-

оксоімідазол-1-іл, 1,3-дигідро-4-(3-тієніл)-2Н-2-оксоімідазол-1-іл, 1,3-дигідро-5-феніл-2Н-2-оксоімідазол-1-іл, 1,3-дигідро-2(2Н)-оксобензімідазол-1-іл, 1,3,3а,4,5,6,7,7а-октагідро-2(2Н)-оксобензімідазол-1-іл, 1Н-індол-3-іл, 2,4(1Н,3Н)-діоксохіназолін-3-іл, 1,3-дигідро-2(2Н)-оксоімідазо[4,5-*d*]піридин-3-іл, 1,3(2Н)-діоксо-1Н-ізоіндол-2-іл, 1Н-бензімідазол-1-іл, 3,4-дигідро-2(1Н)-оксохіназолін-3-іл, 3,4-дигідро-2(1Н)-оксохіназолін-1-іл, 2(3Н)-оксобензоксазол-3-іл, 1,3-дигідро-2(2Н)-оксоімідазо[4,5-*d*]піримідин-3-іл, 2,3,4,5-тетрагідро-2(1Н)-оксо-1,3-бензодіазепін-3-іл, 3,4-дигідро-2(1Н)-оксопіридо[2,3-*d*]піримідин-3-іл, 2(1Н)-оксохінолін-3-іл, 3,4-дигідро-2(1Н)-оксохінолін-3-іл, 2(1Н)-оксохіноксалін-3-іл, 3,4,4а,5,6,7,8,8а-октагідро-2(1Н)-оксохіназолін-3-іл, 1,1-діоксидо-3(4Н)-оксо-1,2,4-бензотіадіазин-2-іл, 2,4(1Н,3Н)-діоксотієно[3,4-*d*]піримідин-3-іл, 3,4-дигідро-2(1Н)-оксотієно[3,4-*d*]піримідин-3-іл, 3,4-дигідро-2(1Н)-оксотієно[3,2-*d*]піримідин-3-іл, 2,4-дигідро-5-феніл-3(3Н)-оксо-1,2,4-триазол-2-іл, 1,3-дигідро-5-метил-4-феніл-2(2Н)-оксоімідазол-1-іл, 2,5-діоксо-4-фенілімідазолідин-1-іл, 2,5-діоксо-4-(фенілметил)імідазолідин-1-іл, 3,4-дигідро-2,2-діоксидо-2,1,3-бензотіадіазин-3-іл, 1,3-дигідро-4-(4-біфеніліл)-2(2Н)-оксоімідазол-1-іл, 1,3-дигідро-4-(2-нафтил)-2(2Н)-оксоімідазол-1-іл, 1,3-дигідро-4,5-дифеніл-2(2Н)-оксоімідазол-1-іл, 1,3-дигідро-2(2Н)-оксоімідазо[4,5-*c*]хінолін-3-іл, 4-феніл-2(1Н)-оксопіримідин-1-іл, 4-[3,4-дигідро-2(1Н)-оксохіназолін-3-іл]-1-піперидиніл, 3,4-дигідро-2(1Н)-оксопіридо[3,4-*d*]піримідин-3-іл, 3,4-дигідро-2(1Н)-оксопіридо[4,3-*d*]піримідин-3-іл або 2,3-дигідро-4(1Н)-оксохіназолін-3-іл, причому вищевказані моно- і бігетероцикли біля одного з атомів азоту можуть бути заміщені метоксикарбонілметилом, і/або вищевказані моно- і бігетероцикли у вуглецевому скелеті і/або в групах, що містяться в цих залишках фенільних груп, можуть бути моно-, ди- або тризамещені атомами фтору, хлору або бром, метилом, трифторметилом, метоксигрупою, гідроксилом, аміногрупою, нітрогрупою, фенілом, фенілметилом, карбоксилом, метоксикарбонілом, етоксикарбонілом, амінокарбонілом, метиламінокарбонілом, гідроксietiламінокарбонілом, (4-морфолініл)карбонілом, (1-піперидиніл)карбонілом або (4-метил-1-піперазиніл)-карбонілом, причому замісники можуть бути однаковими або різними і виключене багаторазове заміщення за допомогою зазначених останніх трьох замісників, або, якщо  $Y^1$  не є атомом азоту і  $R^5$  і  $R^6$  разом являють собою додатковий зв'язок,  $R^N$  разом з  $R^7$  також означає 1,4-бутадієніленову групу; або, якщо  $Y^1$  являє собою атом вуглецю,  $R^N$  разом з  $R^5$  при включенні  $Y^1$  означає також карбоніл або насичений або однократно ненасичений п'яти- або шестичленний 1,3-діагетероцикл, що може містити в циклі одну карбонільну групу, сусідню з одним з атомів азоту, по одному з атомів азоту може бути заміщений фенілом, і, якщо він ненасичений, може бути також конденсований по подвійному зв'язку з бензольним кільцем; Х означає атом кисню або два атоми водню; Z означає метиленову групу або групу  $-NR^{1-}$ , в якій  $R^1$  означає атом водню або метил;  $R^{11}$  означає атом водню, метоксикарбоніл, етоксикарбоніл або метил, n означає число 1 і m означає число 0; або n означає число 0 і m означає число 1;  $R^2$  означає феніл, 1-нафтил, 2-нафтил, 1,2,3,4-тетрагідро-1-нафтил, 1Н-індол-3-іл, 1-метил-1Н-індол-3-іл, 1-(1,1-диметилетоксикарбоніл)-1Н-індол-3-іл, 2-тієніл, 3-тієніл, тіазоліл або алкілтіазоліл з 1-3 атомами вуглецю в алкільній частині, піридиніл або хінолініл, причому вищевказані фенільні і нафтильні залишки можуть бути моно-, ди- або тризамещені атомами фтору, хлору або бром, розгалуженими або нерозгалуженими алкільними групами з кількістю атомів вуглецю до п'яти, алкоксигрупами з 1-3 атомами вуглецю, вінілом, алілом, трифторметилом, метилсульфонілоксигрупою, 2-(диметиламіно)етоксигрупою, гідроксилом, ціаногрупою, нітрогрупою або аміногрупою, тетразолілом, фенілом, піридинілом, тіазолілом або фурилом, при цьому замісники можуть бути однаковими або різними і виключене багаторазове заміщення за допомогою зазначених останніх п'яти замісників, А означає зв'язок або зв'язаний через карбонільну групу з  $NR^3R^4$ -групою загальної формули (I) двовалентний залишок формули (III):



де

$R^8$  і  $R^9$  разом означають н-пропіленову групу,

або

$R^8$  означає атом водню або метил, і

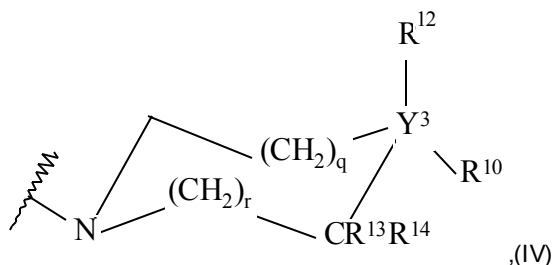
$R^9$  означає атом водню або нерозгалужений алкіл з 1-4 атомами вуглецю, що на кінці може бути заміщений аміногрупою, метиламіногрупою, диметиламиногрупою, аміноімінометиламиногрупою або амінокарбоніламиногрупою, причому у вищевказаних замісниках зв'язаний з атомом азоту атом водню може бути замінений захисною групою, наприклад, фенілметоксикарбонілом або трет.-бутилоксикарбонілом,

$R^3$  означає атом водню або алкіл з 1-4 атомами вуглецю, незаміщений або на кінці заміщений аміногрупою, метиламіногрупою, диметиламиногрупою або 4-(1-піперидиніл)-1-піперидинілом,

$R^4$  означає атом водню, метил або етил,

або

$R^3$  і  $R^4$  разом із включеним атомом азоту означають залишок загальної формули (IV):



де

$Y^3$  означає атом вуглецю або, якщо  $R^{12}$  являє собою вільну електронну пару, також атом азоту;

$r$  означає число 1;

$q$  означає число 1;

$R^{10}$  означає атом водню, алкіл, діалкіламиногрупу, аміноалкіл, алкіламиноалкіл, діалкіламиноалкіл, феніламинокарбоніламиногрупу, алкоксикарбоніл, алкоксикарбонілметил, карбоксиметил, карбоксил або циклоалкіл з 4-7 атомами вуглецю в циклі, бензоїл, піридинілкарбоніл, феніл, піридиніл і діазиніл, що у вуглецевому скелеті можуть бути заміщені атомом фтору, хлору або бром, ацетилом, метилом, етилом, метоксигрупою або диметиламиноалкілом з 1-4 атомами вуглецю в алкільній частині, незаміщеним або заміщеним в алкільному залишку гідроксилом, зв'язаний через атом азоту 1,3-дигідро-2-оксо-2H-імідазоліл, що може бути конденсований по подвійному зв'язку з бензольним або піридиновим кільцем, 1-піролідиніл, 1-піперидиніл, 4-(диметиламіно)-1-піперидиніл, 4-піперидиніл або 4-морфолініл, причому атом азоту 4-піперидинілу може бути заміщений алканоїлом або алкілом, відповідно, з 1-7 атомами вуглецю, бензоїлом, метилсульфонілом, 3-карбоксипропіонілом, циклопропілметилом, алкоксикарбонілметилом, карбоксиметилом або захисною групою, наприклад, фенілметоксикарбонілом або трет.-бутилоксикарбонілом, гексагідро-1H-1-азепініл, 8-метил-8-азабіцикло[3.2.1]окт-3-ил, 4-алкіл-1-піперазиніл, гексагідро-4-алкіл-1H-1,4-діазепін-1-іл, 1-алкіл-4-піперидинілкарбоніл або 4-алкіл-1-піперазинілкарбоніл, або

$R^{10}$  разом з  $R^{12}$  і  $Y^3$  означає п'ятичленний циклоаліфатичний залишок, у якому одна метиленова група може бути заміщена іміногрупою або метиліміногрупою,

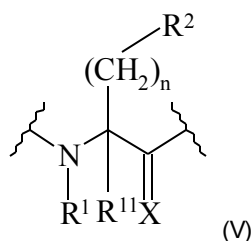
$R^{12}$  означає атом водню, алкіл з одним або двома атомами вуглецю, що на кінці може бути заміщений 1-піролідинілом, 1-піперидинілом або 4-метил-1-піперазинілом, метоксикарбоніл, етоксикарбоніл, ціаногрупу, вільну електронну пару, якщо  $Y^3$  являє собою атом азоту, кожний з  $R^{13}$  і  $R^{14}$  означає атом водню;

або, якщо  $Y^3$  означає атом вуглецю, то  $R^{12}$  разом з  $R^{14}$  також означає вуглець-вуглецевий зв'язок, причому  $R^{10}$  має вищевказане значення і  $R^{13}$  являє собою атом водню; або,

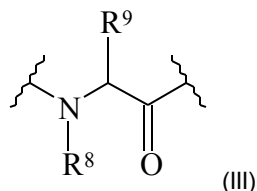
якщо  $Y^3$  означає атом вуглецю, то  $R^{12}$  разом з  $R^{14}$  також означає вуглець-вуглецевий зв'язок і  $R^{10}$  разом з  $R^{13}$  і включеним подвійним зв'язком означає приконденсовану через п'ятичленний цикл індольну групу, причому усі вищевказані алкільні групи, а також наявні в інших зазначених залишках алкільні групи, якщо не зазначено нічого іншого, можуть містити 1-3 атоми вуглецю;

за умови, що A не означає зв'язок, якщо R означає нерозгалужений алкіл з 1-3 атомами вуглецю, незаміщений або на кінці заміщений арилом з числа фенілу, 1-нафтилу і 2-нафтилу, незаміщених або заміщених атомом фтору, хлору або бромом, метилом, метоксигрупою, аміно- або ацетиламіногрупою, X означає атом кисню, Z означає метиліміногрупу, m означає число 0, n означає число 1,  $R^2$  означає арил з числа фенілу, 1-нафтилу і 2-нафтилу, незаміщених або моно-, ди- або тризаміщених атомами фтору, хлору або бромом, нерозгалуженим або розгалуженим алкілом з 1-5 атомами вуглецю, алкоксигрупою з 1-3 атомами вуглецю, трифторметилом, гідроксилом, нітро-, аміно- або ціаногрупою, при цьому замісники можуть бути однаковими або різними,  $R^3$  означає алкіл з 1-4 атомами вуглецю, заміщений на кінці аміногрупою, і  $R^4$  і  $R^{11}$  означають атом водню; їх таутомери, діастереомери, енантіомери і солі.

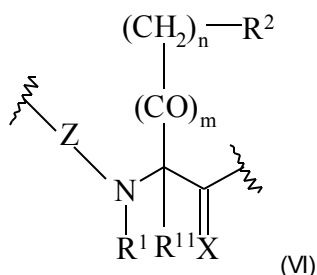
2. Модифіковані амінокислоти загальної формули (I) за п. 1, в яких часткова амінокислотна структура формули (V)



має D-, відповідно, (R)-конфігурацію й щодо можливо наявної в залишку A часткової амінокислотної структури формули (III)



має L-, відповідно, (S)-конфігурацію, або в яких часткова структура формули (VI):



у просторовому відношенні аналогічна частковій структурі формули (V) у (R)-конфігурації.

3. Модифіковані амінокислоти загальної формули (I) за пп. 1 або 2, вибрані з групи, що включає

(А) 1-[N<sup>2</sup>-[3,5-дибром-N-[[4-(3,4-дигідро-2(1H)-оксохіназолін-3-іл)-1-піперидиніл]карбоніл]-D-тирозил]-L-лізил]-4-(4-піридиніл)піперазин,

(Б) 1-[4-аміно-3,5-дибром-N-[[4-(2,3,4,5-тетрагідро-2(1H)-оксо-1,3-бензодіазепін-3-іл)-1-піперидиніл]карбоніл]-D-фенілаланіл]-4-(1-піперидиніл)піперидин,

(В) 1-[N<sup>2</sup>-[4-аміно-3,5-дибром-N-[[4-(3,4-дигідро-2(1H)-оксохіназолін-3-іл)-1-піперидиніл]карбоніл]-D-фенілаланіл]-L-лізил]-4-(4-піридиніл)піперидин,

(Г) 1-[N<sup>2</sup>-[3,5-дибром-N-[[4-(1,3-дигідро-4-феніл-2(2Н)-оксоімідазол-1-іл)-1-піперидиніл]карбоніл]-D-тирозил]-L-лізил]-4-(4-піридиніл)піперазин,

(Д) 1-[N<sup>2</sup>-[4-аміно-3,5-дибром-N-[[4-(1,3-дигідро-4-феніл-2(2Н)-оксоімідазол-1-іл)-1-піперидиніл]карбоніл]-D-фенілаланіл]-L-лізил]-4-(4-піридиніл)піперазин,

(Е) 1-[3,5-дибром-N-[[4-(3,4-дигідро-2(1Н)-оксотієно[3,4-d]піримідин-3-іл)-1-піперидиніл]карбоніл]-D-тирозил]-4-(1-піперидиніл)піперидин,

(Є) 1-[4-аміно-3,5-дибром-N-[[4-(2,4-дигідро-5-феніл-3(3Н)-оксо-1,2,4-триазол-2-іл)-1-піперидиніл]карбоніл]-D-фенілаланіл]-4-(1-метил-4-піперидиніл)піперидин,

(Ж) 1-[4-аміно-3,5-дибром-N-[[4-(2,4-дигідро-5-феніл-3(3Н)-оксо-1,2,4-триазол-2-іл)-1-піперидиніл]карбоніл]-D-фенілаланіл]-4-(1-піперидиніл)піперидин,

(З) 1-[4-аміно-3,5-дибром-N-[[4-(2,4-дигідро-5-феніл-3(3Н)-оксо-1,2,4-триазол-2-іл)-1-піперидиніл]карбоніл]-D-фенілаланіл]-4-(1-метил-4-піперидиніл)піперазин,

(И) 1-[4-аміно-3,5-дибром-N-[[4-(3,4-дигідро-2(1Н)-оксотієно[3,2-d]піримідин-3-іл)-1-піперидиніл]карбоніл]-D-фенілаланіл]-4-(1-піперидиніл)піперидин,

(І) 1-[4-аміно-3,5-дибром-N-[[4-(1,3-дигідро-4-[3-трифторметил]феніл]-2(2Н)-оксоімідазол-1-іл)-1-піперидиніл]-D-фенілаланіл]-4-(1-етил-4-піперидиніл)піперидин,

(К) 1-[N-[[4-(1,3-дигідро-4-[3-(трифторметил)феніл]-2(2Н)-оксоімідазол-1-іл)-1-піперидиніл]карбоніл]-3-(4-піридиніл)-D,L-аланіл]-4-(4-піридиніл)піперазин,

(Л) 1-[4-аміно-3,5-дибром-N-[[4-(3,4-дигідро-2(1Н)-оксохіназолін-3-іл)-1-піперидиніл]карбоніл]-D-фенілаланіл]-4-(1-гексил-4-піперидиніл)піперидин,

(М) 1-[4-аміно-3,5-дибром-N-[[4-(3,4-дигідро-2(1Н)-оксохіназолін-3-іл)-1-піперидиніл]карбоніл]-D-фенілаланіл]-4-(1-циклопропілметил-4-піперидиніл)піперидин,

(Н) 1-[N-[[4-(3,4-дигідро-2(1Н)-оксохіназолін-3-іл)-1-піперидиніл]карбоніл]-3-(2-метил-4-тіазоліл)-D,L-аланіл]-4-(4-піридиніл)піперазин,

(О) 1-[N-[[4-(3,4-дигідро-2(1Н)-оксохіназолін-3-іл)-1-піперидиніл]карбоніл]-3-етеніл-D,L-фенілаланіл]-4-(гексагідро-1Н-1-азепініл)піперидин,

(П) (R,S)-1-[4-[4-(3,4-дигідро-2(1Н)-оксохіназолін-3-іл)-1-піперидиніл]-2-[(4-окси-3,5-диметилфеніл)метил]-1,4-діоксобутил]-4-(1-піперидиніл)піперидин,

(Р) 1-[N<sup>2</sup>-[N-[4-(4-фторфеніл)-1-оксобутил]-3,5-дибром-D-тирозил]-L-лізил]-4-(4-піридиніл)піперазин,

(С) 1-[4-аміно-3,5-дибром-N-[[4-[N-(амінокарбоніл)-N-феніламіно]-1-піперидиніл]карбоніл]-D-фенілаланіл]-4-(1-піперидиніл)піперидин,

(Т) амід 4-аміно-3,5-дибром-N<sup>2</sup>-[[4-(1,3-дигідро-2(2Н)-оксобензімідазол-1-іл)-1-піперидиніл]карбоніл]-N-метил-N-[3-(4-метил-1-піперазиніл)пропіл]-D-фенілаланіну,

(У) 1-[4-аміно-3,5-дибром-N-[[4-(3,4-дигідро-2(1Н)-оксохіназолін-3-іл)-1-піперидиніл]карбоніл]-D-фенілаланіл]-4-(5-метокси-4-піримідиніл)піперазин,

(Ф) 1-[4-аміно-3,5-дибром-N-[[4-(1,1-діоксидо-3(4Н)-оксо-1,2,4-бензотіадіазин-2-іл)-1-піперидиніл]карбоніл]-D-фенілаланіл]-4-(1-піперидиніл)піперидин,

(Х) 1-[4-аміно-3,5-дибром-N-[[4-[2(1Н)-оксохінолін-3-іл)-1-піперидиніл]карбоніл]-D-фенілаланіл]-4-(1-піперидиніл)піперидин,

(Ц) 1-[4-аміно-3,5-дибром-N-[[4-[3,4-дигідро-2(1Н)-оксохінолін-3-іл)-1-піперидиніл]карбоніл]-D-фенілаланіл]-4-[3-(диметиламіно)пропіл]піперазин,

(Ч) 1-[4-аміно-3,5-дибром-N-[[4-[3,4-дигідро-2(1Н)-оксохіназолін-3-іл)-1-піперидиніл]карбоніл]-D-фенілаланіл]-4-[4-метил-1-піперазиніл]піперидин,

(Ш) 1-[4-аміно-3,5-дибром-N-[[4-[3,4-дигідро-2(1Н)-оксохіназолін-3-іл)-1-піперидиніл]карбоніл]-D-фенілаланіл]-4-[[1-метил-4-піперидиніл]карбоніл]піперазин,

(Щ) 1-[4-аміно-3,5-дибром-N-[[4-[3,4-дигідро-2(1Н)-оксохіназолін-3-іл)-1-піперидиніл]карбоніл]-D-фенілаланіл]-4-[[1-метил-4-піперазиніл]карбоніл]піперазин,

(Ю) 1-[4-аміно-3,5-дибром-N-[[4-(3,4-дигідро-2(1H)-оксохіназолін-3-іл)-1-піперидиніл]карбоніл]-D-фенілаланіл]-4-[4-(диметиламіно)бутил]феніл]піперазин,

(Я) 1-[4-аміно-3,5-дибром-N-[[4-(3,4-дигідро-2(1H)-оксохіназолін-3-іл)-1-піперидиніл]карбоніл]-D-фенілаланіл]-4-[4-(диметиламіно)-1-піперидиніл]піперидин,

(АА) 1-[N<sup>2</sup>-[[4-(1,3-дигідро-4-феніл-2(2H)-оксоімідазол-1-іл)-1-піперидиніл]карбоніл]-N'-метил-D-триптил]-4-(4-метил-1-піперазиніл)піперидин,

(АБ) 1-[N<sup>2</sup>-[[4-(1,3-дигідро-4-феніл-2(2H)-оксоімідазол-1-іл)-1-піперидиніл]карбоніл]-N'-(1,1-диметилетоксикарбоніл)-D-триптил]-4-(1-метил-4-піперидиніл)піперидин,

(АВ) (R,S)-1-[4-[4-(3,4-дигідро-2(1H)-оксохіназолін-3-іл)-1-піперидиніл]-2-[(3,5-дибром-4-метилфеніл)метил]-1,4-діоксобутил]-4-(4-метил-1-піперазиніл)піперидин,

(АГ) (R,S)-1-[4-[4-(3,4-дигідро-2(1H)-оксохіназолін-3-іл)-1-піперидиніл]-2-[(3,5-дибром-4-метоксифеніл)метил]-1,4-діоксобутил]-4-(1-метил-4-піперидиніл)піперидин,

(АД) (R,S)-1-[4-[4-(3,4-дигідро-2(1H)-оксохіназолін-3-іл)-1-піперидиніл]-2-[(3,4-дибромфеніл)метил]-1,4-діоксобутил]-4-(4-метил-1-піперазиніл)піперидин,

(АЕ) 1-[N<sup>2</sup>-[N-[[[2-(3-метоксифеніл)етил]аміно]карбоніл]-3,5-дибром-D-тирозил]-L-лізил]-4-(4-піридиніл)піперазин,

(АЄ) 1-[N<sup>2</sup>-[N-[[[2-(3-метоксифеніл)етил]аміно]карбоніл]-3,5-дибром-D-тирозил]-L-аргініл]-4-(4-піридиніл)піперазин,

(АЖ) 1-[N<sup>2</sup>-[N-[[4-(1,3-дигідро-2(2H)-оксобензімідазол-1-іл)-1-піперидиніл]карбоніл]-3,5-дибром-D-тірозил]-L-лізил]-4-(4-піридиніл)піперазин,

(АЗ) амід 3,5-дибром-N<sup>2</sup>-[[4-(1,3-дигідро-2(2H)-оксобензімідазол-1-іл)-1-піперидиніл]карбоніл]-N,N-діетил-D-тироzinу,

(АИ) амід 3,5-дибром-N<sup>2</sup>-[[4-(1,3-дигідро-2(2H)-оксобензімідазол-1-іл)-1-піперидиніл]карбоніл]-N-[(4-диметиламіно)бутил]-D-тироzinу,

(АІ) 1-[4-аміно-3,5-дибром-N-[[4-(1,3-дигідро-6-оксі-2(2H)-оксобензімідазол-1-іл)-1-піперидиніл]карбоніл]-D-фенілаланіл]-4-(1-піперидиніл)піперидин,

(АК) 1-[N<sup>2</sup>-[4-аміно-3,5-дибром-N-[[4-(1,3-дигідро-2(2H)-оксобензімідазол-1-іл)-1-піперидиніл]карбоніл]-D-фенілаланіл]-N<sup>6</sup>,N<sup>6</sup>-диметил-L-лізил]-4-(4-піридиніл)піперазин,

(АЛ) 1-[N<sup>2</sup>-[4-аміно-3,5-дибром-N-[[4-(3,4-дигідро-2(1H)-оксохіназолін-3-іл)-1-піперидиніл]карбоніл]-D-фенілаланіл]-N<sup>6</sup>,N<sup>6</sup>-диметил-L-лізил]-4-(4-піридиніл)піперазин, (АМ) (R,S)-1-[2-(4-аміно-3,5-дибромбензоїл)-4-[4-(3,4-дигідро-2(1H)-оксохіназолін-3-іл)-1-піперидиніл]-4-оксобутил]-4-(1-піридиніл)піперидин,

(АН) 1-[4-аміно-3,5-дибром-N-[[4-(3,4-дигідро-2,2-діоксидо-2,1,3-бензотіадіазин-3-іл)-1-піперидиніл]карбоніл]-D-фенілаланіл]-4-(1-піридиніл)піперидин,

(АО) 1-[4-аміно-3,5-дибром-N-[[4-[1,3-дигідро-2(2H)-оксіімідазо[4,5-з]хінолін-3-іл)-1-піперидиніл]карбоніл]-D-фенілаланіл]-4-(1-піперидиніл)карбоніл]піперидин і

(АП) (R,S)-1-[4-(2,4-дигідро-5-феніл-3(3H)-оксотриазол-2-іл)-1-піперидиніл]-2-[[3-(трифторметил)феніл]метил]-1,4-діоксобутил]-4-(1-метил-4-піперидиніл)піперидин,

їх тауомери, діастереомери, енантіомери, суміші і їх солі.

4. Модифіковані амінокислоти загальної формули (I) за пп. 1 або 2, вибрані з групи, що включає

(А) 1-[N<sup>2</sup>[3,5-дибром-N-[[4-(3,4-дигідро-2(1H)-оксохіназолін-3-іл)-1-піперидиніл]карбоніл]-D-тирозил]-L-лізил]-4-(4-піридиніл)піперазин,

(Б) 1-[4-аміно-3,5-дибром-N-[[4-(2,3,4,5-тетрагідро-2(1H)-оксо-1,3-бензодіазепін-3-іл)-1-піперидиніл]карбоніл]-D-фенілаланіл]-4-(1-піперидиніл)піперидин,

їх тауомери, діастереомери, енантіомери, суміші і їх солі.

5. Модифіковані амінокислоти загальної формули (I) за будь-яким з пп. 1-4, що є фізіологічно прийнятними солями з неорганічними або органічними кислотами або основами.