# (19) World Intellectual Property Organization International Bureau





(43) International Publication Date 9 October 2008 (09.10.2008) (10) International Publication Number WO 2008/121634 A2

- (51) International Patent Classification: Not classified
- (21) International Application Number:

PCT/US2008/058183

- (22) International Filing Date: 26 March 2008 (26.03.2008)
- (25) Filing Language: English
- (26) Publication Language: English
- (30) Priority Data:

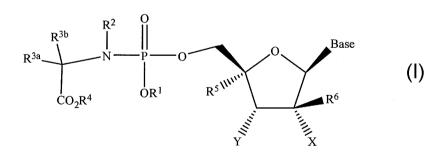
60/909,315	30 March 2007 (30.03.2007)	US
60/982,309	24 October 2007 (24.10.2007)	US
12/053,015	21 March 2008 (21.03.2008)	US

- (71) Applicant (for all designated States except US): PHAR-MASSET, INC. [US/US]; 303a College Road East, Princeton, NJ 08540 (US).
- (72) Inventors; and
- (75) Inventors/Applicants (for US only): SOFIA, Michael, J. [US/US]; 3066 Antler Drive, Doylestown, PA 18902 (US). DU, Jinfa [US/US]; 1206 Reins Circle, New Hope, PA 18938 (US). WANG, Peiyuan [CN/US]; 20 Radburn Road, Glen Rock, NJ 07452 (US). NAGARATHNAM, Dhanapalan [US/US]; 52 Virginia Rail Drive, Bethany, CT 06524 (US).

- (74) Agent: KOWALCHYK, Katherine, M.; Merchant & Gould P.c., P.O. Box 2903, Minneapolis, MA 55402-0903 (US).
- (81) Designated States (unless otherwise indicated, for every kind of national protection available): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SV, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.
- (84) Designated States (unless otherwise indicated, for every kind of regional protection available): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), Eurasian (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MT, NL, NO, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

#### Published:

- without international search report and to be republished upon receipt of that report
- (54) Title: NUCLEOSIDE PHOSPHORAMIDATE PRODRUGS



(57) Abstract: Disclosed herein are phosphoramidate prodrugs of nucleoside derivatives for the treatment of viral infections in mammals, which is a compound, its stereoisomer, salt (acid or basic addition salt), hydrate, solvate, or crystalline form thereof, represented by the following structure: Also disclosed are methods of treatment, uses, and processes for preparing each of which utilize the compound represented by formula (I).

WO 2008/121634 PCT/US2008/058183

## NUCLEOSIDE PHOSPHORAMIDATE PRODRUGS

This application is being filed on March 25, 2008, as a PCT International Patent application in the name of Pharmasset, Inc., a U.S. national corporation, applicant for the designation of all countries except the US, and Michael Joseph Sofia, a citizen of the U.S.; Jinfa Du, a citizen of the U.S.; Peiyuan Wang, a citizen of the People's Republic of China; and Dhanapalan Nagarathnam, a citizen of the U.S.; applicants for the designation of the US only, and claims priority to U.S. Provisional Application Nos. 60/909,315, filed March 30, 2007; 60/982,309, filed October 24, 2007; and U.S. Non-Provisional Application No. 12/053,015, filed March 21, 2008. The contents of each of the above-noted applications is hereby incorporated by reference in its entirety.

### Field of Invention

5

10

The present invention pertains to nucleoside phosphoramidates and their use as agents for treating viral diseases. These compounds are inhibitors of RNA-dependent RNA viral replication and are useful as inhibitors of HCV NS5B polymerase, as inhibitors of HCV replication and for treatment of hepatitis C infection in mammals. The invention provides novel chemical compounds, and the use of these compounds alone or in combination with other antiviral agents for treating HCV infection.

## **Background**

Hepatitis C virus (HCV) infection is a major health problem that leads to chronic liver disease, such as cirrhosis and hepatocellular carcinoma, in a

IPR2018-00126 Page 2 of 751 I-MAK 1005

substantial number of infected individuals, estimated to be 2-15% of the world's population. There are an estimated 4.5 million infected people in the United States alone, according to the U.S. Center for Disease Control. According to the World Health Organization, there are more than 200 million infected individuals 5 worldwide, with at least 3 to 4 million people being infected each year. Once infected, about 20% of people clear the virus, but the rest can harbor HCV the rest of their lives. Ten to twenty percent of chronically infected individuals eventually develop liver-destroying cirrhosis or cancer. The viral disease is transmitted parenterally by contaminated blood and blood products. 10 contaminated needles, or sexually and vertically from infected mothers or carrier mothers to their offspring. Current treatments for HCV infection, which are restricted to immunotherapy with recombinant interferon-α alone or in combination with the nucleoside analog ribavirin, are of limited clinical benefit. Moreover, there is no established vaccine for HCV. Consequently, there is an 15 urgent need for improved therapeutic agents that effectively combat chronic HCV infection.

The HCV virion is an enveloped positive-strand RNA virus with a single oligoribonucleotide genomic sequence of about 9600 bases which encodes a polyprotein of about 3,010 amino acids. The protein products of the HCV gene consist of the structural proteins C, E1, and E2, and the non-structural proteins NS2, NS3, NS4A and NS4B, and NS5A and NS5B. The nonstructural (NS) proteins are believed to provide the catalytic machinery for viral replication. The NS3 protease releases NS5B, the RNA-dependent RNA polymerase from the polyprotein chain. HCV NS5B polymerase is required for the synthesis of a double-stranded RNA from a single-stranded viral RNA that serves as a template

WO 2008/121634 Docket No. 60137.0034WOU1

in the replication cycle of HCV. Therefore, NS5B polymerase is considered to be an essential component in the HCV replication complex (K. Ishi, et al, *Heptology*, 1999, 29: 1227-1235; V. Lohmann, et al., *Virology*, 1998, 249: 108-118). Inhibition of HCV NS5B polymerase prevents formation of the double-stranded HCV RNA and therefore constitutes an attractive approach to the development of HCV-specific antiviral therapies.

HCV belongs to a much larger family of viruses that share many common features.

#### Flaviviridae Viruses

10 The Flaviviridae family of viruses comprises at least three distinct genera: pestiviruses, which cause disease in cattle and pigs; flavivruses, which are the primary cause of diseases such as dengue fever and yellow fever; and hepaciviruses, whose sole member is HCV. The flavivirus genus includes more than 68 members separated into groups on the basis of serological relatedness 15 (Calisher et al., J. Gen. Virol, 1993,70,37-43). Clinical symptoms vary and include fever, encephalitis and hemorrhagic fever (Fields Virology, Editors: Fields, B. N., Knipe, D. M., and Howley, P. M., Lippincott-Raven Publishers, Philadelphia, PA, 1996, Chapter 31, 931-959). Flaviviruses of global concern that are associated with human disease include the Dengue Hemorrhagic Fever 20 viruses (DHF), yellow fever virus, shock syndrome and Japanese encephalitis virus (Halstead, S. B., Rev. Infect. Dis., 1984, 6, 251-264; Halstead, S. B., Science, 239:476-481, 1988; Monath, T. P., New Eng. J. Med, 1988, 319, 64 1-643).

The pestivirus genus includes bovine viral diarrhea virus (BVDV), classical swine fever virus (CSFV, also called hog cholera virus) and border disease virus (BDV) of sheep (Moennig, V. et al. *Adv. Vir. Res.* 1992, 41, 53-98). Pestivirus infections of domesticated livestock (cattle, pigs and sheep) cause significant economic losses worldwide. BVDV causes mucosal disease in cattle and is of significant economic importance to the livestock industry (Meyers, G. and Thiel, H.J., Advances in Virus Research, 1996, 47, 53-118; Moennig V., et al, Adv. Vir. Res. 1992, 41, 53-98). Human pestiviruses have not been as extensively characterized as the animal pestiviruses. However, serological surveys indicate considerable pestivirus exposure in humans.

Pestiviruses and hepaciviruses are closely related virus groups within the Flaviviridae family. Other closely related viruses in this family include the GB virus A, GB virus A-like agents, GB virus-B and GB virus-C (also called hepatitis G virus, HGV). The hepacivirus group (hepatitis C virus; HCV)

15 consists of a number of closely related but genotypically distinguishable viruses that infect humans. There are at least 6 HCV genotypes and more than 50 subtypes. Due to the similarities between pestiviruses and hepaciviruses, combined with the poor ability of hepaciviruses to grow efficiently in cell culture, bovine viral diarrhea virus (BVDV) is often used as a surrogate to study the HCV virus.

The genetic organization of pestiviruses and hepaciviruses is very similar. These positive stranded RNA viruses possess a single large open reading frame (ORF) encoding all the viral proteins necessary for virus replication.

These proteins are expressed as a polyprotein that is co- and post-translationally

2983472-1 - 4 -

processed by both cellular and virus-encoded proteinases to yield the mature viral proteins. The viral proteins responsible for the replication of the viral genome RNA are located within approximately the carboxy-terminal. Two-thirds of the ORF are termed nonstructural (NS) proteins. The genetic

- organization and polyprotein processing of the nonstructural protein portion of the ORF for pestiviruses and hepaciviruses is very similar. For both the pestiviruses and hepaciviruses, the mature nonstructural (NS) proteins, in sequential order from the amino-terminus of the nonstructural protein coding region to the carboxy-terminus of the ORF, consist of p7, NS2, NS3, NS4A, NS4B, NS5A, and NS5B.
- The NS proteins of pestiviruses and hepaciviruses share sequence domains that are characteristic of specific protein functions. For example, the NS3 proteins of viruses in both groups possess amino acid sequence motifs characteristic of serine proteinases and of helicases (Gorbalenya et al., *Nature*, 1988, 333, 22; Bazan and Fletterick *Virology*, 1989,171,637-639; Gorbalenya et al., *Nucleic Acid Res.*,1989, 17, 3889-3897). Similarly, the NS5B proteins of pestiviruses and hepaciviruses have the motifs characteristic of RNA-directed RNA polymerases (Koonin, E.V. and Dolja, V.V., *Crir. Rev. Biochem. Molec. Biol.* 1993, 28, 375-430).
- The actual roles and functions of the NS proteins of pestiviruses and hepaciviruses in the lifecycle of the viruses are directly analogous. In both cases, the NS3 serine proteinase is responsible for all proteolytic processing of polyprotein precursors downstream of its position in the ORF (Wiskerchen and Collett, *Virology*, 1991, 184, 341-350; Bartenschlager et al., *J. Virol.* 1993, 67,

2983472-1

5

3835-3844; Eckart et al. Biochem. Biophys. Res. Comm. 1993,192, 399-406; Grakoui et al., J. Virol. 1993, 67, 2832-2843; Grakoui et al., Proc. Natl. Acad Sci. USA 1993, 90, 10583-10587; Hijikata et al., J. Virol. 1993, 67, 4665-4675; Tome et al., J. Virol., 1993, 67, 4017-4026). The NS4A protein, in both cases, 5 acts as a cofactor with the NS3 serine protease (Bartenschlager et al., J. Virol. 1994, 68, 5045-5055; Failla et al., J. Virol. 1994, 68, 3753-3760; Xu et al., J. Virol., 1997, 71:53 12-5322). The NS3 protein of both viruses also functions as a helicase (Kim et al., Biochem. Biophys. Res. Comm., 1995, 215, 160-166; Jin and Peterson, Arch. Biochem. Biophys., 1995, 323, 47-53; Warrener and Collett. 10 J. Virol. 1995, 69,1720-1726). Finally, the NS5B proteins of pestiviruses and hepaciviruses have the predicted RNA-directed RNA polymerases activity (Behrens et al., EMBO, 1996, 15, 12-22; Lechmann et al., J. Virol., 1997, 71, 8416-8428; Yuan et al., Biochem. Biophys. Res. Comm. 1997, 232, 231-235; Hagedorn, PCT WO 97/12033; Zhong et al, J. Virol., 1998, 72, 9365-9369).

Currently, there are limited treatment options for individuals infected with hepatitis C virus. The current approved therapeutic option is the use of immunotherapy with recombinant interferon-α alone or in combination with the nucleoside analog ribavirin. This therapy is limited in its clinical effectiveness and only 50% of treated patients respond to therapy. Therefore, there is significant need for more effective and novel therapies to address the unmet medical need posed by HCV infection.

A number of potential molecular targets for drug development of direct acting antivirals as anti-HCV therapeutics have now been identified including, but not limited to, the NS2-NS3 autoprotease, the N3 protease, the N3 helicase

2983472-1

15

WO 2008/121634 Docket No. 60137.0034WOU1

and the NS5B polymerase. The RNA-dependent RNA polymerase is absolutely essential for replication of the single-stranded, positive sense, RNA genome and this enzyme has elicited significant interest among medicinal chemists.

Inhibitors of HCV NS5B as potential therapies for HCV infection have

been reviewed: Tan, S.-L., et al., *Nature Rev. Drug Discov.*, 2002, 1, 867-881;

Walker, M.P. et al., *Exp. Opin. Investigational Drugs*, 2003, 12, 1269-1280; Ni,

Z-J., et al., *Current Opinion in Drug Discovery and Development*, 2004, 7, 446-459; Beaulieu, P. L., et al., *Current Opinion in Investigational Drugs*, 2004, 5,

838-850; Wu, J., et al., *Current Drug Targets-Infectious Disorders*, 2003, 3,

207-219; Griffith, R.C., et al, *Annual Reports in Medicinal Chemistry*, 2004, 39,

223-237; Carrol, S., et al., *Infectious Disorders-Drug Targets*, 2006, 6, 17-29.

The potential for the emergence of resistant HCV strains and the need to identify agents with broad genotype coverage supports the need for continuing efforts to identify novel and more effective nucleosides as HCV NS5B inhibitors.

- Nucleoside inhibitors of NS5B polymerase can act either as a non-natural substrate that results in chain termination or as a competitive inhibitor which competes with nucleotide binding to the polymerase. To function as a chain terminator the nucleoside analog must be taken up by the cell and converted *in vivo* to a triphosphate to compete for the polymerase nucleotide binding site.
- This conversion to the triphosphate is commonly mediated by cellular kinases which imparts additional structural requirements on a potential nucleoside polymerase inhibitor. Unfortunately, this limits the direct evaluation of nucleosides as inhibitors of HCV replication to cell-based assays capable of *in situ* phosphorylation.

2983472-1

WO 2008/121634 Docket No. 60137.0034WOU1

In some cases, the biological activity of a nucleoside is hampered by its poor substrate characteristics for one or more of the kinases needed to convert it to the active triphosphate form. Formation of the monophosphate by a nucleoside kinase is generally viewed as the rate limiting step of the three 5 phosphorylation events. To circumvent the need for the initial phosphorylation step in the metabolism of a nucleoside to the active triphosphate analog, the preparation of stable phosphate prodrugs has been reported. Nucleoside phosphoramidate prodrugs have been shown to be precursors of the active nucleoside triphosphate and to inhibit viral replication when administered to 10 viral infected whole cells (McGuigan, C., et al., J. Med. Chem., 1996, 39, 1748-1753; Valette, G., et al., J. Med. Chem., 1996, 39, 1981-1990; Balzarini, J., et al., Proc. National Acad Sci USA, 1996, 93, 7295-7299; Siddiqui, A. Q., et al., J. Med. Chem., 1999, 42, 4122-4128; Eisenberg, E. J., et al., Nucleosides, Nucleotides and Nucleic Acids, 2001, 20, 1091-1098; Lee, W.A., et al., Antimicrobial Agents and Chemotherapy, 2005, 49, 1898); US 2006/0241064; 15 and WO 2007/095269.

Also limiting the utility of nucleosides as viable therapeutic agents is their sometimes poor physicochemical and pharmacokinetic properties. These poor properties can limit the intestinal absorption of an agent and limit uptake into the target tissue or cell. To improve on their properties prodrugs of nucleosides have been employed. It has been demonstrated that preparation of nucleoside phosphoramidates improves the systemic absorption of a nucleoside and furthermore, the phosphoramidate moiety of these "pronucleotides" is masked with neutral lipophilic groups to obtain a suitable partition coefficient to optimize uptake and transport into the cell dramatically enhancing the

10

intracellular concentration of the nucleoside monophosphate analog relative to administering the parent nucleoside alone. Enzyme-mediated hydrolysis of the phosphate ester moiety produces a nucleoside monophosphate wherein the rate limiting initial phosphorylation is unnecessary.

#### SUMMARY OF THE INVENTION

The present invention is directed toward novel phosphoramidate prodrugs of nucleoside derivatives for the treatment of viral infections in mammals, which is a compound, its stereoisomers, salts (acid or basic addition salts), hydrates, solvates, or crystalline forms thereof, represented by the following structure:

$$R^{3a}$$
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3a}$ 
 $R^{3a}$ 

wherein

- (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, n-alkyl; branched alkyl; cycloalkyl; or aryl, which includes, but is not limited to, phenyl or naphthyl, where phenyl or naphthyl are optionally substituted with at least one of C<sub>1-6</sub> alkyl, C<sub>2-6</sub> alkenyl, C<sub>2-6</sub> alkynyl, C<sub>1-6</sub> alkoxy, F, Cl, Br, I, nitro, cyano, C<sub>1-6</sub> haloalkyl, -N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, C<sub>1-6</sub> acylamino, -NHSO<sub>2</sub>C<sub>1-6</sub> alkyl, -SO<sub>2</sub>N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, COR<sup>1</sup>, and -SO<sub>2</sub>C<sub>1-6</sub> alkyl; (R<sup>1</sup> is independently hydrogen or alkyl, which includes, but is not limited to, C<sub>1-20</sub> alkyl, C<sub>1-10</sub> alkyl, or C<sub>1-6</sub> alkyl, R<sup>1</sup> is -OR' or -N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>);
  - (b)  $R^2$  is hydrogen,  $C_{1-10}$  alkyl,  $R^{3a}$  or  $R^{3b}$  and  $R^2$  together are  $(CH_2)_n$  so as to form a cyclic ring that includes the adjoining N and C atoms,  $C(O)CR^{3a}R^{3b}NHR^1$ , where n is 2 to 4 and  $R^1$ ,  $R^{3a}$ , and  $R^{3b}$ ;

2983472-1

- 9 -

- R<sup>3a</sup> and R<sup>3b</sup> are (i) independently selected from hydrogen, C<sub>1-10</sub> alkyl, cycloalkyl, - $(CH_2)_c(NR^3)_2$ ,  $C_{1-6}$  hydroxyalkyl, - $CH_2SH$ , - $(CH_2)_2S(O)_dMe$ , -(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>NHC(=NH)NH<sub>2</sub>, (1H-indol-3-yl)methyl, (1H-imidazol-4-yl)methyl, -(CH<sub>2</sub>)<sub>e</sub>COR<sup>3</sup>", aryl and aryl C<sub>1-3</sub> alkyl, said aryl groups optionally substituted 5 with a group selected from hydroxyl, C<sub>1-10</sub> alkyl, C<sub>1-6</sub> alkoxy, halogen, nitro and cyano; (ii) R<sup>3a</sup> and R<sup>3b</sup> both are C<sub>1-6</sub> alkyl; (iii) R<sup>3a</sup> and R<sup>3b</sup> together are(CH<sub>2</sub>)<sub>f</sub> so as to form a spiro ring; (iv) R<sup>3a</sup> is hydrogen and R<sup>3b</sup> and R<sup>2</sup> together are (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> so as to form a cyclic ring that includes the adjoining N and C atoms (v) R<sup>3b</sup> is hydrogen and R<sup>3a</sup> and R<sup>2</sup> together are (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> so as to form a cyclic ring that includes the adjoining N and C atoms, where c is 1 to 6, d is 0 to 2, e is 0 to 3, f 10 is 2 to 5, n is 2 to 4, and where R<sup>3'</sup> is independently hydrogen or C<sub>1-6</sub> alkyl and  $R^{3''}$  is -OR' or -N( $R^{3'}$ )<sub>2</sub>); (vi)  $R^{3a}$  is H and  $R^{3b}$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH2CH(CH3)2, CH(CH3)CH2CH3, CH2Ph, CH2-indol-3-yl, -CH2CH2SCH3, CH2CO2H, CH2C(O)NH2, CH2CH2COOH, CH2CH2C(O)NH2, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>-imidazol-4-yl, 15 CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl; or (viii) R<sup>3a</sup> is CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH2-indol-3-yl, -CH2CH2SCH3, CH2CO2H, CH2C(O)NH2, CH2CH2COOH, CH2CH2C(O)NH2, CH2CH2CH2CH2NH2, -CH2CH2CH2NHC(NH)NH2, CH2-20 imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl and R<sup>3b</sup> is H, where R<sup>3</sup> is independently hydrogen or alkyl, which includes, but is not limited to,  $C_{1-20}$  alkyl,  $C_{1-10}$  alkyl, or  $C_{1-6}$  alkyl,  $R^{3"}$  is -OR' or  $-N(R^{3'})_2);$
- (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, C<sub>1-10</sub> alkyl, C<sub>1-10</sub> alkyl optionally substituted with a lower alkyl, alkoxy, di(lower alkyl)-amino, or halogen, C<sub>1-10</sub> haloalkyl, C<sub>3-10</sub> cycloalkyl, cycloalkyl alkyl, cycloheteroalkyl, aminoacyl, aryl, such as phenyl, heteroaryl, such as, pyridinyl, substituted aryl, or substituted heteroaryl;
  - (e) R<sup>5</sup> is H, a lower alkyl, CN, vinyl, O-(lower alkyl), hydroxyl lower alkyl, i.e., -(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>OH, where p is 1 -6, including hydroxyl methyl (CH<sub>2</sub>OH), CH<sub>2</sub>F, N<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CN, CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>NHCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, alkyne (optionally substituted), or halogen, including F, Cl, Br, or I, with the provisos that when X

2983472-1

is OH, base is cytosine and R<sup>6</sup> is H, R<sup>5</sup> cannot be N<sub>3</sub> and when X is OH, R<sup>6</sup> is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F and B is a purine base, R<sup>5</sup> cannot be H;

- (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, F, or CN:
- (g) X is H, OH, F, OMe, halogen, NH<sub>2</sub>, or N<sub>3</sub>;
- 5 Y is OH, H,  $C_{1-4}$  alkyl,  $C_{2-4}$  alkenyl,  $C_{2-4}$  alkynyl, vinyl,  $N_3$ , CN, Cl, Br, F, I, NO<sub>2</sub>, OC(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), OC(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), OC(O)O(C<sub>2-4</sub> alkynyl),  $OC(O)O(C_{2-4}$  alkenyl),  $OC_{1-10}$  haloalkyl, O(aminoacyl),  $O(C_{1-10}$  acyl),  $O(C_{1-4} \text{ alkyl})$ ,  $O(C_{2-4} \text{ alkenyl})$ ,  $S(C_{1-4} \text{ acyl})$ ,  $S(C_{1-4} \text{ alkyl})$ ,  $S(C_{2-4} \text{ alkynyl})$ ,  $S(C_{2-4} \text{ alkynyl})$ ,  $S(C_{2-4} \text{ alkynyl})$ alkenyl), SO(C<sub>1-4</sub> acyl), SO(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO(C<sub>2-4</sub> alkynyl), SO(C<sub>2-4</sub> alkenyl), 10  $SO_2(C_{1-4} \text{ acyl})$ ,  $SO_2(C_{1-4} \text{ alkyl})$ ,  $SO_2(C_{2-4} \text{ alkynyl})$ ,  $SO_2(C_{2-4} \text{ alkenyl})$ ,  $OS(O)_2(C_{1-4} \text{ alkyl})$ 4 acyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>2-4</sub> alkenyl), NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1-4</sub> alkyl), NH(C<sub>2-4</sub> alkenyl), NH(C<sub>2-4</sub> alkynyl), NH(C<sub>1-4</sub> acyl), N(C<sub>1-4</sub> alkyl)<sub>2</sub>, N(C<sub>1-18</sub> acyl)<sub>2</sub>, wherein alkyl, alkynyl, alkenyl and vinyl are optionally substituted by N<sub>3</sub>, CN, one to three halogen (Cl, Br, F, I), NO<sub>2</sub>, C(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), C(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), 15  $C(O)O(C_{2-4} \text{ alkynyl}), C(O)O(C_{2-4} \text{ alkenyl}), O(C_{1-4} \text{ acyl}), O(C_{1-4} \text{ alkyl}), O(C_{2-4} \text{ alkyl})$ alkenyl), S(C<sub>1-4</sub> acyl), S(C<sub>1-4</sub> alkyl), S(C<sub>2-4</sub> alkynyl), S(C<sub>2-4</sub> alkenyl), SO(C<sub>1-4</sub> acyl),  $SO(C_{1-4} \text{ alkyl})$ ,  $SO(C_{2-4} \text{ alkynyl})$ ,  $SO(C_{2-4} \text{ alkenyl})$ ,  $SO_2(C_{1-4} \text{ acyl})$ ,  $SO_2(C_{1-4} \text{ alkyl}), SO_2(C_{2-4} \text{ alkynyl}), SO_2(C_{2-4} \text{ alkenyl}), OS(O)_2(C_{1-4} \text{ acyl}),$  $OS(O)_2(C_{1-4} \text{ alkyl}), OS(O)_2(C_{2-4} \text{ alkenyl}), NH_2, NH(C_{1-4} \text{ alkyl}), NH(C_{2-4} \text{ alkyl})$ 20 alkenyl), NH( $C_{2-4}$  alkynyl), NH( $C_{1-4}$  acyl), N( $C_{1-4}$  alkyl)<sub>2</sub>, N( $C_{1-4}$  acyl)<sub>2</sub>;

the base is a naturally occurring or modified purine or pyrimidine base represented by the following structures:

wherein

Z is N or  $CR^{12}$ ;

R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup>,R<sup>9</sup>, R<sup>10</sup>, and R<sup>11</sup> are independently H, F, Cl, Br, I, OH, OR', SH, SR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkenyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkynyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkynyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> such as C≡CH, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkynyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkoxy of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkoxy of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>H, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R',

wherein R' is an optionally substituted alkyl , which includes, but is not limited to, an optionally substituted  $C_{1-20}$  alkyl, an optionally substituted  $C_{1-10}$  alkyl, an optionally substituted lower alkyl; an optionally substituted cycloalkyl; an optionally substituted alkynyl of  $C_2$ - $C_6$ , an optionally substituted lower alkenyl of  $C_2$ - $C_6$ , or optionally substituted acyl, which includes but is not limited to C(O) alkyl,  $C(O)(C_{1-20}$  alkyl),  $C(O)(C_{1-10}$  alkyl), or C(O)(lower alkyl) or alternatively, in the instance of  $NR'_2$ , each R' comprise at least one C atom that are joined to form a heterocycle comprising at least two carbon atoms; and

R<sup>12</sup> is H, halogen (including F, Cl, Br, I), OH, OR', SH, SR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub> lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkenyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkenyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkynyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkynyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkoxy of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkoxy of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>H, CO<sub>2</sub>R',

25 CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R'; with the proviso

2983472-1

PCT/US2008/058183

that when base is represented by the structure c with  $R^{11}$  being hydrogen,  $R^{12}$  is not a: (i) -C = C - H, (ii)  $-C = C + H_2$ , or (iii)  $-NO_2$ .

#### **DEFINITIONS**

The phrase "a" or "an" entity as used herein refers to one or more of that entity; for example, a compound refers to one or more compounds or at least one compound. As such, the terms "a" (or "an"), "one or more", and "at least one" can be used interchangeably herein.

The phrase "as defined herein above" refers to the first definition provided in the Summary of the Invention.

The terms "optional" or "optionally" as used herein means that a subsequently described event or circumstance may but need not occur, and that the description includes instances where the event or circumstance occurs and instances in which it does not. For example, "optional bond" means that the bond may or may not be present, and that the description includes single, double, or triple bonds.

The term "independently" is used herein to indicate that a variable is applied in any one instance without regard to the presence or absence of a variable having that same or a different definition within the same compound. Thus, in a compound in which R appears twice and is defined as "independently carbon or nitrogen", both R's can be carbon, both R's can be nitrogen, or one R' can be carbon and the other nitrogen.

The term "alkenyl" refers to an unsubstituted hydrocarbon chain radical having from 2 to 10 carbon atoms having one or two olefinic double bonds, preferably one olefinic double bond. The term " $C_{2-N}$  alkenyl" refers to an alkenyl comprising 2 to N carbon atoms, where N is an integer having the following values: 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, or 10. The term " $C_{2-10}$  alkenyl" refers to an alkenyl comprising 2 to 10 carbon atoms. The term " $C_{2-4}$  alkenyl" refers to an alkenyl comprising 2 to 4 carbon atoms. Examples include, but are not limited to, vinyl, 1-propenyl, 2-propenyl (allyl) or 2-butenyl (crotyl).

15

20

25

10

15

20

25

30

The term "halogenated alkenyl" refers to an alkenyl comprising at least one of F, Cl, Br, and I.

The term "alkyl" refers to an unbranched or branched chain, saturated, monovalent hydrocarbon residue containing 1 to 30 carbon atoms. The term "C<sub>1-M</sub> alkyl" refers to an alkyl comprising 1 to M carbon atoms, where M is an integer having the following values: 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 27, 28, 29, or 30. The term "C<sub>1-4</sub> alkyl" refers to an alkyl containing 1 to 4 carbon atoms. The term "lower alkyl" denotes a straight or branched chain hydrocarbon residue comprising 1 to 6 carbon atoms. "C<sub>1-20</sub> alkyl" as used herein refers to an alkyl comprising 1 to 20 carbon atoms. "C<sub>1-10</sub> alkyl" as used herein refers to an alkyl comprising 1 to 10 carbons. Examples of alkyl groups include, but are not limited to, lower alkyl groups include methyl, ethyl, propyl, *i*-propyl, *n*-butyl, *i*-butyl, *t*-butyl or pentyl, isopentyl, neopentyl, hexyl, heptyl, and octyl. The term (ar)alkyl or (heteroaryl)alkyl indicate the alkyl group is optionally substituted by an aryl or a heteroaryl group respectively.

The term "cycloalkyl" refers to an unsubstituted or substituted carbocycle, in which the carbocycle contains 3 to 10 carbon atoms; preferably 3 to 8 carbon atoms; more preferably 3 to 6 carbon atoms (i.e., lower cycloalkyls). Examples of cycloalkyl groups include, but are not limited to, cyclopropyl, 2-methyl-cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, and cyclohexyl.

The term "cycloalkyl alkyl" refers to an additionally unsubstituted or substituted alkyl substituted by a lower cycloalkyl. Examples of cycloalkyl alkyls include, but are not limited to, any one of methyl, ethyl, propyl, i-propyl, n-butyl, i-butyl, t-butyl or pentyl, isopentyl, neopentyl, hexyl, heptyl, and octyl that is substituted with cyclopropyl, 2-methyl-cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, and cyclohexyl.

The term "cycloheteroalkyl" refers to an unsubstituted or substituted heterocycle, in which the heterocycle contains 2 to 9 carbon atoms; preferably 2 to 7 carbon atoms; more preferably 2 to 5 carbon atoms. Examples of cycloheteroalkyls include, but are not limited to, aziridin-2-yl, *N*-C<sub>1-3</sub>-alkyl-

10

15

20

25

30

aziridin-2-yl, azetidinyl, *N*-C<sub>1-3</sub>-alkyl-azetidin-m'-yl, pyrrolidin-m'-yl, *N*-C<sub>1-3</sub>-alkyl-pyrrolidin-m'-yl, piperidin-m'-yl, and *N*-C<sub>1-3</sub>-alkyl-piperidin-m'-yl, where m' is 2, 3, or 4 depending on the cycloheteroalkyl. Specific examples of N-C<sub>1-3</sub>-alkyl-cycloheteroalkyls include, but are not limited to, N-methyl-aziridin-2-yl, N-methyl-azetidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-4-yl, N-methyl-piperidin-2-yl, N-methyl-piperidin-3-yl, and N-methyl-piperidin-4-yl. In the instance of R<sup>4</sup>, the point of attachment between the cycloheteroalkyl ring carbon and the oxygen occurs at any one of m'

The term "heterocycle" refers to an unsubstituted or substituted heterocycle containing carbon, hydrogen, and at least one of N, O, and S, where the C and N can be trivalent or tetravalent, i.e., sp<sup>2</sup>- or sp<sup>3</sup>-hybridized. Examples of heterocycles include, but are not limited to, aziridine, azetidine, pyrrolidine, piperidine, imidazole, oxazole, piperazine, etc. In the instance of piperazine, as related to R<sup>10</sup> for NR'<sub>2</sub>, the corresponding opposite nitrogen atom of the piperazinyl is substituted by a lower alkyl represented by the following structure:

Preferably, the opposite nitrogen of the piperazinyl is substituted by a methyl group.

The term "halogenated alkyl" (or "haloalkyl") refers to an unbranched or branched chain alkyl comprising at least one of F, Cl, Br, and I. The term "C<sub>1-M</sub> haloalkyl" refers to an alkyl comprising 1 to M carbon atoms that comprises at least one of F, Cl, Br, and I, where M is an integer having the following values: 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 27, 28, 29, or 30. "C<sub>1-3</sub> haloalkyl" refers to a haloalkyl comprising 1 to 3 carbons and at least one of F, Cl, Br, and I. The term "halogenated lower alkyl" (or "lower haloalkyl") refers to a haloalkyl comprising 1 to 6 carbon atoms and at least one of F, Cl, Br, and I. Examples include, but are not limited to, fluoromethyl, chloromethyl, bromomethyl, iodomethyl, difluoromethyl, dichloromethyl, dibromomethyl, trifluoromethyl, trichloromethyl, tribromomethyl, triindomethyl, 1-fluoroethyl, 1-chloroethyl, 1-bromoethyl, 1-tribromomethyl, 1-fluoroethyl, 1-chloroethyl, 1-bromoethyl, 1-

10

15

iodoethyl, 2-fluoroethyl, 2-chloroethyl, 2-bromoethyl, 2-iodoethyl, 2,2-difluoroethyl, 2,2-diiodomethyl, 2-diiodomethyl, 3-fluoropropyl, 3-chloropropyl, 3-bromopropyl, 2,2,2-trifluoroethyl or 1,1,2,2,2-pentafluoroethyl.

The term "alkynyl" refers to an unbranched or branched hydrocarbon chain radical having from 2 to 10 carbon atoms, preferably 2 to 5 carbon atoms, and having one triple bond. The term "C<sub>2-N</sub> alkynyl" refers to an alkynyl comprising 2 to N carbon atoms, where N is an integer having the following values: 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, or 10. The term "C C<sub>2-4</sub> alkynyl" refers to an alkynyl comprising 2 to 4 carbon atoms. The term "C<sub>2-10</sub> alkynyl" refers to an alkynyl comprising 2 to 10 carbons. Examples include, but are limited to, ethynyl, 1-propynyl, 2-propynyl, 1-butynyl, 2-butynyl or 3-butynyl.

The term "halogenated alkynyl" refers to an unbranched or branched hydrocarbon chain radical having from 2 to 10 carbon atoms, preferably 2 to 5 carbon atoms, and having one triple bond and at least one of F, Cl, Br, and I.

The term "cycloalkyl" refers to a saturated carbocyclic ring comprising 3 to 8 carbon atoms, i.e. cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, cycloheptyl or cycloactyl. The term "C<sub>3-7</sub> cycloalkyl" as used herein refers to a cycloalkyl comprising 3 to 7 carbons in the carbocyclic ring.

The term "alkoxy" refers to an -O-alkyl group or an -O-cycloalkyl group, wherein alkyl and cycloalkyl are as defined above. Examples of -O-alkyl groups include, but are not limited to, methoxy, ethoxy, *n*-propyloxy, *i*-propyloxy, *i*-butyloxy, *t*-butyloxy. "Lower alkoxy" as used herein denotes an alkoxy group with a "lower alkyl" group as previously defined. "C<sub>1-10</sub> alkoxy" refers to an-O-alkyl wherein alkyl is C<sub>1-10</sub>. Examples of -O-cycloalkyl groups include, but are not limited to, -O-*c*-propyl, -O-*c*-butyl, -O-*c*-pentyl, and -O-*c*-hexyl.

The term "halogenated alkoxy" refers to an -O-alkyl group in which the alkyl group comprises at least one of F, Cl, Br, and I.

10

15

20

25

The term "halogenated lower alkoxy" refers to an -O-(lower alkyl) group in which the lower alkyl group comprises at least one of F, Cl, Br, and I.

The term "amino acid" includes naturally occurring and synthetic  $\alpha$ ,  $\beta \gamma$ or  $\delta$  amino acids, and includes but is not limited to, amino acids found in proteins, i.e. glycine, alanine, valine, leucine, isoleucine, methionine, phenylalanine, tryptophan, proline, serine, threonine, cysteine, tyrosine, asparagine, glutamine, aspartate, glutamate, lysine, arginine and histidine. In a preferred embodiment, the amino acid is in the L-configuration. Alternatively, the amino acid can be a derivative of alanyl, valinyl, leucinyl, isoleucinyl, prolinyl, phenylalaninyl, tryptophanyl, methioninyl, glycinyl, serinyl, threoninyl, cysteinyl, tyrosinyl, asparaginyl, glutaminyl, aspartoyl, glutaroyl, lysinyl, argininyl, histidinyl, β-alanyl, β-valinyl, β-leucinyl, β-isoleucinyl, β-prolinyl, βphenylalaninyl, β-tryptophanyl, β-methioninyl, β-glycinyl, β-serinyl, βthreoninyl, β-cysteinyl, β-tyrosinyl, β-asparaginyl, β-glutaminyl, β-aspartoyl, βglutaroyl, β-lysinyl, β-argininyl or β-histidinyl. When the term amino acid is used, it is considered to be a specific and independent disclosure of each of the esters of  $\alpha$ ,  $\beta$   $\gamma$  or  $\delta$  glycine, alanine, valine, leucine, isoleucine, methionine, phenylalanine, tryptophan, proline, serine, threonine, cysteine, tyrosine, asparagine, glutamine, aspartate, glutamate, lysine, arginine and histidine in the D and L-configurations.

The term "aminoacyl" includes N,N-unsubstituted, N,N-monosubstituted, and N,N-disubstituted derivatives of naturally occurring and synthetic  $\alpha$ ,  $\beta$   $\gamma$  or  $\delta$  amino acyls, where the amino acyls are derived from amino acids. The aminonitrogen can be substituted or unsubstituted. When the amino-nitrogen is substituted, the nitrogen is either mono- or di-substituted, where the substituent bound to the amino-nitrogen is a lower alkyl or an alkaryl. In the instance of its use for Y, the expression "O(aminoacyl)" is used. It is understood that the C3' carbon of the ribose is bound to the oxygen "O", which is then bound to the carbonyl carbon of the aminoacyl.

The terms "alkylamino" or "arylamino" refer to an amino group that has one or two alkyl or aryl substituents, respectively.

20

25

30

The term "protected," as used herein and unless otherwise defined, refers to a group that is added to an oxygen, nitrogen, or phosphorus atom to prevent its further reaction or for other purposes. A wide variety of oxygen and nitrogen protecting groups are known to those skilled in the art of organic synthesis. Non-limiting examples include: C(O)-alkyl, C(O)Ph, C(O)aryl, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>-alkyl, CH<sub>2</sub>-alkyl, CH<sub>2</sub>-alkyl, CH<sub>2</sub>O-aryl, SO<sub>2</sub>-alkyl, SO<sub>2</sub>-aryl, *tert*-butyldimethylsilyl, *tert*-butyldiphenylsilyl, and 1,3-(1,1,3,3-tetraisopropyldisiloxanylidene).

The term "aryl," as used herein, and unless otherwise specified, refers to substituted or unsubstituted phenyl (Ph), biphenyl, or naphthyl, preferably the term aryl refers to substituted or unsubstituted phenyl. The aryl group can be substituted with one or more moieties selected from among hydroxyl, F, Cl, Br, I, amino, alkylamino, arylamino, alkoxy, aryloxy, nitro, cyano, sulfonic acid, sulfate, phosphonic acid, phosphate, and phosphonate, either unprotected, or protected as necessary, as known to those skilled in the art, for example, as taught in T.W. Greene and P.G. M. Wuts, "Protective Groups in Organic Synthesis," 3rd ed., John Wiley & Sons, 1999.

The terms "alkaryl" or "alkylaryl" refer to an alkyl group with an aryl substituent, such as benzyl. The terms "aralkyl" or "arylalkyl" refer to an aryl group with an alkyl substituent.

The term "di(lower alkyl)amino-lower alkyl" refers to a lower alkyl substituted by an amino group that is itself substituted by two lower alkyl groups. Examples include, but are not limited to, (CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>NCH<sub>2</sub>, (CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>NCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>, (CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>NCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>, etc. The examples above show lower alkyls substituted at the terminus carbon atom with an N,N-dimethyl-amino substituent. These are intended as examples only and are not intended to limit the meaning of the term "di(lower alkyl)amino-lower alkyl" so as to require the same. It is contemplated that the lower alkyl chain can be substituted with an N,N-di(lower alkyl)-amino at any point along the chain, e.g., CH<sub>3</sub>CH(N-(lower alkyl)<sub>2</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>.

The term "halo," as used herein, includes chloro, bromo, iodo and fluoro.

10

15

The term "acyl" refers to a substituent containing a carbonyl moiety and a non-carbonyl moiety. The carbonyl moiety contains a double-bond between the carbonyl carbon and a heteroatom, where the heteroatom is selected from among O, N and S. When the heteroatom is N, the N is substituted by a lower alkyl. The non-carbonyl moiety is selected from straight, branched, and cyclic alkyl, which includes, but is not limited to, a straight, branched, or cyclic C<sub>1-20</sub> alkyl, C<sub>1-10</sub> alkyl, or lower alkyl; alkoxyalkyl, including methoxymethyl; aralkyl, including benzyl; aryloxyalkyl, such as phenoxymethyl; or aryl, including phenyl optionally substituted with halogen (F, Cl, Br, I), hydroxyl, C<sub>1</sub> to C<sub>4</sub> alkyl, or C<sub>1</sub> to C<sub>4</sub> alkoxy, sulfonate esters, such as alkyl or aralkyl sulphonyl, including methanesulfonyl, the mono, di or triphosphate ester, trityl or monomethoxytrityl, substituted benzyl, trialkylsilyl (e.g. dimethyl-t-butylsilyl) or diphenylmethylsilyl. When at least one aryl group is present in the non-carbonyl moiety, it is preferred that the aryl group comprises a phenyl group.

The term "lower acyl" refers to an acyl group in which the non-carbonyl moiety is lower alkyl.

The term "purine" or "pyrimidine" base includes, but is not limited to, adenine, N<sup>6</sup>-alkylpurines, N<sup>6</sup>-acylpurines (wherein acyl is C(O)(alkyl, aryl, alkylaryl, or arylalkyl), N<sup>6</sup>-benzylpurine, N<sup>6</sup>-halopurine, N<sup>6</sup>-vinylpurine, N<sup>6</sup>acetylenic purine, N<sup>6</sup>-acyl purine, N<sup>6</sup>-hydroxyalkyl purine, N<sup>6</sup>-20 allcylaminopurine, N<sup>6</sup>-thioallcyl purine, N<sup>2</sup>-alkylpurines, N<sup>2</sup>-alkyl-6-thiopurines, thymine, cytosine, 5-fluorocytosine, 5-methylcytosine, 6-azapyrimidine, including 6-azacytosine, 2- and/or 4-mercaptopyrmidine, uracil, 5-halouracil, including 5-fluorouracil, C<sup>5</sup>-alkylpyrimidines, C<sup>5</sup>-benzylpyrimidines, C<sup>5</sup>halopyrimidines, C<sup>5</sup>-vinylpyrimidine, C<sup>5</sup>-acetylenic pyrimidine, C<sup>5</sup>-acyl 25 pyrimidine, C<sup>5</sup>-hydroxyalkyl purine, C<sup>5</sup>-amidopyrimidine, C<sup>5</sup>-cyanopyrimidine, ,C<sup>5</sup>-iodopyrimidine, C<sup>6</sup>-lodo-pyrimidine, C<sup>5</sup>-Br-vinyl pyrimidine, C<sup>6</sup>-Br-vinyl pyrimidine, C<sup>5</sup>-nitropyrimidine, C<sup>5</sup>-amino-pyrimidine, N<sup>2</sup>-alkylpurines, N<sup>2</sup>alkyl-6-thiopurines, 5-azacytidinyl, 5-azauracilyl, triazolopyridinyl, 30 imidazolopyridinyl, pyrrolopyrimidinyl, and pyrazolopyrimidinyl. Purine bases include, but are not limited to, guanine, adenine, hypoxanthine, 2,6diaminopurine, and 6-chloropurine. Functional oxygen and nitrogen groups on

10

15

20

25

the base can be protected as necessary or desired. Suitable protecting groups are well known to those skilled in the art, and include trimethylsilyl, dimethylhexylsilyl, *t*-butyldimethylsilyl, and *t*-butyldiphenylsilyl, trityl, alkyl groups, and acyl groups such as acetyl and propionyl, methanesulfonyl, and p-toluenesulfonyl.

The term "tautomerism" and "tautomers" have their accepted plain meanings.

The term "P\*" means that the phosphorous atom is chiral and that it has a corresponding Cahn-Ingold-Prelog designation of "R" or "S" which have their accepted plain meanings. It is contemplated that compounds of the formula I are racemic because the chirality at phosphorous. Applicants contemplate use of the racemate and/or the resolved enantiomers. In some instances, an asterisk does not appear next to the phosphoroamidate phosphorous atom. In these instances, it is understood that the phosphorous atom is chiral and that one of ordinary skill understands this to be so unless the substituents bound to the phosphorous exclude the possibility of chirality at phosphorous, such as in P(O)Cl<sub>3</sub>.

## DETAILED DESCRIPTION OF THE INVENTION

An aspect of the invention is directed to a compound, its salts, hydrates, solvates, crystalline forms, and the like represented by formula I:

$$R^{3a}$$
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3a}$ 
 $R^{3a}$ 

wherein

(a)  $R^1$  is hydrogen, n-alkyl; branched alkyl; cycloalkyl; or aryl, which includes, but is not limited to, phenyl or naphthyl, where phenyl or naphthyl are optionally substituted with at least one of  $C_{1-6}$  alkyl,  $C_{2-6}$  alkenyl,  $C_{2-6}$  alkynyl,  $C_{1-6}$  alkoxy, F, Cl, Br, I, nitro, cyano,  $C_{1-6}$  haloalkyl,  $-N(R^{1'})_2$ ,  $C_{1-6}$  acylamino, -

2983472-1

- 20 -

NHSO<sub>2</sub>C<sub>1-6</sub> alkyl, -SO<sub>2</sub>N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, COR<sup>1</sup>, and -SO<sub>2</sub>C<sub>1-6</sub> alkyl; (R<sup>1</sup> is independently hydrogen or alkyl, which includes, but is not limited to,  $C_{1-20}$  alkyl,  $C_{1-10}$  alkyl, or  $C_{1-6}$  alkyl,  $R^{1''}$  is -OR' or  $-N(R^{1'})_2$ ;

- R<sup>2</sup> is hydrogen, C<sub>1-10</sub> alkyl, R<sup>3a</sup> or R<sup>3b</sup> and R<sup>2</sup> together are (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> so as to form a cyclic ring that includes the adjoining N and C atoms. 5 C(O)CR<sup>3a</sup>R<sup>3b</sup>NHR<sup>1</sup>, where n is 2 to 4 and R<sup>1</sup>, R<sup>3a</sup>, and R<sup>3b</sup>;
- R<sup>3a</sup> and R<sup>3b</sup> are (i) independently selected from hydrogen, C<sub>1-10</sub> (c) alkyl, cycloalkyl, -(CH<sub>2</sub>)<sub>c</sub>(NR<sup>3</sup>')<sub>2</sub>, C<sub>1-6</sub> hydroxyalkyl, -CH<sub>2</sub>SH, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>S(O)<sub>d</sub>Me, -(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>NHC(=NH)NH<sub>2</sub>, (1H-indol-3-yl)methyl, (1H-imidazol-4-yl)methyl, -10 (CH<sub>2</sub>)<sub>e</sub>COR<sup>3"</sup>, aryl and aryl C<sub>1-3</sub> alkyl, said aryl groups optionally substituted with a group selected from hydroxyl, C<sub>1-10</sub> alkyl, C<sub>1-6</sub> alkoxy, halogen, nitro and cyano; (ii) R<sup>3a</sup> and R<sup>3b</sup> both are C<sub>1-6</sub> alkyl; (iii) R<sup>3a</sup> and R<sup>3b</sup> together are(CH<sub>2</sub>)<sub>f</sub> so as to form a spiro ring; (iv) R<sup>3a</sup> is hydrogen and R<sup>3b</sup> and R<sup>2</sup> together are (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> so as to form a cyclic ring that includes the adjoining N and C atoms (v) R<sup>3b</sup> is hydrogen and R<sup>3a</sup> and R<sup>2</sup> together are (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> so as to form a cyclic ring that 15 includes the adjoining N and C atoms, where c is 1 to 6, d is 0 to 2, e is 0 to 3, f is 2 to 5, n is 2 to 4, and where R<sup>3'</sup> is independently hydrogen or C<sub>1-6</sub> alkyl and  $R^{3''}$  is -OR' or -N( $R^{3'}$ )<sub>2</sub>); (vi)  $R^{3a}$  is H and  $R^{3b}$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH<sub>2</sub>-indol-3-yl, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>, CH2CO2H, CH2C(O)NH2, CH2CH2COOH, CH2CH2C(O)NH2, 20 CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>-imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl; or (viii) R<sup>3a</sup> is CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH<sub>2</sub>-indol-3-yl, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H, CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH, 25 CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>-
- imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl and R<sup>3b</sup> is H, where R<sup>3'</sup> is independently hydrogen or alkyl, which includes, but is not limited to,  $C_{1-20}$  alkyl,  $C_{1-10}$  alkyl, or  $C_{1-6}$  alkyl,  $R^{3"}$  is -OR' or  $-N(R^{3'})_2);$
- 30  $R^4$  is hydrogen,  $C_{1-10}$  alkyl,  $C_{1-10}$  alkyl optionally substituted with a lower alkyl, alkoxy, di(lower alkyl)-amino, or halogen, C<sub>1-10</sub> haloalkyl, C<sub>3-10</sub>

cycloalkyl, cycloalkyl alkyl, cycloheteroalkyl, aminoacyl, aryl, such as phenyl, heteroaryl, such as, pyridinyl, substituted aryl, or substituted heteroaryl;

- (e) R<sup>5</sup> is H, a lower alkyl, CN, vinyl, O-(lower alkyl), hydroxyl lower alkyl, i.e., -(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>OH, where p is 1 -6, including hydroxyl methyl (CH<sub>2</sub>OH),
  5 CH<sub>2</sub>F, N<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CN, CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>NHCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, alkyne (optionally substituted), or halogen, including F, Cl, Br, or I, with the provisos that when X is OH, base is cytosine and R<sup>6</sup> is H, R<sup>5</sup> cannot be N<sub>3</sub> and when X is OH, R<sup>6</sup> is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F and B is a purine base, R<sup>5</sup> cannot be H;
  - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, F, or CN;
- 10 (g) X is H, OH, F, OMe, halogen, NH<sub>2</sub>, or N<sub>3</sub>;
- (h) Y is OH, H,  $C_{1-4}$  alkyl,  $C_{2-4}$  alkenyl,  $C_{2-4}$  alkynyl, vinyl,  $N_3$ , CN, Cl, Br, F, I, NO<sub>2</sub>, OC(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), OC(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), OC(O)O(C<sub>2-4</sub> alkynyl), OC(O)O(C<sub>2-4</sub> alkenyl), OC<sub>1-10</sub> haloalkyl, O(aminoacyl), O(C<sub>1-10</sub> acyl),  $O(C_{1-4} \text{ alkyl})$ ,  $O(C_{2-4} \text{ alkenyl})$ ,  $S(C_{1-4} \text{ acyl})$ ,  $S(C_{1-4} \text{ alkyl})$ ,  $S(C_{2-4} \text{ alkynyl})$ ,  $S(C_{2-4} \text{ alkynyl})$ ,  $S(C_{2-4} \text{ alkynyl})$ 15 alkenyl),  $SO(C_{1-4} \text{ acyl})$ ,  $SO(C_{1-4} \text{ alkyl})$ ,  $SO(C_{2-4} \text{ alkynyl})$ ,  $SO(C_{2-4} \text{ alkenyl})$ , SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> acyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>2-4</sub> alkynyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>2-4</sub> alkenyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> 4 acyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>2-4</sub> alkenyl), NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1-4</sub> alkyl), NH(C<sub>2-4</sub> alkenyl), NH(C2-4 alkynyl), NH(C1-4 acyl), N(C1-4 alkyl)2, N(C1-18 acyl)2, wherein alkyl, alkynyl, alkenyl and vinyl are optionally substituted by N<sub>3</sub>, CN, 20 one to three halogen (Cl, Br, F, I), NO<sub>2</sub>, C(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), C(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl),  $C(O)O(C_{2-4} \text{ alkynyl}), C(O)O(C_{2-4} \text{ alkenyl}), O(C_{1-4} \text{ acyl}), O(C_{1-4} \text{ alkyl}), O(C_{2-4} \text{ alkyl})$ alkenyl), S(C<sub>1-4</sub> acyl), S(C<sub>1-4</sub> alkyl), S(C<sub>2-4</sub> alkynyl), S(C<sub>2-4</sub> alkenyl), SO(C<sub>1-4</sub> acyl), SO(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO(C<sub>2-4</sub> alkynyl), SO(C<sub>2-4</sub> alkenyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> acyl),  $SO_2(C_{1-4} \text{ alkyl})$ ,  $SO_2(C_{2-4} \text{ alkynyl})$ ,  $SO_2(C_{2-4} \text{ alkenyl})$ ,  $OS(O)_2(C_{1-4} \text{ acyl})$ , OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>2-4</sub> alkenyl), NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1-4</sub> alkyl), NH(C<sub>2-4</sub> 25 alkenyl), NH( $C_{2-4}$  alkynyl), NH( $C_{1-4}$  acyl), N( $C_{1-4}$  alkyl)<sub>2</sub>, N( $C_{1-4}$  acyl)<sub>2</sub>;

the base is a naturally occurring or modified purine or pyrimidine base represented by the following structures:

wherein

Z is N or  $CR^{12}$ ;

15

R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup>,R<sup>9</sup>, R<sup>10</sup>, and R<sup>11</sup> are independently H, F, Cl, Br, I, OH, OR', SH, SR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkenyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkynyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkynyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> such as C≡CH, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkynyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkoxy of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkoxy of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>H, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R',

wherein R' is an optionally substituted alkyl, which includes, but is not limited to, an optionally substituted  $C_{1-20}$  alkyl, an optionally substituted  $C_{1-10}$  alkyl, an optionally substituted lower alkyl; an optionally substituted cycloalkyl; an optionally substituted alkynyl of  $C_2$ - $C_6$ , an optionally substituted lower alkenyl of  $C_2$ - $C_6$ , or optionally substituted acyl, which includes but is not limited to C(O) alkyl,  $C(O)(C_{1-20}$  alkyl),  $C(O)(C_{1-10}$  alkyl), or C(O)(lower alkyl) or alternatively, in the instance of  $NR'_2$ , each R' comprise at least one C atom that are joined to form a heterocycle comprising at least two carbon atoms; and

R<sup>12</sup> is H, halogen (including F, Cl, Br, I), OH, OR', SH, SR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub> lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkenyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkenyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkynyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkynyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkoxy of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkoxy of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>H, CO<sub>2</sub>R',

25 CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R'; with the proviso

2983472-1 - 23 -

IPR2018-00126 Page 24 of 751 I-MAK 1005

10

that when base is represented by the structure c with  $R^{11}$  being hydrogen,  $R^{12}$  is not a: (i) -C = C - H, (ii)  $-C = C + H_2$ , or (iii)  $-NO_2$ .

As can be appreciated from the structure represented by formula I above, there are myriad ways to express the several embodiments and aspects of each embodiment of the present invention. As seen below, the inventors have disclosed certain embodiments directed to the compound of formula I, each having several aspects, based on the identity of the modified purine or pyrimidine base. This is not intended to be an explicit or implicit admission that the three embodiments are independent or distinct nor should it be interpreted as such. Rather, it is intended to convey information so that the full breadth of the present invention can be understood. Furthermore, the following embodiments, and aspects thereof, are not meant to be limiting on the full breadth of the invention as recited by the structure of formula I.

A first embodiment of the invention is directed to a compound represented by formula **I-1**:

wherein

(a) R<sup>1</sup> is hydrogen, n-alkyl; branched alkyl; cycloalkyl; or aryl, which includes, but is not limited to, phenyl or naphthyl, where phenyl or naphthyl are

2983472-1

I-1

IPR2018-00126 Page 25 of 751 I-MAK 1005

WO 2008/121634 PCT/US2008/058183

Docket No. 60137.0034WOU1

5

optionally substituted with at least one of  $C_{1-6}$  alkyl,  $C_{2-6}$  alkenyl,  $C_{2-6}$  alkynyl,  $C_{1-6}$  alkoxy, F, Cl, Br, I, nitro, cyano,  $C_{1-6}$  haloalkyl,  $-N(R^{1'})_2$ ,  $C_{1-6}$  acylamino,  $-NHSO_2C_{1-6}$  alkyl,  $-SO_2N(R^{1'})_2$ ,  $COR^{1"}$ , and  $-SO_2C_{1-6}$  alkyl; ( $R^{1'}$  is independently hydrogen or alkyl, which includes, but is not limited to,  $C_{1-20}$  alkyl,  $C_{1-10}$  alkyl, or  $C_{1-6}$  alkyl,  $R^{1"}$  is -OR' or  $-N(R^{1'})_2$ );

- (b)  $R^2$  is hydrogen,  $C_{1-10}$  alkyl,  $R^{3a}$  or  $R^{3b}$  and  $R^2$  together are  $(CH_2)_n$  so as to form a cyclic ring that includes the adjoining N and C atoms,  $C(O)CR^{3a}R^{3b}NHR^1$ , where n is 2 to 4 and  $R^1$ ,  $R^{3a}$ , and  $R^{3b}$ ;
- R<sup>3a</sup> and R<sup>3b</sup> are (i) independently selected from hydrogen, C<sub>1-10</sub> alkyl, cycloalkyl, -(CH<sub>2</sub>)<sub>c</sub>(NR<sup>3</sup>)<sub>2</sub>, C<sub>1-6</sub> hydroxyalkyl, -CH<sub>2</sub>SH, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>S(O)<sub>d</sub>Me, -10 (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>NHC(=NH)NH<sub>2</sub>, (1H-indol-3-yl)methyl, (1H-imidazol-4-yl)methyl, -(CH<sub>2</sub>)<sub>e</sub>COR<sup>3</sup>", aryl and aryl C<sub>1-3</sub> alkyl, said aryl groups optionally substituted with a group selected from hydroxyl, C<sub>1-10</sub> alkyl, C<sub>1-6</sub> alkoxy, halogen, nitro and cyano; (ii) R<sup>3a</sup> and R<sup>3b</sup> both are C<sub>1-6</sub> alkyl; (iii) R<sup>3a</sup> and R<sup>3b</sup> together are(CH<sub>2</sub>)<sub>f</sub> so as to form a spiro ring; (iv) R<sup>3a</sup> is hydrogen and R<sup>3b</sup> and R<sup>2</sup> together are (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> 15 so as to form a cyclic ring that includes the adjoining N and C atoms (v) R<sup>3b</sup> is hydrogen and R<sup>3a</sup> and R<sup>2</sup> together are (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> so as to form a cyclic ring that includes the adjoining N and C atoms, where c is 1 to 6, d is 0 to 2, e is 0 to 3, f is 2 to 5, n is 2 to 4, and where R3' is independently hydrogen or C1-6 alkyl and  $R^{3''}$  is -OR' or -N( $R^{3'}$ )<sub>2</sub>); (vi)  $R^{3a}$  is H and  $R^{3b}$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, 20 CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH<sub>2</sub>-indol-3-yl, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H, CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>-imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl; or (viii) R<sup>3a</sup> is CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, 25 CH<sub>2</sub>-indol-3-yl, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H, CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl and R<sup>3b</sup> is H, where R<sup>3'</sup> is independently hydrogen or alkyl, which includes, but is not limited to, C<sub>1-20</sub> alkyl, C<sub>1-10</sub> alkyl, or C<sub>1-6</sub> alkyl, R<sup>3"</sup> is -OR' or 30

2983472-1

 $-N(R^{3'})_2);$ 

IPR2018-00126 Page 26 of 751 I-MAK 1005

WO 2008/121634 PCT/US2008/058183

Docket No. 60137.0034WOU1

5

10

(d)  $R^4$  is hydrogen,  $C_{1-10}$  alkyl,  $C_{1-10}$  alkyl optionally substituted with a lower alkyl, alkoxy, di(lower alkyl)-amino, or halogen,  $C_{1-10}$  haloalkyl,  $C_{3-10}$  cycloalkyl, cycloheteroalkyl, aminoacyl, di(lower alkyl)-amino, aryl, such as phenyl, heteroaryl, such as, pyridinyl, substituted aryl, or substituted heteroaryl;

- (e) R<sup>5</sup> is H, a lower alkyl, CN, vinyl, O-(lower alkyl), hydroxyl lower alkyl, i.e., -(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>OH, where p is 1 -6, including hydroxyl methyl (CH<sub>2</sub>OH), CH<sub>2</sub>F, N<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CN, CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>NHCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, alkyne (optionally substituted), or halogen, including F, Cl, Br, or I, with the provisos that when X is OH, base is cytosine and R<sup>6</sup> is H, R<sup>5</sup> cannot be N<sub>3</sub> and when X is OH, R<sup>6</sup> is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F and B is a purine base, R<sup>5</sup> cannot be H;
  - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, F, or CN;
  - (g) X is H, OH, F, OMe, Cl, Br, I, NH<sub>2</sub>, or N<sub>3</sub>;
- Y is OH, H, C<sub>1-4</sub> alkyl, C<sub>2-4</sub> alkenyl, C<sub>2-4</sub> alkynyl, vinyl, N<sub>3</sub>, CN, (h) Cl, Br, F, I, NO<sub>2</sub>, OC(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), OC(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), OC(O)O(C<sub>2-4</sub> 15 alkynyl), OC(O)O(C<sub>2-4</sub> alkenyl), OC<sub>1-10</sub> haloalkyl, O(aminoacyl), O(C<sub>1-10</sub> acyl),  $O(C_{1-4} \text{ alkyl}), O(C_{2-4} \text{ alkenyl}), S(C_{1-4} \text{ acyl}), S(C_{1-4} \text{ alkyl}), S(C_{2-4} \text{ alkynyl}), S(C_{2-4} \text$ alkenyl),  $SO(C_{1-4} \text{ acyl})$ ,  $SO(C_{1-4} \text{ alkyl})$ ,  $SO(C_{2-4} \text{ alkynyl})$ ,  $SO(C_{2-4} \text{ alkenyl})$ ,  $SO_2(C_{1-4} \text{ acyl})$ ,  $SO_2(C_{1-4} \text{ alkyl})$ ,  $SO_2(C_{2-4} \text{ alkynyl})$ ,  $SO_2(C_{2-4} \text{ alkenyl})$ ,  $OS(O)_2(C_{1-4} \text{ alkyl})$ 4 acyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>2-4</sub> alkenyl), NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1-4</sub> alkyl), NH(C<sub>2-4</sub> 20 alkenyl), NH(C<sub>2-4</sub> alkynyl), NH(C<sub>1-4</sub> acyl), N(C<sub>1-4</sub> alkyl)<sub>2</sub>, N(C<sub>1-18</sub> acyl)<sub>2</sub>, wherein alkyl, alkynyl, alkenyl and vinyl are optionally substituted by N<sub>3</sub>, CN, one to three halogen (Cl, Br, F, I), NO<sub>2</sub>, C(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), C(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl),  $C(O)O(C_{2-4} \text{ alkynyl}), C(O)O(C_{2-4} \text{ alkenyl}), O(C_{1-4} \text{ acyl}), O(C_{1-4} \text{ alkyl}), O(C_{2-4} \text{ alkyl})$ 25 alkenyl), S(C<sub>1-4</sub> acyl), S(C<sub>1-4</sub> alkyl), S(C<sub>2-4</sub> alkynyl), S(C<sub>2-4</sub> alkenyl), SO(C<sub>1-4</sub> acyl), SO(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO(C<sub>2-4</sub> alkynyl), SO(C<sub>2-4</sub> alkenyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> acyl),  $SO_2(C_{1-4} \text{ alkyl})$ ,  $SO_2(C_{2-4} \text{ alkynyl})$ ,  $SO_2(C_{2-4} \text{ alkenyl})$ ,  $OS(O)_2(C_{1-4} \text{ acyl})$ ,  $OS(O)_2(C_{1-4} \text{ alkyl}), OS(O)_2(C_{2-4} \text{ alkenyl}), NH_2, NH(C_{1-4} \text{ alkyl}), NH(C_{2-4} \text{ alkyl})$ alkenyl),  $NH(C_{2-4}$  alkynyl),  $NH(C_{1-4}$  acyl),  $N(C_{1-4}$  alkyl)<sub>2</sub>,  $N(C_{1-4}$  acyl)<sub>2</sub>;
- 30 (i) R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup>,R<sup>9</sup> are independently H, F, Cl, Br, I, OH, OR', SH, SR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, lower alkyl, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkyl, lower

alkenyl of  $C_2$ - $C_6$ ,  $CO_2$ H,  $CO_2$ R',  $CONH_2$ , CONHR',  $CONR'_2$ , wherein R' is a  $C_{1-20}$  alkyl; a  $C_{1-20}$  cycloalkyl; a  $C_2$ - $C_6$  alkenyl, a  $C_2$ - $C_6$  alkynyl.

A first aspect of the first embodiment is directed to a compound represented by formula I-1

## 5 wherein

- (a)  $R^1$  is hydrogen, n-alkyl or aryl, which includes, but is not limited to, phenyl or naphthyl, where phenyl or naphthyl are optionally substituted with at least one of  $C_{1-6}$  alkyl,  $C_{1-6}$  alkoxy, F, Cl, Br, I, nitro, cyano,  $C_{1-6}$  haloalkyl;
  - (b)  $R^2$  is hydrogen or  $CH_3$ ;
- R<sup>3a</sup> and R<sup>3b</sup> are independently (i) R<sup>3a</sup> is hydrogen and R<sup>3b</sup> and R<sup>2</sup> 10 together are (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> so as to form a cyclic ring that includes the adjoining N and C atoms (v)  $R^{3b}$  is hydrogen and  $R^{3a}$  and  $R^2$  together are  $(CH_2)_n$  so as to form a cyclic ring that includes the adjoining N and C atoms, where c is 1 to 6, d is 0 to 2, e is 0 to 3, f is 3 to 5, n is 2 to 4, and where R<sup>3'</sup> is independently hydrogen or  $C_{1-6}$  alkyl and  $R^{3''}$  is -OR' or -N( $R^{3'}$ )<sub>2</sub>); (vi)  $R^{3a}$  is H and  $R^{3b}$  is H, CH<sub>3</sub>, 15 CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH<sub>2</sub>-indol-3-yl, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H, CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>-imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl; or (viii) R<sup>3a</sup> is CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH<sub>2</sub>-indol-3-20 yl, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H, CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH, CH2CH2C(O)NH2, CH2CH2CH2CH2NH2, -CH2CH2CH2NHC(NH)NH2, CH2imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), or CH<sub>2</sub>SH and R<sup>3b</sup> is H;
- (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, C<sub>1-10</sub> alkyl, C<sub>1-10</sub> alkyl optionally substituted with a lower alkyl, alkoxy, di(lower alkyl)-amino, or halogen, C<sub>1-10</sub> haloalkyl, C<sub>3-10</sub> cycloalkyl, cycloalkyl alkyl, cycloheteroalkyl, aminoacyl, aryl, such as phenyl, heteroaryl, such as, pyridinyl, substituted aryl, or substituted heteroaryl;
  - (e) R<sup>5</sup> is H, CN, CH<sub>3</sub>, vinyl, OCH<sub>3</sub>, OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>OH, CH<sub>2</sub>(halo), such as CH<sub>2</sub>F, N<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CN, CH<sub>2</sub>N<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>NHCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>,

WO 2008/121634 PCT/US2008/058183

Docket No. 60137.0034WOU1

halogen, including F, Cl, Br, or I, with the provisos that when X is OH, base is cytosine and  $R^6$  is H,  $R^5$  cannot be  $N_3$ ;

- (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, F, or CN;
- (g) X is H, OH, F, OMe, Cl, Br, I, NH<sub>2</sub>, or N<sub>3</sub>;
- (h) Y is OH, H, C<sub>1-4</sub> alkyl, vinyl, N<sub>3</sub>, CN, Cl, Br, F, I, O(C<sub>1-6</sub> acyl), O(C<sub>1-4</sub> alkyl), NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1-4</sub> alkyl), NH(C<sub>2-4</sub> alkenyl), NH(C<sub>2-4</sub> alkynyl), NH(C<sub>1-4</sub> acyl), N(C<sub>1-4</sub> alkyl)<sub>2</sub>, N(C<sub>1-18</sub> acyl)<sub>2</sub>, wherein alkyl, alkynyl, alkenyl and vinyl are optionally substituted by N<sub>3</sub>, CN, one to three halogen (Cl, Br, F, I), NO<sub>2</sub>, OC(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), OC(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), OC(O)O(C<sub>2-4</sub> alkynyl), OC(O)O(C<sub>2-4</sub> alkynyl), OC(O)O(C<sub>2-4</sub> alkenyl), OC<sub>1-4</sub> alkenyl), OC<sub>1-4</sub> alkyl), O(C<sub>1-4</sub> alkyl), S(C<sub>1-4</sub> alkyl), S(C<sub>1-4</sub> alkyl), S(C<sub>2-4</sub> alkenyl), S(C<sub>1-4</sub> acyl), SO(C<sub>1-4</sub> acyl), SO(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO(C<sub>2-4</sub> alkynyl), SO(C<sub>2-4</sub> alkenyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> acyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), NO<sub>2</sub>(C<sub>2-4</sub> alkenyl), NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1-4</sub> alkyl), NH(C<sub>2-4</sub> alkenyl), NH(C<sub>2-4</sub> alkynyl), NH(C<sub>1-4</sub> acyl)<sub>2</sub>;
  - (i) R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup>,R<sup>9</sup> are independently H, F, Cl, Br, I, OH, OR', SH, SR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, lower alkyl, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkyl, lower alkenyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>H, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, wherein R' is a C<sub>1-20</sub> alkyl; a C<sub>1-20</sub> cycloalkyl; a C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkenyl, a C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkynyl.
  - A second aspect of the first embodiment is directed to a compound represented by formula **I-1**

wherein

20

- (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, n-alkyl or a substituted or unsubstituted phenyl, where the substitutent of the substituted phenyl is at least one of a C<sub>1-3</sub> alkyl, a
   C<sub>1-3</sub> alkoxy, F, Cl, Br, I, nitro, cyano, and a C<sub>1-3</sub> haloalkyl;
  - (b) R<sup>2</sup> is hydrogen or CH<sub>3</sub>;
  - (c)  $R^{3a}$  and  $R^{3b}$  are independently (i)  $R^{3a}$  is hydrogen and  $R^{3b}$  and  $R^2$  together are  $(CH_2)_n$  so as to form a cyclic ring that includes the adjoining N and

2983472-1

- 28 -

IPR2018-00126 Page 29 of 751 I-MAK 1005

C atoms (v)  $R^{3b}$  is hydrogen and  $R^{3a}$  and  $R^2$  together are  $(CH_2)_n$  so as to form a cyclic ring that includes the adjoining N and C atoms, where c is 1 to 6, d is 0 to 2, e is 0 to 3, f is 3 to 5, n is 2 to 4, and where  $R^{3'}$  is independently hydrogen or  $C_{1-6}$  alkyl and  $R^{3''}$  is -OR' or  $-N(R^{3'})_2$ ; (vi)  $R^{3a}$  is H and  $R^{3b}$  is H,  $CH_3$ ,

- 5 CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH<sub>2</sub>-indol-3-yl, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H, CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>-imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl; or (viii) R<sup>3a</sup> is CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH<sub>2</sub>-indol-3-yl, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H, CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>-imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), or CH<sub>2</sub>SH and R<sup>3b</sup> is H;
- (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, CH<sub>3</sub>, Et, <sup>i</sup>Pr, <sup>n</sup>Pr, <sup>n</sup>Bu, 2-butyl, <sup>i</sup>Bu, benzyl, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, N-methyl-aziridin-2-yl, N-methyl-azetidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-4-yl, N-methyl-piperidin-4-yl, lower haloalkyl, di(lower alkyl)amino-lower alkyl, or aminoacyl;
  - (e) R<sup>5</sup> is H, CN, CH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>OH, CH<sub>2</sub>(halo), such as CH<sub>2</sub>F, N<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CN, CH<sub>2</sub>N<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>NHCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, halogen, including F, Cl, Br, or I, with the provisos that when X is OH, base is cytosine and R<sup>6</sup> is H, R<sup>5</sup> cannot be N<sub>3</sub>;
    - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, F, or CN;
    - (g) X is H, OH, F, OCH<sub>3</sub>,  $NH_2$ , or  $N_3$ ;
- (h) Y is OH, H, CH<sub>3</sub>, vinyl, N<sub>3</sub>, CN, Cl, Br, F, I, OC(O)CH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>,
  25 NH<sub>2</sub>, NHCH<sub>3</sub>, NH(vinyl), NH(acetyl), NH(C(O)CH<sub>3</sub>), N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, N(C(O)CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>,
  or O(aminoacyl);
  - (i) R<sup>7</sup> and R<sup>8</sup> are independently H, F, Cl, Br, I, OH, OCH<sub>3</sub>, SH, SCH<sub>3</sub>, NH<sub>2</sub>, NHCH<sub>3</sub>, N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>3</sub>, CH<sub>3-q</sub>X<sub>q</sub>, where X is F, Cl, Br, or I and q is 1 to 3, vinyl, CO<sub>2</sub>H, CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CONH<sub>2</sub>, CONHCH<sub>3</sub>, or CON(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>; and

2983472-1

(j) R<sup>9</sup> is selected from among OH, OCH<sub>3</sub>, SH, SCH<sub>3</sub>, NH<sub>2</sub>, NHCH<sub>3</sub>, N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, OC(O)(C1-20 alkyl), which include but are not limited to OC(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>s</sub>CH<sub>3</sub>, NHC(O)(C1-20 alkyl), which include but are not limited to NHC(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>s</sub>CH<sub>3</sub>, and N(C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>s</sub>CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, which include but is not limited to N(C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>s</sub>CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, where s is an integer selected from 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, and 19.

A third aspect of the first embodiment is directed to a compound represented by formula **I-1** 

#### wherein

- 10 (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, n-alkyl or a substituted or unsubstituted phenyl, where the substitutent of the substituted phenyl is at least one of a CH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, nitro, cyano, and a CH<sub>3-q</sub>X<sub>q</sub>, where X is F, Cl, Br, or I, and q is 1-3;
  - (b)  $R^2$  is hydrogen or  $CH_3$ ;
- (c) R<sup>3a</sup> is H and R<sup>3b</sup> is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>,

  CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH<sub>2</sub>-indol-3-yl, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H,

  CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, 
  CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>-imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl or R<sup>3a</sup> is CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>,

  CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH<sub>2</sub>-indol-3-yl, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H,

  CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, 
  CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>-imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl and R<sup>3b</sup> is H;
- (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, CH<sub>3</sub>, Et, <sup>i</sup>Pr, <sup>n</sup>Pr, <sup>n</sup>Bu, 2-butyl, <sup>t</sup>Bu, benzyl, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, N-methyl-aziridin-2-yl, N-methyl-azetidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-4-yl, lower haloalkyl, di(lower alkyl)amino-lower alkyl, or aminoacyl;
  - (e) R<sup>5</sup> is H, CN, CH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>OH, CH<sub>2</sub>(halo), such as CH<sub>2</sub>F, N<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CN, CH<sub>2</sub>N<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>NHCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, halogen, including F, Cl,

Br, or I, with the provisos that when X is OH , base is cytosine and  $R^6$  is H,  $R^5$  cannot be  $N_3$ ;

- (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, F, or CN;
- (g)  $X \text{ is } H, OH, F, OCH_3, NH_2, \text{ or } N_3;$
- 5 (h) Y is OH, H, CH<sub>3</sub>, vinyl, N<sub>3</sub>, CN, Cl, Br, F, I, OC(O)CH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, NH<sub>2</sub>, NHCH<sub>3</sub>, NH(vinyl), NH(acetyl), NH(C(O)CH<sub>3</sub>), N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, N(C(O)CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, or O(aminoacyl);
- (i) R<sup>7</sup> and R<sup>8</sup> are independently H, F, Cl, Br, I, OH, OCH<sub>3</sub>, SH, SCH<sub>3</sub>, NH<sub>2</sub>, NHCH<sub>3</sub>, N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>3</sub>, CH<sub>3-q</sub>X<sub>q</sub>, where X is F, Cl, Br, or I and q is
  1 to 3, vinyl, CO<sub>2</sub>H, CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CONH<sub>2</sub>, CONHCH<sub>3</sub>, or CON(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, wherein R' is a C<sub>1-20</sub> alkyl; a C<sub>1-20</sub> cycloalkyl; a C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkenyl, a C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkynyl'; and
- (j) R<sup>9</sup> is selected from among OH, OCH<sub>3</sub>, SH, SCH<sub>3</sub>, NH<sub>2</sub>, NHCH<sub>3</sub>, N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, OC(O)(C1-20 alkyl), which include but are not limited to OC(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>s</sub>CH<sub>3</sub>, NHC(O)(C1-20 alkyl), which include but are not limited to NHC(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>s</sub>CH<sub>3</sub>, and N(C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>s</sub>CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, which include but is not limited to N(C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>s</sub>CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, where s is an integer selected from 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, and 19.

A fourth aspect of the first embodiment is directed to a compound represented by formula **I-2** 

**I-2** 

wherein

- (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, methyl, ethyl, *n*-propyl, *i*-propyl, or a substituted or unsubstituted phenyl, where the substitutent of the substituted phenyl is at least one of a CH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, nitro, cyano, and a CH<sub>3-q</sub>X<sub>q</sub>, where X is F, Cl, Br, or I, and q is 1-3;
  - (b)  $R^2$  is hydrogen or  $CH_3$ ;
- (c) R<sup>3a</sup> is H and R<sup>3b</sup> is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>,

  CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH<sub>2</sub>-indol-3-yl, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H,

  CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, 
  CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>-imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl or R<sup>3a</sup> is CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>,

  CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH<sub>2</sub>-indol-3-yl, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H,

  CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, 
  CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>-imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl and R<sup>3b</sup> is H;
- (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, C<sub>1-10</sub> alkyl, C<sub>1-10</sub> alkyl optionally substituted with a lower alkyl, alkoxy or halogen, C<sub>1-10</sub> haloalkyl, C<sub>3-10</sub> cycloalkyl, cycloalkyl
   20 alkyl, cycloheteroalkyl, aminoacyl, di(lower alkyl)amino-lower alkyl, aryl, such

as phenyl, heteroaryl, such as, pyridinyl, substituted aryl, or substituted heteroaryl;

- (e) R<sup>5</sup> is H, CN, CH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>OH, CH<sub>2</sub>F, N<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CN, CH<sub>2</sub>N<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>NHCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, halogen, including F, Cl, Br, or I, with the provisos that when X is OH, base is cytosine and R<sup>6</sup> is H, R<sup>5</sup> cannot be N<sub>3</sub>;
  - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, F, or CN;
  - (g) X is H, OH, F, OCH<sub>3</sub>, Cl, Br, I, NH<sub>2</sub>, or N<sub>3</sub>;
- (h) Y is OH, H, CH<sub>3</sub>, vinyl, N<sub>3</sub>, CN, Cl, Br, F, I, OC(O)CH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, NH<sub>2</sub>, NHCH<sub>3</sub>, NH(vinyl), NH(acetyl), NH(C(O)CH<sub>3</sub>), N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, N(C(O)CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>,
  or O(aminoacyl);
  - (i)  $R^7$  and  $R^8$  are independently H, F, Cl, Br, I, OH, OCH<sub>3</sub>, SH, SCH<sub>3</sub>, NH<sub>2</sub>, NHCH<sub>3</sub>, N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>3</sub>, CH<sub>3-q</sub>X<sub>q</sub>, where X is F, Cl, Br, or I and q is 1 to 3, vinyl, CO<sub>2</sub>H, CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CONH<sub>2</sub>, CONHCH<sub>3</sub>, or CON(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, wherein R' is a C<sub>1-20</sub> alkyl; a C<sub>1-20</sub> cycloalkyl; a C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkenyl, a C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkynyl; and
- (j) R<sup>9</sup> is selected from among OH, OCH<sub>3</sub>, SH, SCH<sub>3</sub>, NH<sub>2</sub>, NHCH<sub>3</sub>, N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, OC(O)(C1-20 alkyl), which include but are not limited to OC(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>s</sub>CH<sub>3</sub>, NHC(O)(C1-20 alkyl), which include but are not limited to NHC(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>s</sub>CH<sub>3</sub>, and and N(C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>s</sub>CH<sub>3</sub>, which include but is not limited to N(C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>s</sub>CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, where s is an integer selected from 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7,
  8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, and 19.

A fifth aspect of the first embodiment is directed to a compound represented by formula **I-2** 

## wherein

- (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, methyl, ethyl, *n*-propyl, *i*-propyl, phenyl, p-tolyl, p-bromo-phenyl, p-chloro-phenyl, p-fluorophenyl;
  - (b) R<sup>2</sup> is hydrogen or CH<sub>3</sub>;

5

(c) R<sup>3a</sup> is H and R<sup>3b</sup> is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH<sub>2</sub>-indol-3-yl, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H, CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>-imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl;

- (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, CH<sub>3</sub>, Et, <sup>i</sup>Pr, <sup>n</sup>Pr, <sup>n</sup>Bu, 2-butyl, <sup>t</sup>Bu, benzyl, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, N-methyl-aziridin-2-yl, N-methyl-azetidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-4-yl, lower haloalkyl, di(lower alkyl)amino-lower alkyl, or aminoacyl;
- 10 (e) R<sup>5</sup> is H, CN, CH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>OH, CH<sub>2</sub>F, halogen, including F, Cl, Br, or I;
  - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, F, or CN;
  - (g)  $X \text{ is } H, OH, F, OCH_3, NH_2, \text{ or } N_3;$
- (h) Y is OH, H, CH<sub>3</sub>, vinyl, N<sub>3</sub>, CN, Cl, Br, F, I, OC(O)CH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, or O(aminoacyl);
  - (i) R<sup>7</sup> and R<sup>8</sup> are independently H, F, Cl, Br, I, OH, OCH<sub>3</sub>, SH, SCH<sub>3</sub>, NH<sub>2</sub>, NHCH<sub>3</sub>, N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>3</sub>, CH<sub>3-q</sub>X<sub>q</sub>, where X is F, Cl, Br, or I and q is 1 to 3, vinyl, CO<sub>2</sub>H, CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CONH<sub>2</sub>, CONHCH<sub>3</sub>, or CON(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, wherein R' is a C<sub>1-20</sub> alkyl; a C<sub>1-20</sub> cycloalkyl; a C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkenyl, a C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkynyl; and
- (j) R<sup>9</sup> is selected from among OH, OCH<sub>3</sub>, SH, SCH<sub>3</sub>, NH<sub>2</sub>, NHCH<sub>3</sub>, N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, OC(O)(C<sub>1-20</sub> alkyl), which include but are not limited to OC(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>8</sub>CH<sub>3</sub>, NHC(O)(C<sub>1-20</sub> alkyl), which include but are not limited to NHC(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>8</sub>CH<sub>3</sub>, and N(C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>8</sub>CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, which include but is not limited to N(C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>8</sub>CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, where s is an integer selected from 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8,
  9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, and 19.

A sixth aspect of the first embodiment is directed to a compound represented by formula **I-2** 

wherein

- (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, methyl, ethyl, *n*-propyl, *i*-propyl, phenyl, p-tolyl, p-bromo-phenyl, p-chloro-phenyl, p-fluorophenyl;
  - (b)  $R^2$  is hydrogen or  $CH_3$ ;
  - (c)  $R^{3a}$  is H and  $R^{3b}$  is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>,
- 5 CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, or lower cycloalkyl;
  - (d)  $R^4$  is hydrogen,  $C_{1-10}$  alkyl,  $C_{1-10}$  alkyl optionally substituted with a lower alkyl, alkoxy or halogen,  $C_{1-10}$  haloalkyl,  $C_{3-10}$  cycloalkyl, cycloalkyl alkyl, cycloheteroalkyl, aminoacyl, di(lower alkyl)amino-lower alkyl, aryl, such as phenyl, heteroaryl, such as, pyridinyl, substituted aryl, or substituted heteroaryl;
    - (e) R<sup>5</sup> is H, OMe, CN, CH<sub>2</sub>F, F, Cl, Br, or I;
      - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, or F;
      - (g)  $X \text{ is } H, OH, F, OCH_3, F, Cl, Br, I, or N_3;$
- (h) Y is H, OH, CH<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, or N<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, OC(O)CH<sub>3</sub>, or O(aminoacyl);
  - (i)  $R^7$  and  $R^8$  are independently H, F, Br, SCH<sub>3</sub>, CH<sub>3</sub>, CH<sub>3-q</sub>X<sub>q</sub>, where X is F, Cl, Br, or I and q is 1 to 3, vinyl, CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CONH<sub>2</sub>, CONHCH<sub>3</sub>, or CON(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>; and
- (j) R<sup>9</sup> is selected from among OH, OCH<sub>3</sub>, SH, SCH<sub>3</sub>, NH<sub>2</sub>, NHCH<sub>3</sub>,
  20 N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, OC(O)(C<sub>1-20</sub> alkyl), which include but are not limited to
  OC(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>s</sub>CH<sub>3</sub>, NHC(O)(C<sub>1-20</sub> alkyl), which include but are not limited to
  NHC(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>s</sub>CH<sub>3</sub>, and N(C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>s</sub>CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, which include but is not limited to
  N(C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>s</sub>CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, where s is an integer selected from 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8,
  9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, and 19.
- A seventh aspect of the first embodiment is directed to a compound represented by formula **I-2**

wherein

2983472-1

- (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, methyl, ethyl, *n*-propyl, *i*-propyl, phenyl, p-tolyl, p-bromo-phenyl, p-chloro-phenyl, p-fluorophenyl;
  - (b)  $R^2$  is hydrogen;
- (c)  $R^{3a}$  is H and  $R^{3b}$  is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>,
- 5 CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, or lower cycloalkyl;
  - (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, CH<sub>3</sub>, Et, <sup>1</sup>Pr, <sup>n</sup>Pr, <sup>n</sup>Bu, 2-butyl, <sup>1</sup>Bu, benzyl, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, N-methyl-aziridin-2-yl, N-methyl-azetidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-4-yl, N-methyl-piperidin-4-yl, lower haloalkyl, or di(lower alkyl)amino-lower alkyl;
- 10 (e)  $R^5$  is H;
  - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, or F;
  - (g)  $X \text{ is H, OH, OCH}_3, F, \text{ or N}_3;$
  - (h) Y is OH, OCH<sub>3</sub>, OC(O)CH<sub>3</sub>, or O(aminoacyl);
- (i) R<sup>7</sup> and R<sup>8</sup> are independently H, F, Br, SCH<sub>3</sub>, CH<sub>3</sub>, CH<sub>3-q</sub>X<sub>q</sub>,

  where X is F, Cl, Br, or I and q is 1 to 3, vinyl, CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CONH<sub>2</sub>, CONHCH<sub>3</sub>, or

  CON(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>; and
- (j) R<sup>9</sup> is selected from among OH, OCH<sub>3</sub>, NH<sub>2</sub>, NHCH<sub>3</sub>, N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, OC(O)(C<sub>1-20</sub> alkyl), which include but are not limited to OC(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>s</sub>CH<sub>3</sub>, NHC(O)(C<sub>1-20</sub> alkyl), which include but are not limited to NHC(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>s</sub>CH<sub>3</sub>,
  20 and N(C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>s</sub>CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, which include but is not limited to N(C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>s</sub>CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, where s is an integer selected from among 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, and 19.

An eighth aspect of the first embodiment is directed to a compound represented by formula **I-2** 

wherein

(a) R<sup>1</sup> is hydrogen, methyl, phenyl, p-bromo-phenyl, p-chlorophenyl, p-fluorophenyl;

Docket No. 60137.0034WOU1

- (b) R<sup>2</sup> is hydrogen;
- (c) R<sup>3a</sup> is H and R<sup>3b</sup> is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, or lower cycloalkyl;
- (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, CH<sub>3</sub>, Et, <sup>i</sup>Pr, <sup>n</sup>Pr, <sup>n</sup>Bu, 2-butyl, <sup>t</sup>Bu, benzyl, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, N-methyl-aziridin-2-yl, N-methyl-azetidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-4-yl, N-methyl-piperidin-4-yl, lower haloalkyl, or di(lower alkyl)amino-lower alkyl;
  - (e)  $R^5$  is H;
  - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, or F;
- 10 (g)  $X \text{ is } H, OH, OCH_3, F, \text{ or } N_3;$ 
  - (h) Y is OH, OCH<sub>3</sub>, OC(O)CH<sub>3</sub>, or O(aminoacyl);
  - (i)  $R^7$  and  $R^8$  are independently H, F, Br, SCH<sub>3</sub>, CH<sub>3</sub>, CH<sub>3-q</sub>X<sub>q</sub>, where X is F, Cl, Br, or I and q is 1 to 3, vinyl, CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CONH<sub>2</sub>, CONHCH<sub>3</sub>, or CON(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>;
- (j) R<sup>9</sup> is selected from among OH, OCH<sub>3</sub>, NH<sub>2</sub>, NHCH<sub>3</sub>, N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, OC(O)(C<sub>1-20</sub> alkyl), which include but are not limited to OC(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>s</sub>CH<sub>3</sub>, NHC(O)(C<sub>1-20</sub> alkyl), which include but are not limited to NHC(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>s</sub>CH<sub>3</sub>, and N(C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>s</sub>CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, which include but is not limited to N(C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>s</sub>CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, where s is an integer selected from among 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6,
  7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, and 19.

A second embodiment of the invention is directed to a compound represented by formula **I** in which the base is a structure represented by formula **b** above, wherein R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3a</sup>, R<sup>3b</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, X, Y, R<sup>7</sup>, and R<sup>8</sup>are defined in the Summary of the Invention section above.

A first aspect of the second embodiment is directed to a compound represented by formula **I-3** 

$$R^{3a}$$
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{3a}$ 
 $R^{3a$ 

wherein

- (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, n-alkyl; branched alkyl; cycloalkyl; or aryl, which includes, but is not limited to, phenyl or naphthyl, where phenyl or naphthyl are optionally substituted with at least one of C<sub>1-6</sub> alkyl, C<sub>2-6</sub> alkenyl, C<sub>2-6</sub> alkynyl, C<sub>1-6</sub> alkoxy, F, Cl, Br, I, nitro, cyano, C<sub>1-6</sub> haloalkyl, -N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, C<sub>1-6</sub> acylamino, -NHSO<sub>2</sub>C<sub>1-6</sub> alkyl, -SO<sub>2</sub>N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, COR<sup>1</sup>, and -SO<sub>2</sub>C<sub>1-6</sub> alkyl; (R<sup>1</sup> is independently hydrogen or alkyl, which includes, but is not limited to, C<sub>1-20</sub> alkyl, C<sub>1-10</sub> alkyl, or C<sub>1-6</sub> alkyl, R<sup>1</sup> is -OR' or -N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>);
  - (b)  $R^2$  is hydrogen or  $CH_3$ ;
- (c) R<sup>3a</sup> and R<sup>3b</sup> are (i) independently selected from hydrogen, C<sub>1-10</sub> alkyl, cycloalkyl, -(CH<sub>2</sub>)<sub>c</sub>(NR<sup>3</sup>)<sub>2</sub>, C<sub>1-6</sub> hydroxyalkyl, -CH<sub>2</sub>SH, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>S(O)<sub>d</sub>Me, (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>NHC(=NH)NH<sub>2</sub>, (1H-indol-3-yl)methyl, (1H-imidazol-4-yl)methyl, (CH<sub>2</sub>)<sub>e</sub>COR<sup>3</sup>", aryl and aryl C<sub>1-3</sub> alkyl, said aryl groups optionally substituted with a group selected from hydroxyl, C<sub>1-10</sub> alkyl, C<sub>1-6</sub> alkoxy, halogen, nitro and cyano; (ii) R<sup>3a</sup> and R<sup>3b</sup> both are C<sub>1-6</sub> alkyl; (iii) R<sup>3a</sup> and R<sup>3b</sup> together are (CH<sub>2</sub>)<sub>f</sub> so as to form a spiro ring; (iv) R<sup>3a</sup> is hydrogen and R<sup>3b</sup> and R<sup>2</sup> together are (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> so as to form a cyclic ring that includes the adjoining N and C atoms (v) R<sup>3b</sup> is hydrogen and R<sup>3a</sup> and R<sup>2</sup> together are (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> so as to form a cyclic ring that includes the adjoining N and C atoms, where c is 1 to 6, d is 0 to 2, e is 0 to 3, f is 2 to 5, n is 2 to 4, and where R<sup>3'</sup> is independently hydrogen or C<sub>1-6</sub> alkyl and R<sup>3"</sup> is -OR' or -N(R<sup>3'</sup>)<sub>2</sub>); (vi) R<sup>3a</sup> is H and R<sup>3b</sup> is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>,

CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH<sub>2</sub>-indol-3-yl, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>,
CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H, CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>,
CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>-imidazol-4-yl,
CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl; or (viii)

R<sup>3a</sup> is CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph,
CH<sub>2</sub>-indol-3-yl, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H, CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH,
CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>-imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower
cycloalkyl and R<sup>3b</sup> is H, where R<sup>3'</sup> is independently hydrogen or alkyl, which
includes, but is not limited to, C<sub>1-20</sub> alkyl, C<sub>1-10</sub> alkyl, or C<sub>1-6</sub> alkyl, R<sup>3"</sup> is -OR' or
-N(R<sup>3'</sup>)<sub>2</sub>);

- (d)  $R^4$  is hydrogen,  $C_{1-10}$  alkyl,  $C_{1-10}$  alkyl optionally substituted with a lower alkyl, alkoxy or halogen,  $C_{1-10}$  haloalkyl,  $C_{3-10}$  cycloalkyl, cycloalkyl alkyl, cycloheteroalkyl, aminoacyl, di(lower alkyl)amino-lower alkyl, aryl, such as phenyl, heteroaryl, such as, pyridinyl, substituted aryl, or substituted heteroaryl;
- (e) R<sup>5</sup> is H, a lower alkyl, CN, vinyl, O-(lower alkyl), hydroxyl lower alkyl, i.e., -(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>OH, where p is 1 -6, including hydroxyl methyl (CH<sub>2</sub>OH), CH<sub>2</sub>F, N<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CN, CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>NHCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, alkyne (optionally substituted), or halogen, including F, Cl, Br, or I, with the provisos that when X is OH, base is cytosine and R<sup>6</sup> is H, R<sup>5</sup> cannot be N<sub>3</sub> and when X is OH, R<sup>6</sup> is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F and B is a purine base, R<sup>5</sup> cannot be H;
  - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, F, or CN;
  - (g) X is H, OH, F, OMe, Cl, Br, I, NH<sub>2</sub>, or N<sub>3</sub>;
- 25 (h) Y is OH, H, C<sub>1-4</sub> alkyl, C<sub>2-4</sub> alkenyl, C<sub>2-4</sub> alkynyl, vinyl, N<sub>3</sub>, CN, Cl, Br, F, I, NO<sub>2</sub>, OC(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), OC(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), OC(O)O(C<sub>2-4</sub> alkynyl), OC(O)O(C<sub>2-4</sub> alkenyl), OC<sub>1-10</sub> haloalkyl, O(aminoacyl), O(C<sub>1-10</sub> acyl), O(C<sub>1-4</sub> alkyl), O(C<sub>2-4</sub> alkenyl), S(C<sub>1-4</sub> acyl), S(C<sub>1-4</sub> alkyl), S(C<sub>2-4</sub> alkynyl), S(C<sub>2-4</sub> alkynyl), SO(C<sub>2-4</sub> alkenyl), SO(C<sub>1-4</sub> acyl), SO(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO(C<sub>2-4</sub> alkynyl), SO(C<sub>2-4</sub> alkenyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> acyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>2-4</sub> alkynyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>2-4</sub> alkenyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1-4</sub> alkyl), NH(C<sub>2-4</sub>

2983472-1

15

Docket No. 60137.0034WOU1

alkenyl), NH(C<sub>2-4</sub> alkynyl), NH(C<sub>1-4</sub> acyl), N(C<sub>1-4</sub> alkyl)<sub>2</sub>, or N(C<sub>1-18</sub> acyl)<sub>2</sub>, wherein alkyl, alkynyl, alkenyl and vinyl are optionally substituted by N<sub>3</sub>, CN, one to three halogen (Cl, Br, F, I), NO<sub>2</sub>, C(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), C(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), C(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), O(C<sub>1-4</sub> alkyl), O(C<sub>1-4</sub> alkyl), O(C<sub>1-4</sub> alkyl), S(C<sub>1-4</sub> alkyl), S(C<sub>1-4</sub> alkyl), S(C<sub>1-4</sub> alkyl), S(C<sub>2-4</sub> alkenyl), S(C<sub>2-4</sub> alkenyl), SO(C<sub>1-4</sub> acyl), SO(C<sub>1-4</sub> acyl), SO(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), NH(C<sub>1-4</sub> alkyl), NH(C<sub>1-4</sub> alkyl), NH(C<sub>1-4</sub> acyl)<sub>2</sub>;

10 (i) R<sup>7</sup> and R<sup>8</sup> are independently H, F, Cl, Br, I, OH, OR', SH, SR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, lower alkyl, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkyl, lower alkenyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>H, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, wherein R' is a C<sub>1-20</sub> alkyl; a C<sub>1-20</sub> cycloalkyl; a C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkenyl, a C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkynyl.

The second aspect of the second embodiment is directed to a compound represented by formula **I-3** 

wherein

25

30

- (a)  $R^1$  is hydrogen, n-alkyl or aryl, which includes, but is not limited to, phenyl or naphthyl, where phenyl or naphthyl are optionally substituted with at least one of  $C_{1-6}$  alkyl,  $C_{1-6}$  alkoxy, F, Cl, Br, I, nitro, cyano,  $C_{1-6}$  haloalkyl;
- 20 (b) R<sup>2</sup> is hydrogen or CH<sub>3</sub>;
  - (c) R<sup>3a</sup> and R<sup>3b</sup> are independently (i) R<sup>3a</sup> is hydrogen and R<sup>3b</sup> and R<sup>2</sup> together are (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> so as to form a cyclic ring that includes the adjoining N and C atoms (v) R<sup>3b</sup> is hydrogen and R<sup>3a</sup> and R<sup>2</sup> together are (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> so as to form a cyclic ring that includes the adjoining N and C atoms, where c is 1 to 6, d is 0 to 2, e is 0 to 3, f is 3 to 5, n is 2 to 4, and where R<sup>3'</sup> is independently hydrogen or C<sub>1-6</sub> alkyl and R<sup>3"</sup> is -OR' or -N(R<sup>3'</sup>)<sub>2</sub>); (vi) R<sup>3a</sup> is H and R<sup>3b</sup> is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH<sub>2</sub>-indol-3-yl, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H, CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>-imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl; or (viii)

2983472-1 - 40 -

IPR2018-00126 Page 41 of 751 I-MAK 1005

$$\begin{split} R^{3a} &\text{ is CH}_3, \text{CH}(\text{CH}_3)_2, \text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2, \text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3, \text{CH}_2\text{Ph}, \text{CH}_2\text{-indol-3-yl, -CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_3, \text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}, \text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{NH}_2, \text{CH}_2\text{CH}_2\text{COOH}, \\ \text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{NH}_2, \text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2, -\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHC}(\text{NH})\text{NH}_2, \text{CH}_2\text{-imidazol-4-yl, CH}_2\text{OH}, \text{CH}(\text{OH})\text{CH}_3, \text{CH}_2(\text{(4'-OH)-Ph}), \text{ or CH}_2\text{SH} \text{ and } R^{3b} \text{ is H;} \end{split}$$

- 6 (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, C<sub>1-10</sub> alkyl, C<sub>1-10</sub> alkyl optionally substituted with a lower alkyl, alkoxy or halogen, C<sub>1-10</sub> haloalkyl, C<sub>3-10</sub> cycloalkyl, cycloalkyl alkyl, cycloheteroalkyl, aminoacyl, di(lower alkyl)amino-lower alkyl, aryl, such as phenyl, heteroaryl, such as, pyridinyl, substituted aryl, or substituted heteroaryl;
- 10 (e) R<sup>5</sup> is H, CN, CH<sub>3</sub>, vinyl, OCH<sub>3</sub>, OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>OH, CH<sub>2</sub>(halo), such as CH<sub>2</sub>F, N<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CN, CH<sub>2</sub>N<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>NHCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, halogen, including F, Cl, Br, or I;
  - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, F, or CN;
  - (g) X is H, OH, F, OMe, halogen, NH<sub>2</sub>, or N<sub>3</sub>;
- (h) Y is OH, H, C<sub>1-4</sub> alkyl, vinyl, N<sub>3</sub>, CN, Cl, Br, F, I, O(C<sub>1-6</sub> acyl), O(C<sub>1-4</sub> alkyl), NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1-4</sub> alkyl), NH(C<sub>2-4</sub> alkenyl), NH(C<sub>2-4</sub> alkynyl), NH(C<sub>1-4</sub> acyl), N(C<sub>1-4</sub> alkyl)<sub>2</sub>, N(C<sub>1-18</sub> acyl)<sub>2</sub>, wherein alkyl, alkynyl, alkenyl and vinyl are optionally substituted by N<sub>3</sub>, CN, one to three halogen (Cl, Br, F, I), NO<sub>2</sub>, OC(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), OC(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), OC(O)O(C<sub>2-4</sub> alkynyl), OC(O)O(C<sub>2-4</sub> alkynyl), OC(O)O(C<sub>2-4</sub> alkenyl), O(C<sub>1-10</sub> haloalkyl, O(aminoacyl), O(C<sub>1-4</sub> acyl), O(C<sub>1-4</sub> alkyl), O(C<sub>2-4</sub> alkenyl), S(C<sub>1-4</sub> acyl), S(C<sub>1-4</sub> alkyl), S(C<sub>2-4</sub> alkynyl), S(C<sub>2-4</sub> alkenyl), SO(C<sub>1-4</sub> acyl), SO(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>2-4</sub> alkenyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> acyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>2-4</sub> alkenyl), NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1-4</sub> alkyl), NH(C<sub>2-4</sub> alkenyl), NH(C<sub>2-4</sub> alkenyl), NH(C<sub>1-4</sub> acyl)<sub>2</sub>;
  - (i) R<sup>7</sup> and R<sup>8</sup> are independently H, F, Cl, Br, I, OH, OR', SH, SR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, lower alkyl, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkyl, lower alkenyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>H, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, wherein R' is a C<sub>1-20</sub> alkyl; a C<sub>1-20</sub> cycloalkyl; a C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkenyl, a C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkynyl.

Docket No. 60137.0034WOU1

The third aspect of the second embodiment is directed to a compound represented by formula **I-3** 

#### wherein

- (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, n-alkyl or a substituted or unsubstituted phenyl, 5 where the substitutent of the substituted phenyl is at least one of a C<sub>1-3</sub> alkyl, a C<sub>1-3</sub> alkoxy, F, Cl, Br, I, nitro, cyano, and a C<sub>1-3</sub> haloalkyl;
  - (b)  $R^2$  is hydrogen,  $CH_3$ ,  $R^{3a}$  or  $R^{3b}$  and  $R^2$  together are  $(CH_2)_3$  so as to form a cyclic ring that includes the adjoining N and C atoms,  $C(O)CR^{3a}R^{3b}NHR^1$ , where n is 2 to 4 and  $R^1$ ,  $R^{3a}$ , and  $R^{3b}$  are as defined herein;
- R<sup>3a</sup> and R<sup>3b</sup> are independently (i) R<sup>3a</sup> is hydrogen and R<sup>3b</sup> and R<sup>2</sup> 10 together are (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> so as to form a cyclic ring that includes the adjoining N and C atoms (v)  $R^{3b}$  is hydrogen and  $R^{3a}$  and  $R^2$  together are  $(CH_2)_n$  so as to form a cyclic ring that includes the adjoining N and C atoms, where c is 1 to 6, d is 0 to 2, e is 0 to 3, f is 3 to 5, n is 2 to 4, and where R<sup>3'</sup> is independently hydrogen or  $C_{1-6}$  alkyl and  $R^{3"}$  is -OR' or -N( $R^{3'}$ )<sub>2</sub>); (vi)  $R^{3a}$  is H and  $R^{3b}$  is H, CH<sub>3</sub>, 15 CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH<sub>2</sub>-indol-3-yl, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H, CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>,  $CH_2CH_2CH_2CH_2NH_2, -CH_2CH_2CH_2NHC(NH)NH_2, CH_2\text{-}imidazol\text{-}4-yl, \\$ CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl; or (viii) R<sup>3a</sup> is CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH<sub>2</sub>-indol-3-20 yl, -CH2CH2SCH3, CH2CO2H, CH2C(O)NH2, CH2CH2COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl and R<sup>3b</sup> is H;
- 25 (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, CH<sub>3</sub>, Et, <sup>i</sup>Pr, <sup>n</sup>Pr, <sup>n</sup>Bu, 2-butyl, <sup>i</sup>Bu, benzyl, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, N-methyl-aziridin-2-yl, N-methyl-azetidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-4-yl, N-methyl-piperidin-4-yl, lower haloalkyl, or di(lower alkyl)amino-lower alkyl;

2983472-1 - 42 -

IPR2018-00126 Page 43 of 751 I-MAK 1005

Docket No. 60137.0034WOU1

(e) R<sup>5</sup> is H, CN, CH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>OH, CH<sub>2</sub>(halo), such as CH<sub>2</sub>F, N<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CN, CH<sub>2</sub>N<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>NHCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, halogen, including F, Cl, Br, or I;

- (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, F, or CN;
- 5 (g) X is H, OH, F, OCH<sub>3</sub>, halogen, NH<sub>2</sub>, or N<sub>3</sub>
  - (h) Y is OH, H, CH<sub>3</sub>, vinyl, N<sub>3</sub>, CN, Cl, Br, F, I, OC(O)CH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, NH<sub>2</sub>, NHCH<sub>3</sub>, NH(vinyl), NH(acetyl), NH(C(O)CH<sub>3</sub>), N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, N(C(O)CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>;
- (i) R<sup>7</sup> and R<sup>8</sup> are independently H, F, Cl, Br, I, OH, OCH<sub>3</sub>, SH, SCH<sub>3</sub>, NH<sub>2</sub>, NHCH<sub>3</sub>, N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>3</sub>, CH<sub>3-q</sub>X<sub>q</sub>, where X is F, Cl, Br, or I and q is 1 to 3, vinyl, CO<sub>2</sub>H, CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CONH<sub>2</sub>, CONHCH<sub>3</sub>, or CON(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>.

The fourth aspect of the second embodiment is directed to a compound represented by formula **I-3** 

# wherein

- (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, n-alkyl or a substituted or unsubstituted phenyl,
  where the substitutent of the substituted phenyl is at least one of a CH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>,
  F, Cl, Br, I, nitro, cyano, and a CH<sub>3-q</sub>X<sub>q</sub>, where X is F, Cl, Br, or I, and q is 1-3;
  - (b)  $R^2$  is hydrogen or  $CH_3$ ;
- (c) R<sup>3a</sup> is H and R<sup>3b</sup> is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>,
  CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH<sub>2</sub>-indol-3-yl, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H,
  20 CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>-imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl or R<sup>3a</sup> is CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>,
  CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH<sub>2</sub>-indol-3-yl, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H,
  CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, 25 CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>-imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl and R<sup>3b</sup> is H;
  - (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, CH<sub>3</sub>, Et, <sup>i</sup>Pr, <sup>n</sup>Pr, <sup>n</sup>Bu, 2-butyl, <sup>t</sup>Bu, benzyl, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, N-methyl-aziridin-2-yl, N-methyl-aziridin-2-yl

5

methyl-azetidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-4-yl, N-methyl-piperidin-4-yl, lower haloalkyl, or di(lower alkyl)amino-lower alkyl;

- (e) R<sup>5</sup> is H, CN, CH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>OH, CH<sub>2</sub>(halo), such as CH<sub>2</sub>F, N<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CN, CH<sub>2</sub>N<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>NHCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, halogen, including F, Cl, Br, or I;
  - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, F, or CN;
  - (g)  $X \text{ is } H, OH, F, OCH_3, NH_2, \text{ or } N_3;$
- (h) Y is OH, H, CH<sub>3</sub>, vinyl, N<sub>3</sub>, CN, Cl, Br, F, I, OC(O)CH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, NH<sub>2</sub>, NHCH<sub>3</sub>, NH(vinyl), NH(acetyl), NH(C(O)CH<sub>3</sub>), N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, N(C(O)CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>;
- (i) R<sup>7</sup> and R<sup>8</sup> are independently H, F, Cl, Br, I, OH, OCH<sub>3</sub>, SH, SCH<sub>3</sub>, NH<sub>2</sub>, NHCH<sub>3</sub>, N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>3</sub>, CH<sub>3-q</sub>X<sub>q</sub>, where X is F, Cl, Br, or I and q is 1 to 3, vinyl, CO<sub>2</sub>H, CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CONH<sub>2</sub>, CONHCH<sub>3</sub>, or CON(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, wherein R' is a C<sub>1-20</sub> alkyl; a C<sub>1-20</sub> cycloalkyl; a C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkenyl, a C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkynyl.

The fifth aspect of the second embodiment is directed to a compound represented by formula **I-4** 

$$R^{3a} = \begin{bmatrix} R^{3b} & R^2 & 0 \\ & & &$$

**I-4** 

wherein

(a) R<sup>1</sup> is hydrogen, methyl, ethyl, *n*-propyl, *i*-propyl, or a substituted or unsubstituted phenyl, where the substitutent of the substituted phenyl is at

2983472-1

- 44 -

least one of a CH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, nitro, cyano, and a CH<sub>3-q</sub>X<sub>q</sub>, where X is F, Cl, Br, or I, and q is 1-3;

- (b)  $R^2$  is hydrogen or  $CH_3$ ;
- (c) R<sup>3a</sup> is H and R<sup>3b</sup> is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>,

  5 CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH<sub>2</sub>-indol-3-yl, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H,

  CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, 
  CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>-imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl or R<sup>3a</sup> is CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>,

  CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH<sub>2</sub>-indol-3-yl, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H,

  10 CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, 
  CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>-imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl and R<sup>3b</sup> is H;
- (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, CH<sub>3</sub>, Et, <sup>i</sup>Pr, <sup>n</sup>Pr, <sup>n</sup>Bu, 2-butyl, <sup>i</sup>Bu, benzyl, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, N-methyl-aziridin-2-yl, N-methyl-azetidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-4-yl, N-methyl-piperidin-4-yl, lower haloalkyl, or di(lower alkyl)amino-lower alkyl;
  - (e) R<sup>5</sup> is H, CN, CH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>OH, CH<sub>2</sub>F, N<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CN, CH<sub>2</sub>N<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>NHCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, halogen, including F, Cl, Br, or I;
    - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, F, or CN;
- 20 (g) X is H, OH, F, OCH<sub>3</sub>, Cl, Br, I, NH<sub>2</sub>, or N<sub>3</sub>;
  - (h) Y is OH, H, CH<sub>3</sub>, vinyl, N<sub>3</sub>, CN, Cl, Br, F, I, OC(O)CH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, NH<sub>2</sub>, NHCH<sub>3</sub>, NH(vinyl), NH(acetyl), NH(C(O)CH<sub>3</sub>), N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, N(C(O)CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>;
- (i) R<sup>7</sup> and R<sup>8</sup> are independently H, F, Cl, Br, I, OH, OCH<sub>3</sub>, SH, SCH<sub>3</sub>, NH<sub>2</sub>, NHCH<sub>3</sub>, N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>3</sub>, CH<sub>3-q</sub>X<sub>q</sub>, where X is F, Cl, Br, or I and q is
  1 to 3, vinyl, CO<sub>2</sub>H, CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CONH<sub>2</sub>, CONHCH<sub>3</sub>, or CON(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, wherein R' is a C<sub>1-20</sub> alkyl; a C<sub>1-20</sub> cycloalkyl; a C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkenyl, a C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkynyl,

The sixth aspect of the second embodiment is directed to a compound represented by formula **I-4** 

#### wherein

- (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, methyl, ethyl, *n*-propyl, *i*-propyl, phenyl, p-tolyl, p-bromo-phenyl, p-chloro-phenyl, p-fluorophenyl;
  - (b)  $R^2$  is hydrogen or  $CH_3$ ;
- 5 (c) R<sup>3a</sup> is H and R<sup>3b</sup> is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH<sub>2</sub>-indol-3-yl, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H, CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>-imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl;
- 10 (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, CH<sub>3</sub>, Et, <sup>i</sup>Pr, <sup>n</sup>Pr, <sup>n</sup>Bu, 2-butyl, <sup>t</sup>Bu, benzyl, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, N-methyl-aziridin-2-yl, N-methyl-azetidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-4-yl, N-methyl-piperidin-4-yl, lower haloalkyl, or di(lower alkyl)amino-lower alkyl;
- (e) R<sup>5</sup> is H, CN, CH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>OH, CH<sub>2</sub>F, halogen, including F, Cl, Br, or I;
  - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, F, or CN;
  - (g)  $X \text{ is } H, OH, F, OCH_3, NH_2, \text{ or } N_3;$
  - (h) Y is OH, H, CH<sub>3</sub>, vinyl, NH<sub>2</sub>, N<sub>3</sub>, CN, Cl, Br, F, I, OC(O)CH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>;
- 20 (i) R<sup>7</sup> and R<sup>8</sup> are independently H, F, Cl, Br, I, OH, OCH<sub>3</sub>, SH, SCH<sub>3</sub>, NH<sub>2</sub>, NHCH<sub>3</sub>, N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>3</sub>, CH<sub>3-q</sub>X<sub>q</sub>, where X is F, Cl, Br, or I and q is 1 to 3, vinyl, CO<sub>2</sub>H, CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CONH<sub>2</sub>, CONHCH<sub>3</sub>, or CON(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, wherein R' is a C<sub>1-20</sub> alkyl; a C<sub>1-20</sub> cycloalkyl; a C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkenyl, a C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkynyl.

The seventh aspect of the second embodiment is directed to a compound represented by formula **I-4** 

wherein

Docket No. 60137.0034WOU1

(a) R<sup>1</sup> is hydrogen, methyl, ethyl, *n*-propyl, *i*-propyl, phenyl, p-tolyl, p-bromo-phenyl, p-chloro-phenyl, p-fluorophenyl;

- (b)  $R^2$  is hydrogen or  $CH_3$ ;
- (c)  $R^{3a}$  is H and  $R^{3b}$  is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>,
- 5 CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, or lower cycloalkyl;
  - (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, CH<sub>3</sub>, Et, <sup>i</sup>Pr, <sup>n</sup>Pr, <sup>n</sup>Bu, 2-butyl, <sup>t</sup>Bu, benzyl, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, N-methyl-aziridin-2-yl, N-methyl-azetidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-4-yl, N-methyl-piperidin-4-yl, lower haloalkyl, or di(lower alkyl)amino-lower alkyl;
- 10 (e)  $R^5$  is H, OMe, CN,  $CH_2F$ , F, Cl, Br, or I;
  - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, or F;
  - (g) X is H, OH, F, OCH<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, NH<sub>2</sub> or N<sub>3</sub>;
  - (h) Y is H, OH, CH<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, NH<sub>2</sub> or N<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, or OC(O)CH<sub>3</sub>;
- (i) R<sup>7</sup> and R<sup>8</sup> are independently H, F, Br, SCH<sub>3</sub>, CH<sub>3</sub>, CH<sub>3-q</sub>X<sub>q</sub>,

  where X is F, Cl, Br, or I and q is 1 to 3, vinyl, CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CONH<sub>2</sub>, CONHCH<sub>3</sub>, or
  CON(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>;

The eighth aspect of the second embodiment is directed to a compound represented by formula I-4

wherein

- 20 (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, methyl, ethyl, *n*-propyl, *i*-propyl, phenyl, p-tolyl, p-bromo-phenyl, p-chloro-phenyl, p-fluorophenyl;
  - (b) R<sup>2</sup> is hydrogen;
  - (c) R<sup>3a</sup> is H and R<sup>3b</sup> is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, or lower cycloalkyl;

Docket No. 60137.0034WOU1

(d) R<sup>4</sup> is hydrogen, CH<sub>3</sub>, Et, 'Pr, "Pr, "Bu, 2-butyl, 'Bu, benzyl, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, N-methyl-aziridin-2-yl, N-methyl-azetidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-4-yl, N-methyl-piperidin-4-yl, lower haloalkyl, or di(lower alkyl)amino-lower alkyl;

- 5 (e)  $R^5$  is H;
  - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, or F;
  - (g) X is H, OH, OCH<sub>3</sub>, F,  $NH_2$  or  $N_3$ ;
  - (h) Y is OH,  $NH_2$  OCH<sub>3</sub>, or OC(O)CH<sub>3</sub>;
- (i) R<sup>7</sup> and R<sup>8</sup> are independently H, F, Br, SCH<sub>3</sub>, CH<sub>3</sub>, CH<sub>3-q</sub>X<sub>q</sub>,

  10 where X is F, Cl, Br, or I and q is 1 to 3, vinyl, CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CONH<sub>2</sub>, CONHCH<sub>3</sub>, or CON(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>.

The ninth aspect of the second embodiment is directed to a compound represented by formula I-4

wherein

- 15 (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, methyl, phenyl, p-bromo-phenyl, p-chloro-phenyl, p-fluorophenyl;
  - (b) R<sup>2</sup> is hydrogen;
  - (c) R<sup>3a</sup> is H and R<sup>3b</sup> is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, or lower cycloalkyl;
- 20 (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, CH<sub>3</sub>, Et, <sup>i</sup>Pr, <sup>n</sup>Pr, <sup>n</sup>Bu, 2-butyl, <sup>t</sup>Bu, benzyl, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, N-methyl-aziridin-2-yl, N-methyl-azetidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-4-yl, N-methyl-piperidin-4-yl, lower haloalkyl, or di(lower alkyl)amino-lower alkyl;
  - (e)  $R^5$  is H;
- 25 (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, or F;

Docket No. 60137.0034WOU1

- (g)  $X \text{ is } H, OH, OCH_3, F, \text{ or } N_3;$
- (h) Y is OH, OCH<sub>3</sub>, or OC(O)CH<sub>3</sub>;
- (i) R<sup>7</sup> and R<sup>8</sup> are independently H, F, Br, SCH<sub>3</sub>, CH<sub>3</sub>, CH<sub>3-q</sub>X<sub>q</sub>, where X is F, Cl, Br, or I and q is 1 to 3, vinyl, CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CONH<sub>2</sub>, CONHCH<sub>3</sub>, or CON(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>.

A third embodiment of the invention is directed to a compound represented by formula I in which the base is a structure represented by formula **c** above, wherein R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3a</sup>, R<sup>3b</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, X, Y, Z, R<sup>10</sup>, R<sup>11</sup>, and R<sup>12</sup> are defined in the Summary of the Invention section above; with the proviso that R<sup>11</sup> is not H.

A first aspect of the third embodiment is directed to a compound represented by formula I-5

$$R^{3a}$$
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{3b}$ 

wherein

20

10

(a)  $R^1$  is hydrogen, n-alkyl; branched alkyl; cycloalkyl; or aryl, which includes, but is not limited to, phenyl or naphthyl, where phenyl or naphthyl are optionally substituted with at least one of  $C_{1-6}$  alkyl,  $C_{2-6}$  alkenyl,  $C_{2-6}$  alkynyl,  $C_{1-6}$  alkoxy, F, Cl, Br, I, nitro, cyano,  $C_{1-6}$  haloalkyl,  $-N(R^{1'})_2$ ,  $C_{1-6}$  acylamino,  $-NHSO_2C_{1-6}$  alkyl,  $-SO_2N(R^{1'})_2$ ,  $COR^{1"}$ , and  $-SO_2C_{1-6}$  alkyl;  $(R^{1'})_3$  is independently hydrogen or alkyl, which includes, but is not limited to,  $C_{1-20}$  alkyl,  $C_{1-10}$  alkyl, or  $C_{1-6}$  alkyl,  $R^{1"}$  is -OR' or  $-N(R^{1'})_2$ );

2983472-1 - 49 -

IPR2018-00126 Page 50 of 751 I-MAK 1005

Docket No. 60137.0034WOU1

- (b)  $R^2$  is hydrogen or  $CH_3$ ;
- R<sup>3a</sup> and R<sup>3b</sup> are (i) independently selected from hydrogen, C<sub>1-10</sub> alkyl, cycloalkyl, -(CH<sub>2</sub>)<sub>c</sub>(NR<sup>3'</sup>)<sub>2</sub>, C<sub>1-6</sub> hydroxyalkyl, -CH<sub>2</sub>SH, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>S(O)<sub>d</sub>Me, -(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>NHC(=NH)NH<sub>2</sub>, (1H-indol-3-yl)methyl, (1H-imidazol-4-yl)methyl, -(CH<sub>2</sub>)<sub>e</sub>COR<sup>3</sup>", aryl and aryl C<sub>1-3</sub> alkyl, said aryl groups optionally substituted 5 with a group selected from hydroxyl, C<sub>1-10</sub> alkyl, C<sub>1-6</sub> alkoxy, halogen, nitro and cyano; (ii) R<sup>3a</sup> and R<sup>3b</sup> both are C<sub>1-6</sub> alkyl; (iii) R<sup>3a</sup> and R<sup>3b</sup> together are(CH<sub>2</sub>)<sub>f</sub> so as to form a spiro ring; (iv) R<sup>3a</sup> is hydrogen and R<sup>3b</sup> and R<sup>2</sup> together are (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> so as to form a cyclic ring that includes the adjoining N and C atoms (v) R<sup>3b</sup> is hydrogen and R<sup>3a</sup> and R<sup>2</sup> together are (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> so as to form a cyclic ring that 10 includes the adjoining N and C atoms, where c is 1 to 6, d is 0 to 2, e is 0 to 3, f is 2 to 5, n is 2 to 4, and where  $R^{3'}$  is independently hydrogen or  $C_{1-6}$  alkyl and  $R^{3''}$  is -OR' or -N( $R^{3'}$ )<sub>2</sub>); (vi)  $R^{3a}$  is H and  $R^{3b}$  is from H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH<sub>2</sub>-indol-3-yl, -15 CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H, CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>-imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl; or (viii) R<sup>3a</sup> is CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH<sub>2</sub>-indol-3-yl, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H, CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>-20 imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl and R<sup>3b</sup> is H, where R<sup>3'</sup> is independently hydrogen or alkyl, which includes, but is not limited to, C<sub>1-20</sub> alkyl, C<sub>1-10</sub> alkyl, or C<sub>1-6</sub> alkyl, R<sup>3"</sup> is -OR' or  $-N(R^{3'})_2);$
- 25 (d)  $R^4$  is hydrogen,  $C_{1-10}$  alkyl,  $C_{1-10}$  alkyl optionally substituted with a lower alkyl, alkoxy or halogen,  $C_{1-10}$  haloalkyl,  $C_{3-10}$  cycloalkyl, cycloalkyl alkyl, cycloheteroalkyl, aminoacyl, di(lower alkyl)amino-lower alkyl, aryl, such as phenyl, heteroaryl, such as, pyridinyl, substituted aryl, or substituted heteroaryl;
- 30 (e) R<sup>5</sup> is H, a lower alkyl, CN, vinyl, O-(lower alkyl), hydroxyl lower alkyl, i.e., -(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>OH, where p is 1 -6, including hydroxyl methyl (CH<sub>2</sub>OH), CH<sub>2</sub>F, N<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CN, CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>NHCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, alkyne (optionally

2983472-1

IPR2018-00126 Page 51 of 751 I-MAK 1005

Docket No. 60137.0034WOU1

substituted), or halogen, including F, Cl, Br, or I, with the provisos that when X is OH, base is cytosine and R<sup>6</sup> is H, R<sup>5</sup> cannot be N<sub>3</sub> and when X is OH, R<sup>6</sup> is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F and B is a purine base, R<sup>5</sup> cannot be H;

- (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, F, or CN;
- 5 (g) X is H, OH, F, OMe, halogen, NH<sub>2</sub>, or N<sub>3</sub>;
- Y is OH, H, C<sub>1-4</sub> alkyl, C<sub>2-4</sub> alkenyl, C<sub>2-4</sub> alkynyl, vinyl, N<sub>3</sub>, CN, (h) Cl, Br, F, I, NO<sub>2</sub>, OC(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), OC(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), OC(O)O(C<sub>2-4</sub> alkynyl),  $OC(O)O(C_{2-4}$  alkenyl),  $OC_{1-10}$  haloalkyl, O(aminoacyl),  $O(C_{1-10}$  acyl),  $O(C_{1-4} \text{ alkyl}), O(C_{2-4} \text{ alkenyl}), S(C_{1-4} \text{ acyl}), S(C_{1-4} \text{ alkyl}), S(C_{2-4} \text{ alkynyl}), S(C_{2-4} \text$ alkenyl), SO(C<sub>1-4</sub> acyl), SO(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO(C<sub>2-4</sub> alkynyl), SO(C<sub>2-4</sub> alkenyl), 10 SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> acyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>2-4</sub> alkynyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>2-4</sub> alkenyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> 4 acyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>2-4</sub> alkenyl), NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1-4</sub> alkyl), NH(C<sub>2-4</sub> alkenyl), NH(C<sub>2-4</sub> alkynyl), NH(C<sub>1-4</sub> acyl), N(C<sub>1-4</sub> alkyl)<sub>2</sub>, N(C<sub>1-18</sub> acyl)<sub>2</sub>, wherein alkyl, alkynyl, alkenyl and vinyl are optionally substituted by N<sub>3</sub>, CN, one to three halogen (Cl, Br, F, I), NO<sub>2</sub>, C(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), C(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), 15  $C(O)O(C_{2-4} \text{ alkynyl}), C(O)O(C_{2-4} \text{ alkenyl}), O(C_{1-4} \text{ acyl}), O(C_{1-4} \text{ alkyl}), O(C_{2-4} \text{ alkyl})$ alkenyl),  $S(C_{1-4} \text{ acyl})$ ,  $S(C_{1-4} \text{ alkyl})$ ,  $S(C_{2-4} \text{ alkynyl})$ ,  $S(C_{2-4} \text{ alkenyl})$ ,  $S(C_{1-4} \text{ alkenyl})$ ,  $S(C_{1-4} \text{ alkynyl})$ ,  $S(C_{2-4} \text{ alkenyl})$ ,  $S(C_{2-4} \text$ acyl), SO(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO(C<sub>2-4</sub> alkynyl), SO(C<sub>2-4</sub> alkenyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> acyl),  $SO_2(C_{1-4} \text{ alkyl}), SO_2(C_{2-4} \text{ alkynyl}), SO_2(C_{2-4} \text{ alkenyl}), OS(O)_2(C_{1-4} \text{ acyl}),$  $OS(O)_2(C_{1-4} \text{ alkyl}), OS(O)_2(C_{2-4} \text{ alkenyl}), NH_2, NH(C_{1-4} \text{ alkyl}), NH(C_{2-4} \text{ alkyl})$ 20 alkenyl), NH( $C_{2-4}$  alkynyl), NH( $C_{1-4}$  acyl), N( $C_{1-4}$  alkyl)<sub>2</sub>, N( $C_{1-4}$  acyl)<sub>2</sub>;
  - (i)  $R^{10}$  and  $R^{11}$  are independently H, F, Cl, Br, I, OH, OR', SH, SR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkenyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkenyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkynyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> such as C=CH, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkynyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkoxy of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkoxy of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>H, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R', with the proviso that when  $R^{10}$  is OH and  $R^{11}$  is not NH<sub>2</sub>;
- wherein R' is an optionally substituted alkyl, which includes, but is not limited to, an optionally substituted  $C_{1-20}$  alkyl, an optionally substituted  $C_{1-10}$  alkyl, an optionally substituted lower alkyl; an optionally substituted cycloalkyl;

2983472-1 - 51 -

25

IPR2018-00126 Page 52 of 751 I-MAK 1005

Docket No. 60137.0034WOU1

an optionally substituted alkynyl of  $C_2$ - $C_6$ , an optionally substituted lower alkenyl of  $C_2$ - $C_6$ , or optionally substituted acyl, which includes but is not limited to C(O) alkyl,  $C(O)(C_{1-20}$  alkyl),  $C(O)(C_{1-10}$  alkyl), or C(O)(lower alkyl) or alternatively, in the instance of  $NR'_2$ , each R' comprise at least one C atom that are joined to form a heterocycle comprising at least two carbon atoms; and

(j) Z is N or  $CR^{12}$ ; and

R<sup>12</sup> is an H, halogen (including F, Cl, Br, I), OH, OR', SH, SR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub> lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkenyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkenyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkynyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkynyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkoxy of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkoxy of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>H, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R'.

A second aspect of the third embodiment is directed to a compound represented by formula **I-5** 

wherein

5

10

- (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, methyl, ethyl, *n*-propyl, *i*-propyl, phenyl, p-tolyl, p-bromo-phenyl, p-chloro-phenyl, p-fluorophenyl;
  - (b) R<sup>2</sup> is hydrogen or CH<sub>3</sub>;
- (c) R<sup>3a</sup> is H and R<sup>3b</sup> is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>,

  CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH<sub>2</sub>-indol-3-yl, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H,

  CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, 
  CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>-imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl;
- (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, CH<sub>3</sub>, Et, <sup>i</sup>Pr, <sup>n</sup>Pr, <sup>n</sup>Bu, 2-butyl, <sup>i</sup>Bu, benzyl,
   cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, N-methyl-aziridin-2-yl, N-methyl-azetidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-4-yl, lower haloalkyl, or di(lower alkyl)amino-lower alkyl;

2983472-1

IPR2018-00126 Page 53 of 751 I-MAK 1005

Docket No. 60137.0034WOU1

(e) R<sup>5</sup> is H, CN, CH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>OH, CH<sub>2</sub>F, halogen, including F, Cl, Br, or I, with the provisos that when X is OH, R<sup>6</sup> is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F, R<sup>5</sup> cannot be H.

- (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, F, or CN;
- 5 (g) X is H, OH, F, OCH<sub>3</sub>, Cl, Br, I, NH<sub>2</sub>, or N<sub>3</sub>;
  - (h) Y is OH, H, CH<sub>3</sub>, vinyl, NH<sub>2</sub>, N<sub>3</sub>, CN, Cl, Br, F, I, OC(O)CH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>;
- (i) R<sup>10</sup> and R<sup>11</sup> are independently H, F, Br, I, OH, OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R', with the proviso that when R<sup>10</sup> is OH and R<sup>11</sup> is not NH<sub>2</sub>;

wherein R' is a lower alkyl, a lower cycloalkyl, or C(O)(lower alkyl) or alternatively, in the instance of NR'<sub>2</sub>, each R' comprise at least one C atom that are joined to form a heterocycle comprising at least two carbon atoms; and

- (j) Z is N or  $CR^{12}$ ; and
- R<sup>12</sup> is an H, halogen (including F, Cl, Br, I), OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>, lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R'.

A third aspect of the third embodiment is directed to a compound represented by formula **I-5** 

wherein

20

- (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, methyl, ethyl, *n*-propyl, *i*-propyl, phenyl, p-tolyl, p-bromo-phenyl, p-chloro-phenyl, p-fluorophenyl;
  - (b)  $R^2$  is hydrogen or  $CH_3$ ;
- 25 (c) R<sup>3a</sup> is H and R<sup>3b</sup> is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, or lower cycloalkyl;

2983472-1

- 53 -

Docket No. 60137.0034WOU1

(d) R<sup>4</sup> is hydrogen, CH<sub>3</sub>, Et, <sup>i</sup>Pr, <sup>n</sup>Pr, <sup>n</sup>Bu, 2-butyl, <sup>t</sup>Bu, benzyl, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, N-methyl-aziridin-2-yl, N-methyl-azetidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-4-yl, N-methyl-piperidin-4-yl, lower haloalkyl, or di(lower alkyl)amino-lower alkyl;

- 5 (e) R<sup>5</sup> is H, CN, CH<sub>2</sub>F, F, Cl, Br, or I; with the proviso that X is OH, R<sup>6</sup> is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F, R<sup>5</sup> cannot be H;
  - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, or F;
  - (g) X is H, OH, F, OCH<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, NH<sub>2</sub> or N<sub>3</sub>;
  - (h) Y is H, OH, CH<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, NH<sub>2</sub> or N<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, or OC(O)CH<sub>3</sub>;
- 10 (i) R<sup>10</sup> and R<sup>11</sup> are independently H, F, Br, I, OH, OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R', with the proviso that when R<sup>10</sup> is OH and R<sup>11</sup> is not NH<sub>2</sub>;

wherein R' is a lower alkyl, a lower cycloalkyl, or C(O)(lower alkyl) or alternatively, in the instance of NR'<sub>2</sub>, each R' comprise at least one C atom that are joined to form a heterocycle comprising at least two carbon atoms; and

(j) Z is N or  $CR^{12}$ ; and

 $R^{12}$  is an H, halogen (including F, Cl, Br, I), OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>, lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R'.

A fourth aspect of the third embodiment is directed to a compound represented by formula I-5

wherein

- (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, methyl, ethyl, *n*-propyl, *i*-propyl, phenyl, p-tolyl, p-bromo-phenyl, p-chloro-phenyl, p-fluorophenyl;
  - (b) R<sup>2</sup> is hydrogen;

2983472-1

Docket No. 60137.0034WOU1

5

15

(c) R<sup>3a</sup> is H and R<sup>3b</sup> is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, or lower cycloalkyl;

- (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, CH<sub>3</sub>, Et, <sup>i</sup>Pr, <sup>n</sup>Pr, <sup>n</sup>Bu, 2-butyl, <sup>i</sup>Bu, benzyl, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, N-methyl-aziridin-2-yl, N-methyl-azetidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-4-yl, N-methyl-piperidin-4-yl, lower haloalkyl, or di(lower alkyl)amino-lower alkyl;
  - (e)  $R^5$  is H, with the provisos that when X is OH,  $R^6$  is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F,  $R^5$  cannot be H;
    - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, or F;
- 10 (g) X is H, OH, OCH<sub>3</sub>, F, NH<sub>2</sub> or N<sub>3</sub>;
  - (h) Y is OH,  $NH_2$ ,  $OCH_3$ , or  $OC(O)CH_3$ ;
  - (i)  $R^{10}$  and  $R^{11}$  are independently H, F, Br, I, OH, OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R', with the proviso that when  $R^{10}$  is OH and  $R^{11}$  is not NH<sub>2</sub>;
  - wherein R' is a lower alkyl, a lower cycloalkyl, or C(O)(lower alkyl) or alternatively, in the instance of NR'<sub>2</sub>, each R' comprise at least one C atom that are joined to form a heterocycle comprising at least two carbon atoms; and
    - (j) Z is N or  $CR^{12}$ ; and

R<sup>12</sup> is an H, halogen (including F, Cl, Br, I), OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>, lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R'.

A fifth aspect of the third embodiment is directed to a compound represented by formula I-5

25 wherein

(a) R<sup>1</sup> is hydrogen, methyl, phenyl, p-bromo-phenyl, p-chloro-phenyl, p-fluorophenyl;

Docket No. 60137.0034WOU1

- (b)  $R^2$  is hydrogen;
- (c) R<sup>3a</sup> is H and R<sup>3b</sup> is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, or lower cycloalkyl;
- (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, CH<sub>3</sub>, Et, <sup>1</sup>Pr, <sup>n</sup>Pr, <sup>n</sup>Bu, 2-butyl, <sup>1</sup>Bu, benzyl, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, N-methyl-aziridin-2-yl, N-methyl-azetidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-4-yl, N-methyl-piperidin-4-yl, lower haloalkyl, or di(lower alkyl)amino-lower alkyl;
  - (e) R<sup>5</sup> is H, with the provisos that when X is OH, R<sup>6</sup> is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F, R<sup>5</sup> cannot be H;
- 10 (f)  $R^6$  is H,  $CH_3$ ,  $CH_2F$ ,  $CHF_2$ ,  $CF_3$ , or F;
  - (g)  $X \text{ is } H, OH, OCH_3, F, NH_2 \text{ or } N_3;$
  - (h) Y is OH,  $NH_2$ ,  $OCH_3$ , or  $OC(O)CH_3$ ;
- (i) R<sup>10</sup> and R<sup>11</sup> are independently H, F, Br, I, OH, OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R', with the proviso that when R<sup>10</sup> is OH and R<sup>11</sup> is not NH<sub>2</sub>;

wherein R' is a lower alkyl, a lower cycloalkyl, or C(O)(lower alkyl) or alternatively, in the instance of NR'<sub>2</sub>, each R' comprise at least one C atom that are joined to form a heterocycle comprising at least two carbon atoms; and

- (j) Z is N or  $CR^{12}$ ; and
- 20 R<sup>12</sup> is an H, halogen (including F, Cl, Br, I), OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>, lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R'.

A sixth aspect of the third embodiment is directed to a compound represented by formula I-5

25 wherein

- (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, methyl, ethyl, *n*-propyl, *i*-propyl, phenyl, p-tolyl, p-bromo-phenyl, p-chloro-phenyl, p-fluorophenyl;
  - (b)  $R^2$  is hydrogen or  $CH_3$ ;
- (c) R<sup>3a</sup> is H and R<sup>3b</sup> is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>,

  5 CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH<sub>2</sub>-indol-3-yl, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H,

  CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, 
  CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>-imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl;
- (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, CH<sub>3</sub>, Et, <sup>i</sup>Pr, <sup>n</sup>Pr, <sup>n</sup>Bu, 2-butyl, <sup>i</sup>Bu, benzyl, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, N-methyl-aziridin-2-yl, N-methyl-azetidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-4-yl, N-methyl-piperidin-4-yl, lower haloalkyl, or di(lower alkyl)amino-lower alkyl;
  - (e) R<sup>5</sup> is H, CN, CH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>OH, CH<sub>2</sub>F, halogen, including F, Cl, Br, or I, with the provisos that when X is OH, R<sup>6</sup> is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F, R<sup>5</sup> cannot be H.
    - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, F, or CN;
    - (g) X is H, OH, F, OCH<sub>3</sub>, Cl, Br, I, NH<sub>2</sub>, or N<sub>3</sub>;
    - (h) Y is OH, H, CH<sub>3</sub>, vinyl, NH<sub>2</sub>, N<sub>3</sub>, CN, Cl, Br, F, I, OC(O)CH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>;
- 20 (i)  $R^{10}$  is  $NH_2$  and  $R^{11}$  is H, F, Br, I, OH, OR',  $NH_2$ , NHR',  $NR'_2$ ,  $CO_2R'$ ,  $CONH_2$ , CONHR',  $CONR'_2$ ,  $CH=CHCO_2H$ , or  $CH=CHCO_2R'$ ;

wherein R' is a lower alkyl, a lower cycloalkyl, or C(O)(lower alkyl) or alternatively, in the instance of NR'<sub>2</sub>, each R' comprise at least one C atom that are joined to form a heterocycle comprising at least two carbon atoms; and

25 (j)  $Z ext{ is } N ext{ or } CR^{12}$ ; and

2983472-1

 $R^{12}$  is an H, halogen (including F, Cl, Br, I), OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>, lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R'.

A seventh aspect of the third embodiment is directed to a compound represented by formula **I-5** 

#### wherein

- (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, methyl, ethyl, *n*-propyl, *i*-propyl, phenyl, p-tolyl, p-bromo-phenyl, p-chloro-phenyl, p-fluorophenyl;
  - (b)  $R^2$  is hydrogen or  $CH_3$ ;
- 10 (c) R<sup>3a</sup> is H and R<sup>3b</sup> is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, or lower cycloalkyl;
  - (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, CH<sub>3</sub>, Et, 'Pr, "Pr, "Bu, 2-butyl, 'Bu, benzyl, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, N-methyl-aziridin-2-yl, N-methyl-azetidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-4-yl, N-methyl-piperidin-4-yl, lower haloalkyl, or di(lower alkyl)amino-lower alkyl;
  - (e)  $R^5$  is H, CN, CH<sub>2</sub>F, F, Cl, Br, or I; with the proviso that X is OH,  $R^6$  is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F,  $R^5$  cannot be H;
    - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, or F;
    - (g) X is H, OH, F, OCH<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, NH<sub>2</sub> or N<sub>3</sub>;
- 20 (h) Y is H, OH, CH<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, NH<sub>2</sub> or N<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, or OC(O)CH<sub>3</sub>;
  - (i)  $R^{10}$  is  $NH_2$  and  $R^{11}$  is H, F, Br, I, OH, OR',  $NH_2$ , NHR',  $NR'_2$ ,  $CO_2R'$ ,  $CONH_2$ , CONHR',  $CONR'_2$ ,  $CH=CHCO_2H$ , or  $CH=CHCO_2R'$ ;

wherein R' is a lower alkyl, a lower cycloalkyl, or C(O)(lower alkyl) or alternatively, in the instance of NR'<sub>2</sub>, each R' comprise at least one C atom that are joined to form a heterocycle comprising at least two carbon atoms; and

(j) Z is N or  $CR^{12}$ ; and

2983472-1

25

Docket No. 60137.0034WOU1

 $R^{12}$  is an H, halogen (including F, Cl, Br, I), OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>, lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R'.

An eighth aspect of the third embodiment is directed to a compound represented by formula **I-5** 

## wherein

15

25

- (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, methyl, ethyl, *n*-propyl, *i*-propyl, phenyl, p-tolyl, p-bromo-phenyl, p-chloro-phenyl, p-fluorophenyl;
  - (b) R<sup>2</sup> is hydrogen;
- 10 (c) R<sup>3a</sup> is H and R<sup>3b</sup> is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, or lower cycloalkyl;
  - (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, CH<sub>3</sub>, Et, <sup>i</sup>Pr, <sup>n</sup>Pr, <sup>n</sup>Bu, 2-butyl, <sup>t</sup>Bu, benzyl, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, N-methyl-aziridin-2-yl, N-methyl-azetidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-4-yl, N-methyl-piperidin-4-yl, lower haloalkyl;
    - (e)  $R^5$  is H, with the provisos that when X is OH,  $R^6$  is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F,  $R^5$  cannot be H;
      - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, or F;
      - (g)  $X \text{ is } H, OH, OCH_3, F, NH_2 \text{ or } N_3;$
- 20 (h) Y is OH, NH<sub>2</sub>, OCH<sub>3</sub>, or OC(O)CH<sub>3</sub>;
  - (i) R<sup>10</sup> is NH<sub>2</sub> and R<sup>11</sup> is H, F, Br, I, OH, OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R';

wherein R' is a lower alkyl, a lower cycloalkyl, or C(O)(lower alkyl) or alternatively, in the instance of NR'<sub>2</sub>, each R' comprise at least one C atom that are joined to form a heterocycle comprising at least two carbon atoms; and

- 59 -

(j) Z is N or  $CR^{12}$ ; and

2983472-1

IPR2018-00126 Page 60 of 751 I-MAK 1005

Docket No. 60137.0034WOU1

 $R^{12}$  is an H, halogen (including F, Cl, Br, I), OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>, lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R'.

A ninth aspect of the third embodiment is directed to a compound represented by formula I-5

## wherein

- (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, methyl, phenyl, p-bromo-phenyl, p-chlorophenyl, p-fluorophenyl;
  - (b) R<sup>2</sup> is hydrogen;
- 10 (c) R<sup>3a</sup> is H and R<sup>3b</sup> is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, or lower cycloalkyl;
  - (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, CH<sub>3</sub>, Et, <sup>i</sup>Pr, <sup>n</sup>Pr, <sup>n</sup>Bu, 2-butyl, <sup>t</sup>Bu, benzyl, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, N-methyl-aziridin-2-yl, N-methyl-azetidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, or N-methyl-pyrrolidin-4-yl, lower haloalkyl, or di(lower alkyl)amino-lower alkyl;
    - (e)  $R^5$  is H, with the provisos that when X is OH,  $R^6$  is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F,  $R^5$  cannot be H;
      - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, or F;
      - (g)  $X \text{ is } H, OH, OCH_3, F, NH_2 \text{ or } N_3;$
- 20 (h) Y is OH, NH<sub>2</sub>, OCH<sub>3</sub>, or OC(O)CH<sub>3</sub>;
  - (i)  $R^{10}$  is NH<sub>2</sub> and  $R^{11}$  is H, F, Br, I, OH, OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R';

wherein R' is a lower alkyl, a lower cycloalkyl, or C(O)(lower alkyl) or alternatively, in the instance of NR'<sub>2</sub>, each R' comprise at least one C atom that are joined to form a heterocycle comprising at least two carbon atoms; and

(j) Z is N or  $CR^{12}$ ; and

2983472-1

25

15

- 60 -

 $R^{12}$  is an H, halogen (including F, Cl, Br, I), OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>, lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R'.

A tenth aspect of the third embodiment is directed to a compound represented by formula **I-6** 

$$R^{3a} = \begin{bmatrix} R^{2} & 0 & & \\ &$$

**I-6** 

wherein

- (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, n-alkyl; branched alkyl; cycloalkyl; or aryl, which includes, but is not limited to, phenyl or naphthyl, where phenyl or naphthyl are optionally substituted with at least one of C<sub>1-6</sub> alkyl, C<sub>2-6</sub> alkenyl, C<sub>2-6</sub> alkynyl, C<sub>1-6</sub> alkoxy, F, Cl, Br, I, nitro, cyano, C<sub>1-6</sub> haloalkyl, -N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, C<sub>1-6</sub> acylamino, -NHSO<sub>2</sub>C<sub>1-6</sub> alkyl, -SO<sub>2</sub>N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, COR<sup>1</sup>, and -SO<sub>2</sub>C<sub>1-6</sub> alkyl; (R<sup>1</sup> is independently hydrogen or alkyl, which includes, but is not limited to, C<sub>1-20</sub> alkyl, C<sub>1-10</sub> alkyl, or C<sub>1-6</sub> alkyl, R<sup>1</sup> is -OR' or -N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>);
  - (b) R<sup>2</sup> is hydrogen or CH<sub>3</sub>;
- (c) R<sup>3a</sup> and R<sup>3b</sup> are (i) independently selected from hydrogen, C<sub>1-10</sub> alkyl, cycloalkyl, -(CH<sub>2</sub>)<sub>c</sub>(NR<sup>3'</sup>)<sub>2</sub>, C<sub>1-6</sub> hydroxyalkyl, -CH<sub>2</sub>SH, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>S(O)<sub>d</sub>Me, -20 (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>NHC(=NH)NH<sub>2</sub>, (1H-indol-3-yl)methyl, (1H-imidazol-4-yl)methyl, (CH<sub>2</sub>)<sub>e</sub>COR<sup>3"</sup>, aryl and aryl C<sub>1-3</sub> alkyl, said aryl groups optionally substituted with a group selected from hydroxyl, C<sub>1-10</sub> alkyl, C<sub>1-6</sub> alkoxy, halogen, nitro and cyano; (ii) R<sup>3a</sup> and R<sup>3b</sup> both are C<sub>1-6</sub> alkyl; (iii) R<sup>3a</sup> and R<sup>3b</sup> together are(CH<sub>2</sub>)<sub>f</sub> so

2983472-1

-61-

as to form a spiro ring; (iv) R<sup>3a</sup> is hydrogen and R<sup>3b</sup> and R<sup>2</sup> together are (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> so as to form a cyclic ring that includes the adjoining N and C atoms  $(v) \, R^{3b}$  is hydrogen and R<sup>3a</sup> and R<sup>2</sup> together are (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> so as to form a cyclic ring that includes the adjoining N and C atoms, where c is 1 to 6, d is 0 to 2, e is 0 to 3, f is 2 to 5, n is 2 to 4, and where  $R^{3'}$  is independently hydrogen or  $C_{1-6}$  alkyl and  $R^{3"}$  is -OR' or -N( $R^{3'}$ )<sub>2</sub>); (vi)  $R^{3a}$  is H and  $R^{3b}$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH<sub>2</sub>-indol-3-yl, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>, CH2CO2H, CH2C(O)NH2, CH2CH2COOH, CH2CH2C(O)NH2, CH2CH2CH2CH2NH2, -CH2CH2CH2NHC(NH)NH2, CH2-imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl; or (viii) 10 R<sup>3a</sup> is CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH2-indol-3-yl, -CH2CH2SCH3, CH2CO2H, CH2C(O)NH2, CH2CH2COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl and R3b is H, where R3' is independently hydrogen or alkyl, which 15 includes, but is not limited to,  $C_{1\text{--}20}$  alkyl,  $C_{1\text{--}10}$  alkyl, or  $C_{1\text{--}6}$  alkyl,  $R^{3"}$  is -OR' or  $-N(R^{3'})_2);$ 

- (d)  $R^4$  is hydrogen,  $C_{1-10}$  alkyl,  $C_{1-10}$  alkyl optionally substituted with a lower alkyl, alkoxy or halogen,  $C_{1-10}$  haloalkyl,  $C_{3-10}$  cycloalkyl, cycloalkyl alkyl, cycloheteroalkyl, aminoacyl, di(lower alkyl)amino-lower alkyl, aryl, such as phenyl, heteroaryl, such as, pyridinyl, substituted aryl, or substituted heteroaryl;
- (e) R<sup>5</sup> is H, a lower alkyl, CN, vinyl, O-(lower alkyl), hydroxyl lower alkyl, i.e., -(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>OH, where p is 1 -6, including hydroxyl methyl (CH<sub>2</sub>OH),

  CH<sub>2</sub>F, N<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CN, CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>NHCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, alkyne (optionally substituted), or halogen, including F, Cl, Br, or I, with the provisos that when X is OH, base is cytosine and R<sup>6</sup> is H, R<sup>5</sup> cannot be N<sub>3</sub> and when X is OH, R<sup>6</sup> is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F and B is a purine base, R<sup>5</sup> cannot be H;
  - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, F, or CN;
- 30 (g) X is H, OH, F, OMe, Cl, Br, I, NH<sub>2</sub>, or N<sub>3</sub>;

2983472-1

- Y is OH, H, C<sub>1-4</sub> alkyl, C<sub>2-4</sub> alkenyl, C<sub>2-4</sub> alkynyl, vinyl, N<sub>3</sub>, CN, (h) Cl, Br, F, I, NO<sub>2</sub>, OC(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), OC(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), OC(O)O(C<sub>2-4</sub> alkynyl), OC(O)O(C2-4 alkenyl), OC1-10 haloalkyl, O(aminoacyl), O(C1-10 acyl), O(C<sub>1-4</sub> alkyl), O(C<sub>2-4</sub> alkenyl), S(C<sub>1-4</sub> acyl), S(C<sub>1-4</sub> alkyl), S(C<sub>2-4</sub> alkynyl), S(C<sub>2-4</sub> alkenyl), SO(C<sub>1-4</sub> acyl), SO(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO(C<sub>2-4</sub> alkynyl), SO(C<sub>2-4</sub> alkenyl), 5 SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> acyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>2-4</sub> alkynyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>2-4</sub> alkenyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub>  $_{4} \ acyl), \ OS(O)_{2}(C_{1\text{-}4} \ alkyl), \ OS(O)_{2}(C_{2\text{-}4} \ alkenyl), \ NH_{2}, \ NH(C_{1\text{-}4} \ alkyl), \ NH(C_{2\text{-}4} \ alkyl), \$ alkenyl),  $NH(C_{2-4}$  alkynyl),  $NH(C_{1-4}$  acyl),  $N(C_{1-4}$  alkyl)<sub>2</sub>,  $N(C_{1-18}$  acyl)<sub>2</sub>, wherein alkyl, alkynyl, alkenyl and vinyl are optionally substituted by N<sub>3</sub>, CN, one to three halogen (Cl, Br, F, I), NO2, C(O)O(C1-4 alkyl), C(O)O(C1-4 alkyl), 10  $C(O)O(C_{2-4} \text{ alkynyl}), C(O)O(C_{2-4} \text{ alkenyl}), O(C_{1-4} \text{ acyl}), O(C_{1-4} \text{ alkyl}), O(C_{2-4} \text{ alkyl})$ alkenyl), S(C<sub>1-4</sub> acyl), S(C<sub>1-4</sub> alkyl), S(C<sub>2-4</sub> alkynyl), S(C<sub>2-4</sub> alkenyl), SO(C<sub>1-4</sub> acyl), SO(C1-4 alkyl), SO(C2-4 alkynyl), SO(C2-4 alkenyl), SO2(C1-4 acyl),  $SO_2(C_{1-4} \text{ alkyl}), SO_2(C_{2-4} \text{ alkynyl}), SO_2(C_{2-4} \text{ alkenyl}), OS(O)_2(C_{1-4} \text{ acyl}),$  $OS(O)_2(C_{1-4} \text{ alkyl}), OS(O)_2(C_{2-4} \text{ alkenyl}), NH_2, NH(C_{1-4} \text{ alkyl}), NH(C_{2-4} \text{ alkyl})$ 15 alkenyl),  $NH(C_{2-4}$  alkynyl),  $NH(C_{1-4}$  acyl),  $N(C_{1-4}$  alkyl)<sub>2</sub>,  $N(C_{1-4}$  acyl)<sub>2</sub>;
  - (i)  $R^{10}$  and  $R^{11}$  are independently H, F, Br, I, OH, OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R', with the proviso that when  $R^{10}$  is OH and  $R^{11}$  is not NH<sub>2</sub>;
  - wherein R' is a lower alkyl, a lower cycloalkyl, or C(O)(lower alkyl) or alternatively, in the instance of NR'<sub>2</sub>, each R' comprise at least one C atom that are joined to form a heterocycle comprising at least two carbon atoms; and
    - (j) Z is N or  $CR^{12}$ ; and
- R<sup>12</sup> is an H, halogen (including F, Cl, Br, I), OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>, lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R'.

An eleventh aspect of the third embodiment is directed to a compound represented by formula **I-6** 

wherein

2983472-1

- (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, methyl, ethyl, *n*-propyl, *i*-propyl, phenyl, p-tolyl, p-bromo-phenyl, p-chloro-phenyl, p-fluorophenyl;
  - (b)  $R^2$  is hydrogen or  $CH_3$ ;
- (c) R<sup>3a</sup> is H and R<sup>3b</sup> is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>,
  5 CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH<sub>2</sub>-indol-3-yl, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H,
  CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>-imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl;
- (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, CH<sub>3</sub>, Et, 'Pr, "Pr, "Bu, 2-butyl, 'Bu, benzyl, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, N-methyl-aziridin-2-yl, N-methyl-azetidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-4-yl, N-methyl-piperidin-4-yl, lower haloalkyl, or di(lower alkyl)amino-lower alkyl;
- (e) R<sup>5</sup> is H, CN, CH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>OH, CH<sub>2</sub>F, halogen, including F, Cl, Br, or I, with the provisos that when X is OH, R<sup>6</sup> is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F, R<sup>5</sup> cannot be H;
  - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, F, or CN;
  - (g) X is H, OH, F, OCH<sub>3</sub>, Cl, Br, I, NH<sub>2</sub>, or N<sub>3</sub>;
  - (h) Y is OH, H, CH<sub>3</sub>, vinyl, NH<sub>2</sub>, N<sub>3</sub>, CN, Cl, Br, F, I, OC(O)CH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>;
- 20 (i) R<sup>10</sup> and R<sup>11</sup> are independently H, F, Br, I, OH, OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R', with the proviso that when R<sup>10</sup> is OH and R<sup>11</sup> is not NH<sub>2</sub>;

wherein R' is a lower alkyl, a lower cycloalkyl, or C(O)(lower alkyl) or alternatively, in the instance of NR'<sub>2</sub>, each R' comprise at least one C atom that are joined to form a heterocycle comprising at least two carbon atoms; and

(j) Z is N or  $CR^{12}$ ; and

 $R^{12}$  is an H, halogen (including F, Cl, Br, I), OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>, lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R'.

5 A twelvth aspect of the third embodiment is directed to a compound represented by formula **I-6** 

## wherein

- (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, methyl, ethyl, *n*-propyl, *i*-propyl, phenyl, p-tolyl, p-bromo-phenyl, p-chloro-phenyl, p-fluorophenyl;
- 10 (b) R<sup>2</sup> is hydrogen or CH<sub>3</sub>;
  - (c) R<sup>3a</sup> is H and R<sup>3b</sup> is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, or lower cycloalkyl;
  - (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, CH<sub>3</sub>, Et, <sup>i</sup>Pr, <sup>n</sup>Pr, <sup>n</sup>Bu, 2-butyl, <sup>i</sup>Bu, benzyl, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, N-methyl-aziridin-2-yl, N-methyl-azetidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-4-yl, N-methyl-piperidin-4-yl, lower haloalkyl, or di(lower alkyl)amino-lower alkyl;
    - (e) R<sup>5</sup> is H, CN, CH<sub>2</sub>F, F, Cl, Br, or I, with the provisos that when X is OH, R<sup>6</sup> is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F, R<sup>5</sup> cannot be H;
      - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, or F;
- 20 (g) X is H, OH, F, OCH<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, NH<sub>2</sub> or N<sub>3</sub>;
  - (h) Y is H, OH, CH<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, NH<sub>2</sub> or N<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, or OC(O)CH<sub>3</sub>;
  - (i)  $R^{10}$  and  $R^{11}$  are independently H, F, Br, I, OH, OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R', with the proviso that when  $R^{10}$  is OH and  $R^{11}$  is not NH<sub>2</sub>;
- wherein R' is a lower alkyl, a lower cycloalkyl, or C(O)(lower alkyl) or alternatively, in the instance of NR'<sub>2</sub>, each R' comprise at least one C atom that are joined to form a heterocycle comprising at least two carbon atoms; and

2983472-1

(i) Z is N or  $CR^{12}$ ; and

 $R^{12}$  is a H, halogen (including F, Cl, Br, I), OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>, lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R'.

A thirteenth aspect of the third embodiment is directed to a compound represented by formula **I-6** 

wherein

- (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, methyl, ethyl, *n*-propyl, *i*-propyl, phenyl, p-tolyl, p-bromo-phenyl, p-chloro-phenyl, p-fluorophenyl;
- 10 (b) R<sup>2</sup> is hydrogen;
  - (c) R<sup>3a</sup> is H and R<sup>3b</sup> is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, or lower cycloalkyl;
- (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, CH<sub>3</sub>, Et, <sup>i</sup>Pr, <sup>n</sup>Pr, <sup>n</sup>Bu, 2-butyl, <sup>i</sup>Bu, benzyl, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, N-methyl-aziridin-2-yl, N-methyl-azetidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-4-yl, N-methyl-piperidin-4-yl, lower haloalkyl, or di(lower alkyl)amino-lower alkyl;
  - (e)  $R^5$  is H, with the provisos that when X is OH,  $R^6$  is  $CH_3$  or  $CH_2F$ ,  $R^5$  cannot be H;
    - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, or F;
- 20 (g)  $X \text{ is } H, OH, OCH_3, F, NH_2 \text{ or } N_3;$ 
  - (h) Y is OH,  $NH_2$ ,  $OCH_3$ , or  $OC(O)CH_3$ ;
  - (i) R<sup>10</sup> and R<sup>11</sup> are independently H, F, Br, I, OH, OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R', with the proviso that when R<sup>10</sup> is OH and R<sup>11</sup> is not NH<sub>2</sub>;

Docket No. 60137.0034WOU1

wherein R' is a lower alkyl, a lower cycloalkyl, or C(O)(lower alkyl) or alternatively, in the instance of NR'<sub>2</sub>, each R' comprise at least one C atom that are joined to form a heterocycle comprising at least two carbon atoms; and

- (i) Z is N or  $CR^{12}$ ; and
- R<sup>12</sup> is an H, halogen (including F, Cl, Br, I), OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>, lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R'.

A fourteenth aspect of the third embodiment is directed to a compound represented by formula **I-6** 

wherein

- (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, methyl, phenyl, p-bromo-phenyl, p-chloro-phenyl, p-fluorophenyl;
  - (b) R<sup>2</sup> is hydrogen;
- (c) R<sup>3a</sup> is H and R<sup>3b</sup> is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>,

  15 CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, or lower cycloalkyl;
  - (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, CH<sub>3</sub>, Et, <sup>i</sup>Pr, <sup>n</sup>Pr, <sup>n</sup>Bu, 2-butyl, <sup>t</sup>Bu, benzyl, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, N-methyl-aziridin-2-yl, N-methyl-azetidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-4-yl, N-methyl-piperidin-4-yl, lower haloalkyl, or di(lower alkyl)amino-lower alkyl;
- 20 (e) R<sup>5</sup> is H, with the provisos that when X is OH, R<sup>6</sup> is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F, R<sup>5</sup> cannot be H;
  - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, or F;
  - (g)  $X \text{ is } H, OH, OCH_3, F, NH_2 \text{ or } N_3;$
  - (h) Y is OH,  $NH_2$ ,  $OCH_3$ , or  $OC(O)CH_3$ ;

Docket No. 60137.0034WOU1

(i)  $R^{10}$  and  $R^{11}$  are independently H, F, Br, I, OH, OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R', with the proviso that when  $R^{10}$  is OH and  $R^{11}$  is not NH<sub>2</sub>;

wherein R' is a lower alkyl, a lower cycloalkyl, or C(O)(lower alkyl) or alternatively, in the instance of NR'<sub>2</sub>, each R' comprise at least one C atom that are joined to form a heterocycle comprising at least two carbon atoms; and

(i) Z is N or  $CR^{12}$ ; and

R<sup>12</sup> is an H, halogen (including F, Cl, Br, I), OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>, lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R'.

A fifteenth aspect of the third embodiment is directed to a compound represented by formula **I-6** 

wherein

- (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, n-alkyl; branched alkyl; cycloalkyl; or aryl, which includes, but is not limited to, phenyl or naphthyl, where phenyl or naphthyl are optionally substituted with at least one of C<sub>1-6</sub> alkyl, C<sub>2-6</sub> alkenyl, C<sub>2-6</sub> alkynyl, C<sub>1-6</sub> alkoxy, F, Cl, Br, I, nitro, cyano, C<sub>1-6</sub> haloalkyl, -N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, C<sub>1-6</sub> acylamino, -NHSO<sub>2</sub>C<sub>1-6</sub> alkyl, -SO<sub>2</sub>N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, COR<sup>1</sup>, and -SO<sub>2</sub>C<sub>1-6</sub> alkyl; (R<sup>1</sup> is independently hydrogen or alkyl, which includes, but is not limited to, C<sub>1-20</sub> alkyl, C<sub>1-10</sub> alkyl, or C<sub>1-6</sub> alkyl, R<sup>1</sup> is -OR' or -N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>);
  - (b)  $R^2$  is hydrogen or  $CH_3$ ;
  - (c)  $R^{3a}$  and  $R^{3b}$  are (i) independently selected from hydrogen,  $C_{1-10}$  alkyl, cycloalkyl,  $-(CH_2)_c(NR^3)_2$ ,  $C_{1-6}$  hydroxyalkyl,  $-CH_2SH$ ,  $-(CH_2)_2S(O)_dMe$ ,  $-(CH_2)_3NHC(=NH)NH_2$ , (1H-indol-3-yl)methyl, (1H-imidazol-4-yl)methyl,  $-(CH_2)_eCOR^3$ , aryl and aryl  $C_{1-3}$  alkyl, said aryl groups optionally substituted with a group selected from hydroxyl,  $C_{1-10}$  alkyl,  $C_{1-6}$  alkoxy, halogen, nitro and cyano; (ii)  $R^{3a}$  and  $R^{3b}$  both are  $C_{1-6}$  alkyl; (iii)  $R^{3a}$  and  $R^{3b}$  together are  $(CH_2)_f$  so as to form a cyclic ring that includes the adjoining N and C atoms (v)  $R^{3b}$  is

2983472-1

hydrogen and R<sup>3a</sup> and R<sup>2</sup> together are (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> so as to form a cyclic ring that includes the adjoining N and C atoms, where c is 1 to 6, d is 0 to 2, e is 0 to 3, f is 2 to 5, n is 2 to 4, and where R<sup>3'</sup> is independently hydrogen or C<sub>1-6</sub> alkyl and  $R^{3"}$  is -OR' or -N( $R^{3'}$ )<sub>2</sub>); (vi)  $R^{3a}$  is H and  $R^{3b}$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH2CH(CH3)2, CH(CH3)CH2CH3, CH2Ph, CH2-indol-3-yl, -CH2CH2SCH3, 5 CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H, CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH2CH2CH2CH2NH2, -CH2CH2CH2NHC(NH)NH2, CH2-imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl; or (viii) R<sup>3a</sup> is CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH2-indol-3-vl, -CH2CH2SCH3, CH2CO2H, CH2C(O)NH2, CH2CH2COOH, 10 CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl and R3b is H, where R3' is independently hydrogen or alkyl, which includes, but is not limited to,  $C_{1\text{--}20}$  alkyl,  $C_{1\text{--}10}$  alkyl, or  $C_{1\text{--}6}$  alkyl,  $R^{3"}$  is -OR' or  $-N(R^{3'})_2);$ 15

- (d)  $R^4$  is hydrogen,  $C_{1-10}$  alkyl,  $C_{1-10}$  alkyl optionally substituted with a lower alkyl, alkoxy or halogen,  $C_{1-10}$  haloalkyl,  $C_{3-10}$  cycloalkyl, cycloalkyl alkyl, cycloheteroalkyl, aminoacyl, di(lower alkyl)amino-lower alkyl, aryl, such as phenyl, heteroaryl, such as, pyridinyl, substituted aryl, or substituted heteroaryl;
- (e) R<sup>5</sup> is H, a lower alkyl, CN, vinyl, O-(lower alkyl), hydroxyl lower alkyl, i.e., -(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>OH, where p is 1 -6, including hydroxyl methyl (CH<sub>2</sub>OH), CH<sub>2</sub>F, N<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CN, CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>NHCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, alkyne (optionally substituted), or halogen, including F, Cl, Br, or I, with the provisos that when X is OH, base is cytosine and R<sup>6</sup> is H, R<sup>5</sup> cannot be N<sub>3</sub> and when X is OH, R<sup>6</sup> is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F and B is a purine base, R<sup>5</sup> cannot be H;
  - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, F, or CN;
  - (g) X is H, OH, F, OMe, halogen, NH<sub>2</sub>, or N<sub>3</sub>;
- (h) Y is OH, H, C<sub>1-4</sub> alkyl, C<sub>2-4</sub> alkenyl, C<sub>2-4</sub> alkynyl, vinyl, N<sub>3</sub>, CN,
  30 Cl, Br, F, I, NO<sub>2</sub>, OC(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), OC(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), OC(O)O(C<sub>2-4</sub> alkynyl), OC(O)O(C<sub>2-4</sub> alkenyl), OC<sub>1-10</sub> haloalkyl, O(aminoacyl), O(C<sub>1-10</sub> acyl),

2983472-1

O(C<sub>1-4</sub> alkyl), O(C<sub>2-4</sub> alkenyl), S(C<sub>1-4</sub> acyl), S(C<sub>1-4</sub> alkyl), S(C<sub>2-4</sub> alkynyl), S(C<sub>2-4</sub> alkenyl), SO(C<sub>1-4</sub> acyl), SO(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO(C<sub>2-4</sub> alkynyl), SO(C<sub>2-4</sub> alkenyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> acyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>2-4</sub> alkynyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>2-4</sub> alkenyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> acyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>2-4</sub> alkenyl), NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1-4</sub> alkyl), NH(C<sub>2-4</sub> alkenyl), NH(C<sub>2-4</sub> alkynyl), NH(C<sub>1-4</sub> acyl), N(C<sub>1-1</sub> alkyl)<sub>2</sub>, N(C<sub>1-1</sub> acyl)<sub>2</sub>, wherein alkyl, alkynyl, alkenyl and vinyl are optionally substituted by N<sub>3</sub>, CN, one to three halogen (Cl, Br, F, I), NO<sub>2</sub>, C(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), C(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), C(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), O(C<sub>1-4</sub> alkyl), O(C<sub>1-4</sub> alkyl), S(C<sub>1-4</sub> alkyl), S(C<sub>1-4</sub> alkyl), S(C<sub>2-4</sub> alkenyl), S(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), NO<sub>2</sub>(C<sub>2-4</sub> alkenyl), NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1-4</sub> alkyl), NH(C<sub>2-4</sub> alkenyl), NH(C<sub>2-4</sub> alkenyl), NH(C<sub>1-4</sub> acyl), NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1-4</sub> alkyl), NH(C<sub>2-4</sub> alkenyl);

(i) R<sup>10</sup> is NH<sub>2</sub> and R<sup>11</sup> is H, F, Br, I, OH, OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R';

wherein R' is a lower alkyl, a lower cycloalkyl, or C(O)(lower alkyl) or alternatively, in the instance of NR'<sub>2</sub>, each R' comprise at least one C atom that are joined to form a heterocycle comprising at least two carbon atoms; and

(j) Z is N or  $CR^{12}$ ; and

20 R<sup>12</sup> is an H, halogen (including F, Cl, Br, I), OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>, lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R'.

An sixteenth aspect of the third embodiment is directed to a compound represented by formula I-6

wherein

- (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, methyl, ethyl, *n*-propyl, *i*-propyl, phenyl, p-tolyl, p-bromo-phenyl, p-chloro-phenyl, p-fluorophenyl;
  - (b) R<sup>2</sup> is hydrogen or CH<sub>3</sub>;

5

(c) R<sup>3a</sup> is H and R<sup>3b</sup> is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>,
CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH<sub>2</sub>-indol-3-yl, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H,
CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>-imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl;

- (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, CH<sub>3</sub>, Et, <sup>i</sup>Pr, <sup>n</sup>Pr, <sup>n</sup>Bu, 2-butyl, <sup>t</sup>Bu, benzyl, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, N-methyl-aziridin-2-yl, N-methyl-azetidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-4-yl, N-methyl-piperidin-4-yl, lower haloalkyl, or di(lower alkyl)amino-lower alkyl;
- 10 (e) R<sup>5</sup> is H, CN, CH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>OH, CH<sub>2</sub>F, halogen, including F, Cl, Br, or I, with the provisos that when X is OH, R<sup>6</sup> is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F, R<sup>5</sup> cannot be H;
  - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, F, or CN;
  - (g) X is H, OH, F, OCH<sub>3</sub>, Cl, Br, I, NH<sub>2</sub>, or N<sub>3</sub>;
- 15 (h) Y is OH, H, CH<sub>3</sub>, vinyl, NH<sub>2</sub>, N<sub>3</sub>, CN, Cl, Br, F, I, OC(O)CH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>;
  - (i)  $R^{10}$  is  $NH_2$  and  $R^{11}$  is H, F, Br, I, OH, OR',  $NH_2$ , NHR',  $NR'_2$ ,  $CO_2R'$ ,  $CONH_2$ , CONHR',  $CONR'_2$ ,  $CH=CHCO_2H$ , or  $CH=CHCO_2R'$ ;

wherein R' is a lower alkyl, a lower cycloalkyl, or C(O)(lower alkyl) or 20 alternatively, in the instance of NR'<sub>2</sub>, each R' comprise at least one C atom that are joined to form a heterocycle comprising at least two carbon atoms; and

(j) Z is N or  $CR^{12}$ ; and

R<sup>12</sup> is an H, halogen (including F, Cl, Br, I), OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>, lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R'.

A seventeenth aspect of the third embodiment is directed to a compound represented by formula **I-6** 

2983472-1

# wherein

- (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, methyl, ethyl, *n*-propyl, *i*-propyl, phenyl, p-tolyl, p-bromo-phenyl, p-chloro-phenyl, p-fluorophenyl;
  - (b) R<sup>2</sup> is hydrogen or CH<sub>3</sub>;
- 5 (c) R<sup>3a</sup> is H and R<sup>3b</sup> is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, or lower cycloalkyl;
  - (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, CH<sub>3</sub>, Et, <sup>i</sup>Pr, <sup>n</sup>Pr, <sup>n</sup>Bu, 2-butyl, <sup>i</sup>Bu, benzyl, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, N-methyl-aziridin-2-yl, N-methyl-azetidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-4-yl, N-methyl-piperidin-4-yl, lower haloalkyl, or di(lower alkyl)amino-lower alkyl;
  - (e) R<sup>5</sup> is H, CN, CH<sub>2</sub>F, F, Cl, Br, or I, with the provisos that when X is OH, R<sup>6</sup> is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F, R<sup>5</sup> cannot be H;
    - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, or F;
    - (g) X is H, OH, F, OCH<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, NH<sub>2</sub> or N<sub>3</sub>;
- 15 (h) Y is H, OH, CH<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, NH<sub>2</sub> or N<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, or OC(O)CH<sub>3</sub>;
  - (i) R<sup>10</sup> is NH<sub>2</sub> and R<sup>11</sup> is H, F, Br, I, OH, OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R';

wherein R' is a lower alkyl, a lower cycloalkyl, or C(O)(lower alkyl) or alternatively, in the instance of NR'<sub>2</sub>, each R' comprise at least one C atom that are joined to form a heterocycle comprising at least two carbon atoms; and

(j) Z is N or CR<sup>12</sup>; and

 $R^{12}$  is an H, halogen (including F, Cl, Br, I), OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>, lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R'.

An eighteenth aspect of the third embodiment is directed to a compound represented by formula **I-6** 

2983472-1

10

# wherein

- (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, methyl, ethyl, *n*-propyl, *i*-propyl, phenyl, p-tolyl, p-bromo-phenyl, p-chloro-phenyl, p-fluorophenyl;
  - (b) R<sup>2</sup> is hydrogen;
- 5 (c) R<sup>3a</sup> is H and R<sup>3b</sup> is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, or lower cycloalkyl;
  - (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, CH<sub>3</sub>, Et, <sup>i</sup>Pr, <sup>n</sup>Pr, <sup>n</sup>Bu, 2-butyl, <sup>t</sup>Bu, benzyl, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, N-methyl-aziridin-2-yl, N-methyl-azetidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-4-yl, N-methyl-piperidin-4-yl, lower haloalkyl, or di(lower alkyl)amino-lower alkyl;
  - (e) R<sup>5</sup> is H, with the provisos that when X is OH, R<sup>6</sup> is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F, R<sup>5</sup> cannot be H;
    - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, or F;
    - (g)  $X \text{ is } H, OH, OCH_3, F, NH_2 \text{ or } N_3;$
- 15 (h) Y is OH,  $NH_2$ ,  $OCH_3$ , or  $OC(O)CH_3$ ;
  - (i) R<sup>10</sup> is NH<sub>2</sub> and R<sup>11</sup> is H, F, Br, I, OH, OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R';

wherein R' is a lower alkyl, a lower cycloalkyl, or C(O)(lower alkyl) or alternatively, in the instance of NR'<sub>2</sub>, each R' comprise at least one C atom that are joined to form a heterocycle comprising at least two carbon atoms; and

(j) Z is N or  $CR^{12}$ ; and

 $R^{12}$  is an H, halogen (including F, Cl, Br, I), OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>, lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R'.

A ninteenth aspect of the third embodiment is directed to a compound represented by formula **I-6** 

2983472-1

10

# wherein

- (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, methyl, phenyl, p-bromo-phenyl, p-chlorophenyl, p-fluorophenyl;
  - (b) R<sup>2</sup> is hydrogen;
- 5 (c) R<sup>3a</sup> is H and R<sup>3b</sup> is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, or lower cycloalkyl;
  - (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, CH<sub>3</sub>, Et, <sup>i</sup>Pr, <sup>n</sup>Pr, <sup>n</sup>Bu, 2-butyl, <sup>t</sup>Bu, benzyl, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, N-methyl-aziridin-2-yl, N-methyl-azetidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-4-yl, N-methyl-piperidin-4-yl, lower haloalkyl, or di(lower alkyl)amino-lower alkyl;
    - (e) R<sup>5</sup> is H, with the provisos that when X is OH, R<sup>6</sup> is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F, R<sup>5</sup> cannot be H:
      - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, or F;
      - (g)  $X \text{ is H, OH, OCH}_3, F, NH_2 \text{ or } N_3;$
- 15 (h) Y is OH, NH<sub>2</sub>, OCH<sub>3</sub>, or OC(O)CH<sub>3</sub>;
  - (i) R<sup>10</sup> is NH<sub>2</sub> and R<sup>11</sup> are independently H, F, Br, I, OH, OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R';

wherein R' is a lower alkyl, a lower cycloalkyl, or C(O)(lower alkyl) or 20 alternatively, in the instance of NR'<sub>2</sub>, each R' comprise at least one C atom that are joined to form a heterocycle comprising at least two carbon atoms; and

(j) Z is N or  $CR^{12}$ ; and

 $R^{12}$  is an H, halogen (including F, Cl, Br, I), OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>, lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R'.

2983472-1

25

A fourth embodiment of the invention is directed to a compound represented by formula I in which the base is a structure represented by formula  $\bf c$  above, where  $\bf R^{11}$  is H and  $\bf R^2$ ,  $\bf R^{3a}$ ,  $\bf R^{3b}$ ,  $\bf R^4$ ,  $\bf R^5$ ,  $\bf R^6$ , X, and Y are defined in the Summary of the Invention section above.

A first aspect of the fourth embodiment is directed to a compound represented by formula I-7

$$R^{3a}$$
 $R^{2}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{$ 

10 wherein

15

- (a)  $R^1$  is hydrogen, n-alkyl; branched alkyl; cycloalkyl; or aryl, which includes, but is not limited to, phenyl or naphthyl, where phenyl or naphthyl are optionally substituted with at least one of  $C_{1-6}$  alkyl,  $C_{2-6}$  alkenyl,  $C_{2-6}$  alkynyl,  $C_{1-6}$  alkoxy, F, Cl, Br, I, nitro, cyano,  $C_{1-6}$  haloalkyl,  $-N(R^1)_2$ ,  $C_{1-6}$  acylamino,  $-NHSO_2C_{1-6}$  alkyl,  $-SO_2N(R^1)_2$ ,  $COR^1$ , and  $-SO_2C_{1-6}$  alkyl;  $(R^1)_2$  is independently hydrogen or alkyl, which includes, but is not limited to,  $C_{1-20}$  alkyl,  $C_{1-10}$  alkyl, or  $C_{1-6}$  alkyl,  $R^1$  is -OR or  $-N(R^1)_2$ ;
  - (b)  $R^2$  is hydrogen or  $CH_3$ ;
- (c) R<sup>3a</sup> and R<sup>3b</sup> are (i) independently selected from hydrogen, C<sub>1-10</sub>
  20 alkyl, cycloalkyl, -(CH<sub>2</sub>)<sub>c</sub>(NR<sup>3'</sup>)<sub>2</sub>, C<sub>1-6</sub> hydroxyalkyl, -CH<sub>2</sub>SH, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>S(O)<sub>d</sub>Me, (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>NHC(=NH)NH<sub>2</sub>, (1H-indol-3-yl)methyl, (1H-imidazol-4-yl)methyl, (CH<sub>2</sub>)<sub>e</sub>COR<sup>3"</sup>, aryl and aryl C<sub>1-3</sub> alkyl, said aryl groups optionally substituted
  with a group selected from hydroxyl, C<sub>1-10</sub> alkyl, C<sub>1-6</sub> alkoxy, halogen, nitro and

Docket No. 60137.0034WOU1

cyano; (ii)  $R^{3a}$  and  $R^{3b}$  both are  $C_{1-6}$  alkyl; (iii)  $R^{3a}$  and  $R^{3b}$  together are  $(CH_2)_f$  so as to form a spiro ring; (iv)  $R^{3a}$  is hydrogen and  $R^{3b}$  and  $R^2$  together are  $(CH_2)_n$ so as to form a cyclic ring that includes the adjoining N and C atoms (v)  $R^{3b}$  is hydrogen and R<sup>3a</sup> and R<sup>2</sup> together are (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> so as to form a cyclic ring that includes the adjoining N and C atoms, where c is 1 to 6, d is 0 to 2, e is 0 to 3, f 5 is 2 to 5, n is 2 to 4, and where R3 is independently hydrogen or C1-6 alkyl and R<sup>3"</sup> is -OR' or -N(R<sup>3'</sup>)<sub>2</sub>); (vi) R<sup>3a</sup> is H and R<sup>3b</sup> is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>,  $CH_2CH(CH_3)_2,\ CH(CH_3)CH_2CH_3,\ CH_2Ph,\ CH_2-indol-3-yl,\ -CH_2CH_2SCH_3,$ CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H, CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH2CH2CH2CH2NH2, -CH2CH2CH2NHC(NH)NH2, CH2-imidazol-4-yl, 10 CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl; or (viii) R<sup>3a</sup> is CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH2-indol-3-yl, -CH2CH2SCH3, CH2CO2H, CH2C(O)NH2, CH2CH2COOH, CH2CH2C(O)NH2, CH2CH2CH2CH2NH2, -CH2CH2CH2NHC(NH)NH2, CH2-

- imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl and R<sup>3b</sup> is H, where R<sup>3'</sup> is independently hydrogen or alkyl, which includes, but is not limited to, C<sub>1-20</sub> alkyl, C<sub>1-10</sub> alkyl, or C<sub>1-6</sub> alkyl, R<sup>3"</sup> is –OR' or -N(R<sup>3'</sup>)<sub>2</sub>);
- (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, C<sub>1-10</sub> alkyl, C<sub>1-10</sub> alkyl optionally substituted with a lower alkyl, alkoxy or halogen, C<sub>1-10</sub> haloalkyl, C<sub>3-10</sub> cycloalkyl, cycloalkyl alkyl, cycloheteroalkyl, aminoacyl, di(lower alkyl)amino-lower alkyl, aryl, such as phenyl, heteroaryl, such as, pyridinyl, substituted aryl, or substituted heteroaryl;
- (e) R<sup>5</sup> is H, a lower alkyl, CN, vinyl, O-(lower alkyl), hydroxyl lower alkyl, i.e., -(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>OH, where p is 1 -6, including hydroxyl methyl (CH<sub>2</sub>OH), CH<sub>2</sub>F, N<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CN, CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>NHCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, alkyne (optionally substituted), or halogen, including F, Cl, Br, or I, with the provisos that when X is OH, base is cytosine and R<sup>6</sup> is H, R<sup>5</sup> cannot be N<sub>3</sub> and when X is OH, R<sup>6</sup> is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F and B is a purine base, R<sup>5</sup> cannot be H;
- 30 (f)  $R^6$  is H,  $CH_3$ ,  $CH_2F$ ,  $CHF_2$ ,  $CF_3$ , F, or CN;
  - (g) X is H, OH, F, OMe, halogen, NH<sub>2</sub>, or N<sub>3</sub>;

- Y is OH, H, C<sub>1-4</sub> alkyl, C<sub>2-4</sub> alkenyl, C<sub>2-4</sub> alkynyl, vinyl, N<sub>3</sub>, CN, (h) Cl, Br, F, I, NO<sub>2</sub>, OC(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), OC(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), OC(O)O(C<sub>2-4</sub> alkynyl), OC(O)O(C2-4 alkenyl), OC1-10 haloalkyl, O(aminoacyl), O(C1-10 acyl), O(C<sub>1-4</sub> alkyl), O(C<sub>2-4</sub> alkenyl), S(C<sub>1-4</sub> acyl), S(C<sub>1-4</sub> alkyl), S(C<sub>2-4</sub> alkynyl), S(C<sub>2-4</sub> alkenyl), SO(C<sub>1-4</sub> acyl), SO(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO(C<sub>2-4</sub> alkynyl), SO(C<sub>2-4</sub> alkenyl), 5  $SO_2(C_{1-4} \text{ acyl})$ ,  $SO_2(C_{1-4} \text{ alkyl})$ ,  $SO_2(C_{2-4} \text{ alkynyl})$ ,  $SO_2(C_{2-4} \text{ alkenyl})$ ,  $OS(O)_2(C_{1-4} \text{ alkyl})$ 4 acyl), OS(O)2(C1-4 alkyl), OS(O)2(C2-4 alkenyl), NH2, NH(C1-4 alkyl), NH(C2-4 alkenyl), NH(C2-4 alkynyl), NH(C1-4 acyl), N(C1-4 alkyl)2, N(C1-18 acyl)2, wherein alkyl, alkynyl, alkenyl and vinyl are optionally substituted by N<sub>3</sub>, CN, one to three halogen (Cl, Br, F, I), NO<sub>2</sub>, C(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), C(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), 10 C(O)O(C<sub>2-4</sub> alkynyl), C(O)O(C<sub>2-4</sub> alkenyl), O(C<sub>1-4</sub> acyl), O(C<sub>1-4</sub> alkyl), O(C<sub>2-4</sub> alkenyl), S(C<sub>1-4</sub> acyl), S(C<sub>1-4</sub> alkyl), S(C<sub>2-4</sub> alkynyl), S(C<sub>2-4</sub> alkenyl), SO(C<sub>1-4</sub> acyl), SO(C1-4 alkyl), SO(C2-4 alkynyl), SO(C2-4 alkenyl), SO2(C1-4 acyl),  $SO_2(C_{1-4} \text{ alkyl})$ ,  $SO_2(C_{2-4} \text{ alkynyl})$ ,  $SO_2(C_{2-4} \text{ alkenyl})$ ,  $OS(O)_2(C_{1-4} \text{ acyl})$ ,  $OS(O)_2(C_{1-4} \text{ alkyl}), OS(O)_2(C_{2-4} \text{ alkenyl}), NH_2, NH(C_{1-4} \text{ alkyl}), NH(C_{2-4} \text{ alkyl})$ 15 alkenyl), NH( $C_{2-4}$  alkynyl), NH( $C_{1-4}$  acyl), N( $C_{1-4}$  alkyl)<sub>2</sub>, N( $C_{1-4}$  acyl)<sub>2</sub>;
- (i) R<sup>10</sup> is H, F, Cl, Br, I, OH, OR', SH, SR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkenyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkenyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkynyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>
  20 such as C≡CH, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkynyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkoxy of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkoxy of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>H, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R',

wherein R' is an optionally substituted alkyl , which includes, but is not limited to, an optionally substituted  $C_{1-20}$  alkyl, an optionally substituted  $C_{1-10}$  alkyl, an optionally substituted lower alkyl; an optionally substituted cycloalkyl; an optionally substituted alkynyl of  $C_2$ - $C_6$ , an optionally substituted lower alkenyl of  $C_2$ - $C_6$ , or optionally substituted acyl, which includes but is not limited to C(O) alkyl,  $C(O)(C_{1-20}$  alkyl),  $C(O)(C_{1-10}$  alkyl), or C(O) (lower alkyl) or alternatively, in the instance of  $NR'_2$ , each R' comprise at least one C atom that are joined to form a heterocycle comprising at least two carbon atoms; and

(j) Z is N or  $CR^{12}$ ; and

2983472-1

25

30

- 77 -

Docket No. 60137.0034WOU1

 $R^{12}$  is H, halogen (including F, Cl, Br, I), OH, OR', SH, SR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub> lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkenyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkenyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkynyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkynyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkoxy of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkoxy of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>H, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R'; with the proviso that  $R^{12}$  is not a: (i) -C = C - H, (ii) -C = C + H, or (iii)  $-NO_2$ .

A second aspect of the fourth embodiment is directed to a compound represented by formula I-7

# 10 wherein

5

- (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, methyl, ethyl, *n*-propyl, *i*-propyl, phenyl, p-tolyl, p-bromo-phenyl, p-chloro-phenyl, p-fluorophenyl;
  - (b)  $R^2$  is hydrogen or  $CH_3$ ;
- (c) R<sup>3a</sup> is H and R<sup>3b</sup> is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>,

  15 CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH<sub>2</sub>-indol-3-yl, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H,

  CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, 
  CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>-imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl;
- (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, CH<sub>3</sub>, Et, <sup>i</sup>Pr, <sup>n</sup>Pr, <sup>n</sup>Bu, 2-butyl, <sup>t</sup>Bu, benzyl, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, N-methyl-aziridin-2-yl, N-methyl-azetidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-4-yl, N-methyl-piperidin-4-yl, lower haloalkyl, or di(lower alkyl)amino-lower alkyl;
- (e) R<sup>5</sup> is H, CN, CH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>OH, CH<sub>2</sub>F, halogen, including F, Cl, Br, or I, with the provisos that when X is OH, R<sup>6</sup> is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F, R<sup>5</sup> cannot be H.
  - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, F, or CN;
  - (g) X is H, OH, F, OCH<sub>3</sub>, halogen, NH<sub>2</sub>, or N<sub>3</sub>;

2983472-1

IPR2018-00126 Page 79 of 751 I-MAK 1005

Docket No. 60137.0034WOU1

(h) Y is OH, H, CH<sub>3</sub>, vinyl, NH<sub>2</sub>, N<sub>3</sub>, CN, Cl, Br, F, I, OC(O)CH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>;

- (i) R<sup>10</sup> is H, F, Br, I, OH, OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R',
- wherein R' is a lower alkyl, a lower cycloalkyl, or C(O)(lower alkyl) or alternatively, in the instance of NR'<sub>2</sub>, each R' comprise at least one C atom that are joined to form a heterocycle comprising at least two carbon atoms; and
  - (j) Z is N or  $CR^{12}$ ; and

 $R^{12}$  is H, halogen (including F, Cl, Br, I), OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>, lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R'; with the proviso that  $R^{12}$  is not a: (i) -C=C-H, (ii)  $-C=CH_2$ , or (iii)  $-NO_2$ .

A third aspect of the third embodiment is directed to a compound represented by formula I-7

wherein

- (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, methyl, ethyl, *n*-propyl, *i*-propyl, phenyl, p-tolyl, p-bromo-phenyl, p-chloro-phenyl, p-fluorophenyl;
  - (b)  $R^2$  is hydrogen or  $CH_3$ ;
- (c) R<sup>3a</sup> is H and R<sup>3b</sup> is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>,

  20 CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, or lower cycloalkyl;
  - (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, CH<sub>3</sub>, Et, <sup>i</sup>Pr, <sup>n</sup>Pr, <sup>n</sup>Bu, 2-butyl, <sup>t</sup>Bu, benzyl, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, N-methyl-aziridin-2-yl, N-methyl-azetidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-4-yl, N-methyl-piperidin-4-yl, lower haloalkyl, or di(lower alkyl)amino-lower alkyl;
- 25 (e) R<sup>5</sup> is H, CN, CH<sub>2</sub>F, F, Cl, Br, or I; with the proviso that X is OH, R<sup>6</sup> is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F, R<sup>5</sup> cannot be H;
  - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, or F;

- (g) X is H, OH, F, OCH<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, NH<sub>2</sub> or N<sub>3</sub>;
- (h) Y is H, OH, CH<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, NH<sub>2</sub> or N<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, or OC(O)CH<sub>3</sub>;
- (i) R<sup>10</sup> is H, F, Br, I, OH, OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R',
- wherein R' is a lower alkyl, a lower cycloalkyl, or C(O)(lower alkyl) or alternatively, in the instance of NR'<sub>2</sub>, each R' comprise at least one C atom that are joined to form a heterocycle comprising at least two carbon atoms; and
  - (j) Z is N or  $CR^{12}$ ; and

 $R^{12}$  is H, halogen (including F, Cl, Br, I), OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>, lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R'; with the proviso that  $R^{12}$  is not a: (i) -C=C-H, (ii)  $-C=CH_2$ , or (iii)  $-NO_2$ .

A fourth aspect of the fourth embodiment is directed to a compound represented by formula I-7

# wherein

- (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, methyl, ethyl, *n*-propyl, *i*-propyl, phenyl, p-tolyl, p-bromo-phenyl, p-chloro-phenyl, p-fluorophenyl;
  - (b) R<sup>2</sup> is hydrogen;
- (c) R<sup>3a</sup> is H and R<sup>3b</sup> is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>,

  20 CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, or lower cycloalkyl;
  - (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, CH<sub>3</sub>, Et, <sup>1</sup>Pr, <sup>n</sup>Pr, <sup>n</sup>Bu, 2-butyl, <sup>1</sup>Bu, benzyl, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, N-methyl-aziridin-2-yl, N-methyl-azetidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-4-yl, N-methyl-piperidin-4-yl, lower haloalkyl, or di(lower alkyl)amino-lower alkyl;
- 25 (e) R<sup>5</sup> is H, with the provisos that when X is OH, R<sup>6</sup> is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F, R<sup>5</sup> cannot be H;

- (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, or F;
- (g)  $X \text{ is } H, OH, OCH_3, F, NH_2 \text{ or } N_3;$
- (h) Y is OH,  $NH_2$ ,  $OCH_3$ , or  $OC(O)CH_3$ ;
- (i) R<sup>10</sup> and R<sup>11</sup> H, F, Br, I, OH, OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONH<sub>2</sub>, CONH<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R',

wherein R' is a lower alkyl, a lower cycloalkyl, or C(O)(lower alkyl) or alternatively, in the instance of NR'<sub>2</sub>, each R' comprise at least one C atom that are joined to form a heterocycle comprising at least two carbon atoms; and

- (j) Z is N or  $CR^{12}$ ; and
- 10  $R^{12}$  is an H, halogen (including F, Cl, Br, I), OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>, lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R'; with the proviso that  $R^{12}$  is not a: (i) -C=C-H, (ii)  $-C=CH_2$ , or (iii)  $-NO_2$ .

A fifth aspect of the fourth embodiment is directed to a compound represented by formula I-7

wherein

15

- (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, methyl, phenyl, p-bromo-phenyl, p-chloro-phenyl, p-fluorophenyl;
  - (b) R<sup>2</sup> is hydrogen;
- 20 (c) R<sup>3a</sup> is H and R<sup>3b</sup> is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, or lower cycloalkyl;
  - (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, CH<sub>3</sub>, Et, <sup>i</sup>Pr, <sup>n</sup>Pr, <sup>n</sup>Bu, 2-butyl, <sup>i</sup>Bu, benzyl, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, N-methyl-aziridin-2-yl, N-methyl-azetidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-4-yl, N-methyl-piperidin-4-yl, lower haloalkyl, or di(lower alkyl)amino-lower alkyl;

2983472-1

Docket No. 60137.0034WOU1

(e)  $R^5$  is H, with the provisos that when X is OH,  $R^6$  is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F,  $R^5$  cannot be H;

- (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, or F;
- (g)  $X \text{ is } H, OH, OCH_3, F, NH_2 \text{ or } N_3;$
- 5 (h) Y is OH, NH<sub>2</sub>, OCH<sub>3</sub>, or OC(O)CH<sub>3</sub>;
  - (i) R<sup>10</sup> is H, F, Br, I, OH, OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R',

wherein R' is a lower alkyl, a lower cycloalkyl, or C(O)(lower alkyl) or alternatively, in the instance of NR'2, each R' comprise at least one C atom that are joined to form a heterocycle comprising at least two carbon atoms; and

(j) Z is N or  $CR^{12}$ ; and

 $R^{12}$  is H, halogen (including F, Cl, Br, I), OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>, lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R'.

A sixth aspect of the fourth embodiment is directed to a compound represented by formula I-8

$$R^{3a} = \begin{bmatrix} R^{2b} & R^{2} & 0 \\ R^{2b} & R^{2} & 0 \\ R^{3a} & R^{2b} & R^{2b} & R^{2b} \\ R^{3a} & R^{3a} & R^{2b} & R^{2b} & R^{2b} \\ R^{3a} & R^{3a} & R^{2b} & R^{2b} & R^{2b} \\ R^{3a} & R^{3a} & R^{3a} & R^{3a} & R^{3a} \\ R^{3a} & R^{3a} & R^{3a} & R^{3a} & R^{3a} \\ R^{3a} & R^{3a} & R^{3a} & R^{3a} & R^{3a} \\ R^{3a} & R^{3a} & R^{3a} & R^{3a} & R^{3a} \\ R^{3a} & R^{3a} & R^{3a} & R^{3a} & R^{3a} \\ R^{3a} & R^{3a} & R^{3a} & R^{3a} & R^{3a} \\ R^{3a} & R^$$

**I-8** 

wherein

2983472-1

10

- (a)  $R^1$  is hydrogen, n-alkyl; branched alkyl; cycloalkyl; or aryl, which includes, but is not limited to, phenyl or naphthyl, where phenyl or naphthyl are optionally substituted with at least one of  $C_{1-6}$  alkyl,  $C_{2-6}$  alkenyl,  $C_{2-6}$  alkynyl,  $C_{1-6}$  alkoxy, F, Cl, Br, I, nitro, cyano,  $C_{1-6}$  haloalkyl,  $-N(R^1)_2$ ,  $C_{1-6}$  acylamino,  $NHSO_2C_{1-6}$  alkyl,  $-SO_2N(R^1)_2$ ,  $COR^1$ , and  $-SO_2C_{1-6}$  alkyl; ( $R^1$  is independently hydrogen or alkyl, which includes, but is not limited to,  $C_{1-20}$  alkyl,  $C_{1-10}$  alkyl, or  $C_{1-6}$  alkyl,  $R^1$  is -OR or  $-N(R^1)_2$ ;
  - (b)  $R^2$  is hydrogen or  $CH_3$ ;
- R<sup>3a</sup> and R<sup>3b</sup> are (i) independently selected from hydrogen, C<sub>1-10</sub> alkyl, cycloalkyl, - $(CH_2)_c(NR^3)_2$ ,  $C_{1-6}$  hydroxyalkyl, - $CH_2SH$ , - $(CH_2)_2S(O)_dMe$ , -10 (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>NHC(=NH)NH<sub>2</sub>, (1H-indol-3-yl)methyl, (1H-imidazol-4-yl)methyl, -(CH<sub>2</sub>)<sub>e</sub>COR<sup>3"</sup>, aryl and aryl C<sub>1-3</sub> alkyl, said aryl groups optionally substituted with a group selected from hydroxyl, C<sub>1-10</sub> alkyl, C<sub>1-6</sub> alkoxy, halogen, nitro and cyano; (ii)  $R^{3a}$  and  $R^{3b}$  both are  $C_{1-6}$  alkyl; (iii)  $R^{3a}$  and  $R^{3b}$  together are  $(CH_2)_f$  so as to form a spiro ring; (iv)  $R^{3a}$  is hydrogen and  $R^{3b}$  and  $R^2$  together are  $(CH_2)_n$ 15 so as to form a cyclic ring that includes the adjoining N and C atoms (v) R3b is hydrogen and R<sup>3a</sup> and R<sup>2</sup> together are (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> so as to form a cyclic ring that includes the adjoining N and C atoms, where c is 1 to 6, d is 0 to 2, e is 0 to 3, f is 2 to 5, n is 2 to 4, and where R3' is independently hydrogen or C1-6 alkyl and  $R^{3"}$  is -OR' or -N( $R^{3'}$ )<sub>2</sub>); (vi)  $R^{3a}$  is H and  $R^{3b}$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, 20 CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH<sub>2</sub>-indol-3-yl, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>, CH2CO2H, CH2C(O)NH2, CH2CH2COOH, CH2CH2C(O)NH2, CH2CH2CH2CH2NH2, -CH2CH2CH2NHC(NH)NH2, CH2-imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl; or (viii) R<sup>3a</sup> is CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, 25 CH2-indol-3-yl, -CH2CH2SCH3, CH2CO2H, CH2C(O)NH2, CH2CH2COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl and R3b is H, where R3' is independently hydrogen or alkyl, which includes, but is not limited to,  $C_{1\text{--}20}$  alkyl,  $C_{1\text{--}10}$  alkyl, or  $C_{1\text{--}6}$  alkyl,  $R^{3"}$  is -OR' or 30  $-N(R^{3'})_2);$

Docket No. 60137.0034WOU1

5

- (d)  $R^4$  is hydrogen,  $C_{1-10}$  alkyl,  $C_{1-10}$  alkyl optionally substituted with a lower alkyl, alkoxy or halogen,  $C_{1-10}$  haloalkyl,  $C_{3-10}$  cycloalkyl, cycloalkyl alkyl, cycloheteroalkyl, aminoacyl, di(lower alkyl)amino-lower alkyl, aryl, such as phenyl, heteroaryl, such as, pyridinyl, substituted aryl, or substituted heteroaryl;
- (e) R<sup>5</sup> is H, a lower alkyl, CN, vinyl, O-(lower alkyl), hydroxyl lower alkyl, i.e., -(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>OH, where p is 1 -6, including hydroxyl methyl (CH<sub>2</sub>OH), CH<sub>2</sub>F, N<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CN, CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>NHCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, alkyne (optionally substituted), or halogen, including F, Cl, Br, or I, with the provisos that when X is OH, base is cytosine and R<sup>6</sup> is H, R<sup>5</sup> cannot be N<sub>3</sub> and when X is OH, R<sup>6</sup> is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F and B is a purine base, R<sup>5</sup> cannot be H;
  - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, F, or CN;
  - (g) X is H, OH, F, OMe, halogen, NH<sub>2</sub>, or N<sub>3</sub>;
- Y is OH, H, C<sub>1-4</sub> alkyl, C<sub>2-4</sub> alkenyl, C<sub>2-4</sub> alkynyl, vinyl, N<sub>3</sub>, CN, (h) Cl, Br, F, I, NO<sub>2</sub>, OC(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), OC(O)O(C<sub>2-4</sub> alkynyl), OC(O)O(C<sub>2-4</sub> 15 alkenyl), OC1-10 haloalkyl, O(aminoacyl), O(C1-10 acyl), O(C1-4 alkyl), O(C2-4 alkenyl), S(C<sub>1-4</sub> acyl), S(C<sub>1-4</sub> alkyl), S(C<sub>2-4</sub> alkynyl), S(C<sub>2-4</sub> alkenyl), SO(C<sub>1-4</sub> acyl), SO(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO(C<sub>2-4</sub> alkynyl), SO(C<sub>2-4</sub> alkenyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> acyl),  $SO_2(C_{1-4} \text{ alkyl})$ ,  $SO_2(C_{2-4} \text{ alkynyl})$ ,  $SO_2(C_{2-4} \text{ alkenyl})$ ,  $OS(O)_2(C_{1-4} \text{ acyl})$ , OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>2-4</sub> alkenyl), NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1-4</sub> alkyl), NH(C<sub>2-4</sub> 20 alkenyl), NH(C2-4 alkynyl), NH(C1-4 acyl), N(C1-4 alkyl)2, N(C1-18 acyl)2, wherein alkyl, alkynyl, alkenyl and vinyl are optionally substituted by N<sub>3</sub>, CN, one to three halogen (Cl, Br, F, I), NO<sub>2</sub>, C(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), C(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), C(O)O(C<sub>2-4</sub> alkynyl), C(O)O(C<sub>2-4</sub> alkenyl), O(C<sub>1-4</sub> acyl), O(C<sub>1-4</sub> alkyl), O(C<sub>2-4</sub> alkenyl),  $S(C_{1-4} \text{ acyl})$ ,  $S(C_{1-4} \text{ alkyl})$ ,  $S(C_{2-4} \text{ alkynyl})$ ,  $S(C_{2-4} \text{ alkenyl})$ ,  $SO(C_{1-4} \text{ alkynyl})$ 25 acyl), SO(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO(C<sub>2-4</sub> alkynyl), SO(C<sub>2-4</sub> alkenyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> acyl),  $SO_2(C_{1-4} \text{ alkyl}), SO_2(C_{2-4} \text{ alkynyl}), SO_2(C_{2-4} \text{ alkenyl}), OS(O)_2(C_{1-4} \text{ acyl}),$ OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>2-4</sub> alkenyl), NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1-4</sub> alkyl), NH(C<sub>2-4</sub> alkenyl),  $NH(C_{2-4}$  alkynyl),  $NH(C_{1-4}$  acyl),  $N(C_{1-4}$  alkyl)<sub>2</sub>,  $N(C_{1-4}$  acyl)<sub>2</sub>;
- 30 (i) R<sup>10</sup> is H, F, Br, I, OH, OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R',

Docket No. 60137.0034WOU1

wherein R' is a lower alkyl, a lower cycloalkyl, or C(O)(lower alkyl) or alternatively, in the instance of NR'<sub>2</sub>, each R' comprise at least one C atom that are joined to form a heterocycle comprising at least two carbon atoms; and

(j) Z is N or  $CR^{12}$ ; and

R<sup>12</sup> is H, halogen (including F, Cl, Br, I), OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>, lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R'; with the proviso that when base is represented by the structure c with R<sup>11</sup> being hydrogen, R<sup>12</sup> is not a: (i) -C=C-H, (ii)  $-C=CH_2$ , or (iii)  $-NO_2$ .

A seventh aspect of the fourth embodiment is directed to a compound represented by formula **I-8** 

wherein

- (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, methyl, ethyl, *n*-propyl, *i*-propyl, phenyl, p-tolyl, p-bromo-phenyl, p-chloro-phenyl, p-fluorophenyl;
  - (b)  $R^2$  is hydrogen or  $CH_3$ ;
- 15 (c) R<sup>3a</sup> is H and R<sup>3b</sup> is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>,
  CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH<sub>2</sub>-indol-3-yl, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H,
  CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>-imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl;
- 20 (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, CH<sub>3</sub>, Et, <sup>i</sup>Pr, <sup>n</sup>Pr, <sup>n</sup>Bu, 2-butyl, <sup>i</sup>Bu, benzyl, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, N-methyl-aziridin-2-yl, N-methyl-azetidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-4-yl, N-methyl-piperidin-4-yl, lower haloalkyl, or di(lower alkyl)amino-lower alkyl;
- (e) R<sup>5</sup> is H, CN, CH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>OH, CH<sub>2</sub>F, halogen, including F,
   25 Cl, Br, or I, with the provisos that when X is OH, R<sup>6</sup> is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F, R<sup>5</sup> cannot be H;
  - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, F, or CN;

Docket No. 60137.0034WOU1

- (g) X is H, OH, F, OCH<sub>3</sub>, halogen, NH<sub>2</sub>, or N<sub>3</sub>;
- (h) Y is OH, H, CH<sub>3</sub>, vinyl, NH<sub>2</sub>, N<sub>3</sub>, CN, Cl, Br, F, I, OC(O)CH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>;
- (i) R<sup>10</sup> is H, F, Br, I, OH, OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>,

  5 CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R',

wherein R' is a lower alkyl, a lower cycloalkyl, or C(O)(lower alkyl) or alternatively, in the instance of NR'<sub>2</sub>, each R' comprise at least one C atom that are joined to form a heterocycle comprising at least two carbon atoms; and

(j) Z is N or  $CR^{12}$ ; and

10  $R^{12}$  is an H, halogen (including F, Cl, Br, I), OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>, lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R'; with the proviso that  $R^{12}$  is not a: (i) -C=C-H, (ii)  $-C=CH_2$ , or (iii)  $-NO_2$ .

An eighth aspect of the fourth embodiment is directed to a compound represented by formula **I-8** 

wherein

- (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, methyl, ethyl, *n*-propyl, *i*-propyl, phenyl, p-tolyl, p-bromo-phenyl, p-chloro-phenyl, p-fluorophenyl;
  - (b)  $R^2$  is hydrogen or  $CH_3$ ;
- 20 (c) R<sup>3a</sup> is H and R<sup>3b</sup> is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, or lower cycloalkyl;
  - (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, CH<sub>3</sub>, Et, 'Pr, "Pr, "Bu, 2-butyl, 'Bu, benzyl, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, N-methyl-aziridin-2-yl, N-methyl-azetidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-4-yl, lower haloalkyl, or di(lower alkyl)amino-lower alkyl;
  - (e) R<sup>5</sup> is H, CN, CH<sub>2</sub>F, F, Cl, Br, or I, with the provisos that when X is OH, R<sup>6</sup> is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F, R<sup>5</sup> cannot be H;

2983472-1

Docket No. 60137.0034WOU1

- (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, or F;
- (g) X is H, OH, F, OCH<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, NH<sub>2</sub> or N<sub>3</sub>;
- (h) Y is H, OH, CH<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, NH<sub>2</sub> or N<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, or OC(O)CH<sub>3</sub>;
- (i) R<sup>10</sup> is H, F, Br, I, OH, OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R',

wherein R' is a lower alkyl, a lower cycloalkyl, or C(O)(lower alkyl) or alternatively, in the instance of NR'<sub>2</sub>, each R' comprise at least one C atom that are joined to form a heterocycle comprising at least two carbon atoms; and

- (j) Z is N or  $CR^{12}$ ; and
- 10  $R^{12}$  is an H, halogen (including F, Cl, Br, I), OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>, lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R'; with the proviso that  $R^{12}$  is not a: (i) -C=C-H, (ii)  $-C=CH_2$ , or (iii)  $-NO_2$ .

A ninth aspect of the fourth embodiment is directed to a compound represented by formula I-8

wherein

- (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, methyl, ethyl, *n*-propyl, *i*-propyl, phenyl, p-tolyl, p-bromo-phenyl, p-chloro-phenyl, p-fluorophenyl;
  - (b) R<sup>2</sup> is hydrogen;
- 20 (c) R<sup>3a</sup> is H and R<sup>3b</sup> is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, or lower cycloalkyl;
  - (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, CH<sub>3</sub>, Et, <sup>1</sup>Pr, <sup>n</sup>Pr, <sup>n</sup>Bu, 2-butyl, <sup>1</sup>Bu, benzyl, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, N-methyl-aziridin-2-yl, N-methyl-azetidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-4-yl, N-methyl-piperidin-4-yl, lower haloalkyl, or di(lower alkyl)amino-lower alkyl;

2983472-1

Docket No. 60137.0034WOU1

(e)  $R^5$  is H, with the provisos that when X is OH,  $R^6$  is  $CH_3$  or  $CH_2F$ ,  $R^5$  cannot be H;

- (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, or F;
- (g)  $X \text{ is } H, OH, OCH_3, F, NH_2 \text{ or } N_3;$
- 5 (h) Y is OH, NH<sub>2</sub>, OCH<sub>3</sub>, or OC(O)CH<sub>3</sub>;
  - (i) R<sup>10</sup> is H, F, Br, I, OH, OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R',

wherein R' is a lower alkyl, a lower cycloalkyl, or C(O)(lower alkyl) or alternatively, in the instance of NR'<sub>2</sub>, each R' comprise at least one C atom that are joined to form a heterocycle comprising at least two carbon atoms; and

(j) Z is N or  $CR^{12}$ ; and

R<sup>12</sup> is an H, halogen (including F, Cl, Br, I), OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>, lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R'; with the proviso that R<sup>12</sup> is not a: (i) −C≡C−H, (ii) −C=CH<sub>2</sub>, or (iii) −NO<sub>2</sub>.

A tenth aspect of the fourth embodiment is directed to a compound represented by formula I-8

wherein

- (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, methyl, phenyl, p-bromo-phenyl, p-chloro-20 phenyl, p-fluorophenyl;
  - (b) R<sup>2</sup> is hydrogen;
  - (c) R<sup>3a</sup> is H and R<sup>3b</sup> is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, or lower cycloalkyl;
- (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, CH<sub>3</sub>, Et, <sup>1</sup>Pr, <sup>n</sup>Pr, <sup>n</sup>Bu, 2-butyl, <sup>1</sup>Bu, benzyl, 25 cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, N-methyl-aziridin-2-yl, N-

2983472-1

Docket No. 60137.0034WOU1

5

20

methyl-azetidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-4-yl, N-methyl-piperidin-4-yl, lower haloalkyl, or di(lower alkyl)amino-lower alkyl;

- (e)  $R^5$  is H, with the provisos that when X is OH,  $R^6$  is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F,  $R^5$  cannot be H;
- (f)  $R^6$  is H,  $CH_3$ ,  $CH_2F$ ,  $CHF_2$ ,  $CF_3$ , or F;
  - (g)  $X \text{ is } H, OH, OCH_3, F, NH_2 \text{ or } N_3;$
  - (h) Y is OH,  $NH_2$ ,  $OCH_3$ , or  $OC(O)CH_3$ ;
  - (i) R<sup>10</sup> is H, F, Br, I, OH, OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R',
- wherein R' is a lower alkyl, a lower cycloalkyl, or C(O)(lower alkyl) or alternatively, in the instance of NR'2, each R' comprise at least one C atom that are joined to form a heterocycle comprising at least two carbon atoms; and
  - (i) Z is N or  $CR^{12}$ ; and

R<sup>12</sup> is an H, halogen (including F, Cl, Br, I), OR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>, lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R'; with the proviso that R<sup>12</sup> is not a: (i) −C=C−H, (ii) −C=CH<sub>2</sub>, or (iii) −NO<sub>2</sub>.

A fifth embodiment of the invention is directed to a compound represented by formula I in which the base is a structure represented by formula d above, wherein R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3a</sup>, R<sup>3b</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, X, and Y are defined in the Summary of the Invention section above.

The first aspect of the fifth embodiment is directed to a compound represented by formula I-9

Docket No. 60137.0034WOU1

$$R^{3a}$$
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{3b}$ 

wherein

15

20

- (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, n-alkyl; branched alkyl; cycloalkyl; or aryl, which includes, but is not limited to, phenyl or naphthyl, where phenyl or naphthyl are optionally substituted with at least one of C<sub>1-6</sub> alkyl, C<sub>2-6</sub> alkenyl, C<sub>2-6</sub> alkynyl, C<sub>1-6</sub> alkoxy, F, Cl, Br, I, nitro, cyano, C<sub>1-6</sub> haloalkyl, -N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, C<sub>1-6</sub> acylamino, -NHSO<sub>2</sub>C<sub>1-6</sub> alkyl, -SO<sub>2</sub>N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, COR<sup>1</sup>, and -SO<sub>2</sub>C<sub>1-6</sub> alkyl; (R<sup>1</sup> is independently hydrogen or alkyl, which includes, but is not limited to, C<sub>1-20</sub> alkyl, C<sub>1-10</sub> alkyl, or C<sub>1-6</sub> alkyl, R<sup>1</sup> is -OR' or -N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>);
  - (b)  $R^2$  is hydrogen or  $CH_3$ ;
  - (c)  $R^{3a}$  and  $R^{3b}$  are (i) independently selected from hydrogen,  $C_{1-10}$  alkyl, cycloalkyl,  $-(CH_2)_c(NR^{3'})_2$ ,  $C_{1-6}$  hydroxyalkyl,  $-CH_2SH$ ,  $-(CH_2)_2S(O)_dMe$ ,  $-(CH_2)_3NHC(=NH)NH_2$ , (1H-indol-3-yl)methyl, (1H-imidazol-4-yl)methyl,  $-(CH_2)_eCOR^{3''}$ , aryl and aryl  $C_{1-3}$  alkyl, said aryl groups optionally substituted with a group selected from hydroxyl,  $C_{1-10}$  alkyl,  $C_{1-6}$  alkoxy, halogen, nitro and cyano; (ii)  $R^{3a}$  and  $R^{3b}$  both are  $C_{1-6}$  alkyl; (iii)  $R^{3a}$  and  $R^{3b}$  together are  $(CH_2)_f$  so as to form a spiro ring; (iv)  $R^{3a}$  is hydrogen and  $R^{3b}$  and  $R^2$  together are  $(CH_2)_n$  so as to form a cyclic ring that includes the adjoining  $R^{3a}$  and  $R^{3a}$  and  $R^{3a}$  and  $R^{3a}$  and  $R^{3a}$  and  $R^{3a}$  together are  $(CH_2)_n$  so as to form a cyclic ring that includes the adjoining  $R^{3a}$  and  $R^{3a}$  and  $R^{3a}$  and  $R^{3a}$  together are  $(CH_2)_n$  so as to form a cyclic ring that includes the adjoining  $R^{3a}$  and  $R^{3a}$  and  $R^{3a}$  together are  $(CH_2)_n$  so as to form a cyclic ring that includes the adjoining  $R^{3a}$  and  $R^{3a}$  and  $R^{3a}$  to  $R^{3a}$  and  $R^{3a}$  to  $R^{3a}$  and  $R^{3a}$  and

2983472-1 - 90 -

IPR2018-00126 Page 91 of 751 I-MAK 1005

Docket No. 60137.0034WOU1

CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H, CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>,

CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>-imidazol-4-yl,

CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl; or (viii)

R<sup>3a</sup> is CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph,

5 CH<sub>2</sub>-indol-3-yl, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H, CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH,

CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>-imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl and R<sup>3b</sup> is H, where R<sup>3'</sup> is independently hydrogen or alkyl, which includes, but is not limited to, C<sub>1-20</sub> alkyl, C<sub>1-10</sub> alkyl, or C<sub>1-6</sub> alkyl, R<sup>3"</sup> is -OR' or -N(R<sup>3'</sup>)<sub>2</sub>);

- (d)  $R^4$  is hydrogen,  $C_{1-10}$  alkyl,  $C_{1-10}$  alkyl optionally substituted with a lower alkyl, alkoxy or halogen,  $C_{1-10}$  haloalkyl,  $C_{3-10}$  cycloalkyl, cycloalkyl alkyl, cycloheteroalkyl, aminoacyl, di(lower alkyl)amino-lower alkyl, aryl, such as phenyl, heteroaryl, such as, pyridinyl, substituted aryl, or substituted heteroaryl;
- (e) R<sup>5</sup> is H, a lower alkyl, CN, vinyl, O-(lower alkyl), hydroxyl lower alkyl, i.e., -(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>OH, where p is 1 -6, including hydroxyl methyl (CH<sub>2</sub>OH), CH<sub>2</sub>F, N<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CN, CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>NHCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, alkyne (optionally substituted), or halogen, including F, Cl, Br, or I, with the provisos that when X is OH, base is cytosine and R<sup>6</sup> is H, R<sup>5</sup> cannot be N<sub>3</sub> and when X is OH, R<sup>6</sup> is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F and B is a purine base, R<sup>5</sup> cannot be H;
  - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, F, or CN;
  - (g) X is H, OH, F, OMe, halogen, NH<sub>2</sub>, or N<sub>3</sub>;
- (h) Y is OH, H, C<sub>1-4</sub> alkyl, C<sub>2-4</sub> alkenyl, C<sub>2-4</sub> alkynyl, vinyl, N<sub>3</sub>, CN, Cl, Br, F, I, NO<sub>2</sub>, OC(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), OC(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), OC(O)O(C<sub>2-4</sub> alkynyl), OC(O)O(C<sub>2-4</sub> alkenyl), OC<sub>1-10</sub> haloalkyl, O(aminoacyl), O(C<sub>1-10</sub> acyl), O(C<sub>1-4</sub> alkyl), O(C<sub>2-4</sub> alkenyl), S(C<sub>1-4</sub> acyl), S(C<sub>1-4</sub> alkyl), S(C<sub>2-4</sub> alkynyl), S(C<sub>2-4</sub> alkenyl), SO(C<sub>1-4</sub> acyl), SO(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO(C<sub>2-4</sub> alkynyl), SO(C<sub>2-4</sub> alkenyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> acyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>2-4</sub> alkynyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>2-4</sub> alkenyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1-4</sub> alkyl), NH(C<sub>2-4</sub> alkenyl), NH(C<sub>1-4</sub> alkyl), NH(C<sub>1-4</sub> acyl)<sub>2</sub>,

2983472-1

Docket No. 60137.0034WOU1

wherein alkyl, alkynyl, alkenyl and vinyl are optionally substituted by  $N_3$ , CN, one to three halogen (Cl, Br, F, I),  $NO_2$ ,  $C(O)O(C_{1-4}$  alkyl),  $C(O)O(C_{1-4}$  alkyl),  $C(O)O(C_{2-4}$  alkynyl),  $C(O)O(C_{2-4}$  alkenyl),  $O(C_{1-4}$  acyl),  $O(C_{1-4}$  alkyl),  $O(C_{1-4}$  alkyl),  $O(C_{2-4}$  alkenyl),  $O(C_{1-4}$  alkyl),  $O(C_{1-4}$  alkyl),  $O(C_{1-4}$  alkyl),  $O(C_{1-4}$  alkyl),  $O(C_{1-4}$  alkyl),  $O(C_{2-4}$  alkenyl),  $O(C_{2-4}$  alkyl),  $O(C_{2-4}$  alkyl),

A second aspect of the fifth embodiment is directed to a compound represented by formula **I-9** 

wherein

- (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, methyl, ethyl, *n*-propyl, *i*-propyl, phenyl, p-tolyl, p-bromo-phenyl, p-chloro-phenyl, p-fluorophenyl;
  - (b)  $R^2$  is hydrogen or  $CH_3$ ;
- 15 (c) R<sup>3a</sup> is H and R<sup>3b</sup> is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>,
  CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH<sub>2</sub>-indol-3-yl, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H,
  CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>-imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl;
- 20 (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, CH<sub>3</sub>, Et, 'Pr, "Pr, "Bu, 2-butyl, 'Bu, benzyl, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, N-methyl-aziridin-2-yl, N-methyl-azetidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-4-yl, N-methyl-piperidin-4-yl, lower haloalkyl, or di(lower alkyl)amino-lower alkyl;
- (e) R<sup>5</sup> is H, CN, CH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>OH, CH<sub>2</sub>F, halogen, including F,
   Cl, Br, or I, with the provisos that when X is OH, R<sup>6</sup> is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F, R<sup>5</sup> cannot be H.
  - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, F, or CN;
  - (g) X is H, OH, F, OCH<sub>3</sub>, halogen, NH<sub>2</sub>, or N<sub>3</sub>;

Docket No. 60137.0034WOU1

(h) Y is OH, H, CH<sub>3</sub>, vinyl, NH<sub>2</sub>, N<sub>3</sub>, CN, Cl, Br, F, I, OC(O)CH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>;

A third aspect of the fifth embodiment is directed to a compound represented by formula **I-9** 

# 5 wherein

- (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, methyl, ethyl, *n*-propyl, *i*-propyl, phenyl, p-tolyl, p-bromo-phenyl, p-chloro-phenyl, p-fluorophenyl;
  - (b)  $R^2$  is hydrogen or  $CH_3$ ;
- (c) R<sup>3a</sup> is H and R<sup>3b</sup> is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>,

  10 CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, or lower cycloalkyl;
  - (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, CH<sub>3</sub>, Et, 'Pr, "Pr, "Bu, 2-butyl, 'Bu, benzyl, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, N-methyl-aziridin-2-yl, N-methyl-azetidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-4-yl, N-methyl-piperidin-4-yl, lower haloalkyl, or di(lower alkyl)amino-lower alkyl;
- 15 (e) R<sup>5</sup> is H, CN, CH<sub>2</sub>F, F, Cl, Br, or I; with the proviso that X is OH, R<sup>6</sup> is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F, R<sup>5</sup> cannot be H;
  - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, or F;
  - (g) X is H, OH, F, OCH<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, NH<sub>2</sub> or N<sub>3</sub>;
  - (h) Y is H, OH, CH<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, NH<sub>2</sub> N<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, or OC(O)CH<sub>3</sub>;
- A fourth aspect of the fifth embodiment is directed to a compound represented by formula **I-9**

#### wherein

- (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, methyl, ethyl, *n*-propyl, *i*-propyl, phenyl, p-tolyl, p-bromo-phenyl, p-chloro-phenyl, p-fluorophenyl;
- 25 (b) R<sup>2</sup> is hydrogen;

Docket No. 60137.0034WOU1

5

(c) R<sup>3a</sup> is H and R<sup>3b</sup> is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, or lower cycloalkyl;

- (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, CH<sub>3</sub>, Et, <sup>i</sup>Pr, <sup>n</sup>Pr, <sup>n</sup>Bu, 2-butyl, <sup>i</sup>Bu, benzyl, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, N-methyl-aziridin-2-yl, N-methyl-azetidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-4-yl, N-methyl-piperidin-4-yl, lower haloalkyl, or di(lower alkyl)amino-lower alkyl;
- (e) R<sup>5</sup> is H, with the provisos that when X is OH, R<sup>6</sup> is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F, R<sup>5</sup> cannot be H;
  - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, or F;
- 10 (g) X is H, OH, OCH<sub>3</sub>, F, NH<sub>2</sub> or N<sub>3</sub>;
  - (h) Y is OH,  $NH_2$ ,  $OCH_3$ , or  $OC(O)CH_3$ ;

A fifth aspect of the fifth embodiment is directed to a compound represented by formula I-9

wherein

- 15 (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, methyl, phenyl, p-bromo-phenyl, p-chloro-phenyl, p-fluorophenyl;
  - (b)  $R^2$  is hydrogen;
  - (c) R<sup>3a</sup> is H and R<sup>3b</sup> is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, or lower cycloalkyl;
- 20 (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, CH<sub>3</sub>, Et, <sup>i</sup>Pr, <sup>n</sup>Pr, <sup>n</sup>Bu, 2-butyl, <sup>t</sup>Bu, benzyl, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, N-methyl-aziridin-2-yl, N-methyl-azetidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-4-yl, N-methyl-piperidin-4-yl, lower haloalkyl, or di(lower alkyl)amino-lower alkyl;
- (e) R<sup>5</sup> is H, with the provisos that when X is OH, R<sup>6</sup> is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F,
  25 R<sup>5</sup> cannot be H;
  - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, or F;

2983472-1

- 94 -

IPR2018-00126 Page 95 of 751 I-MAK 1005

Docket No. 60137.0034WOU1

- (g)  $X \text{ is } H, OH, OCH_3, F, NH_2 \text{ or } N_3;$
- (h) Y is OH,  $NH_2$ ,  $OCH_3$ , or  $OC(O)CH_3$ ;

A sixth aspect of the fifth embodiment is directed to a compound represented by formula I-10

I-10

wherein

5

- (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, methyl, ethyl, *n*-propyl, *i*-propyl, or a substituted or unsubstituted phenyl, where the substitutent of the substituted phenyl is at least one of a CH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, nitro, cyano, and a CH<sub>3-q</sub>X<sub>q</sub>, where X is F, Cl, Br, or I, and q is 1-3;
  - (b)  $R^2$  is hydrogen or  $CH_3$ ;
- (c) R<sup>3a</sup> is H and R<sup>3b</sup> is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>,
  CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH<sub>2</sub>-indol-3-yl, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H,
  15 CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>-imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl or R<sup>3a</sup> is CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>,
  CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH<sub>2</sub>-indol-3-yl, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H,
  CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, 20 CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>-imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl and R<sup>3b</sup> is H;

2983472-1

- 95 -

I-MAK 1005

IPR2018-00126 Page 96 of 751

Docket No. 60137.0034WOU1

(d) R<sup>4</sup> is hydrogen, CH<sub>3</sub>, Et, <sup>i</sup>Pr, <sup>n</sup>Pr, <sup>n</sup>Bu, 2-butyl, <sup>t</sup>Bu, benzyl, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, N-methyl-aziridin-2-yl, N-methyl-azetidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-4-yl, N-methyl-piperidin-4-yl, lower haloalkyl, or di(lower alkyl)amino-lower alkyl;

- 5 (e) R<sup>5</sup> is H, CN, CH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>OH, CH<sub>2</sub>F, N<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CN, CH<sub>2</sub>N<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>NHCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, halogen, including F, Cl, Br, or I, with the provisos that when X is OH, R<sup>6</sup> is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F, R<sup>5</sup> cannot be H;
  - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, F, or CN;
  - (g) X is H, OH, F, OCH<sub>3</sub>, Cl, Br, I, NH<sub>2</sub>, or N<sub>3</sub>;
- 10 (h) Y is OH, H, CH<sub>3</sub>, vinyl, N<sub>3</sub>, CN, Cl, Br, F, I, OC(O)CH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, NH<sub>2</sub>, NHCH<sub>3</sub>, NH(vinyl), NH(acetyl), NH(C(O)CH<sub>3</sub>), N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, N(C(O)CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>;

A seventh aspect of the fifth embodiment is directed to a compound represented by formula I-10

wherein

- 15 (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, methyl, ethyl, *n*-propyl, *i*-propyl, phenyl, p-tolyl, p-bromo-phenyl, p-chloro-phenyl, p-fluorophenyl;
  - (b) R<sup>2</sup> is hydrogen or CH<sub>3</sub>;
- (c) R<sup>3a</sup> is H and R<sup>3b</sup> is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>,
  CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH<sub>2</sub>-indol-3-yl, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H,
  20 CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>-imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl;
- (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, CH<sub>3</sub>, Et, <sup>i</sup>Pr, <sup>n</sup>Pr, <sup>n</sup>Bu, 2-butyl, <sup>t</sup>Bu, benzyl, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, N-methyl-aziridin-2-yl, N-methyl-azetidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-4-yl, N-methyl-piperidin-4-yl, lower haloalkyl, or di(lower alkyl)amino-lower alkyl;

2983472-1

IPR2018-00126 Page 97 of 751 I-MAK 1005

Docket No. 60137.0034WOU1

(e) R<sup>5</sup> is H, CN, CH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>OH, CH<sub>2</sub>F, halogen, including F, Cl, Br, or I, with the provisos that when X is OH, R<sup>6</sup> is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F, R<sup>5</sup> cannot be H;

- (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, F, or CN;
- 5 (g) X is H, OH, F, OCH<sub>3</sub>, Cl, Br, I, NH<sub>2</sub>, or N<sub>3</sub>; and
  - (h) Y is OH, H, CH<sub>3</sub>, vinyl, NH<sub>2</sub>, N<sub>3</sub>, CN, Cl, Br, F, I, OC(O)CH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>.

An eighth aspect of the fifth embodiment is directed to a compound represented by formula I-10

# 10 wherein

- (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, methyl, ethyl, *n*-propyl, *i*-propyl, phenyl, p-tolyl, p-bromo-phenyl, p-chloro-phenyl, p-fluorophenyl;
  - (b)  $R^2$  is hydrogen or  $CH_3$ ;
- (c) R<sup>3a</sup> is H and R<sup>3b</sup> is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>,

  15 CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, or lower cycloalkyl;
  - (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, CH<sub>3</sub>, Et, 'Pr, "Pr, "Bu, 2-butyl, 'Bu, benzyl, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, N-methyl-aziridin-2-yl, N-methyl-azetidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-4-yl, N-methyl-piperidin-4-yl, lower haloalkyl, or di(lower alkyl)amino-lower alkyl;
- 20 (e) R<sup>5</sup> is H, CN, CH<sub>2</sub>F, F, Cl, Br, or I, with the provisos that when X is OH, R<sup>6</sup> is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F, R<sup>5</sup> cannot be H;
  - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, or F;
  - (g)  $X \text{ is } H, OH, F, OCH_3, F, Cl, Br, I, NH_2 \text{ or } N_3;$
  - (h) Y is H, OH, CH<sub>3</sub>, F, Cl, Br, I, NH<sub>2</sub> or N<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, or OC(O)CH<sub>3</sub>;
- A ninth aspect of the fifth embodiment is directed to a compound

2983472-1

- 97 -

IPR2018-00126 Page 98 of 751 I-MAK 1005

# represented by formula I-10

# wherein

- (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, methyl, ethyl, *n*-propyl, *i*-propyl, phenyl, p-tolyl, p-bromo-phenyl, p-chloro-phenyl, p-fluorophenyl;
- 5 (b) R<sup>2</sup> is hydrogen;
  - (c) R<sup>3a</sup> is H and R<sup>3b</sup> is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, or lower cycloalkyl;
- (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, CH<sub>3</sub>, Et, <sup>i</sup>Pr, <sup>n</sup>Pr, <sup>n</sup>Bu, 2-butyl, <sup>i</sup>Bu, benzyl, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, N-methyl-aziridin-2-yl, N-methyl-azeridin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-4-yl, N-methyl-piperidin-4-yl, lower haloalkyl, or di(lower alkyl)amino-lower alkyl;
  - (e)  $R^5$  is H, with the provisos that when X is OH,  $R^6$  is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F,  $R^5$  cannot be H;
    - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, or F;
- 15 (g) X is H, OH, OCH<sub>3</sub>, F, NH<sub>2</sub> or N<sub>3</sub>;
  - (h) Y is OH, NH<sub>2</sub>, OCH<sub>3</sub>, or OC(O)CH<sub>3</sub>;

A tenth aspect of the fifth embodiment is directed to a compound represented by formula I-10

# wherein

- 20 (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, methyl, phenyl, p-bromo-phenyl, p-chloro-phenyl, p-fluorophenyl;
  - (b) R<sup>2</sup> is hydrogen;
  - (c) R<sup>3a</sup> is H and R<sup>3b</sup> is H, CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, or lower cycloalkyl;

Docket No. 60137.0034WOU1

(d) R<sup>4</sup> is hydrogen, CH<sub>3</sub>, Et, <sup>i</sup>Pr, <sup>n</sup>Pr, <sup>n</sup>Bu, 2-butyl, <sup>t</sup>Bu, benzyl, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, N-methyl-aziridin-2-yl, N-methyl-azetidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-3-yl, N-methyl-pyrrolidin-4-yl, N-methyl-piperidin-4-yl, lower haloalkyl, or di(lower alkyl)amino-lower alkyl;

- 5 (e)  $R^5$  is H, with the provisos that when X is OH,  $R^6$  is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F,  $R^5$  cannot be H;
  - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, or F;
  - (g)  $X \text{ is H, OH, OCH}_3, F, NH_2 \text{ or } N_3;$
  - (h) Y is OH, NH<sub>2</sub>, OCH<sub>3</sub>, or OC(O)CH<sub>3</sub>.

The following tables contain numeric identifiers associated with various 10 substituent designators that should be viewed in light of the accompanying structure. These structures are contemplated species of the various aspects of the disclosed embodiments and are not intended to be limiting on full breadth of the contemplated compound represented by the structure of formula I. However, it is contemplated that any one of the exemplified nucleoside bases can be used in 15 combination with any one of contemplated species that specify a particular combination of R1, R2, R3a, R3b, R4, R5, R6, X, and Y. In each of the presented tables, the phosphoramidate substituent containing the substituents R<sup>3a</sup> and R<sup>3b</sup> are depicted without reference to stereochemical structure (cf. structures I-1, I-3, I-5, I-7, and I-9 above). It is contemplated that the compounds recited below 20 embody compounds in which R3a projects toward the viewer while R3b projects away from the viewer (cf. structures I-2, I-4, I-6, I-8, and I-10). Moreover, it is contemplated that the compounds recited below also embody compounds in which R<sup>3a</sup> projects away from the viewer while R<sup>3b</sup> projects towards the viewer. Not meant to be limiting, however, it is contemplated that preferred compounds 25 are those in which R<sup>3a</sup> projects towards the viewer and R<sup>3b</sup> projects away from the viewer such that the natural L-amino acid (S)-configuration is presented. Additionally, the inventors recognize that the phosphorus atom of the phosphoramidate moiety is another source of chirality. Although the structures below do not specifically depict chirality at phosphorus, the inventors recognize 30 that stereochemical configurations are possible such that in a staggered (or zig-

2983472-1 - 99 -

Docket No. 60137.0034WOU1

5

zag) line structure the oxo-substitutent projects towards the viewer while the OR¹ substitutent projects away from the viewer, and vice versa, i.e., where the Cahn-Ingold-Prelog stereochemical designation of phosphorous is either R or S. Therefore, the structures below include all possible stereochemical configurations possible for phosphorus.

II

Table	II-1.									_ 7	- 8	70
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R۶	$R^6$	X	Y	R'	R°	R′
II-1-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	H	$NH_2$
II-1-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	H	$NH_2$
II-1-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
II-1-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$CH_3$	H	CH <sub>3</sub>	OH	ОН	Н	Н	$NH_2$
II-1-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н	$NH_2$
II-1-6	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	H	$NH_2$
	CH <sub>3</sub>			CH₂CH₂SCH₃								$NH_2$
II-1-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

10	Table l			2-	21.	- 4	-5	<del></del>	77	3.7	<del>D</del> 7	D8	D9
	№	$R^{I}$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>30</sup>	R	R	R <sup>6</sup>	X	Y	K	K	К
	II-2-1	Et	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	H	H	$NH_2$
	II-2-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	H	$NH_2$
	II-2-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н	$NH_2$
	II-2-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	H	$CH_3$	ОН	OH	H	H	$NH_2$
	II-2-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$\text{CH}_3$	ОН	OH	H	Н	$NH_2$
	II-2-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$CH_3$	OH	OH	H	Н	$NH_2$

2983472-1

- 100 -

WO 2008/121634

Docket No. 6013	87.0034WOU1
-----------------	-------------

<u>№</u>	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>36</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
II-2-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
II-2-8	Et	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table 1							,				- 0	
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°	R <sup>3</sup>
II-3-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
II-3-2	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н	$NH_2$
11-3-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	OH	ОН	H	Н	$NH_2$
11-3-4	$^{i}$ Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н	$NH_2$
II-3-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	OH	ОН	H	Н	$NH_2$
11-3-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н	$NH_2$
II-3-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH₂CH₂SCH₃	$CH_3$	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н	$NH_2$
II-3-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

1-4.									7	_ 8	- 0
$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R۶	R°	X	Y	R'	R°	R'
<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Η	Н	$NH_2$
<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	H	$NH_2$
<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	Н	$CH_3$	ОН	OH	H	Н	$NH_2$
<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	H	$NH_2$
<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н	$NH_2$
<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
	'Bu 'Bu 'Bu 'Bu 'Bu 'Bu 'Bu 'Bu 'Bu	R¹ R²  'Bu H  'Bu H	R¹ R² R³a  ¹Bu H H  ¹Bu H H	R¹         R²         R³a         R³b           'Bu         H         H         H           'Bu         H         H         CH3           'Bu         H         H         CH(CH3)2           'Bu         H         H         CH2CH(CH3)2           'Bu         H         H         CH2Ph           'Bu         H         H         CH2-indol-3-yl           'Bu         H         H         CH2CH2SCH3	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴           'Bu         H         H         H         CH₃           'Bu         H         H         CH₃         CH₃           'Bu         H         H         CH(CH₃)₂         CH₃           'Bu         H         H         CH₂CH(CH₃)₂         CH₃           'Bu         H         H         CH₂Ph         CH₃           'Bu         H         H         CH₂-indol-3-yl         CH₃           'Bu         H         H         CH₂-CH₂SCH₃         CH₃	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴         R⁵           ¹Bu         H         H         H         CH₃         H           ¹Bu         H         H         CH₃         CH₃         H           ¹Bu         H         H         CH(CH₃)₂         CH₃         H           ¹Bu         H         H         CH₂CH(CH₃)₂         CH₃         H           ¹Bu         H         H         CH₂Ph         CH₃         H           ¹Bu         H         H         CH₂-indol-3-yl         CH₃         H           ¹Bu         H         H         CH₂-CH₂SCH₃         CH₃         H	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴         R⁵         R⁶           ¹Bu         H         H         H         CH₃         H         CH₃           ¹Bu         H         H         CH(CH₃)₂         CH₃         H         CH₃           ¹Bu         H         H         CH₂CH(CH₃)₂         CH₃         H         CH₃           ¹Bu         H         H         CH₂Ph         CH₃         H         CH₃           ¹Bu         H         H         CH₂-indol-3-yl         CH₃         H         CH₃           ¹Bu         H         H         CH₂-cH₂CH₂CH₃         CH₃         H         CH₃	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴         R⁵         R⁶         X           'Bu         H         H         H         CH₃         H         CH₃         OH           'Bu         H         H         CH(CH₃)₂         CH₃         H         CH₃         OH           'Bu         H         H         CH₂CH(CH₃)₂         CH₃         H         CH₃         OH           'Bu         H         H         CH₂Ph         CH₃         H         CH₃         OH           'Bu         H         H         CH₂-indol-3-yl         CH₃         H         CH₃         OH           'Bu         H         H         CH₂-CH₂CH₂SCH₃         CH₃         H         CH₃         OH	R¹         R²         R³a         R³bu         R⁴         R⁵         R6         X         Y           ¹Bu         H         H         H         CH₃         H         CH₃         OH         OH           ¹Bu         H         H         CH(CH₃)₂         CH₃         H         CH₃         OH         OH           ¹Bu         H         H         CH₂CH(CH₃)₂         CH₃         H         CH₃         OH         OH           ¹Bu         H         H         CH₂Ph         CH₃         H         CH₃         OH         OH           ¹Bu         H         H         CH₂-indol-3-yl         CH₃         H         CH₃         OH         OH           ¹Bu         H         H         CH₂-cH₂CH₂SCH₃         CH₃         H         CH₃         OH         OH	R¹         R²         R³a         R³bu         R⁴         R⁵         R6         X         Y         R²           ¹Bu         H         H         H         CH₃         H         CH₃         OH         OH         H           ¹Bu         H         H         CH(CH₃)₂         CH₃         H         CH₃         OH         OH         H           ¹Bu         H         H         CH₂CH(CH₃)₂         CH₃         H         CH₃         OH         OH         H           ¹Bu         H         H         CH₂Ph         CH₃         H         CH₃         OH         OH         H           ¹Bu         H         H         CH₂-indol-3-yl         CH₃         H         CH₃         OH         OH         H           ¹Bu         H         H         CH₂-cH₂CH₂SCH₃         CH₃         H         CH₃         OH         OH         OH         H	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴         R⁵         R6         X         Y         R²         R²           ¹Bu         H         H         H         CH₃         H         CH₃         OH         OH         H         H           ¹Bu         H         H         CH(CH₃)₂         CH₃         H         CH₃         OH         OH         H         H           ¹Bu         H         H         CH₂CH(CH₃)₂         CH₃         H         CH₃         OH         OH         H         H           ¹Bu         H         H         CH₂-Indol-3-yl         CH₃         H         CH₃         OH         OH         H         H           ¹Bu         H         H         CH₂-Indol-3-yl         CH₃         H         CH₃         OH         OH         H         H           ¹Bu         H         H         CH₂-CH₂SCH₃         CH₃         H         CH₃         OH         OH         H         H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table 1	(I-5.											
No	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R5	$R^6$	X	Y	R'	R°	R <sup>3</sup>
II-5-1	Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
II-5-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$\text{CH}_3$	Н	$CH_3$	OH	ОН	H	Н	$NH_2$
II-5-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
II-5-4	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н	$NH_2$
II-5-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
II-5-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
II-5-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	OH	ОН	Н	Н	$NH_2$

Docket No. 60137.0034WOU1

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$\mathbb{R}^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
11-5-8	Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table II-6.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>		R <sup>6</sup>					R <sup>9</sup>
II-	p-Me-	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
6-1	Ph											
II-	p-Me-	H	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	OH	Н	H	NH <sub>2</sub>
6-2	Ph											
II-	p-Me-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
6-3	Ph								011			) II I
II-	p-Me-	Н	H	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	H	NH <sub>2</sub>
6-4	Ph				~**	**	OI I	OH	OII	TT	TT	NILL
II-	p-Me- Ph	H	Н	CH₂Ph	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	П	INIT2
6-5				CTY 1 1 1 2	CII	τY	CH	OII	OLI	Ц	Н	NILI.
II-	p-Me- Ph	Н	H	CH <sub>2</sub> -indol-3-	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	UH	ОП	П	п	NH <sub>2</sub>
6-6			7.7	yl CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CII	T.Y	CH	ОĦ	ОH	н	н	NH <sub>2</sub>
II-	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	П	СП3	On	OII	11	11	11112
6-7		4		*	CH	Ц	CH <sub>3</sub>	UП	ОH	н	Н	NH <sub>2</sub>
II-	p-Me- Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	П	СП3	On	OH	11	11	14112
6-8	1 11								1 .			

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tat	le	11.	-/	•

14010	11 / •		- 30	- 3h	D4	D.5	R <sup>6</sup>	v	V	$\mathbf{p}^7$	D8	<b>D</b> 9
$N_{\underline{0}}$	$R^1$	R²	R	R <sup>30</sup>	K.	K	K	Λ	ľ	K	K	IX.
					CII	TY	OII	OII	OII	TT	П	NILI
II-7-	p-F-	Η	Н	Н	$CH_3$	Н	CH <sub>3</sub>	OH	UП	П	П	11112
	Ph											
1	1 11											
	_		**	CIT	OII	ΤT	CH <sub>3</sub>	ΛU	ОH	Ц	н	NH.
II-7 <b>-</b>	p-F-	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	П	СП3	OH	OH	11	11	14112
2	Ph											
2												
** =	r	TT	TT	$CH(CH_3)_2$	CH.	Н	$CH_2$	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
11-/-	р-г-	П	П	CH(CH3)2	C1 13	11	C113	OII	011			- 12
3	Ph											
3												
TT 7	n E	Ц	н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_2$	Н	$CH_3$	OH	OH	Η	Η	$NH_2$
11-/-	-	11	11	C112C11(C113)2	<b>C11</b> 3		5					-
4	Ph											
11.7.	n-F-	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Η	$CH_3$	OH	OH	H	Н	$NH_2$
11-/-					,							
6	Ph											
•												

R<sup>9</sup> R<sup>8</sup>  $R^2$   $R^{3a}$   $R^{3b}$  $R^7$  $R^5$   $R^6$  $R^1$ NH<sub>2</sub> OH ОН Н Н CH<sub>3</sub> CH<sub>3</sub> H CH<sub>2</sub>-indol-3-II-7p-F-Н Н Ph yl CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub> CH<sub>3</sub> H CH<sub>3</sub> OH OH H  $NH_2$ II-7p-F-Н Η Ph 8 CH<sub>3</sub> H CH<sub>3</sub> OH OH H H  $NH_2$ II-7p-F-Η Ph 20

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	e II-8.							_				
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
II-	p-Cl-	Н	Н	H	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	OH	Н	Н	$NH_2$
8-1	Ph											
II-	p-Cl-	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
8-2	Ph											
II-	p-Cl-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
8-3	Ph											
II-	p-Cl-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
8-4	Ph											
II-	p-Cl-	Н	Н	CH₂Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
8-5	Ph											
II-	p-Cl-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	$CH_3$	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
8-6	Ph			yl								
II-	p-Cl-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н	$NH_2$
8-7	Ph											
II-	p-Cl-	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
8-8	Ph											

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	Table II-9.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$ $R^9$												
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R3	Rº	X	Y	R'	R°	R'	
	p-Br- Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>	
II-9- 2	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>	
II-9- 3	p-Br- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>	

Docket No. 60137.0034WOU1

No	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
II-9-	-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
4	Ph											
II <b>-</b> 9-	-	Н	H	CH <sub>2</sub> Ph	CH <sub>3</sub>	Н	$CH_3$	OH	ОН	H	H	NH <sub>2</sub>
6	Ph											277
II-9-	-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
7	Ph			yl			~~~		OII	**	T Y	NITT
II-9 <b>-</b>		Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
8	Ph				~**		OI I	OII	OH		т т	NILI
11-9-	p-Br- Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	н	INFI <sub>2</sub>
20	LII											

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	Table II-10.  No R <sup>1</sup> $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$ $R^9$												
N₂	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>				R°	R' 	
II-	p-I-	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	OH	ОН	Н	Н	$NH_2$	
10-1	Ph												
II-	p-I-	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	H	Н	$NH_2$	
10-2	Ph												
II-	p-I-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$	
10-3	Ph												
II-	p-I-	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	$NH_2$	
10-4	Ph												
II-	p-I-	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	$NH_2$	
10-5	Ph												
II-	p-I-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	$CH_3$	H	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	H	$NH_2$	
10-6	Ph			yl									
II-	p-I-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	H	$NH_2$	
10-7	Ph												
II-	p-I-	*	Н	*	$CH_3$	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	$NH_2$	
10-8	Ph												

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table II	-11.											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°	R <sup>9</sup>
II-11-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
II-11-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н	$NH_2$

2983472-1

PCT/US2008/058183

<u>№</u>	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
II-11-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
II-11-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н	$NH_2$
II-11-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	H	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
II-11-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$\mathbf{H}_{\mathbf{x}}$	$CH_3$	ОН	OH	H	Н	$NH_2$
II-11-7	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
II-11-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table II-12

Table II		$\mathbf{p}^2$	D3a	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	$\mathbf{R}^{5}$	R <sup>6</sup>	X	Y	$\mathbb{R}^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
№	K	K	ĸ	K								
II-12-1	Et	Н	Н	Н	Et	H	CH <sub>3</sub>	OH	OH	H	Н	$NH_2$
II-12-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	H	$NH_2$
II-12-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
II-12-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	OH	OH	H	Н	$NH_2$
II-12-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н	$NH_2$
II-12-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
II-12-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
II-12-8	Et	*	Н	*	Et	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table II-13.

No No		$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
II-13-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
II-13-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	H	Н	$NH_2$
II-13-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
II-13-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н	$NH_2$
II-13-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	$CH_3$	OH	OH	H	Н	$NH_2$
II-13-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н	$NH_2$
II-13-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н	$NH_2$
II-13-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Et	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>36</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table II	-14.								.,			
№	$R^1$	$R^2$	R	$R^{3b}$	$R^4$	$R^5$	$R^6$	X	Y	R'	R°	R
			3a									
II-14-1	'Bu	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	OH	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
II-14-2	'Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$

Docket No. 60137.0034W0	OU1
-------------------------	-----

№	R¹	R <sup>2</sup>	R	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
			3a									
II-14-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
II-14-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
II-14-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
II-14-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
II-14-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
II-14-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	H	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table II	Table II-15.  No R <sup>1</sup> R <sup>2</sup> R <sup>3a</sup> R <sup>3b</sup> R <sup>4</sup> R <sup>5</sup> R <sup>6</sup> X Y R <sup>7</sup> R <sup>8</sup> R <sup>9</sup>												
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R۶	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°	R'	
II-15-1	Ph	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	OH	ОН	Н	H	$NH_2$	
II-15-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	OH	OH	H	Н	$NH_2$	
II-15-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	$NH_2$	
II-15-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	$NH_2$	
II-15-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	$NH_2$	
II-15-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н	$NH_2$	
II-15-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$	
II-15-8	Ph	*	Н	*	Et	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	Table II-16.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$ $R^9$												
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	R°	X	Y	R'	R°	R'	
II-	p-Me-	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	Н	$NH_2$	
16-1	Ph												
II-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$	
16-2	Ph												
II-	p-Me-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$	
16-3	Ph												
II-	p-Me-	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$	
16-4	Ph												
II-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н	$NH_2$	
16-5	Ph												
II-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	Et	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н	$NH_2$	
16-6	Ph			yl									
II-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	CH <sub>3</sub>	OH	ОН	Н	Н	$NH_2$	
	Ph												

Docket No. 60137.0034WOU1

<u>№</u>	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
16-7												
	p-Me-	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
16-8	Ph											

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table II-17.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$ $R^9$												
No	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R⁴		$R^6$					
II-17-	p-F-	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	OH	Н	Н	$NH_2$
1	Ph											
II-17-	p-F-	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	CH <sub>3</sub>	OH	ОН	Н	Н	$NH_2$
2	Ph											
II-17-	p-F-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
3	Ph											
II-17-	n-F-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
4	Ph			2 ( -/-								
т II-17-	n_F_	н	н	CH₂Ph	Et	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
5	Ph	,,,	••	C1121 II			,					
•		7.7	T T	CH <sub>2</sub> -indol-3-	E+	П	CH.	OH	OH	Н	Н	NH₂
	p-F- Ph	Н	н		Ľt	11	C113	OII	OII	11	•	1 1112
6	FII			yl								> H Y
II-17-	p-F-	Н	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
7	Ph											
II-17-	p-F-	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
8	Ph											

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table II-18.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$ $R^9$												
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$\mathbf{R}^{7}$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
II-	p-Cl-	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	OH	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
18-1	Ph											
II-	p-Cl-	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н	$NH_2$
18-2	Ph											
II-	p-Cl-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н	$NH_2$
18-3	Ph											
II-	p-Cl-	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
18-4	Ph											
II-	p-Cl- Ph	Н	Н	CH₂Ph	Et	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

2983472-1

PCT/US2008/058183

<b>№</b>	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
18-5												
II-	p-Cl-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	Et	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н	$NH_2$
18-6	Ph			yl								
II-	p-Cl-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	H	$CH_3$	OH	OH	H	Н	$NH_2$
18-7	Ph											
II-	p-Cl-	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
18-8	Ph											

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	Table II-19.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$ $R^9$													
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°	R <sup>9</sup>		
II-	p-Br-	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	H	Н	$NH_2$		
19-1	Ph													
II-	p-Br-	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	$NH_2$		
19-2	Ph													
II-	p-Br-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$		
19-3	Ph													
II-	p-Br-	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н	$NH_2$		
19-4	Ph													
II-	p-Br-	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н	$NH_2$		
19-5	Ph													
II-	p-Br-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	Et	H	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н	$NH_2$		
19-6	Ph			yl										
II-	p-Br-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$		
19-7	Ph													
II-	p-Br-	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$		
19-8	Ph													

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table I	I-20.											
No	R¹	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
II-20- 1	p-I- Ph	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
II-20- 2	p-I- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	CH <sub>3</sub>	OH	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
11-20-	p-I- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	CH <sub>3</sub>	OH	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

№	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
3												
II-20-	-	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	H	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
4	Ph				_		CT.	OII	OII	**	* *	NITT
	p-I- Ph	Н	Н	CH₂Ph	Et	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	н	INH <sub>2</sub>
5				CYY ! 1.1.0	Ε.	* *	OI I	ΟΠ	OII	ш	п	NILI
	p-I- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	Et	н	CH <sub>3</sub>	OH	ОП	п	п	11112
6		T.Y	T Y	yl	174	11	CH	ΟĽ	ОĦ	ц	П	NH.
II-20-	p-1- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	El	п	CI13	OH	OH	11	11	11112
7		*	Н	*	Ft	Н	СНа	ОН	ОН	н	н	NH <sub>2</sub>
II-20- 8	p-1- Ph	٠	п	·	υl	11	CH	011	OII	**	••	1.112

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table II	-21.											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
II-21-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	OH	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
II-21-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	H	Н	$NH_2$
II-21-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	OH	ОН	H	H	$NH_2$
II-21-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
II-21-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
II-21-6	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
II_21_7	CH <sub>2</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	H	$NH_2$

II-21-8 CH<sub>3</sub> \* H \* Pr H CH<sub>3</sub> OH OH H NH<sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table II	-22.											
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°	R <sup>9</sup>
II-22-1	Et	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
II-22-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	OH	H	Н	$NH_2$
II-22-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
II-22-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	$CH_3$	ОН	OH	H	Н	$NH_2$
11-22-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н	$NH_2$
II-22-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
II-22-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
II-22-8	Et	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>36</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table II	<b>-23</b> .											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	$R^5$	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
II-23-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	OH	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
II-23-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
II-23-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н	$NH_2$
II-23-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	H	$NH_2$
II-23-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
II-23-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	H	$NH_2$
II-23-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$

II-23-8 <sup>i</sup>Pr \* H \* <sup>i</sup>Pr H CH<sub>3</sub> OH OH H H NH<sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table II	-24.											
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	R'	R <sup>8</sup>	R
II-24-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
II-24-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	H	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н	$NH_2$
II-24-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н	$NH_2$
II-24-4	'Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$^{i}$ Pr	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
II-24-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
II-24-6	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н	$NH_2$
II-24-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
II-24-8	'Bu	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>5 \*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table II	Table II-25.														
Nº	$\mathbb{R}^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>	R			
II-25-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>			
II-25-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$			
II-25-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$			
II-25-4	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$			
II-25-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$			
II-25-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$			
II-25-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2 \\$			
11-25-8	Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$			

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	II-26.											
N₂	R¹	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	R'	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
II-	p-Me- Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
<b>26-1</b>												
II-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	H	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
26-2	Ph											
II-	p-Me-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н	$NH_2$
26-3	Ph											
II-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
26-4	Ph											
II-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
26-5	Ph											
II-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
26-6	Ph			yl								
II-	p-Me-	Н	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
26-7	Ph			2 2 0								
	M.	*	TT	*	i <b>D</b> ⊷	Н	CH.	OH	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
II-	p-Me- Ph	*	Н	•	П	п	C1 13	OH	OII	11	11	1 4117
26-8	LII											

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table I	I-27.											
Nº	$R^1$	$\mathbb{R}^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
II-27- 1	p-F- Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
II-27- 2	p <del>-</del> F- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	OH	H	Н	NH <sub>2</sub>
II-27- 3	p-F- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
II-27- 4	p-F- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	'Pr	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
II-27- 5	p-F- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
II-27- 6	p-F- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
II-27- 7	p-F- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

Docket No. 60137.0034WOU1

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
II-27-	p-F-	*	Н	*	'Pr	Н	CH <sub>3</sub>	OH	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
8	Ph											

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	II-28.											
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R*	R <sup>9</sup>
II-	p-Cl-	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
28-1	Ph											
II-	p-Cl-	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	H	$CH_3$	OH	OH	H	Н	$NH_2$
28-2	Ph											
II-	p-Cl-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	H	$CH_3$	ОН	OH	H	H	$NH_2$
28-3	Ph											
II-	p-Cl-	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	OH	OH	H	Н	$NH_2$
28-4	Ph											
II-	p-Cl-	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
28-5	Ph											
II-	p-Cl-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	H	$NH_2$
28-6	Ph			yl								
II-	p-Cl-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	OH	OH	H	Η	$NH_2$
<b>28-</b> 7	Ph											
II-	p-Cl-	*	Н	*	'Pr	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
28-8	Ph											

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table												
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
II-	p-Br-	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
29-1	Ph											
II-	p-Br-	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	H	$CH_3$	OH	OH	H	Н	$NH_2$
29-2	Ph											
II-	p-Br-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	H	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
29-3	Ph											
II-	p-Br-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н	$NH_2$
29-4	Ph											
II-	p-Br-	Н	Н	CH₂Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н	$NH_2$
29-5	Ph											

PCT/US2008/058183

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
II-	1	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
29-6				yl								
		Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
29-7	Ph											
	r	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	OH	H	Н	$NH_2$
29-8	Ph											

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table I	I-30.											
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>		R <sup>6</sup>		Y			R <sup>3</sup>
II-30-	p-I-	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
1	Ph											
11-30-	p-I-	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
2	Ph											
II-30-	p-I-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
3	Ph											
II-30-	p-I-	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
4	Ph											
II-30-	p-I-	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	OH	OH	H	H	$NH_2$
5	Ph											
II-30-	p-I-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н	$NH_2$
6	Ph			yl								
11-30-	p-I-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н	$NH_2$
7	Ph											
II-30-	p-I-	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	OH	ОН	Н	Н	$NH_2$
8	Ph											

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table I	I-31.									a		
N₂	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>*</sup>	R <sup>9</sup>
II-31-	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
1												
II-31-	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
2												
II-31-	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	OH	Н	Н	$NH_2$
3												

WO 2008/121634 Docket No. 60137.0034WOU1

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
II-31-	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
4												
II-31-	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
5												
II-31-	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
6				yl								
II-31-	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
7												
II-31-	$CH_3$	*	Н	*	"Bu	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н	$NH_2$
8												

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table II										-		
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°	R <sup>9</sup>
II-32-1	Et	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
II-32-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н	$NH_2$
II-32-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н	$NH_2$
II-32-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н	$NH_2$
II-32-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н	$NH_2$
II-32-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
II-32-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
II-32-8	Et	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

	Table II											- 0	
-	№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°	R <sup>9</sup>
-	II-33-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	OH	Н	H	$NH_2$
	II-33-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н	$NH_2$
	II-33-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
	II-33-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
	II-33-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH₂Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
	II-33-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н	$NH_2$
	II-33-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
	II-33-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>5 \*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

WO 2008/121634 Docket No. 60137.0034WOU1

Table II	<b>-</b> 34.											
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$\mathbf{R}'$	R <sup>8</sup>	R
II-34-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
II-34-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н	$NH_2$
II-34-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н	$NH_2$
II-34-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	OH	ОН	Н	Η	$NH_2$
II-34-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н	$NH_2$
II-34-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	$\mathrm{CH}_3$	OH	ОН	Н	Н	$NH_2$
II-34-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
II-34-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table II												
Nº	$R^1$	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R5	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°	R
II-35-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
11-35-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<i>n</i> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
II-35-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
II-35-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
II-35-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
II-35-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	$\text{CH}_3$	OH	ОН	Н	Н	$NH_2$
II-35-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
II-35-8	Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	$R^5$	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R
I-	p-	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH
36-1	Me- Ph											
I-	p-	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	H	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
36-2	Me- Ph											
II-	p-	Н	H	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
36-3	Me- Ph				<b>v</b> _		~		011		**	) III I
I-	p-	Н	H	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	OH	Н	Н	NH;
36-4	Me- Ph											
II-	p-	Н	Н	CH₂Ph	"Bu	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
36-5	Me- Ph											
II-	p-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	"Bu	Η	$CH_3$	OH	OH	Η	Н	NH:

Docket No. 60137.0034WOU1

№	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
36-6	Me- Ph			yl								
II-	p-	H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
36-7	Me- Ph											
II-	p-	*	Н	*	"Bu	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
36-8	Me- Ph											

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	II-37.									<u>-</u> -		
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
II-	p-F-	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	OH	Н	Н	$NH_2$
37-1	Ph											
II-	p-F-	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	H	$CH_3$	OH	OH	H	Н	$NH_2$
37-2	Ph											
II-	p-F-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н	$NH_2$
37-3	Ph											
II-	p-F-	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н	$NH_2$
37-4	Ph											
II-	p-F-	Н	Н	CH₂Ph	"Bu	Н	$CH_3$	ОН	ОН	H	Н	$NH_2$
37-5	Ph											
II-	p-F-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	"Bu	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н	$NH_2$
37-6	Ph			yl								
II-	p-F-	H	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	ОН	ОН	H	Н	$NH_2$
37-7	Ph											
II-	p-F-	*	Н	*	"Bu	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
37-8	Ph											

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table												
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>	R
II-	p-Cl-	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
38-1	Ph											
II-	p-Cl-	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
38-2	Ph											
II-	p-Cl-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
38-3	Ph											

PCT/US2008/058183

Docket No. 60137.0034WOU1

No	R¹	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
II-	1	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	OH	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
38-4	Ph											
	-	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
38-5												
		Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
20 0	Ph			yl								
II-	•	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
38-7	Ph											
II-	p-Cl-	*	Н	*	"Bu	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н	$NH_2$
38-8	Ph											

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table II-39

	11-39.	$\mathbf{p}^2$	R <sup>3a</sup>	D3b	R <sup>4</sup>	<b>P</b> <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	Y	V	$\mathbf{R}^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
№												
II-	p-Br-	Н	Н	Н	"Bu	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	H	$NH_2$
39-1	Ph											
II-	p-Br-	Η	Н	CH <sub>3</sub>	<i>"</i> Bu	Н	$CH_3$	OH	OH	H	H	$NH_2$
39-2	Ph											
II-	p-Br-	Η	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	H	$CH_3$	OH	OH	H	Η	$NH_2$
39-3	Ph											
II-	p-Br-	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
39-4	Ph											
II-	p-Br-	Η	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	$CH_3$	OH	OH	Η	Η	$NH_2$
39-5	Ph											
II-	p-Br-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Η	Н	$NH_2$
39-6	Ph			yl								
II-	p-Br-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
39-7	Ph											
II-	p-Br-	*	Н	*	"Bu	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Η	$NH_2$
39-8	Ph											

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

 Table II-40.

 №
  $R^1$   $R^2$   $R^{3a}$   $R^{3b}$   $R^4$   $R^5$   $R^6$  X Y  $R^7$   $R^8$   $R^9$  

 II p-I H

WO 2008/121634 Docket No. 60137.0034WOU1

№	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
II- 40-2	p-I- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	OH	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
II-	p-I- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
40-3 II-	p-I-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
40-4 II-	Ph p-I-	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
40-5 II-	Ph p-I-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
40-6	Ph	Н	Н	yl CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	CH₃	ОН	ОН	Н	Н	$\mathrm{NH}_2$
II- 40-7	p-I- Ph											_
II- 40-8	p-I- Ph	*	Н	*	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

No No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
II-41-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
II-41-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	ОН	OH	H	Н	$NH_2$
II-41-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	OH	OH	H	H	$NH_2$
II-41-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	H	$CH_3$	OH	ОН	Ή	H	$NH_2$
II-41-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	H	$NH_2$
II-41-6	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
II-41-7	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н	$NH_2$
II-41-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	Bz	Н	$CH_3$	ОН	OH	H	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table II-42

	Table II										_ 7	_ 2	<del>-</del> 0
•	№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°	R'
٠	II-42-1	Et	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	OH	Н	Н	$NH_2$
	II-42-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	ОН	OH	H	Н	$NH_2$
	II-42-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	OH	ОН	H	H	$NH_2$
	II-42-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	H	$\text{CH}_3$	OH	ОН	H	Н	$NH_2$
	II-42-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	H	Н	$NH_2$
	II-42-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	H	$NH_2$

WO 2008/121634

Docket No. 60137.0034WOU1

Nº	$\mathbb{R}^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
II-42-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
II-42-8	Et	*	Н	*	Bz	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

<b>1</b>	1	TT	40
Tab	10	11.	_4 4
1 au	v	TT.	7,7

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
II-43-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
II-43-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
II-43-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	· OH	OH	Н	Н	$NH_2$
II-43-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н	$NH_2$
II-43-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н	$NH_2$
II-43-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
II-43-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
II-43-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table II-44

No		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
II-44-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
II-44-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	OH	OH	H	Н	$NH_2$
II-44-3	<sup>t</sup> Bu	Ή	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н	$NH_2$
II-44-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
II-44-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
II-44-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
II-44-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н	$NH_2$
II-44-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$

 $<sup>^{*}</sup>$ R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table II-45.

rable II										7	9	_ 0
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R⁴	R <sup>3</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°	R <sup>2</sup>
II-45-1	Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
II-45-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н	$NH_2$
II-45-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н	$NH_2$
II-45-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
II-45-5	Ph	Н	Н	CH₂Ph	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
II-45-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
II-45-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$

№	R¹	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
II-45-8	Ph	*	Н	*	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

\*R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	II-46.											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	R'	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
II-	p-Me-	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
46-1	Ph											
II-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
46-2	Ph											
II-	•	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	OH	ОН	Н	Н	$NH_2$
46-3	Ph											
II-		Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
46-4	Ph											
II-		Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
46-5	Ph											
II-	p-Me-	Η	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	OH	Н	Η	$NH_2$
46-6	Ph			yl								
II-	p-Me-	Η	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н	$NH_2$
46-7	Ph											
II-	p-Me-	*	Н	*	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
46-8	Ph											

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table l	[I-47.									_ 7	_ 0	
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°	R'
II-47-	p-F-	Н	Н	H	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	H	H	$NH_2$
1	Ph											
II-47-	p-F-	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
. 2	Ph											
II-47-	p-F-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
3	Ph											
II-47-	p-F-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
4	Ph											
•	n-F-	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$
5	Ph			~~- <u>/</u>	~2		. 3					_
•	. F	LT	Ľ	CH <sub>2</sub> -indol-3-	D <sub>7</sub>	н	CH.	ОН	OH	Н	Н	NΗ
11-47-	p-r- Ph	П	ц	CH2-111001-3-	DΖ	11	C1 13	011	OII	11	11	1112

Docket No. 60137.0034WOU1

No	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
6				yl								
II-47-	-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
′	p-F-	*	Н	*	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
8	Ph											

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	II-48.						,				_ 0	_ 0
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°	R <sup>9</sup>
II-	p-Cl-	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
48-1	Ph											
II-	p-Cl-	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	H	Н	NH <sub>2</sub>
48-2	Ph											
II-	-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н	$NH_2$
48-3	Ph											
II-		Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
48-4	Ph											
II-	-	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н	$NH_2$
48-5	Ph											
II-	p-Cl-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	Bz	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	$NH_2$
48-6	Ph			yl								
II-	p-Cl-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	OH	H	Н	NH <sub>2</sub>
48-7	Ph											
II-	p-Cl-	*	Н	*	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
48-8	Ph											

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	II-49.											
No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
II- 49-1	p-Br- Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
II- 49-2	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
II- 49-3	p-Br- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
II-	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
49-4												
II- 49-5	-	Н	Н	CH₂Ph	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
II- 49-6	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
II- 49-7	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
II- 49-8	p-Br- Ph	*	Н	*	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table I	Table II-50.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$ $R^9$													
№	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$										
II-50-	),	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	OH	Н	Н	$NH_2$		
1	Ph													
II-50-	p-I-	Н	H	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н	$NH_2$		
2	Ph													
II-50-	p <b>-</b> I-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$		
3	Ph													
II-50-	p-I-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$		
4	Ph													
II-50-	p-I-	Н	Н	CH₂Ph	Bz	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н	$NH_2$		
5	Ph													
II-50-	p-I-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	OH	ОН	Н	Н	$NH_2$		
6	Ph			yl										
II-50-	p-I-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$		
7	Ph													
II-50-	p-I-	*	Н	*	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н	$NH_2$		
8	Ph													

\*R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$$R^{3a}$$
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{3b}$ 

Ш

Table I											- o	
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$\mathbb{R}^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	R'	R°	R <sup>9</sup>
III-1-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-1-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	H	$NH_2$
III-1-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-1-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-1-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$
III-1-6	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-1-7	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-1-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	H	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

5  $R^2$  and  $R^{3b}$  joined together by  $(CH_2)_3$  to form five-membered ring.

Table I										-	- 0	
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
III-2-1	Et	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-2-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH	H	Н	$NH_2$
III-2-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	H	Н	$NH_2$
III-2-4	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	H	H	$NH_2$
III-2-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	H	Н	$NH_2$
III-2-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH	H	Н	$NH_2$
III-2-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-2-8	Et	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table I	II <b>-</b> 3.											
Nº	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	$R^5$	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>	R
III-3-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-3-2	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$
III-3-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$
111-3-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH	H	H	$NH_2$
111-3-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH	Н	H	$NH_2$
III-3-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	H	$NH_2$
III-3-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Ή	$NH_2$
III-3-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH	H	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table I												
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
III-4-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-4-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н	$NH_2$
III-4-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$
III-4-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$
III-4-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
<b>III-4-6</b>	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-4-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-4-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table II	I-5.											
	№	$\mathbb{R}^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	$R^9$
	III-5-1	Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
	III-5-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$
	III-5-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
	III-5-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
	III-5-5	Ph	Н	Н	CH₂Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
	III-5-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
	III-5-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	H	$NH_2$
	<b>11I-5-8</b>	Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	III-6.										0	
№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>		Y			
III-	p-Me-	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н	$NH_2$
6-1	Ph											
III-	p-Me-	Н	H	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$
6-2	Ph											
III-	p-Me-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
6-3	Ph											
III-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
6-4	Ph											
III-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$
6-5	Ph											
III-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$
6-6	Ph			yl								
III-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH	Н	H	$NH_2$
6-7	Ph											
III-	p-Me-	*	Н	*	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$
6-8	Ph											

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table I	II-7.									- 4		
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R5	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°	R <sup>3</sup>
III-7-	p-F-	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н	$NH_2$
1	Ph											
III-7-	p-F-	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	H	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$
2	Ph											
III <b>-</b> 7-	p-F-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
3	Ph											
III-7-	p-F-	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$
4	Ph											
III-7-	p-F-	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	CH <sub>3</sub>	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
6	Ph											
III-7-	p-F-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	CH <sub>3</sub>	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
7	Ph			yl								
III-7-	n-F-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
8	Ph		••	22 33	-5		-					
_	Τ.	4	TT	*	Ch	ц	CH	E	OH	н	н	NH <sub>2</sub>
111-7-	p-F-	T	Н	-3-	СП3	Л	CH <sub>3</sub>	Τ.	<u> </u>	11	11	14112

Docket No. 60137.0034WOU1

<u>№</u>	$R^1$	$R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup> R <sup>6</sup>	X Y	$R^7$ $R^8$ $R^9$
20	Ph					

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	III-8.			•								
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°	R <sup>9</sup>
III-8- 1	p-Cl- Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-8- 2	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-8- 3	p-Cl- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
11I-8- 4	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-8- 5	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-8- 6	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-8- 7	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-8- 8	p-Cl- Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table l	Table III-9. $N_{2} = R^{1} = R^{2} = R^{3a} = R^{3b} = R^{4} = R^{5} = R^{6} = X = Y = R^{7} = R^{8} = R^{9}$											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
III-9- 1	p-Br- Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-9- 2	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-9- 3	p-Br- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-9- 4	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-9- 6	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-9-	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
	p-Br- Ph	Н	Н	yl CH₂CH₂SCH₃	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-9- 20	p-Br- Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table 1	Table III-10.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$ $R^9$											
No	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
III-	p-I-	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
10-1	Ph											
III-	p-I-	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
10-2	Ph											
III-	p-I-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$
10-3	Ph											
III-	p-I-	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$
10-4	Ph											
III-	p-I-	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
10-5	Ph											
III-	p-I-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
10-6	Ph			yl								
III-	p-I-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$
10-7	Ph											
III-	p-I-	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$
10-8	Ph											

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$T_{\alpha}$	hle	Ш	r_ 1	1	ŧ
111					Ł

rable III											- 0	
No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
III-11-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-11-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	H	$NH_2$
III-11-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$
III-11-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$
III-11-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-11-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-11-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

Docket No. 60137.0034WOU1

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
III-11-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

		~~~	- 4	•
Tabl	e	ш	- i	"

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
III-12-1	Et	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-12-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	H	Н	$NH_2$
III-12-3	Et	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$
III-12-4	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$\mathrm{NH}_2$
III-12-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	H	Н	$NH_2$
III-12-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	H	$NH_2$
III-12-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-12-8	Et	*	Н	*	Et		CH <sub>3</sub>				Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table III-13.

№	R¹	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
III-13-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-13-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	OH	Η	Н	$NH_2$
III-13-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Η	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-13-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$
III-13-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	H	$NH_2$
III-13-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-13-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-13-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$

<sup>5 \*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table III-14

Table II												
No	R <sup>1</sup>	$R^2$	R	$R^{3b}$	$R^4$	$R^5$	$R^6$	X	Y	R'	R°	R
			3a									
III-14-	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н	$NH_2$
1												
III-14-	tBu	Н	H	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
	Du			<b>3</b>								
2												
III-14-	'Bu	H	Η	$CH(CH_3)_2$	Et	H	$CH_3$	F	OH	H	H	$NH_2$
3												
III-14-	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>		$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
			3a									
4												
III-14-	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$
5												
III-14-	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$
6												
III-14-	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$
7												
III-14-	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
8												

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table III-15

Nº		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
III-15-1	Ph	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-15-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$
III-15-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$
III-15-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-15-5	Ph	Н	Н	CH₂Ph	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-15-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$
III-15-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-15-8	Ph	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table III-16.

Table 1.											- 0	0
№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R*	R <sup>9</sup>
III-	p-Me-	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
16-1	Ph											
III-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$
16-2	Ph											
III-	p-Me-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
16-3	Ph											
III-	p-Me-	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
16-4	Ph											
III-	p-Me-	Н	Н	$CH_2Ph$	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
16-5	Ph											

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
III-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
16-6	Ph			yl								
III-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
16-7	Ph											
III-	p-Me-	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
16-8	Ph											

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table II				21						_ 7	_ 8	- 0
№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>36</sup>	R <sup>4</sup>	R³	R <sup>6</sup>	Х				
III-17-	1	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	H	Н	NH <sub>2</sub>
1	Ph											
III-17-	p-F-	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	H	$\text{CH}_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$
2	Ph											
III-17-	p-F-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Η	Н	$NH_2$
3	Ph											
III-17-	p-F-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
4	Ph											
III-17-	p-F-	Н	Н	CH₂Ph	Et	Н	$CH_3$	F	OH	Н	$\mathbf{H}_{\mathbf{u}}$	$NH_2$
5	Ph											
III-17-	p-F-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
6	Ph			yl								
III-17-	p-F-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
7	Ph											
III-17-	p-F-	*	Н	*	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
8	Ph											

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table I												
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
III-18- 1	p-Cl- Ph	Н	Н	Н .	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-18- 2	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-18- <sub>.</sub>	p-Cl- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$\mathbb{R}^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
III-18- 4	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
111-18- 5	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-18- 6	p <b>-</b> Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-18- 7	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-18- 8	p-Cl- Ph	*	Н	*	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	III-	19
-------	------	----

No No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
III-19- 1	p-Br- Ph	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-19- 2	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-19- 3	p-Br- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-19- 4	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-19- 5	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-19- 6	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-19- 7	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-19- 8	p-Br- Ph	*	Н	*	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table III-20

I auto II											- 0	
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R۶	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°	R <sup>9</sup>
III-20-	* .	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
1	Ph											

<u>№</u>	R <sup>1</sup>	$\mathbb{R}^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
111-20- 2	p-I- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-20-	p-I- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
111-20- 4	p-I- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-20- 5	p-I- Ph	Н	Н	CH₂Ph	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-20- 6	p-I- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-20- 7	p-I- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-20- 8	p-I- Ph	*	Н	*	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

OC 1.	1 .	TTI	1	1	
Tab	ıe	ш	-2	1	

Table III											- 0	
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>s</sup>	R <sup>9</sup>
III-21-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	'Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	H	NH <sub>2</sub>
III-21-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$
III-21-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-21-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH	H	Н	$NH_2$
III-21-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-21-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-21-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	H	Н	$NH_2$
III-21-8	$CH_3$	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Η	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table III-22

Table III-22.  No. $R^1 R^2 R^{3a} R^{3b}$ $R^4 R^5 R^6 X Y R^7 R^8 R^9$													
Nº	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	
III-22-1	Et	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>	
III-22-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	H	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$	
III-22-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	$NH_2$	
III-22-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$	
III-22-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$	
III-22-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$	

WO 2008/121634 Docket No. 60137.0034WOU1

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
III-22-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-22-8	Et	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table III-23. $R^1 R^2 R^{3a} R^{3b}$ $R^4 R^5 R^6 X Y R^7 R^8 R^9$													
N₂	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>	R	
III-23-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>	
III-23-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$	
III-23-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$	
III-23-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$	
III-23-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$	
III-23-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$	
III-23-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$	
111-23-8	$^{i}\mathbf{Pr}$	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	$NH_2$	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table III-24. $ N_{9}  R^{1}  R^{2}  R^{3a}  R^{3b} \qquad \qquad R^{4}  R^{5}  R^{6}  X  Y  R^{7}  R^{8}  R^{9} $													
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°	R <sup>y</sup>	
III-24-1	'Bu	Н	Н	Н	'Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>	
III-24-2	<sup>t</sup> Bu	H	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	Н	$CH_3$	F	OH	Н	H	$NH_2$	
III-24-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$	
III-24-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$	
III-24-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$	
III-24-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$	
III-24-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$	
III-24-8	'Bu	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>	
	71												

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table III-25.  No $R^1 R^2 R^{3a} R^{3b}$ $R^4 R^5 R^6 X Y R^7 R^8 R^9$													
Nº	$\mathbb{R}^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$\mathbf{R}'$	R <sup>8</sup>	R	
III-25-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>	
III-25-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$	
III-25-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$	
III-25-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$	
III-25-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$	
III-25-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$	
III-25-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$	

№	R¹	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>								
III-25-8	Ph	*	Н	*	'Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table !	Table III-26.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$ $R^9$													
№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°	R³		
III-	p-Me-	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Η	Н	$NH_2$		
26-1	Ph													
III-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н	$NH_2$		
26-2	Ph													
III-	p-Me-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	H	$NH_2$		
26-3	Ph													
III-	p-Me-	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	H	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$		
26-4	Ph													
III-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	H	$NH_2$		
26-5	Ph													
III-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	<sup>i</sup> Pr	Η	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$		
26-6	Ph			yl										
III-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	H	$CH_3$	F	OH	Н	H	$NH_2$		
26-7	Ph													
III-	p-Me-	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH	Η	Η	$NH_2$		
26-8	Ph													

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table II	I-27.			2).		5				<b>5</b> 7	8	<del> </del>
№	$R^1$	$R^2$	R3a	R <sup>36</sup>			R <sup>6</sup>					
III-27- 1	p-F- Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-27-	p-F- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
2 III-27-	p-F-	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
3	Ph	ц	ŭ	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Dr	н	CH <sub>2</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
4	p-r- Ph	П	П	C112C11(C113)2	11	11	CII3	•	OH	**	**	1112
III-27- 5	p-F- Ph	Н	Н	CH₂Ph	'Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
_		Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

No	R¹	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
6				yl								
III-27- 7	p-F- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-27- 8	p-F- Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table II	[I-28.											
Nº	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	$R^9$
III-28- 1	p-Cl- Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-28- 2	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-28-	p-Cl- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-28- 4	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	'Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-28- 5	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-28- 6	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Η	Н	NH <sub>2</sub>
III-28- 7	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-28- 8	p-Cl- Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

			~~	
Ta	hl	e.	ш	[-29]

Table II												
№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
III-29- 1	p-Br- Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-29- 2	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-29- 3	p-Br- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-29-	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

№	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
4 III-29-	p-Br- Ph	Н	Н	CH₂Ph	'Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-29- 6	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-29- 7	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-29- 8	p-Br- Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	H	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table II	I-30.											
№	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	$R^5$	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
III-30- 1	p-I- Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-30- 2	p-I- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-30-	p-I- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-30- 4	p-I- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	'Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-30- 5	p-I- Ph	Н	Н	CH₂Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-30- 6	p-I <b>-</b> Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-30-	p-I- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-30- 8	p-I- Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table III												
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
III-31-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-31-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$
III-31-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

Docket No. 60137.0034WOU1

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
III-31-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-31-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-31-6	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-31-7	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-31-8	$CH_3$	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

_	. 1	•	-		_	$\sim$
1	ar	Ŋlε	•	ш	- 1	Z

Nº		$\mathbb{R}^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$\mathbb{R}^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
III-32-1	Et	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-32-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	H	$CH_3$	F	OH	H	Н	$NH_2$
III-32-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	OH	H	Н	$NH_2$
III-32-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-32-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$
III-32-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	H	$NH_2$
III-32-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-32-8	Et	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## Table III-33.

No No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
III-33-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-33-2	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	H	$CH_3$	F	OH	Н	H	$NH_2$
III-33-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	H	Н	$NH_2$
III-33-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	OH	H	Н	$NH_2$
III-33-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-33-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-33-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-33-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>5 \*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

WO 2008/121634 Docket No. 60137 0034WOU1

Docket	NO.	0013	7.0034	FWUC	١.

	NH <sub>2</sub>
III.34-1 <sup>t</sup> Ru H H H H <sup>n</sup> Ru H CH <sub>2</sub> F OH H H N	
111-34-1 Bu 11 11 11 Bu 11 51-5	3 TT T
III-34-2 <sup>t</sup> Bu H H CH <sub>3</sub> <sup>n</sup> Bu H CH <sub>3</sub> F OH H H N	$NH_2$
III-34-3 <sup>t</sup> Bu H H CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> <sup>n</sup> Bu H CH <sub>3</sub> F OH H H N	$NH_2$
III-34-4 <sup>t</sup> Bu H H CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> <sup>n</sup> Bu H CH <sub>3</sub> F OH H H N	$NH_2$
III-34-5 Bu H H CH <sub>2</sub> Ph Bu H CH <sub>3</sub> F OH H H N	$NH_2$
III-34-6 Bu H H CH <sub>2</sub> -indol-3-yl Bu H CH <sub>3</sub> F OH H H N	$NH_2$
III-34-7 Bu H H CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> Bu H CH <sub>3</sub> F OH H H N	$NH_2$
III-34-8 'Bu * H * "Bu H CH <sub>3</sub> F OH H H N	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table III									***			
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
III-35-1	Ph	Н	Н	Н	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-35-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-35-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-35-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-35-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-35-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-35-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-35-8	Ph	*	Н	*	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	$R^9$
III-	p-Me-	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
36-1	Ph											
III-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
36-2	Ph											
III-	p-Me-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
36-3	Ph											
III-	p-Me-	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
36-4	Ph											
III-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$
36-5	Ph											

2983472-1

36-5

III-

p-Me- H H  $CH_2$ -indol-3-  $^nBu$  H  $CH_3$  F OH H H  $NH_2$ 

5

Table III-36.

N₀	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
36-6				yl								
III-		Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
36-7	Ph											
	p-Me-	*	Н	*	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
36-8	Ph											

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$T_{2}$	ahl	ٔ ما	m	_3	7

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
III- 37-1	p-F- Ph	Н	Н	Н	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III- 37-2	p-F- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	H	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III- 37-3	p-F- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III- 37-4	p-F- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III- 37-5	p-F- Ph	Н	Н	CH₂Ph	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III- 37-6	p-F- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III- 37-7	p-F- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III- 37-8	p-F- Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table III-38.

1 4010 1												
N₂	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
III-	p-Cl-	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
38-1	Ph											
III-	p-Cl-	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Η	Н	$NH_2$
38-2	Ph											
III-	p-Cl-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
38-3	Ph											
III-	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

№	$\mathbb{R}^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
38-4					· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·							
III-	p-Cl-	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
38-5	Ph											
III-	p-Cl-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	<sup>n</sup> Bu	H	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
38-6	Ph			yl							•	
III-	p-Cl-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
38-7	Ph											
III-	p-Cl-	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
38-8	Ph											

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$T_{\alpha}$	ble	Ш	_39
	1115		- 17

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
III- 39-1	p-Br- Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III- 39-2	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III- 39-3	p-Br- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III- 39-4	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III- 39-5	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III- 39-6	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III- 39-7	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III- 39-8	p-Br- Ph	*	Н	*	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table III-40.

Nº	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
III-40- 1	-	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-40-	p-I- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
2						•						
III-40- 3	p-I- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-40- 4	p-I- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-40- 5	p-I- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-40- 6	p-I- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-40- 7	p-I- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-40- 8	p-I- Ph	*	Н	*	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tab.	le II	[-41

No	R <sup>I</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
III-41-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-41-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$
III-41-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-41-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-41-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-41-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$
III-41-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-41-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table III-42.

			_ 20	?L						_ 7	_ 0	_ 0
Nº	R,	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R30	R*	R <sup>3</sup>	R°	X	Y	R'	R°	R <sup>9</sup>
III-42-1	Et	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-42-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$
III-42-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Η	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-42-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-42-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-42-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-42-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
III-42-8	Et	*	Н	*	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table III-43.

№	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
III-43-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-43-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-43-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-43-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-43-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-43-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-43-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-43-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Bz	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table III-44.

№	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
III-44-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-44-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$\mathrm{NH}_2$
III-44-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-44-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-44-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-44-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-44-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-44-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

 $<sup>^{*}</sup>$ R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Ta	hl	<b>a</b> 1	(T	[_45	
1 7	1111			I <del>-4</del> .)	

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
III-45-1	Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-45-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$
III-45-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-45-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-45-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-45-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	H	Н	$NH_2$
III-45-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
III-45-8	Ph	*	Н	*	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table III-46.

Table.				21		-						
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
III-	p-Me-	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
46-1	Ph											
III-	1	H	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$
46-2	Ph											
III-	p-Me-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$
46-3	Ph											
III-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
46-4	Ph											
III-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
46-5	Ph											
III-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
46-6	Ph			yl								
III-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
46-7	Ph											
III-	p-Me-	*	Н	*	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
46-8	Ph											

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table III-47.

	i auto ii	J- <b>T</b> / •											
J	Лō	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
	II-47-	p-F- Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
)	III-47-	p-F- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

Table III-48.

R<sup>8</sup> R<sup>9</sup>

 $NH_2$ 

Н

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
2												
III-47- 3	p-F- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-47- 4	p-F- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-47- 5	p-F- Ph	Н	Н	CH₂Ph	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-47- 6	p-F- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-47- 7	p-F- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III-47- 8	p-F- Ph	*	Н	*	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Nº	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>
	p-Cl-	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н
48-1	Ph									

III- p-Cl- H H CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> Bz H CH<sub>3</sub> F OH H H NH<sub>2</sub>
48-3

III- p-Cl- H H CH<sub>2</sub>Ph Bz H CH<sub>3</sub> F OH H H NH<sub>2</sub>

48-5 Ph

III- p-Cl- H H CH<sub>2</sub>-indol-3- Bz H CH<sub>3</sub> F OH H NH<sub>2</sub>

48-6 Ph yl

III- p-Cl- H H CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub> Bz H CH<sub>3</sub> F OH H H NH<sub>2</sub>

48-7

III- p-Cl- \* H \* Bz H CH<sub>3</sub> F OH H H NH<sub>2</sub>
48-8

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table 1	Table III-49.											
№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	$R^9$
III- 49-1	p-Br- Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III- 49-2	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III- 49-3	p-Br- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III- 49-4	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III- 49-5	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III- 49-6	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III- 49-7	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
III- 49-8	p-Br- Ph	*	Н	*	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table II	I-50.											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	$R^9$
III-50-	•	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
1	Ph											
III-50-		Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н	$NH_2$
2	Ph											
III-50-		Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
3	Ph											
III-50-		Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
4	Ph											
III-50-		H	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Η	Н	$NH_2$
5	Ph											
III-50-		Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
6	Ph			yl								
III-50-		Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
7	Ph											
III-50-	p-I-	*	Н	*	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

**WO 2008/121634**Docket No. 60137.0034WOU1

№	$\mathbb{R}^1$	$R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
8	Ph							1.1.11.11.11	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

IV

IV-1-1 CH <sub>3</sub> H H H CH <sub>3</sub> H F F OH H H	_
	NILI.
IV-1-2 CH <sub>3</sub> H H CH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> H F F OH H H	14115
IV-1-3 CH <sub>3</sub> H H CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> H F F OH H H	$NH_2$
IV-1-4 CH <sub>3</sub> H H CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> H F F OH H H	NH <sub>2</sub>
IV-1-5 CH <sub>3</sub> H H CH <sub>2</sub> Ph CH <sub>3</sub> H F F OH H H	$NH_2$
IV-1-6 CH <sub>3</sub> H H CH <sub>2</sub> -indol-3-yl CH <sub>3</sub> H F F OH H H	NH <sub>2</sub>
IV-1-7 CH <sub>3</sub> H H CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> H F F OH H H	$NH_2$
IV-1-8 CH <sub>3</sub> * H * CH <sub>3</sub> H F F OH H H	NH <sub>2</sub>

<sup>5 \*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table IV-2

I able I												
No	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-2-1	Et	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-2-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-2-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-2-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-2-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-2-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-2-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-2-8	Et	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

	١ ١	1	TT 7	_
1	ลท	le.	Iν	- 4

№	R¹	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-3-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-3-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	H	$NH_2$
IV-3-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-3-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Η	Н	$NH_2$
IV-3-5	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-3-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-3-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-3-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table IV-4.

Nº	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-4-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-4-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH	Н	H	$NH_2$
IV-4-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH	H	Н	$NH_2$
IV-4-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-4-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-4-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-4-7	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-4-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

IV-5-8 Ph \* H

Table IV-5.													
Nº	R¹	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	
IV-5-1	Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>	
IV-5-2	Ph	Н	H	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	OH	Н	Н	$NH_2$	
IV-5-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Η	F	F	OH	Н	Н	$NH_2$	
IV-5-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	OH	Н	Н	$NH_2$	
IV-5-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$	

IV-5-6 Ph H H CH<sub>2</sub>-indol-3-yl CH<sub>3</sub> H F F OH H H NH<sub>2</sub> IV-5-7 Ph H H CH2CH2SCH3 CH3 H F F OH H H NH2

CH<sub>3</sub> H F F OH H H NH<sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table IV-6.												
No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-6-	p-Me-	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
1	Ph											
IV-6-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
2	Ph											
IV-6-		Η	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Η	F	F	OH	Н	Н	$NH_2$
3	Ph											
IV-6-	-	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Η	NH <sub>2</sub>
4	Ph											
IV-6-		Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
5	Ph											
IV-6-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	$CH_3$	Н	F	F	OH	Н	Н	$NH_2$
6	Ph			yl								
IV-6-	1	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	OH	Н	Н	$NH_2$
7	Ph											
IV-6-	p-Me-	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	F	OH	Н	Н	$NH_2$
8	Ph											

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

)	Table	LV-7.	
	•		•

	No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$ $R^9$													
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>		
IV-7-1	p-F- Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>		
IV-7-2	p-F- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>		
IV-7-3	p-F-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Η	F	F	OH	Н	Н	$NH_2$		

Table IV-8.

R<sup>1</sup>

Ph

Ph

p-Cl-

p-Cl-

IV-8-

IV-8-

7

<u>№</u>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-7-4	Ph p-F- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-7-6	p-F- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-7-7	p-F- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-7-8	p-F- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-7- 20	p-F- Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

 $R^2$   $R^{3a}$   $R^{3b}$ 

IV-8- 1	p-Cl- Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-8- 2	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-8- 3	p-Cl- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-8- 4	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	H	Н	NH <sub>2</sub>
IV-8- 5	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-8-	p-Cl-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

R<sup>4</sup>

R<sup>5</sup> R<sup>6</sup> X Y

F OH H

F OH H

H NH<sub>2</sub>

yl

Н Н

Η

Table IV-9. R<sup>2</sup> R<sup>3a</sup> R<sup>3b</sup> R<sup>4</sup> R<sup>5</sup> R<sup>6</sup> R<sup>7</sup> R<sup>8</sup> R<sup>9</sup>  $R^1$ X Y N₂ CH<sub>3</sub> H Η F ОН Н Η IV-9-1 p-Br-Η Η  $NH_2$ Ph

CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub> CH<sub>3</sub> H F

CH<sub>3</sub> H F

IV-9-2 p-Br- H H CH<sub>3</sub> CH<sub>3</sub> H F F OH H H NH<sub>2</sub> Ph

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

№	R¹	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-9-3	p-Br- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-9-4	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-9-6	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-9-7		Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-9-8	p-Br- Ph	Н	Н	CH₂CH₂SCH₃	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-9- 20	p-Br- Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table IV-10.													
N₂	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	
IV-10-	p-I-	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>	
1	Ph												
IV-10-		Н	Н	CH <sub>3</sub>	$\text{CH}_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$	
2	Ph												
IV-10-	•	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН	H	Н	$NH_2$	
3	Ph												
IV-10-	p-I-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$	
. 4	Ph												
IV-10-	p-I-	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$	
5	Ph												
IV-10-	p-I-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$	
6	Ph			yl									
IV-10-	p-I-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>	
7	Ph												
IV-10-	p-I-	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>	
8	Ph												

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table IV-11

1 able 1 v	-11.											
Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-11-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-11-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-11-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	F	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-11-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	OH	Н	H	$NH_2$
IV-11-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-11-6	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-11-7	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-11-8	$CH_3$	*	Н	*	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table IV-12.

No No		$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-12-1	Et	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-12-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	OH	H	H	$NH_2$
IV-12-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	ОН	Н	H	$NH_2$
IV-12-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	ОН	Н	H	$NH_2$
IV-12-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-12-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	F	OH	Н	Н	$NH_2$
IV-12-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-12-8	Et	*	Н	*	Et	H	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table IV-13

$N_{\odot}$ R <sup>1</sup> R <sup>2</sup> R <sup>3a</sup> R <sup>3b</sup> R <sup>4</sup> R <sup>5</sup> R <sup>6</sup> X Y R <sup>7</sup> R <sup>8</sup> R <sup>9</sup>													
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	
IV-13-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>	
IV-13-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН	Н	H	$NH_2$	
IV-13-3	$^{i}$ Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$	
IV-13-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$	
IV-13-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH₂Ph	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$	
IV-13-6	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>	
IV-13-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$	
IV-13-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table IV-14.  $R^4$   $R^5$   $R^6$ R<sup>3b</sup>  $R^2$  R IV-14- <sup>t</sup>Bu H H H Et H F F OH H H NH<sub>2</sub> 1

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
			3a									
IV-14-	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
2												
IV-14-	'Bu	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
3												
IV-14-	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
4												
IV-14-	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	H	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
5												
IV-14-	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
6												
IV-14-	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	H	F	F	OH	Н	Н	$NH_2$
7												
IV-14-	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Et	H	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
8	3h .											

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Ta	h	ٔ ما	TX.	7_	15	
10			ıv	-		ι.

No	R¹	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-15-1	Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-15-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	OH	Н	Н	$NH_2$
IV-15-3	Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-15-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	OH	Н	Н	$NH_2$
IV-15-5	Ph	Н	Н	CH₂Ph	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-15-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	F	OH	Н	Н	$NH_2$
IV-15-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-15-8	Ph	*	Н	*	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table IV-16.

№	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-16- 1	p-Me- Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-16- 2	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-16-	p-Me- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
3												
IV-16- 4	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-16- 5	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-16- 6	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-16- 7	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-16- 8	p-Me- Ph	*	Н	*	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table :	IV-1	7
---------	------	---

<u>No</u>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-17-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-17-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-17-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-17-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-17-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-17-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-17-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-17-8	p-F-Ph	*	Н	*	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table IV-18.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-18- 1	p-Cl- Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-18- 2	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-18- 3	p-Cl- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-18- 4	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-18-	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
5												
IV-18- 6	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-18- 7	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-18- 8	p-Cl- Ph	*	Н	*	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$T_{a}$	1.	ا ما	rτ	7	1 (	ጎ
19	n		١.	-	ı٠	ч.

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-19- 1	p-Br- Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-19- 2	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-19- 3	p-Br- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-19- 4	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-19- 5	p-Br- Ph	Н	Н	CH₂Ph	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-19- 6	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-19- 7	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-19- 8	p-Br- Ph	*	Н	*	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table IV-20.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-20-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-20-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-20-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-20-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-20-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-20-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-20-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-20-8	p-I-Ph	*	Н	*	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

- 1 1			
Tob	<u>α</u> Ι΄	<b>1</b> 7 7 1	
Tau		V-21	

№		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-21-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	H .	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-21-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	Н	F	F	OH	Н	Н	$NH_2$
IV-21-3	$\text{CH}_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-21-4	$\text{CH}_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-21-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-21-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-21-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-21-8	$CH_3$	*	Н	*	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table IV-22.

1 4010 1 1												
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-22-1	Et	Н	Н	Н	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-22-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	H	Н	$NH_2$
IV-22-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH	Н	Н	$NH_2$
IV-22-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-22-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-22-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-22-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-22-8	Et	*	Н	*	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

 $<sup>^{*}</sup>$ R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table IV-23.

1 4010 1												
No	R <sup>i</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-23-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-23-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-23-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-23-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-23-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-23-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-23-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-23-8	$^{i}$ Pr	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

п	r. 1	. 1.	_ 7	Υ:	,	٦4
	Γal	DИ	3 1	v	<b>-</b> 2	24.

No	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-24-1	'Bu	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-24-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-24-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-24-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	H	Н	$NH_2$
IV-24-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH	Н	Н	$NH_2$
IV-24-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-24-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-24-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table IV-25.

№	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-25-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-25-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH	Н	H	$NH_2$
IV-25-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-25-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-25-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	$\mathrm{NH}_2$
IV-25-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	$\mathrm{NH}_2$
IV-25-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	H	Н	$NH_2$
IV-25-8	Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	H	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>5 \*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table IV-26.

I aute I												
№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-26- 1	p-Me- Ph	Н	Н	Н	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-26- 2	p-Me- Ph	Н	Η	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-26- 3	p-Me- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-26-	p-Me-	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
4	Ph											
IV-26- 5	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-26- 6	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-26- 7	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-26- 8	p-Me- Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Та	LI	۱.	TΥ	7	2		7
11	601			٠.	-/	. /	

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-27-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-27-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-27-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-27-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-27-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-27-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-27-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-27-8	p-F-Ph	*	Н	*	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table IV-28.

Table IV	-Zo.											
№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-28- 1	p-Cl- Ph	Н	Н	Н	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-28- 2	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-28- 3	p-Cl- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-28- 4	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-28- 5	p-Cl- Ph	Н	Н	CH₂Ph	'Pr	Н	F	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-28-	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
6				yl								
IV-28- 7	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-28- 8	p-Cl- Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

T'	ah	ما	ľΥ	Ι.	.29
- 1 2	an.		1 \	/ -	-/4

Table I			25	. 2h	1	-5	-6			-7	T-8	<b>D</b> 9
№	R¹	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>30</sup>	R⁺	R <sup>3</sup>	R°					R <sup>9</sup>
IV-29-	p-Br-	Н	Н	Н	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
1	Ph											
IV-29-	p-Br-	H	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	H	F	F	OH	Н	H	$NH_2$
2	Ph											
IV-29-	p-Br-	H	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH	Η	Н	$NH_2$
3	Ph											
IV-29-	p-Br-	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	F	F	OH	Н	Н	$NH_2$
4	Ph											
IV-29-	p-Br-	H	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH	Η	Н	$NH_2$
5	Ph											
IV-29-	p-Br-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH	Н	Н	$NH_2$
6	Ph			yl								
IV-29-	p-Br-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH	Н	Н	$NH_2$
7	Ph											
IV-29-	p-Br-	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
8	Ph											
-												

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table IV-30.

Table IV	-30.											
№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-30-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-30-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH	Н	Н	$NH_2$
IV-30-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	$\mathrm{NH}_2$
IV-30-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-30-5	p-I <b>-</b> Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-30-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-30-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-30-8	p-I-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tr. 1.1	١_	TΥ	7 2	1
Tabl	ıe	I۷	1-3	1

No No	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-31-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-31-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH	Н	Н	$NH_2$
IV-31-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-31-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-31-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-31-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2 \\$
IV-31-7	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	OH	Н	Н	$NH_2$
IV-31-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table IV-32.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-32-1	Et	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-32-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	OH	H	Н	$NH_2$
IV-32-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	OH	Н	Н	$NH_2$
IV-32-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	OH	Н	Н	$NH_2$
IV-32-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	F	F	OH	Н	Н	$\mathrm{NH}_2$
IV-32-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-32-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-32-8	Et	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH	Н	Н	$NH_2$

<sup>5</sup>  ${}^*R^2$  and  $R^{3b}$  joined together by  $(CH_2)_3$  to form five-membered ring.

Table IV-33.

Nº	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-33-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-33-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	OH	Н	Н	$NH_2$
IV-33-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	H	F	F	OH	Н	Н	$NH_2$
IV-33-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH	Н	Н	$NH_2$
IV-33-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH	Н	Н	$\mathrm{NH}_2$
IV-33-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	F	OH	Н	Н	$NH_2$
IV-33-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-33-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

\*R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

OD 1.1		<b>T</b> 7	A 4
Tabl	le I	V-	. 34.

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-34-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-34-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	$\mathrm{NH_2}$
IV-34-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-34-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-34-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH₂Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-34-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-34-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-34-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table IV-35.

1401011				A1							0	
№	$R^{I}$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R⁴	R	R°	X	Y	R'	R°	R <sup>9</sup>
IV-35-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-35-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-35-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-35-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-35-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-35-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-35-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-35-8	Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>5 \*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table IV-36.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-	p-Me- Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
36-1	T II											
IV-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
36-2	Ph											
IV-	p-Me-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
36-3	Ph											
IV-	•	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
36-4	Ph											
IV-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
36-5	Ph											

№	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV- 36-6		Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV- 36-8	p-Me- Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F,	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

<b>T</b>	. 1		T		_	~
Tal	n	$\Delta$		١,	_ 4	•
10			•	v	- ,	,

Table I										_ 7	_ 0	_ 0
№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>36</sup>	R <sup>4</sup>							R <sup>9</sup>
IV-37-	p-F-	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH	H	Н	$NH_2$
1	Ph											
IV-37-	p-F-	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	OH	Н	Н	$NH_2$
2	Ph											
IV-37-	p-F-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
3	Ph											
IV-37-	p-F-	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH	Н	Н	$NH_2$
4	Ph											
IV-37-	p-F-	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
5	Ph											
IV-37-	p-F-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
6	Ph			yl								
IV-37-	p-F-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH	Н	Н	$NH_2$
7	Ph											
IV-37-	p-F-	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
8	Ph											

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table IV-38.

1 auto 1	v -50.											
No	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-38- 1	p-Cl- Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-38- 2	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-38- 3	p-Cl- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-38-	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-38- 5	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-38-	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-38- 7	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-38- 8	p-Cl- Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table I'	V-39.
----------	-------

No No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-39- 1	p-Br- Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-39- 2	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-39- 3	p-Br- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Ή	NH <sub>2</sub>
IV-39-	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-39- 5	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-39-	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-39- 7	p-Br- Ph	Н	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	H	Н	NH <sub>2</sub>
IV-39- 8	p-Br- Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table IV-40.

No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-40-	p-I-	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
1	Ph											

<u>№</u>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-40- 2	p-I- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-40- 3	p-I- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-40- 4	p-I- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-40- 5	p-I- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-40- 6	p-I- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-40-	p-I- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-40- 8	p-I- Ph	*	Н	*	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	H	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

n	_	1 1		TT	7	4 1	
1	0	nı	_		1	41	
	а	IJ		1 1	, -	т.	

No No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-41-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-41-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	OH	Н	Н	$NH_2$
IV-41-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$\mathbf{F}$	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-41-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-41-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-41-6	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-41-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-41-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table IV-42.

№	$\mathbb{R}^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-42-1	Et	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-42-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-42-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-42-4	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-42-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-42-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-42-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-42-8	Et	*	Н	*	Bz	H	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table IV-43.

Nº	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-43-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-43-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	OH	Н	Н	$NH_2$
IV-43-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-43-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	OH	Н	Н	$NH_2$
IV-43-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-43-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-43-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН	Н	H	$NH_2$
IV-43-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table IV-44.

No	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-44-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-44-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	OH	H	Н	$NH_2$
IV-44-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	OH	H	Н	$NH_2$
IV-44-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	OH	Н	Н	$NH_2$
IV-44-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-44-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	F	ОН	H	Н	$NH_2 \\$
IV-44-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН	H	Н	$NH_2$
IV-44-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Bz	Н	F	F	OH	Н	H	$NH_2$

 $<sup>^{*}</sup>$ R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table IV-45.

Table IV	$N_0 = R^1 R^2 R^{3a} R^{3b} = R^4 R^5 R^6 X Y R^7 R^8 R^9$											
No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-45-1	Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-45-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	H	F	F	OH	H	Н	$NH_2$
IV-45-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН	H	Н	$NH_2$
IV-45-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-45-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-45-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-45-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

Nº	$\mathbb{R}^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-45-8	Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

T	abla	. 117	-46
	ame	. 1 V	-41

Table 1												
No	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-46-	p-Me-	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
1	Ph											
IV-46-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	H	F	F	OH	Н	Н	$NH_2$
2	Ph											
IV-46-	•	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
3	Ph											
IV-46-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
4	Ph											
IV-46-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
5	Ph											
IV-46-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
6	Ph			yl								
IV-46-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
7	Ph											
IV-46-	p-Me-	*	Н	*	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
8	Ph											

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>36</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# Table IV-47.

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-47-	p-F-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
1												
IV-47-	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	OH	Н	H	$NH_2$
2												
IV-47-	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	OH	Н	Н	$NH_2$
3												
IV-47-	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	OH	Н	Н	$NH_2$
4												
IV-47-	p-F-Ph	Н	H	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	H	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
5												
IV-47-	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	H	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
6												
IV-47-	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	OH	Н	Н	$NH_2$
7												
IV-47-	p-F-Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
8												

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

OF 1 1		TT	40
Tabl	Δ	11/	/I Y
тапл		1 7	

Table 1												
Nº	$R^{\Gamma}$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-48-	p-Cl-	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
1	Ph											
IV-48-	-	Η	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	OH	Н	Н	$NH_2$
2	Ph											
IV-48-	p-Cl-	Η	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
3	Ph											
IV-48-	p-Cl-	Η	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
4	Ph											
IV-48-	p-Cl-	Н	Н	CH₂Ph	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
5	Ph											
IV-48-	p-Cl-	Η	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
6	Ph			yl								
IV-48-	p-Cl-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
7	Ph											
IV-48-	p-Cl-	*	Н	*	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
8	Ph											

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table IV-49.

140101	. 12.											
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-49- 1	p-Br- Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-49- 2	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-49- 3	p-Br- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-49-	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

N₂	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
4												
IV-49- 5	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-49- 6	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-49- 7	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-49- 8	p-Br- Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

٦	Γa	hl	۵	T٦	7_4	'n	
	11	11			/ -	" "	

No No		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
IV-50-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
IV-50-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-50-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-50-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-50-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-50-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-50-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
IV-50-8	p-I-Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$$R^{3a}$$
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{3b}$ 

Tab	12	17	-1
- i an	ıe	V -	• 1

№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-1-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-1-2	$CH_3$	Н	H	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	H	H	F	OH	Н	Н	$NH_2$
V-1-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	H	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-1-4	$CH_3$	H	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	H	Н	$NH_2$
V-1-5	$CH_3$	H	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-1-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	H	Н	F	OH	H	Н	$NH_2$
V-1-7	$CH_3$	Н	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	H	H	$NH_2$
V-1-8	$CH_3$	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	H	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table V-2.

№		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-2-1	Et	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-2-2	Et	H	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-2-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	OH	Н	Н	$NH_2$
V-2-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-2-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-2-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	Н	F	OH	Н	Н	$NH_2$
V-2-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	H	Н	$NH_2$
V-2-8	Et	*	Н	*	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	H	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## 5 Table V-3.

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-3-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-3-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-3-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	OH	Н	H	$NH_2$
V-3-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-3-5	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	H	F	ОН	H	Н	$NH_2$
V-3-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Η	$NH_2$
V-3-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Η	$NH_2$
V-3-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table												
Nº	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-4-1	'Bu	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-4-2	'Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	H	Н	F	OH	Н	H	$NH_2$
V-4-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$CH_3$	H	H	F	OH	H	H	$NH_2$
V-4-4	<sup>t</sup> Bu	H	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	H	H	F	ОН	H	H	$NH_2$
V-4-5	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	H	H	F	ОН	H	H	$NH_2$
V-4-6	<sup>t</sup> Bu	H	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	H	H	F	ОН	H	Н	$NH_2$
V-4-7	<sup>t</sup> Bu	Н	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

V-4-8  $^{\prime}Bu$  \* H \* CH<sub>3</sub> H H F OH H NH<sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	V.	-5
-------	----	----

No	pl	<b>D</b> 2	n 3a	n3b	D4	<b>m</b> 5	<b>D</b> 6	3.7	7.7	<b>D</b> 7	ъ8	R <sup>9</sup>
7/40	K.	K-	K	K	K.	K°	K*	X	Y	K.	K°	K'
V-5-1	Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-5-2	Ph	H	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН	Н	H	$NH_2$
V-5-3	Ph	H	Н	$CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	H	H	F	OH	H	Н	$NH_2$
V-5-4	Ph	H	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	OH	H	H	$NH_2$
V-5-5	Ph	Η	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-5-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	CH <sub>3</sub>	H	H	F	OH	Н	Н	$NH_2$
V-5-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН	Н	H	$NH_2$
V-5-8	Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН	Н	H	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# 5 Table V-6.

Table												
№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-6- 1	p-Me- Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-6- 2	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-6- 3	p-Me- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-6- 4	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-6- 5	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-6-	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
6				yl								
V-6- 7	•	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
	p-Me- Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

T.	. 1. :	ı _	۲.	7 7
12	ì'n	ıe	v	-/

Table	V - / .											
№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-7-1	p-F- Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-7-2	p-F- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-7-3	p-F- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-7-4	p-F- Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-7-6	p-F- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-7-7	p-F- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-7-8	p-F- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	H	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-7- 20	p-F- Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table V-8.

	, 0,											
№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-8-	p-Cl- Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-8- 3	p-Cl- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-8- 4	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-8-	p-Cl- Ph	Н	Н	CH₂Ph	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-8-	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	CH₃	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-8- 8	p-Cl- Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

<b>7</b> 0	1 1		T 7	$\sim$
Ta	h	le.	v	-9

N₂	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-9-1	p-Br- Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	H	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-9-2	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-9-3	p-Br- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-9-4	p-Br- Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-9-6	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
<b>V</b> -9-7	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-9-8	p-Br- Ph		Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-9- 20		*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table V-10.

<u>No</u>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-10-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-10-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-10-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-10-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-10-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-10-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-10-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-10-8	p-I-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>5 \*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

<b>700 1</b>	•	<b>T</b> 7	-	-
Tar	)le	٧.	- [	Ι.

№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-11-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-11-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-11-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-11-4	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-11-5	$CH_3$	Н	Н	CH₂Ph	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-11-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-11-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-11-8	$\mathrm{CH}_3$	*	Н	*	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table V-12.

10010 1		<b>D</b> 2	T3 3a	R <sup>3b</sup>	D4	D 5	D6	317	3.7	<b>D</b> 7	ъ8	D9
№	K <sup>*</sup>	K <sup>z</sup>	K	K°	K.	K <sup>s</sup>	K*	X	Y	K.	K°	R <sup>9</sup>
V-12-1	Et	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-12-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-12-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-12-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-12-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	Н	F	OH	Н	Н	$NH_2$
V-12-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-12-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-12-8	Et	*	Н	*	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table V-13. 5

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-13-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-13-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	OH	Н	Н	$NH_2$
V-13-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-13-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-13-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-13-6	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-13-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-13-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table V	Table V-14.											
<u>№</u>	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	R	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
			3a									
V-14-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-14-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-14-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	Н	F	OH	Н	Н	$NH_2$
V-14-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	Н	F	OH	Н	Η	$NH_2$
V-14-5	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	H	F	OH	Н	Н	$NH_2$
V-14-6	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	H	F	OH	Н	Н	$NH_2$
V-14-7	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	OH	H	Н	$NH_2$
V-14-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table V-15.												
№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-15-1	Ph	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-15-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	OH	Н	Н	$NH_2$
V-15-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-15-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-15-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	Н	F	OH	Н	Н	$NH_2$
V-15-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-15-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-15-8	Ph	*	Н	*	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R⁴	R5	R <sup>6</sup>	X	Y	$\mathbf{R}'$	R <sup>8</sup>	F
V-16-		Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	Ŋ
1	Ph											
V-16-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	1
2	Ph											
V-16-	p-Me-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	Ì
3	Ph											
V-16-	p-Me-	Ή	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	ì
4	Ph											
V-16-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	Н	F	OH	Н	Н	Ì
5	Ph											

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-16- 6	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	Et	Н	Н	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-16- 7	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-16- 8	p-Me- Ph	*	Н	*	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

7D 1	1	<b>T</b> 7	1 7	•
Tab	$\Delta$	1/		
1 (1)		v -		

No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-17-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-17-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-17-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-17-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	H	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-17-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	Н	F	OH	Н	Н	$NH_2$
V-17-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-17-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-17-8	p-F-Ph	*	Н	*	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table V-18.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-18-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-18-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	H	F	OH	Н	Н	$NH_2$
V-18-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	OH	Н	Н	$NH_2$
V-18-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-18-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-18-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-18-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-18-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>5 \*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table V-19.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-19-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-19-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-19-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<u>№</u>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-19-4	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-19-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-19-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-19-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-19-8	p-Br-Ph	*	Н	*	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$T_{\alpha}$	h	ı	17	2	n
- 12	ıh	le.	ν.	- / 1	.,

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-20-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-20-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-20-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-20-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-20-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-20-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-20-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-20-8	p-I-Ph	*	Н	*	Et	H	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table V-21.

<u>№</u>	$\mathbf{R}^{1}$	$\mathbf{R}^2$	$\mathbf{P}^{3a}$	$\mathbb{R}^{3b}$	$\mathbf{P}^4$	$\mathbb{R}^5$	R <sup>6</sup>	Y	v	$\mathbf{P}^7$	P8	R <sup>9</sup>
712		1	17		17	17	1		1	17	17	
V-21-1	$CH_3$	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Η	Η	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-21-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-21-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-21-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-21-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-21-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH	Н	H	$NH_2$
V-21-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	H	Н	$NH_2$
V-21-8	$CH_3$	*	Н	*	'Pr	H	H	F	ОН	Н	H	$NH_2$

 $<sup>^{*}</sup>$ R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table V-22.

1 4010												
Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-22-1	Et	Н	Н	Н	'Pr	Н	Н	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-22-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-22-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-22-4	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	'Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

№	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-22-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-22-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-22-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-22-8	Et	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tahl	_	17	22
- 1 an		ν.	-/. 1

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-23-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-23-2	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH	Н	Н	$NH_2$
V-23-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-23-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-23-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH₂Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-23-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-23-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$^{i}$ Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-23-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table V-24.

	1 auto V												
•	No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
•	V-24-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
	V-24-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
	V-24-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$\mathrm{NH}_2$
	V-24-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
	V-24-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
	V-24-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	$\mathbf{H}$	$NH_2$
	V-24-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
	V-24-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

 $<sup>^{*}</sup>$ R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table V-25

I auto v												
N2	R¹	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-25-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-25-2	Ph	Н	H	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-25-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-25-4	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-25-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	Н	F	ОН	H	Н	$NH_2$

No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-25-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-25-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-25-8	Ph	*	Н	*	$^{i}$ Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

TO 1 1		T 7	~ ~
Inh	_	•	
Tabl	יסו	v	-20

1 able v												
No	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-26-	p-Me-	Н	Н	Н	'Pr	Н	Н	F	OH	Н	Н	$NH_2$
1	Ph											
V-26-		Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	Н	Н	F	OH	Н	Н	$NH_2$
2	Ph											
V-26-	p-Me-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH	Н	Н	$NH_2$
3	Ph											
V-26-	p-Me-	Н	Η	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH	Н	Н	$NH_2$
4	Ph											
V-26-	p-Me-	Η	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
5	Ph											
V-26-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	'Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
6	Ph			yl								
V-26-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
7	Ph											
V-26-	p-Me-	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
8	Ph											

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table V-27

Table v												
№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-27-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-27-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-27-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-27-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-27-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-27-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-27-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-27-8	p-F-Ph	*	Н	*	'Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$\mathrm{NH}_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table V-28.													
	№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
٠	V-28-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
	V-28-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	H	H	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
	V-28-3	p-Cl-Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	'Pr	Н	Н	F	OH	Н	Н	$NH_2$
	V-28-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Η	Н	NH <sub>2</sub>
	V-28-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH	H	Н	$NH_2$
	V-28-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH	Н	Н	$NH_2$
	V-28-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH	H	H	$NH_2$
	V-28-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	'Pr	Н	Н	F	ОН	H	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table V-29.													
<u>№</u>	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	
V-29-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	'Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>	
V-29-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH	Н	Н	$NH_2$	
V-29-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$	
V-29-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Η	$NH_2$	
V-29-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$^{i}$ Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$	
V-29-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$^{i}$ Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$	
V-29-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$	
V-29-8	p-Br-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	H	$NH_2$	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table V.	20

No No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-30-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-30-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	Н	Н	F	OH	Н	Н	$NH_2$
V-30-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$^{i}\mathrm{Pr}$	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-30-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$^{i}$ Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-30-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-30-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-30-7	p-I-Ph	H	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-30-8	p-I-Ph	*	Н	*	'Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

_			~ ~	_	-	
`T`a	ıhl	P	V.	-'-		

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-31-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-31-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH	Н	Н	$NH_2$
V-31-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-31-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-31-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH	Н	Н	$NH_2$
V-31-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-31-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-31-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	"Bu	Н	Н	F	ОН	H	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table V-32.

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-32-1	Et	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-32-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-32-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-32-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	ОН	H	Н	$NH_2$
V-32-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-32-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-32-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$\mathrm{NH}_2$
V-32-8	Et	*	Н	*	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table V-33. 5

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-33-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-33-2	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$\mathrm{NH}_2$
V-33-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-33-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-33-5	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-33-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-33-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-33-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

	1 1		T 1	•	
10	h	$\Delta$	\ /		/4
Ta	.171		v	7	4.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-34-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-34-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	H	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-34-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-34-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-34-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-34-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-34-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-34-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table V-35.

№	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-35-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-35-2	Ph	H	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	Н	F	OH	Н	Н	$NH_2$
V-35-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-35-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-35-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-35-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-35-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-35-8	Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Η	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# 5 Table V-36.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-36- 1	p-Me- Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-36- 2	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-36- 3	p-Me- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-36- 4	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-36- 5	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-36-	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

№	R¹	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
6				yl								
	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-36- 8	p-Me- Ph	*	Н	*	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

~			* 7	~ =
12	ıhا	6	v	-37

Table												
No	$R^1$	$\mathbb{R}^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	$R^8$	R <sup>9</sup>
V-37-	p-F-	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
1	Ph											
V-37-	p-F-	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
2	Ph											
V-37-	p-F-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
3	Ph											
V-37-	p-F-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
4	Ph											
V-37-	p-F-	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
5	Ph											
V-37-	p-F-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
6	Ph			yl								
V-37-	p-F-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
7	Ph											
V-37-	p-F-	*	Н	*	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
8	Ph											

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table V-38.

10010	50.											
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	$R^5$	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-38- 1	p-Cl- Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-38- 3	p-Cl- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-38-	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
4												
V-38- 5	p-Cl- Ph	Н	Н	CH₂Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-38- 6	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-38- 7	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-38- 8	p-Cl- Ph	*	Н	*	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table `	V-3	9.
---------	-----	----

Taulc												
No	R¹	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-39-	p-Br- Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-39- 2	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-39- 3	p-Br- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-39-	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-39- 5	p-Br- Ph	Н	Н	CH₂Ph	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-39- 6	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-39-	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-39- 8	p-Br- Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table V-40.

Table v	- <del>4</del> 0.											
Nº	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-40-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-40-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-40-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-40-4	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-40-5	p-I-Ph	Н	Н	CH₂Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	H	$\mathrm{NH}_2$
V-40-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	H	Н	$NH_2$
V-40-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-40-8	p-I-Ph	*	Н	*	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$\mathrm{NH}_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tal	h	Δ	١,	/1	1	
- 1 4	. , ,	•	v	-4		

<u>No</u>		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-41-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-41-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$\mathrm{NH}_2$
V-41-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	H	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-41-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-41-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-41-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-41-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-41-8	$CH_3$	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table V-42

Table V												
№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-42-1	Et	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-42-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH	Н	Н	$NH_2$
V-42-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-42-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-42-5	Et	Н	Н	CH₂Ph	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	H	$NH_2$
V-42-6	Et	Ή	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-42-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-42-8	Et	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>5</sup>  $R^2$  and  $R^{3b}$  joined together by  $(CH_2)_3$  to form five-membered ring.

Table V-43.

I dole v												
Nº	R <sup>I</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-43-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	H	NH <sub>2</sub>
V-43-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH	Н	Н	$NH_2$
V-43-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-43-5	'Pr	Н	Н	$CH_2PH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

V-43-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-43-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-43-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

OT 1 1		<b>T</b> 7	
Tab]	Α	- \/	_4/1
1 417	•	v	

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-44-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-44-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-44-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-44-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-44-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH₂Ph	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$\mathrm{NH}_2$
V-44-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-44-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-44-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table V-45.

No	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-45-1	Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-45-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-45-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-45-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-45-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$\mathrm{NH}_2$
V-45-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-45-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-45-8	Ph	*	$\mathbf{H}^{-}$	*	Bz	Н	Н	F	OH	Н	Н	$NH_2$

 $<sup>^{*}</sup>$ R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table V-46.

Labic												
№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-46- 1	p-Me- Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-46-	p-Me- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-46-	p-Me-	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
4	Ph					·						
V-46- 5	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	H	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-46- 6	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-46- 7	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-46- 8	p-Me- Ph	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$\mathbf{T}$	ah	ام	V	-47
- 1	1111		v	-4/

	$N_{\bullet} = R^1 = R^2 R^{3a} R^{3b} = R^4 R^5 R^6 X Y R^7 R^8 R^9$												
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	
V-47-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>	
V-47-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$\mathrm{NH}_2$	
V-47-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$	
V-47-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$	
V-47-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$	
V-47-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$	
V-47-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$	
V-47-8	p-F-Ph	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$\mathrm{NH}_2$	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table V-48

1 abic v	7-40.											
№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-48- 1	p-Cl- Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-48- 2	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-48- 3	p-Cl- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-48- 4	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-48- 5	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-48-	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
6				yl								
	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
	p-Cl- Ph	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

OD 1	11	<b>T</b> 7	40
Tal	nie.	\/	.44
1 a	$\sigma$	v -	てノ

I able v	-47.											
№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-49-	p-Br-	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
1	Ph											
V-49-	1	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH	Н	Н	$NH_2$
2	Ph											
V-49-	p-Br-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	OH	Н	Н	$NH_2$
3	Ph											
V-49-	p-Br-	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	OH	Н	Н	$NH_2$
4	Ph											
V-49-	p-Br-	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
5	Ph											
V-49-	p-Br-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	Bz	Н	Н	F	OH	Н	Н	$NH_2$
6	Ph			yl								
V-49-	p-Br-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH	Н	Н	$NH_2$
7	Ph											
V-49-	p-Br-	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
8	Ph											

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table V-50.

Table v												
№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-50-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-50-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH	Н	Н	$NH_2$
V-50-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	OH	Н	Н	$NH_2$
V-50-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
V-50-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-50-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$
V-50-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н	$NH_2$

Nº	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
V-50-8	p-I-Ph	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>

\*R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$$R^{3a}$$
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3a}$ 
 $R^{3a}$ 

VI

Table V											
Nº	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	$\mathbb{R}^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VI-1-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-1-2	$\text{CH}_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	OH	H	Н
VI-1-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-1-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-1-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-1-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-1-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-1-8	$CH_3$	*	Н	*	$\mathrm{CH}_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н

 $^{*}$ R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table V											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
VI-2-1	Et	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-2-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-2-3	Et	H	Н	$CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-2-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Η	ОН	Н	Н
VI-2-5	Et	Н	Н	CH₂Ph	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-2-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-2-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н

№	R¹	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VI-2-8	Et	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table VI-3.

<u>№</u>	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
VI-3-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-3-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-3-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-3-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-3-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-3-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-3-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-3-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table VI-4.

№	R <sup>I</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$\mathbb{R}^7$	R <sup>8</sup>
VI-4-1	'Bu	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-4-2	'Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Η	OH	Н	Н
VI-4-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Η	OH	Н	Н
VI-4-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-4-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-4-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-4-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-4-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н

 $<sup>*</sup>R^2$  and  $R^{3b}$  joined together by  $(CH_2)_3$  to form five-membered ring.

Tah	le	VI	[_5

No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
VI-5-1	Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-5-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-5-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-5-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-5-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-5-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-5-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-5-8	Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table VI-6.

Table v	1-0.										
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VI-6-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-6-2	p-Me-Ph	Н	H	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-6-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-6-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-6-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-6-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-6-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-6-8	p-Me-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table VI-7. 5

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
VI-7-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	H
VI-7-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-7-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-7-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	OH	H	Н
VI-7-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	Н	OH	H	Н
VI-7-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-7-8	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Ή	F	Н	ОН	Н	H
VI-7-20	p-F-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table V	/I <b>-</b> 8.										
№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VI-8-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-8-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Η	OH	Н	Н
VI-8-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-8-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Η
VI-8-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-8-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-8-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-8-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table V											
No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VI-9-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-9-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-9-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-9-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-9-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Η	F	Η	ОН	Н	Н
VI-9-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	Η	ОН	Н	Н
VI-9-8	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-9-20	p-Br-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table	VI-1	l 0.

Table VI	l-10.										
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VI-10-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-10-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-10-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-10-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-10-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-10-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-10-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-10-8	p-I-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table VI	[-11.										
Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$\mathbb{R}^7$	R <sup>8</sup>
VI-11-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-11-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-11-3	$\text{CH}_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-11-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-11-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-11-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI_11_7	CH <sub>2</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub>	Et	Н	F	Н	OH	Н	H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Et H F H OH H H

Table	V	[-]	2

VI-11-8 CH<sub>3</sub> \* H

Table V											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VI-12-1	Et	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-12-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	OH	Н	Ή
VI-12-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Η	ОН	Н	Н
VI-12-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	H	ОН	Н	Н
VI-12-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	Η	ОН	Н	Н
VI-12-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-12-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-12-8	Et	*	Н	*	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### 5 Table VI-13.

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VI-13-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-13-2	'Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	OH	H	Н
VI-13-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	ОН	H	Н
VI-13-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-13-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	Η	ОН	Н	Н
VI-13-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-13-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-13-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

п	۲۰.	h	ےا	V	ľ 1	1/
	ıя	n	e.	v	_	14.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VI-14-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-14-2	'Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	H	OH	Н	H
VI-14-3	'Bu	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	F	H	OH	Н	Н
VI-14-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-14-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH₂Ph	Et	Н	F	Н	OH	H	Н
VI-14-6	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-14-7	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-14-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table VI-15

Table V											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	$R^5$	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VI-15-1	Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-15-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-15-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-15-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-15-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-15-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-15-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-15-8	Ph	*	Н	*	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### 5 Table VI-16.

No No	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
VI-16-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	ОН	Н	H
VI-16-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-16-3	p-Me-Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-16-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	OH	H	Н
VI-16-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-16-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-16-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-16-8	p-Me-Ph	*	Н	*	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table VI-17.

N₂	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	 R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
VI-17-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-17-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-17-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-17-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-17-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-17-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-17-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-17-8	p-F-Ph	*	Н	*	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	VI.	1	Q
Taine	V 1-	. 1	О

Table V	1-10.										
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R⁴	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
VI-18-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-18-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-18-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-18-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-18-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-18-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-18-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-18-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table VI-19.

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
VI-19-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-19-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Η	ОН	Н	Н
VI-19-3	p-Br-Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-19-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-19-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-19-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	Η	ОН	Н	Н
VI-19-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-19-8	p-Br-Ph	*	Н	*	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table VI-20.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VI-20-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VI-20-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-20-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Η	ОН	Н	Н
VI-20-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-20-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-20-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-20-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-20-8	p-I-Ph	*	Н	*	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$T_{-1}$	L 1 ~	X 7 T	21
า ล	hle	VI	- / I

Table V											
No	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VI-21-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-21-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-21-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-21-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-21-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH₂Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-21-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-21-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-21-8	$CH_3$	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## Table VI-22.

№	пl	<b>D</b> 2	ъ3а	D3b	ъ4	D 5	D6	37	Y	D.7	D8
7.45	K	K	K	K	K	K	K	Λ	Y	K	K
VI-22-1	Et	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-22-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-22-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-22-4	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-22-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-22-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-22-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-22-8	Et	*	H	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>5 \*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table VI-23.

Table V.											
№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VI-23-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-23-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$^{i}$ Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н

Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VI-23-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-23-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-23-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-23-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-23-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-23-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	'Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

7	Га	h	ما	V	1_2	1
	11	.,		v	-/.	4

Nº	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VI-24-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	'Pr	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-24-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-24-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-24-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-24-5	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-24-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-24-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-24-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>36</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table VI-25.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
VI-25-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-25-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	H	OH	Н	Н
VI-25-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-25-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-25-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-25-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-25-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-25-8	Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>5</sup>  $R^2$  and  $R^{3b}$  joined together by  $(CH_2)_3$  to form five-membered ring.

Table VI-26.

I dolo ,											
Nº	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VI-26-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	'Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-26-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-26-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$^{i}$ Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н

№	R¹	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VI-26-4	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-26-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH	H	Н
VI-26-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	H	F	Н	OH	Н	Н
VI-26-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-26-8	p-Me-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table VI-27.

I dole v											
Nº	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VI-27-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-27-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-27-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-27-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-27-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-27-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	H	Н
VI-27-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-27-8	p-F-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table VI-28.

14010 1											
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VI-28-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-28-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-28-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-28-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-28-5	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2Ph$	'Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-28-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$^{i}$ Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-28-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$^{i}$ Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-28-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	'Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>5 \*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table VI-29.

Tuble V											
Nº	$\mathbb{R}^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VI-29-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-29-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	Н	F	$\mathbf{H}_{\cdot}$	ОН	Н	Н
VI-29-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-29-4	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$^{i}$ Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VI-29-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-29-6	p-Br-Ph	Н	H	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	H	F	Н	ОН	Н	Н
VI-29-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-29-8	p-Br-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

7	L <sup>2</sup> .	h	ما	V	[_2	Λ
	121	m		v	I 1	11

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VI-30-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-30-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	Н	F	Н	ОН	H	Н
VI-30-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	H	F	Н	ОН	Н	Н
VI-30-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	H	Н
VI-30-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-30-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-30-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-30-8	p-I-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table VI-31

Table V											
Nº	R¹	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
VI-31-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	H	"Bu	Н	F	Н	ОН	Н	H
VI-31-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	H	ОН	Н	H
VI-31-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-31-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-31-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	H
VI-31-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-31-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-31-8	$CH_3$	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>5 \*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table VI-32

Table V.											
N₂	$\mathbb{R}^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VI-32-1	Et	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-32-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	OH	H	Н
VI-32-3	Et	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-32-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-32-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н

№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VI-32-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-32-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-32-8	Et	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

No	R¹	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VI-33-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	"Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-33-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-33-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-33-4	<sup>i</sup> Pr	Η	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-33-5	<sup>i</sup> Pr	Η	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-33-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-33-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-33-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table VI-34.

		_									
Nº	R¹	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VI-34-1	′Bu	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-34-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	H	F	Н	ОН	Н	Н
VI-34-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-34-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	Н	ОН	Н	H
VI-34-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	F	Н	OH	H	Н
VI-34-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	H
VI-34-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-34-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н

 $<sup>\</sup>frac{1}{12}$  and  $R^{3b}$  joined together by  $(CH_2)_3$  to form five-membered ring.

Table VI-35.

Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VI-35-1	Ph	Н	Н	Н	"Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-35-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-35-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-35-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-35-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-35-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VI-35-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-35-8	Ph	*	H	*	"Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table VI-36.

14010 1	. 50.										
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VI-36-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-36-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	H	F	Н	ОН	H	Н
VI-36-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-36-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-36-5	p-Me-Ph	Н	H	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-36-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-36-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	H	F	Н	ОН	Н	Н
VI-36-8	p-Me-Ph	*	Н	*	"Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table VI-37.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
VI-37-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH	Н	H
VI-37-2	p-F-Ph	Н	H	CH <sub>3</sub>	"Bu	H	F	Η	ОН	H	Н
VI-37-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	H	F	Н	ОН	Н	Н
VI-37-4	p-F-Ph	H	H	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-37-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-37-6	p-F-Ph	H	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-37-7	p-F-Ph	H	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-37-8	p-F-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>5 \*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table \											
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VI-38-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	"Bu	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-38-2	p-Cl-Ph	H	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-38-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-38-4	p-Cl-Ph	H	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-38-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-38-6	p-Cl-Ph	H	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-38-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-38-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tabl	۱,	171	20
1 an	ı	V I	77

table v.											
Nº	$\mathbb{R}^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VI-39-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-39-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-39-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-39-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-39-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-39-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-39-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-39-8	p-Br-Ph	*	H	*	"Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table VI-40 5

Table V.											
№	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VI-40-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-40-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-40-3	p-I-Ph	H	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-40-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-40-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-40-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-40-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	ОН	H	Н
VI-40-8	p-I-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Τ	ab	le	V	[-4	1	

Nº	R¹	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
VI-41-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-41-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-41-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-41-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	OH	Η	Н
VI-41-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-41-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-41-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-41-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table VI-42

Table V											
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
VI-42-1	Et	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-42-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-42-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-42-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-42-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-42-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-42-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-42-8	Et	*	Н	*	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table VI-43 5

Table V.											
Nº	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VI-43-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-43-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-43-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-43-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-43-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Ή
VI-43-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-43-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	110
VI-43-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н

 $<sup>*</sup>R^2$  and  $R^{3b}$  joined together by  $(CH_2)_3$  to form five-membered ring.

Table V											
N₂	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VI-44-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	H
VI-44-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-44-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-44-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	H	F	Н	OH	Н	H
VI-44-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-44-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-44-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-44-8	<sup>t</sup> Bn	*	H	*	Bz	H	F	Н	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	VI-45
1 auto	V 1-4J

14010 1				~							
No	$R^{1}$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R5	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VI-45-1	Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-45-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-45-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-45-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-45-5	Ph	Н	Н	CH₂Ph	Bz	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-45-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-45-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-45-8	Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# Table VI-46.

Nº	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VI-46-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-46-2	p-Me-Ph	Н	H	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	OH	Н	H
VI-46-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	H
VI-46-4	p-Me-Ph	Η	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-46-5	p-Me-Ph	Н	H	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-46-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-46-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-46-8	p-Me-Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

н он н н

H OH H H

VI-47-7 p-F-Ph H H

VI-47-8 p-F-Ph \*

Table VI											
№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	
VI-47-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	H
VI-47-2	p-F-Ph	H	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	H	ОН	Н	Н
VI-47-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-47-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-47-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-47-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	H

CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub> Bz H F

Bz H F

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table V											
No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
VI-48-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-48-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-48-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-48-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-48-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-48-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-48-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-48-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table VI											
	№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
	VI-49-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н
	VI-49-2	p-Br-Ph	Н	H	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н
	VI-49-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	H	ОН	Н	Н
	VI-49-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	H	ОН	Н	Н
	VI-49-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	H	ОН	Н	Н
	VI-49-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	H	ОН	Н	Н
	VI-49-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н
	VI-49-8	p-Br-Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	H	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

OD 1 1		T 71		
l'ab.	9	VΙ	-50	
I an		v ,		,

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VI-50-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-50-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-50-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-50-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-50-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	Н	OH	Н	Н
VI-50-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-50-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н
VI-50-8	p-I-Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$$R^{3a}$$
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{3b}$ 

VII

Tal	hle	VI	Ī_1
1 (1)	,,,,	v 1	I – I .

5

Table V												
№	R <sup>1</sup>	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
VII-1-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-1-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	OH	Н	Н	$NH_2$
VII-1-3	$CH_3$	H	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-1-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-1-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-1-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-1-7	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-1-8	$CH_3$	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$T_{\alpha}$	hi	a 1	ZT	r 2
14	DI	e	V I	<b>-</b> Z.

№	R¹	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
VII-2-1	Et	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-2-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-2-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-2-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-2-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-2-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$\mathrm{CH}_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-2-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-2-8	Et	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table VII-3.

1 auto v												
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
VII-3-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-3-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-3-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-3-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-3-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-3-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-3-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$\text{CH}_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-3-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### 5 Table VII-4.

No No		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
VII-4-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-4-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-4-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-4-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-4-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-4-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-4-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-4-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

7P 11	T TYY	_
Table	- V/ I I	_ `
1 auto	V 11	-J.

No	$\mathbb{R}^1$	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$\mathbb{R}^4$	<b>R</b> <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	Y	v	$\mathbf{R}^7$	R8	R <sup>9</sup>
			11	10	1.	1,	11			11		
VII-5-1	Ph	Н	Н	Н	$CH_3$	H	F	Н	OH	Η	Н	$NH_2$
VII-5-2	Ph	H	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	H	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-5-3	Ph	H	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	H	Н	$NH_2$
VII-5-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	H	F	Н	ОН	H	H	$NH_2$
VII-5-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	H	Н	$NH_2$
VII-5-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	Н	Η	$NH_2$
VII-5-7	Ph	H	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	H	Н	$NH_2$
VII-5-8	Ph	*	Н	*	$CH_3$	H	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table VII-6.

Table												
№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	$R^9$
VII-6-	p-Me- Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-6- 2	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-6- 3	p-Me- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-6- 4	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-6- 5	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-6- 6	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-6- 7	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-6- 8	p-Me- Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table VII-7. 5

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
VII-7-1	p-F- Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-7-2	p-F- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-7-3	p-F-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	H	Н	$NH_2$

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
VII-7-4	Ph p-F- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-7-6	p-F- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-7-7	p-F- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-7-8	p-F- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-7- 20	p-F- Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

	1		X 71	rr	Ω
Та	n	ıe.	v	I I	·X

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
VII-8-	p-Cl- Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-8- 2	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-8- 3	p-Cl- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-8- 4	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-8- 5	p-Cl- Ph	Н	Н	CH₂Ph	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-8-	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
<b>VII-8-</b> 7	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-8- 8	p-Cl- Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table VII-9.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
VII-9- 1	p-Br- Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-9-	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
2												
VII-9- 3	p-Br- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-9-	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-9- 6	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-9- 7	p-Br- Ph	Н	Ĥ	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-9- 8	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-9- 20	p-Br- Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table VI	II-10.											
№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
VII-10- 1	p-I- Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-10- 2	p-I- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-10- 3	p-I- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-10- 4	p-I- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-10- 5	p-I- Ph	Н	Н	CH₂Ph	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-10- 6	p-I- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-10- 7	p-I- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-10-	p-I- Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Ta	ble	·V	II-	1	1	_

№ $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$ $R^9$ VII-11-1 $CH_3$ $H$ $H$ $H$ $Et$ $H$ $F$ $H$ $OH$ $H$ $H$ $NH_2$ VII-11-2 $CH_3$ $H$ $H$ $CH_3$ $Et$ $H$ $F$ $H$ $OH$ $H$ $H$ $NH_2$ VII-11-3 $CH_3$ $H$ $H$ $CH(CH_3)_2$ $Et$ $H$ $F$ $H$ $OH$ $H$ $H$ $NH_2$ VII-11-4 $CH_3$ $H$ $H$ $CH_2CH(CH_3)_2$ $Et$ $H$ $F$ $H$ $OH$ $H$ $H$ $NH_2$ VII-11-5 $CH_3$ $H$ $H$ $CH_2Ph$ $Et$ $H$ $F$ $H$ $OH$ $H$ $H$ $NH_2$ VII-11-6 $CH_3$ $H$ $H$ $CH_2-indol-3-yl$ $Et$ $H$ $F$ $H$ $OH$ $H$ $H$ $NH_2$ VII-11-7 $CH_3$ $H$ $H$ $CH_2CH_2SCH_3$ $Et$ $H$ $F$ $H$ $OH$ $H$ $H$ $NH_2$ VII-11-8 $CH_3$ $*$ $H$ $*$ $Et$ $H$ $F$ $H$ $OH$ $H$ $H$ $NH_2$	14316 111												
VII-11-2         CH <sub>3</sub> H         H         CH <sub>3</sub> Et         H         F         H         OH         H         H         NH <sub>2</sub> VII-11-3         CH <sub>3</sub> H         H         CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> Et         H         F         H         OH         H         H         NH <sub>2</sub> VII-11-4         CH <sub>3</sub> H         H         CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> Et         H         F         H         OH         H         H         NH <sub>2</sub> VII-11-5         CH <sub>3</sub> H         H         CH <sub>2</sub> Ph         Et         H         F         H         OH         H         H         NH <sub>2</sub> VII-11-6         CH <sub>3</sub> H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         Et         H         F         H         OH         H         H         NH <sub>2</sub> VII-11-7         CH <sub>3</sub> H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         Et         H         F         H         OH         H         H         NH <sub>2</sub>	№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
VII-11-3         CH3         H         H         CH(CH3)2         Et         H         F         H         OH         H         H         NH2           VII-11-4         CH3         H         H         CH2CH(CH3)2         Et         H         F         H         OH         H         H         NH2           VII-11-5         CH3         H         H         CH2Ph         Et         H         F         H         OH         H         H         NH2           VII-11-6         CH3         H         H         CH2CH2SCH3         Et         H         F         H         OH         H         H         NH2           VII-11-7         CH3         H         H         CH2CH2SCH3         Et         H         F         H         OH         H         H         NH2	VII-11-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-11-4 $CH_3$ $H$ $H$ $CH_2CH(CH_3)_2$ $Et$ $H$ </th <th>VII-11-2</th> <th><math>CH_3</math></th> <th>Н</th> <th>Н</th> <th>CH<sub>3</sub></th> <th>Et</th> <th>Н</th> <th>F</th> <th>Н</th> <th>ОН</th> <th>Н</th> <th>Н</th> <th><math>NH_2</math></th>	VII-11-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-11-5 $CH_3$ $H$ $H$ $CH_2Ph$ $Et$ $H$ $F$ $H$ $OH$ $H$ $NH_2$ VII-11-6 $CH_3$ $H$ $H$ $CH_2$ -indol-3-yl $Et$ $H$ $F$ $H$ $OH$ $H$ $NH_2$ VII-11-7 $CH_3$ $H$ $H$ $CH_2CH_2SCH_3$ $Et$ $H$ $OH$ $H$ $H$ $NH_2$	VII-11-3	$CH_3$	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-11-6         CH <sub>3</sub> H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         Et         H         F         H         OH         H         H         NH <sub>2</sub> VII-11-7         CH <sub>3</sub> H         H         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> Et         H         F         H         OH         H         H         NH <sub>2</sub>	VII-11-4	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-11-7 CH <sub>3</sub> H H CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> Et H F H OH H H NH <sub>2</sub>	VII-11-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Η	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
	VII-11-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	Н	ОН	H	H	$NH_2$
<b>VII-11-8</b> CH <sub>3</sub> * H * Et H F H OH H NH <sub>2</sub>	VII-11-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
	VII-11-8	$CH_3$	*	Н	*	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## Table VII-12.

No	$\mathbb{R}^1$	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$\mathbb{R}^6$	X	Y	$\mathbb{R}^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
VII-12-1	Et	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-12-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН	H	Н	$NH_2$
VII-12-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-12-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-12-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-12-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-12-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-12-8	Et	*	Н	*	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### 5 Table VII-13.

№	R <sup>1</sup>	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$\mathbb{R}^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
VII-13-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-13-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-13-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-13-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-13-5	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-13-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-13-7	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-13-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table \	VII-14											
No	$R^1$	$R^2$	R	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
			3a									
VII-	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
14-1												
VII-	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
14-2												
VII-	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
14-3												
VII-	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
14-4												
VII-	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	Н	ОН	Н	H	$NH_2$
14-5												
VII-	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	Н	ОН	H	H	$NH_2$
14-6												
VII-	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	H	F	Н	ОН	H	Н	$NH_2$
14-7												
VII-	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Et	Н	F	Н	ОН	H	H	$NH_2$
14-8												

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

7	റം	h	حا	1	<b>7</b> T	T	1	5	
	ıa	n	ю.	١.	, ,	-		7	

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
VII-15-1	Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-15-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-15-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	ОН	Н	H	$NH_2$
VII-15-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-15-5	Ph	Н	H	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-15-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-15-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-15-8	Ph	*	Н	*	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### 5 Table VII-16.

No		R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
VII-16-	p-Me-	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
1	Ph											

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
VII-16- 2	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-16- 3	p-Me- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-16- 4	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-16- 5	p-Me- Ph	Н	Н	CH₂Ph	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-16- 6	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-16- 7	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-16- 8	p-Me- Ph	*	Н	*	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table VI	I-17.											
N₂	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
VII-17-	p-F-	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
1	Ph											
VII-17-		Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
2	Ph											
VII-17-	p-F-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
3	Ph											
VII-17-	p-F-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
4	Ph											
VII-17-	p-F-	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
5	Ph											
VII-17-	p-F-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
6	Ph			yl								
VII-17-	p-F-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
7	Ph											
VII-17-	p-F-	*	Н	*	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
8	Ph											

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table V	II-18.											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
VII-18-	1	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
1	Ph											
VII-18-		Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Η	ОН	Н	Н	$NH_2$
2	Ph											
VII-18-	-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
3	Ph											
VII-18-	•	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	OH	Н	Н	$NH_2$
4	Ph											
VII-18-	-	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
5	Ph											
VII-18-		Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
6	Ph			yl								
VII-18-	p-Cl-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
7	Ph											
VII-18-	•	*	Н	*	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
8	Ph											

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table V	II-19.											
N₂	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
VII-19-	p-Br-	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
1	Ph											
VII-19-	p-Br-	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
2	Ph											
VII-19-	p-Br-	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
3	Ph											
VII-19-	p-Br-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
4	Ph											
VII-19-	p-Br-	Н	Н	CH₂Ph	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
5	Ph											
VII-19-	p-Br-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
6	Ph			yl								
VII-19-	p-Br-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
7	Ph											
VII-19-	p-Br-	*	Н	*	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<u>№</u>	R <sup>1</sup>	$R^2$ $R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	_
8	Ph											_

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table VII-20.

Nº		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
VII-20-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-20-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-20-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-20-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-20-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-20-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-20-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-20-8	p-I-Ph	*	Н	*	Et	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table VII-21

Table VII												
№	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^{7}$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
VII-21-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-21-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Η	ОН	Н	H	$NH_2$
VII-21-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-21-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-21-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-21-6	$CH_3$	Н	H	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Η	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-21-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-21-8	$CH_3$	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table VII-22.

Nº		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
VII-22-1	Et	Н	Н	Н	'Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-22-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-22-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	H	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-22-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-22-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-22-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-22-7	Et	H	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-22-8	Et	*	Н	*	'Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$

\*R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tabl	ٔ ما	VI.	1 22
1 (11)		VΙ	1-2.7

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
VII-23-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-23-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-23-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-23-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-23-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-23-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-23-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-23-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	'Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table VII-24.

№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
VII-24-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-24-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-24-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-24-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-24-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Η	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-24-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-24-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-24-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	'Pr	Н	F	Н	ОН	H	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# Table VII-25.

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
VII-25-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-25-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-25-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-25-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	F	Н	OH	Н	Н	$NH_2$
VII-25-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-25-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-25-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-25-8	Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table VII-26.												
Nº	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
VII-26- 1	p-Me- Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-26- 2	p-Me- Ph	Н	Н	CH₃	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-26- 3	p-Me- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-26- 4	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-26- 5	p-Me- Ph	Н	Н	CH₂Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-26- 6	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
<b>VII-26-</b> 7	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-26- 8	p-Me- Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table VI												
Nº	R <sup>1</sup>	$\mathbb{R}^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
VII-27-		Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
1	Ph											
VII-27-	•	Η	Η	CH <sub>3</sub>	'Pr	Н	F	Η	OH	Н	Н	$NH_2$
2	Ph											
VII-27-	p-F-	Η	H	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Η	OH	Н	Н	$NH_2$
3	Ph											
VII-27-	p-F-	$\mathbf{H}$	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$^{i}$ Pr	Н	F	Η	ОН	Н	Н	$NH_2$
4	Ph											
VII-27-	p-F-	Н	H	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
5	Ph											
VII-27-		Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
6	Ph			yl								
VII-27-	p-F-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
7	Ph											

VII-27- p-F-

\* H \*

Pr H F H OH H H NH<sub>2</sub>

Nº	R <sup>1</sup>	$R^2$ $R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
8	Ph			-							

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

٦	Го1	h	ما	1	71	Ţ	-28	
	1	. , ,		٠,	, ,		= /. O	

No No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
VII-28- 1	p-Cl- Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-28- 2	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-28- 3	p-Cl- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-28- 4	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-28- 5	p-Cl- Ph	Н	Н	CH₂Ph	'Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-28- 6	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-28- 7	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-28- 8	p-Cl- Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table VII-29.

rable vi												
Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
VII-29- 1	p-Br- Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-29- 2	p-Br- Ph	Н	Н	CH₃	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-29-	p-Br- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	H	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-29- 4	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-29- 5	p-Br- Ph	Н	Н	CH₂Ph	'Pr	H	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-29-	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	'Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
6 .				yl								
VII-29- 7	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-29- 8	p-Br- Ph	*	Н	*	'Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tal	L1~	. 17	TT	21	`
1 21	me	: v	11-	· วเ	1.

Table VI		2	30	2h	4	5	6			7		0
№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R³a	R <sup>30</sup>	R <sup>+</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>σ</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
VII-30-	p-I-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	H	NH <sub>2</sub>
1												
VII-30-	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
2												
VII-30-	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
3												
VII-30-	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
4												
VII-30-	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
5												
VII-30-	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
6												
VII-30-	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
7	-											
VII-30-	p-I-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
8												-

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table VII												
No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
VII-31-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-31-2	$CH_3$	Н	H	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-31-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-31-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	Н	OH	Н	Н	$NH_2$
VII-31-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-31-6	$CH_3$	H	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-31-7	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-31-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

1 auto 111-52	Tab	le V	VII-	-32
---------------	-----	------	------	-----

<u>No</u>		R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
VII-32-1	Et	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-32-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-32-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-32-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-32-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-32-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-32-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-32-8	Et	*	Н	*	"Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table VII-33. 5

1 4010 7 11												
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
VII-33-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-33-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH	Н	Н	$NH_2$
VII-33-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	Н	ОН	H	Н	$NH_2$
VII-33-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	Н	ОН	Н	H	$NH_2$
VII-33-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-33-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-33-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-33-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	H	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

H OH H H NH<sub>2</sub>

H NH<sub>2</sub>

н он н

**VII-34-7** 'Bu H H

VII-34-8 <sup>t</sup>Bu \*

Table VI	I <b>-</b> 34.											
№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
VII-34-1	'Bu	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-34-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-34-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-34-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-34-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-34-6	tB11	Н	Н	CH2-indol-3-vl	$^{n}$ Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>n</sup>Bu H

<sup>n</sup>Bu H F

CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>

Table VI												
№	$R^1$	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
VII-35-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-35-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-35-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-35-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-35-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-35-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-35-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-35-8	Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table V	′II-36.											
	№	$\mathbb{R}^1$	$\mathbb{R}^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
	VII-	p-Me-	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
	36-1	Ph											
	VII-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
	36-2	Ph											
	VII-	p-Me-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
	36-3	Ph											
	VII-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
	36-4	Ph											
	VII-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
	36-5	Ph											
	VII-	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	"Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

N₂	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
36-6				yl								
VII-	-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
36-7	Ph											
VII-	p-Me-	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
36-8	Ph											

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

_		* **	· ·	_
10	ble	1/		ι.,
1 4	1110	· •	11	"

No No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
VII-37- 1	p-F- Ph	Н	Н	Н	"Bu	Н	F	Н	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-37- 2	p-F- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-37- 3	p-F- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-37- 4	p-F- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	Н	F	Н	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-37- 5	p-F- Ph	Н	Н	CH₂Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-37-	p-F- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-37-	p-F- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-37- 8	p-F- Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# Table VII-38.

I dolo v	11 50.											
No	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
VII- 38-1	p-Cl- Ph	Н	Н	Н	"Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII- 38-2	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII- 38-3	p-Cl- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<u>№</u>	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$\mathbb{R}^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
38-4												
VII-	p-Cl-	Н	Н	CH₂Ph	"Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
38-5	Ph											
VII-	p-Cl-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	"Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
38-6	Ph			yl								
VII-	p-Cl-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	H	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
38-7	Ph											
VII-	p-Cl-	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
38-8	Ph											

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	VII	-39.
-------	-----	------

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
VII-	p-Br-	Н	Н	Н	"Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
39-1	Ph											
VII-		Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	OH	Н	Н	$NH_2$
39-2	Ph											
VII-		Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	H	OH	Н	Н	$NH_2$
39-3	Ph											
VII-	p-Br-	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
39-4	Ph											
VII-		Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
39-5	Ph											
VII-	p-Br-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	"Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
39-6	Ph			yl								
VII-	p-Br-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
39-7	Ph											
VII-	p-Br-	*	Н	*	"Bu	Н	F	Н	OH	Н	Н	$NH_2$
39-8	Ph											

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table VII-40

Table V	u- <del>4</del> 0.											
№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
VII-40- 1	p-I- Ph	Н	Н	Н	"Bu	Н	F	Н	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-40-	p-I- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
2											,	
VII-40- 3	p-I- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-40- 4	p-I- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-40- 5	p-I- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-40- 6	p-I- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-40- 7	p-I- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-40- 8	p-I- Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Ta	h	l۵	V	IT.	.41	
10			·	••	•	

No		D2	D.3a	<b>D</b> 3b	D4	D.5	n6	37	37	<b>D</b> 7	ъ8	R <sup>9</sup>
Nō	K.	K-	K*-	K**	K	K	K	Λ	Y	K	K	K
VII-41-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	H	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-41-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-41-3	$CH_3$	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-41-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$\mathrm{NH}_2$
VII-41-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	H	$NH_2$
VII-41-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	H	$NH_2$
VII-41-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-41-8	$CH_3$	*	Н	*	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tal	-1-	X/T	I-42.
1 at	סוכ	V 1	1-44.

14010 113											o	
№	Ri	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	R°	X	Y	R'	R°	R <sup>9</sup>
VII-42-1	Et	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-42-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-42-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-42-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН	H	Н	$NH_2$
VII-42-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-42-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-42-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$\mathrm{NH}_2$
VII-42-8	Et	*	Н	*	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## Table VII-43.

Nº		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
VII-43-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-43-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	OH	Н	Н	$NH_2$
VII-43-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-43-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-43-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-43-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-43-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-43-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# 5 Table VII-44.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
VII-44-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-44-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	OH	Н	Н	$NH_2$
VII-44-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	OH	Н	Н	$NH_2$
VII-44-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-44-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	Н	OH	Ή	Н	$NH_2$
VII-44-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-44-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-44-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table VI												
Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
VII-45-1	Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-45-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-45-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-45-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-45-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-45-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-45-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
VII-45-8	Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table V	/II-46.											
No	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
VII-	p-Me-	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
46-1	Ph											
VII-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
46-2	Ph											
VII-	p-Me-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
46-3	Ph											
VII-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
46-4	Ph											
VII-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
46-5	Ph											
VII-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
46-6	Ph			yl								
VII-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
46-7	Ph											
VII-	p-Me-	*	Н	*	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
46-8	Ph											

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table VI												
	Nº	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
	VII-47- 1		Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
	VII-47-	p-F- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

№	$\mathbb{R}^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
2												
VII-47- 3	p-F- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-47-	p-F- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-47- 5	p-F- Ph	Н	Н	CH₂Ph	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-47- 6	p-F- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-47- 7	p-F- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-47- 8	p-F- Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	VIII	10
Lanie	vii	-4X

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
VII-48- 1	p-Cl- Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-48- 2	p-Cl- Ph	Н	H	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-48- 3	p-Cl- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-48- 4	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-48- 5	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-48- 6	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-48- 7	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
VII-48- 8	p-Cl- Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table V	II <b>-</b> 49.											
№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
VII-49-	p-Br-	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
1	Ph											
VII-49-	p-Br-	Н	H	CH <sub>3</sub>	Bz	H	F	H	ОН	H	H	$NH_2$
2	Ph											
VII-49-	p-Br-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
3	Ph											
VII-49-	p-Br-	Η	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
4	Ph											
VII-49-	-	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
5	Ph											
VII-49-	p-Br-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
6	Ph			yl								
VII-49-	p-Br-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
7	Ph											
VII-49-	p-Br-	*	Н	*	Bz	Η	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
8	Ph											

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table VI	I-50.											
№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
VII-50-	p-I-	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	OH	Н	Н	NH <sub>2</sub>
1	Ph											
VII-50-	p-I-	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
2	Ph											
VII-50-	p-I-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
3	Ph											
VII-50-	p-I-	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	H	ОН	Н	Н	$NH_2$
4	Ph											
VII-50-	p-I-	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	$NH_2$
5	Ph											
VII-50-	p-I-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
6	Ph			yl								
VII-50-	p-I-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>
7	Ph											
VII-50-	p-I-	*	Н	*	Bz	Н	F	Н	ОН	Н	Н	NH <sub>2</sub>

№	R <sup>1</sup>	$R^2$ $R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>
8	Ph										

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

VШ

Т	L.	١,	V	TT	T 1	
เฉ	n	10	- \/	11	I – I	

1 doio											
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VIII-1-	1 CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	H
VIII-1-	2 CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н
VIII-1-	3 CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-1-	4 CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н
VIII-1-	5 CH <sub>3</sub>	Н	H	CH₂Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-1-	6 CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н
VIII-1-	7 CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	H
VIII-1-	8 CH <sub>3</sub>	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н

<sup>5</sup>  $R^2$  and  $R^{3b}$  joined together by  $(CH_2)_3$  to form five-membered ring.

Table VI											
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
VIII-2-1	Et	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	Н
VIII-2-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н
VIII-2-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н
VIII-2-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н
VIII-2-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-2-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-2-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$\text{CH}_3$	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н
VIII-2-8	Et	*	Н	*	CH <sub>2</sub>	Н	CH <sub>2</sub>	ОН	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table VI											
Nº	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VIII-3-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	OH	Н	Н
VIII-3-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н
VIII-3-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	Н	$CH_3$	OH	ОН	H	Н
VIII-3-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-3-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-3-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н
VIII-3-7	<sup>i</sup> Pr	H	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-3-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	$CH_3$	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-3-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$\mathrm{CH}_3$	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table VIII-4. 5

<u> 10010 VI.</u>							. ,				
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VIII-4-1	′Bu	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	Н
VIII-4-2	'Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-4-3	'Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н
VIII-4-4	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-4-5	'Bu	H	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н
VIII-4-6	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-4-7	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н
VIII-4-8	'Bu	*	Н	*	$CH_3$	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table VI											
No	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VIII-5-1	Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	OH	Н	Н
VIII-5-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	OH	OH	H	Н
VIII-5-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	H	$CH_3$	OH	OH	H	H
VIII-5-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	H
VIII-5-5	Ph	H	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	H
VIII-5-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$\text{CH}_3$	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н
VIII-5-7	Ph	H	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н
VIII-5-8	Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table V	III <b>-</b> 6.										
Nº	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VIII-6-	1	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
1	Ph										
VIII-6-	•	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н
2	Ph										
VIII-6-	p-Me-	H	Н	$CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	Н
3	Ph										
VIII-6-		Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	H	H
4	Ph										
VIII-6-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	Н
5	Ph										
VIII-6-		Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	H
6	Ph			yl							
VIII-6-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
7	Ph										
VIII-6- 8	p-Me- Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table	: VIII-7
_	1 4010	* ***

Table VII	I"/.										
№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
VIII-7-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	OH	ОН	Н	H
VIII-7-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-7-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
VIII-7-4	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-7-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	H	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-7-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-7-8	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-7-20	p-F-Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# Table VIII-8.

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
VIII-8-1	p-Cl-Ph	Н	H	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	Н
VIII-8-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	Н
VIII-8-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-8-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	CH <sub>3</sub>	OH	ОН	Н	Н
VIII-8-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-8-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$\mathrm{CH}_3$	ОН	ОН	Н	Н
<b>VIII-8-7</b>	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-8-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# Table VIII-9.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
VIII-9-1	p-Br- Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	H
VIII-9-2	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-9-3	p-Br- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-9-4	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-9-6	p-Br- Ph	Н	Н	CH₂Ph	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-9-7	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-9-8	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-9- 20	p-Br- Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н

<sup>5</sup>  $R^2$  and  $R^{3b}$  joined together by  $(CH_2)_3$  to form five-membered ring.

Table VIII											
№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
VIII-10-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-10-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н
VIII-10-3	p-I-Ph	Η	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-10-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	H	$CH_3$	OH	ОН	H	Н
VIII-10-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	H	$CH_3$	OH	OH	Н	Н
VIII-10-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	CH <sub>3</sub>	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-10-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-10-8	p-I-Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Ta	ble	V	Щ	[-	11	١.

Table VIII											
№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VIII-11-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	H
VIII-11-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н
VIII-11-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н
VIII-11-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н
VIII-11-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-11-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	H	Н
VIII-11-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н
VIII-11-8	$CH_3$	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	H	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## 5 Table VIII-12.

Table VIII											
№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VIII-12-1	Et	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	Н
VIII-12-2	Et	H	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	H
VIII-12-3	Et	H	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	H	$CH_3$	OH	OH	Н	Н
VIII-12-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-12-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	Н
VIII-12-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-12-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-12-8	Et	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tal	hle	VI	II-	13	ζ.
	$\sigma$	7 1	7T	1 -	٠.

№	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VIII-13-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	OH	Н	H
VIII-13-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	H
VIII-13-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-13-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-13-5	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-13-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-13-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	H	Н
VIII-13-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Et	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# Table VIII-14.

No No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
VIII-14-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	H	Et	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	OH	Н	Н
VIII-14-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-14-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-14-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-14-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-14-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	H
VIII-14-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	H
VIII-14-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# 5 Table VIII-15.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
VIII-15-1	Ph	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	OH	Н	Н
VIII-15-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	H
VIII-15-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	H	$CH_3$	OH	OH	Н	Н
VIII-15-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н
VIII-15-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	H	Н
VIII-15-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-15-7	Ph	H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-15-8	Ph	*	Н	*	Et	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table VII	I-16.										
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VIII-16- 1	p-Me- Ph	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-16- 2	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	OH	Н	Н
VIII-16- 3	p-Me- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-16- 4	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-16- 5	p-Me- Ph	Н	Н	CH₂Ph	Et	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-16- 6	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	Et	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
<b>VIII-16-</b> 7	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-16- 8	p-Me- Ph	*	Н	*	Et	Н	CH <sub>3</sub>	OH	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	V	Ш	_1	7	7
Table	v	ш	-		٠.

Table vill											
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VIII-17-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	OH	ОН	Н	H
VIII-17-2	p-F-Ph	Н	H	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н
VIII-17-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-17-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	H
VIII-17-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н
VIII-17-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	OH	ОН	Ή	H
VIII-17-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	CH <sub>3</sub>	OH	ОН	Н	Н
VIII-17-8	p-F-Ph	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table VIII-18. 5

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
VIII-18-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	Н
VIII-18-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н
VIII-18-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VIII-18-4	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	OH	Н	Н
VIII-18-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-18-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-18-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	CH <sub>3</sub>	OH	ОН	Н	Н
VIII-18-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# Table VIII-19.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VIII-19-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-19-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н
VIII-19-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-19-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	OH	Н	Н
VIII-19-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-19-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-19-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-19-8	p-Br-Ph	*	Н	*	Et	Н	$\text{CH}_3$	ОН	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## Table VIII-20.

	Table VIII											
	№	$R^1$	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
•	VIII-20-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	OH	Н	H
	VIII-20-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н
	VIII-20-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	H	Н
	VIII-20-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
	VIII-20-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н
	VIII-20-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н
	VIII-20-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
	VIII-20-8	p-I-Ph	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н

<sup>5</sup>  $R^2$  and  $R^{36}$  joined together by  $(CH_2)_3$  to form five-membered ring.

### Table VIII-21

Table VIII											
No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VIII-21-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	H
VIII-21-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н
VIII-21-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-21-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VIII-21-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-21-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-21-7	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Ή	Н
VIII-21-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	'Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

	_		
11.0	~ \	,,,,,	77
1211	- v		-//

Nº	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
VIII-22-1	Et	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	OH	ОН	Н	Н
VIII-22-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н
VIII-22-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-22-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-22-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н
VIII-22-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-22-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-22-8	Et	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# Table VIII-23.

No	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
VIII-23-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	OH	Н	Н
VIII-23-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н
VIII-23-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н
VIII-23-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-23-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-23-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-23-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-23-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н

<sup>5 \*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table VIII-24.

Table VIII											
No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
VIII-24-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	H
VIII-24-2	'Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-24-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н
VIII-24-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-24-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH₂Ph	'Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н

№	R¹	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
VIII-24-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-24-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-24-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

No	R¹	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VIII-25-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-25-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н
VIII-25-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	H	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-25-4	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-25-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-25-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-25-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-25-8	Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# Table VIII-26.

No No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
VIII-26- 1	p-Me- Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-26- 2	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-26- 3	p-Me- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	'Pr	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-26- 4	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-26- 5	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-26- 6	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-26- 7	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-26- 8	p-Me- Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

<sup>i</sup>Pr H CH<sub>3</sub> OH OH H H

Table VIII-27.											
No	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$\mathbb{R}^7$	R <sup>8</sup>
VIII-27-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	OH	ОН	Н	H
VIII-27-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-27-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-27-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	$\mathbf{H}^{-}$
VIII-27-5	p-F-Ph	Н	Н	CH₂Ph	$^{i}$ Pr	Н	CH3	ОН	ОН	Н	Н

VIII-27-6 p-F-Ph H H CH<sub>2</sub>-indol-3-yl <sup>i</sup>Pr H CH<sub>3</sub> OH OH H H VIII-27-7 p-F-Ph H H CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub> <sup>i</sup>Pr H CH<sub>3</sub> OH OH H H

Н

### Table VIII-28.

VIII-27-8 p-F-Ph \*

No No		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
VIII-28-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-28-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-28-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-28-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-28-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-28-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-28-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
	p-Cl-Ph	*	Н	*	'Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table VIII-29. 5

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$\mathbb{R}^7$	R <sup>8</sup>
VIII-29-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	'Pr	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	OH	Н	Н
VIII-29-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-29-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-29-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-29-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-29-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-29-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
	p-Br-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	H	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table VIII-30.											
№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VIII-30-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	OH	ОН	Н	Н
VIII-30-2	p-I-Ph	H	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	Н
VIII-30-3	p-I-Ph	Н	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	'Pr	Н	$CH_3$	ОН	OH	H	Н
VIII-30-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н
VIII-30-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н
VIII-30-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н
VIII-30-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	H	$CH_3$	OH	OH	Н	Н
VIII-30-8	p-I-Ph	*	Н	*	'Pr	Н	$\text{CH}_3$	ОН	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table VIII	Table VIII-31.										
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VIII-31-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-31-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-31-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-31-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-31-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-31-6	$CH_3$	Н	H	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-31-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-31-8	$CH_3$	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

_	on 11	T TYY'	
5	Table	·VII	I=32

No		$\mathbf{R}^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
VIII-32-1	Et	Н	Н	Н	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	Н
VIII-32-2	Et	Н	Η	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Η	$CH_3$	OH	OH	Н	Н
VIII-32-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н
VIII-32-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н
VIII-32-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н
VIII-32-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н
VIII-32-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	H	$CH_3$	OH	OH	Н	Н
VIII-32-8	Et	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	H	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table VIII-33.											
N₂	R¹	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
VIII-33-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-33-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н
VIII-33-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-33-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-33-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-33-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-33-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-33-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tal	ble	VI	[I-34.

No No		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VIII-34-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-34-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н
VIII-34-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-34-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н
VIII-34-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-34-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н
VIII-34-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-34-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table VIII-35. 5

No No		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
VIII-35-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-35-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-35-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-35-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-35-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-35-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-35-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-35-8	Ph	*	Н	*	"Bu	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table VI	II-36.										
N₂	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VIII-36- 1	p-Me- Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-36- 2	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-36- 3	p-Me- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	H	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-36- 4	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	OH	ОН	Н	Н
VIII-36- 5	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	.CH <sub>3</sub>	OH	ОН	Н	Н
VIII-36- 6	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-36- 7	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-36- 8	p-Me- Ph	*	Н	*	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>36</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tab	Je.	VI	II.	.37
1 au	ш	V 1.	II.	

Table VIII			- 20	26							- 0
No	R'	R²	R³a	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R³	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
VIII-37-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-37-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н
VIII-37-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-37-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-37-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-37-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-37-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-37-8	p-F-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# 5 Table VIII-38.

Table VII											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
VIII-38- 1	p-Cl- Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-38-	p <b>-</b> Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н

PCT/US2008/058183

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
2											
VIII-38- 3	p-Cl- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-38- 4	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-38- 5	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-38- 6	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-38- 7	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	OH	Н	Н
VIII-38- 8	p-Cl- Ph	*	Н	*	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

7	$\Gamma_{\alpha}$	h	ے	V	m	[3	0
	1	n	10	v		- 1	ч.

N₂	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	- R <sup>8</sup>
VIII-39- 1	p-Br- Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-39- 2	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	Н
VIII-39- 3	p-Br- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-39- 4	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-39- 5	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-39- 6	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-39- 7	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-39- 8	p-Br- Ph	*	Н	*	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	VIII-40.
-------	----------

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
VIII-40-1	p-I-Ph	Н	Н	H	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-40-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-40-3	p-I-Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-40-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-40-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-40-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-40-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-40-8	p-I-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## Table VIII-41.

1 4010 7 111											
No	R¹	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>30</sup>	R <sup>4</sup>	R٥	$R^6$	X	Y	$\mathbb{R}^7$	R <sup>8</sup>
VIII-41-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	Н
VIII-41-2	$CH_3$	Н	Н	$CH_3$	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-41-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-41-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-41-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	OH	OH	Н	Н
VIII-41-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-41-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-41-8	$CH_3$	*	Н	*	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	H	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table VIII-42. 5

14010 1111											
Nº	$R^{1}$	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$\mathbb{R}^7$	R <sup>8</sup>
VIII-42-1	Et	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-42-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-42-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-42-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-42-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-42-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-42-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$\mathrm{CH}_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-42-8	Et	*	Н	*	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
V 111-42-0	Ŀι	-	П	•	ΒZ	П	$CH_3$	UП	UH	П	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tahl	e V	HII	_43
i adi	CV	ш	1-43.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
VIII-43-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	OH	OH	Н	Н
VIII-43-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	OH	ОН	H	Н
VIII-43-3	$^{i}$ Pr	H	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-43-4	$^{i}$ Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	H	Н
VIII-43-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	H	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-43-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-43-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-43-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## Table VIII-44.

Nº S	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VIII-44-1	'Bu	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-44-2	'Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-44-3	'Bu	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н
VIII-44-4	'Bu	H	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н
VIII-44-5	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-44-6	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н
VIII-44-7	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-44-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## 5 Table VIII-45.

No No		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
VIII-45-1	Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-45-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	H	Н
VIII-45-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	H	Н
VIII-45-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-45-5	Ph	Н	H	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-45-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-45-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-45-8	Ph	*	Н	*	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table VII	I-46.										
No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VIII-46- 1	p-Me- Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	OH	Н	Н
VIII-46- 2	p-Me- Ph	Н	Н	CH₃	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	OH	Н	Н
VIII-46- 3	p-Me- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	OH	ОН	Н	Н
VIII-46- 4	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	OH	Н	Н
VIII-46- 5	p-Me- Ph	Н	Н	CH₂Ph	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-46- 6	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-46- 7	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-46- 8	p-Me- Ph	*	Н	*	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	VIII-47	7.
N.C.	n	Г

No No		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
VIII-47-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-47-2	p-F-Ph	Н	Η,	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-47-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-47-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-47-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-47-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-47-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-47-8	p-F-Ph	*	Н	*	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## Table VIII-48

Table VIII											
№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
VIII-48-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	H
VIII-48-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-48-3	p-Cl-Ph	Н	H	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
VIII-48-4	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-48-5	p-Cl-Ph	H	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-48-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-48-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-48-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# Table VIII-49.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
VIII-49-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-49-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н
VIII-49-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-49-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-49-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-49-6	p-Br-Ph	H	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н
VIII-49-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	ОН	OH	Н	Н
VIII-49-8	p-Br-Ph	*	Н	*	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# Table VIII-50.

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
VIII-50-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	OH	Н	Н
VIII-50-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-50-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	H	CH <sub>3</sub>	ОН	OH	Н	Н
VIII-50-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	ОН	ОН	Н	Н
VIII-50-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	OH	ОН	Н	Н
VIII-50-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-50-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н
VIII-50-8	p-I-Ph	*	Н	*	Bz	Н	$CH_3$	ОН	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$$R^{3a}$$
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3a}$ 
 $R^{3a}$ 

IX

J	la	ιb	le	12	<b>X</b> -	l	
_		_	_		_	_	-

Nº		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
IX-1-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н
IX-1-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-1-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-1-4	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-1-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-1-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	H	Н
IX-1-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-1-8	$CH_3$	*	Н	*	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# 5 Table IX-2.

1 4010 1											
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
IX-2-1	Et	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-2-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-2-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н
IX-2-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-2-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-2-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	CH <sub>3</sub>	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-2-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-2-8	Et	*	Н	*	$CH_3$	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table I											
№	R¹	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
IX-3-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-3-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-3-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-3-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-3-5	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH₂Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-3-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	H	Н

IX-3-7 <sup>i</sup>Pr H H CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub> CH<sub>3</sub> H CH<sub>3</sub> F OH H H

CH<sub>3</sub> H CH<sub>3</sub> F OH H H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$\overline{}$	٦.	1 1		TTY	
	2	n	9	IX	_/!
_1	а	v		1/	

IX-3-8 <sup>1</sup>Pr \* H \*

Nº		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
IX-4-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-4-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-4-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-4-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-4-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н
IX-4-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-4-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н
IX-4-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table IX-5 5

Table 1											
N₂	R¹	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
IX-5-1	Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н
IX-5-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-5-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-5-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-5-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-5-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-5-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-5-8	Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table I											
Nº	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
IX-6-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н
IX-6-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	H
IX-6-3	p-Me-Ph	H	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-6-4	p-Me-Ph	H	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-6-5	p-Me-Ph	H	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-6-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	CH <sub>3</sub>	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-6-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-6-8	p-Me-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

1 1		TTT	$\overline{}$
าก	0	IX-	. /
 av		1/1	- 1

1 4010 12											
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
IX-7-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-7-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-7-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-7-4	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-7-6	p-F-Ph	H	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-7-7	p-F-Ph	H	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-7-8	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-7-20	p-F-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table IX-8. 5

№	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
IX-8-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-8-2	p-Cl-Ph	H	H	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-8-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-8-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-8-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н
IX-8-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-8-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-8-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table IX											
Nº	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
IX-9-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-9-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-9-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-9-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-9-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Η	Н
IX-9-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Ĥ	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-9-8	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Η	$CH_3$	F	ОН	Η	Н
IX-9-20	p-Br-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

~	4 4	YY	
10	hla	\ IV	111
1 11	1310	5 I A	. – 1 ()

№         R¹         R²         R³a         R³b         R⁴         R⁵         R⁶         X         Y         R³         R⁵           IX-10-1         p-I-Ph         H         H         H         CH₃         H         CH₃         F         OH         H         H           IX-10-2         p-I-Ph         H         H         CH₃         CH₃         H         CH₃         F         OH         H         H           IX-10-3         p-I-Ph         H         H         CH(CH₃)₂         CH₃         H         CH₃         F         OH         H         H           IX-10-4         p-I-Ph         H         H         CH₂CH(CH₃)₂         CH₃         H         CH₃         F         OH         H         H           IX-10-5         p-I-Ph         H         H         CH₂Ph         CH₃         H         CH₃         F         OH         H         H           IX-10-6         p-I-Ph         H         H         CH₂CH₂CH₂SCH₃         CH₃         H         CH₃         F         OH         H         H           IX-10-8         p-I-Ph         *         H         *         CH₃         H         CH₃ </th <th>1 4010 121</th> <th></th>	1 4010 121											
IX-10-2         p-I-Ph         H         H         CH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> H         CH <sub>3</sub> F         OH         H         H           IX-10-3         p-I-Ph         H         H         CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> H         CH <sub>3</sub> F         OH         H         H           IX-10-4         p-I-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> H         CH <sub>3</sub> F         OH         H         H           IX-10-5         p-I-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> Ph         CH <sub>3</sub> H         CH <sub>3</sub> F         OH         H         H           IX-10-6         p-I-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         CH <sub>3</sub> H         CH <sub>3</sub> F         OH         H         H           IX-10-7         p-I-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         CH <sub>3</sub> H         CH <sub>3</sub> F         OH         H         H           IX-10-7         p-I-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         CH <sub>3</sub> H         CH <sub>3</sub> F         OH         H         H           IX-10-7         p-I-Ph         H         H </th <th>№</th> <th><math>R^1</math></th> <th><math>R^2</math></th> <th><math>R^{3a}</math></th> <th><math>R^{3b}</math></th> <th><math>R^4</math></th> <th>R<sup>5</sup></th> <th><math>R^6</math></th> <th>X</th> <th>Y</th> <th><math>R^7</math></th> <th>R<sup>8</sup></th>	№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
IX-10-3         p-I-Ph         H         H         CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> H         CH <sub>3</sub> F         OH         H         H           IX-10-4         p-I-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> H         CH <sub>3</sub> F         OH         H         H           IX-10-5         p-I-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> Ph         CH <sub>3</sub> H         CH <sub>3</sub> F         OH         H         H           IX-10-6         p-I-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         CH <sub>3</sub> H         CH <sub>3</sub> F         OH         H         H           IX-10-6         p-I-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         CH <sub>3</sub> H         CH <sub>3</sub> F         OH         H         H           IX-10-7         p-I-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         CH <sub>3</sub> H         CH <sub>3</sub> F         OH         H         H           IX-10-6         p-I-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         CH <sub>3</sub> H         CH <sub>3</sub> F         OH         H         H           IX-10-10-10-10-10-10-10-10-10-10-10-10-10-	IX-10-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-10-4         p-I-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> H         CH <sub>3</sub> F         OH         H         H           IX-10-5         p-I-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> Ph         CH <sub>3</sub> H         CH <sub>3</sub> F         OH         H         H           IX-10-6         p-I-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         CH <sub>3</sub> H         CH <sub>3</sub> F         OH         H         H           IX-10-7         p-I-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> H         CH <sub>3</sub> F         OH         H         H	IX-10-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-10-5         p-I-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> Ph         CH <sub>3</sub> H         CH <sub>3</sub> F         OH         H         H           IX-10-6         p-I-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         CH <sub>3</sub> H         CH <sub>3</sub> F         OH         H         H           IX-10-7         p-I-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> H         CH <sub>3</sub> F         OH         H         H	IX-10-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$\text{CH}_3$	F	ОН	Н	Н
IX-10-6         p-I-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         CH <sub>3</sub> H         CH <sub>3</sub> F         OH         H         H           IX-10-7         p-I-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> H         CH <sub>3</sub> F         OH         H         H	IX-10-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-10-7 p-I-Ph H H CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> H CH <sub>3</sub> F OH H H	IX-10-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
•	IX-10-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$\text{CH}_3$	F	ОН	Н	Н
IX-10-8 p-I-Ph * H * CH <sub>3</sub> H CH <sub>3</sub> F OH H H	IX-10-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
	IX-10-8	p-I-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table IX-11 5

I auto in											
№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
IX-11-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	H
IX-11-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-11-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-11-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-11-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-11-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-11-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-11-8	$CH_3$	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

OD 1 1		T T 7	10
Lab	Δ	1 2	1')
Lan		IA-	12.

Nº	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
IX-12-1	Et	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н
IX-12-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н
IX-12-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-12-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-12-5	Et	Н	Н	$CH_2Ph$	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-12-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Η
IX-12-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-12-8	Et	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table IX-13.

1 4010 171											
№	R¹	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
IX-13-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н
IX-13-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-13-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-13-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-13-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	$CH_3$	F.	ОН	Н	Н
IX-13-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-13-7	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-13-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table IX-14. 5

№	$\mathbb{R}^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	$R^5$	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
IX-14-1	'Bu	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н
IX-14-2	'Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-14-3	'Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н
IX-14-4	'Bu	Н	Н	$\mathrm{CH_2CH}(\mathrm{CH_3})_2$	Et	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н
IX-14-5	'Bu	H	Н	CH₂Ph	Et	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н
IX-14-6	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	H	$CH_3$	F	OH	Н	Н
IX-14-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н
IX-14-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tah	آ ۾ا	$\mathbf{I}\mathbf{Y}_{-}$	15
1 417	10		

№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
IX-15-1	Ph	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-15-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-15-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-15-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-15-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-15-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-15-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-15-8	Ph	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## Table IX-16.

№	$\mathbb{R}^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
IX-16-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	H
IX-16-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-16-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-16-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-16-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-16-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-16-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$\mathrm{CH}_3$	F	ОН	Н	Н
IX-16-8	p-Me-Ph	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table IX-17.

1 4010 12											
№	R¹	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
IX-17-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н
IX-17-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-17-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-17-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-17-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-17-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-17-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-17-8	p-F-Ph	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

OD 1 1		T 7 7	4	$\mathbf{a}$
I ab	le.	IX-	·	8.

№	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
IX-18-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-18-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-18-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-18-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-18-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-18-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-18-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-18-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# Table IX-19.

№	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	
IX-19-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	H
IX-19-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-19-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-19-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-19-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-19-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-19-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-19-8	p-Br-Ph	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table IX-20. 5

1 4010 121											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
IX-20-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	H
IX-20-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-20-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-20-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$\text{CH}_3$	F	ОН	Н	Н
IX-20-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н
IX-20-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-20-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-20-8	p-I-Ph	*	Н	*	Et	Н	$\text{CH}_3$	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

- T			~ .
Toh	ட	ıv	′) [
Tab.	10	ıa.	-21

Nº	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
IX-21-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-21-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-21-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-21-4	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-21-5	$CH_3$	Н	Н	CH₂Ph	'Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-21-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-21-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-21-8	$CH_3$	*	Н	*	'Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table IX-22

Taule 17											
№	R¹	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
IX-22-1	Et	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-22-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-22-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-22-4	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-22-5	Et	Н	Н	CH₂Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-22-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-22-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-22-8	Et	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>36</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table IX-23.

№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
IX-23-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-23-2	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-23-3	$^{i}$ Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-23-4	$^{i}$ Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-23-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-23-6	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-23-7	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-23-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	'Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tak	۱.	IX.	24
1 210	С	17.	-24

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
IX-24-1	'Bu	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-24-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-24-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-24-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-24-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-24-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-24-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-24-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table IX-25.

Table 17											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
IX-25-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-25-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-25-3	Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-25-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-25-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-25-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-25-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-25-8	Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table IX-26.

<u>№</u>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$\mathbb{R}^7$	R <sup>8</sup>
IX-26-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-26-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н
IX-26-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н
IX-26-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-26-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-26-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-26-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-26-8	p-Me-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

7	$\Gamma_{\alpha}$	h	10	IV	7	7
	ιи	n	ıe.	IΛ	-/	

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
IX-27-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	'Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н
IX-27-2	p-F-Ph	H	H	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н
IX-27-3	p-F-Ph	H	H	$CH(CH_3)_2$	'Pr	H	CH <sub>3</sub>	F	OH	H	Н
IX-27-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	H	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-27-5	p-F-Ph	H	H	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-27-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	H	CH <sub>3</sub>	F	ОН	H	Н
IX-27-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	H	Н
IX-27-8	p-F-Ph	*	Н	*	'Pr	Н	$\text{CH}_3$	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# Table IX-28.

№	$\mathbb{R}^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
IX-28-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	'Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-28-2	p-Cl-Ph	Н	H	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-28-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-28-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	H	Н
IX-28-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	H	$CH_3$	F	ОН	H	Н
IX-28-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-28-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-28-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# 5 Table IX-29.

1 4010 111											
No	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
IX-29-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	H
IX-29-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-29-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-29-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-29-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-29-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-29-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-29-8	p-Br-Ph	*	Н	*	'Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

т	٦L.	1~ `	TV	-30
- 1	ลท	ıe	ΙX.	- 511

No	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
IX-30-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	H
IX-30-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-30-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$^{i}$ Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-30-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-30-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-30-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-30-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-30-8	p-I-Ph	*	Н	*	'Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table IX-31.

No No		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
IX-31-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	<u>H</u>
IX-31-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-31-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-31-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-31-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-31-6	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-31-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-31-8	$CH_3$	*	Н	*	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table IX-32. 5

1 4010 121											
№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
IX-32-1	Et	Н	Н	Н	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-32-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-32-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-32-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-32-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-32-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-32-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-32-8	Et	*	Н	*	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tala	۱.	IX.	22	٠
Lab	ıe	IA:	).:	١.

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
IX-33-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н
IX-33-2	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н
IX-33-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-33-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-33-5	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-33-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-33-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-33-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	"Bu	Η	$CH_3$	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table IX-34.

1 4010 121											
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
IX-34-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н
IX-34-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-34-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-34-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-34-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н
IX-34-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-34-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-34-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# 5 Table IX-35.

1 4010 121											
No	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
IX-35-1	Ph	Н	Н	Н	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	H
IX-35-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-35-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-35-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-35-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-35-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-35-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-35-8	Ph	*	Н	*	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$T_{-}I_{-}I$	ا ـ ا	137	20	-
Tabl	le -	ŀΛ-	∙3€	).

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
IX-36-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н
IX-36-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н
IX-36-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-36-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-36-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-36-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н
IX-36-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-36-8	p-Me-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table IX-37.

14010 123											
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	$R^5$	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
IX-37-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-37-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н
IX-37-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-37-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н
IX-37-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-37-6	p-F-Ph	Η	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Ħ	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-37-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-37-8	p-F-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table IX-38.

1 4010 125											
№	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
IX-38-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-38-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н
IX-38-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-38-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-38-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-38-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-38-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-38-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	H	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

7	Γah	ا ما	IX.	.39.
	111)			. 17.

No No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
IX-39-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-39-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-39-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	H	$CH_3$	F	OH	Н	Н
IX-39-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-39-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-39-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-39-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-39-8	p-Br-Ph	*	Н	*	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$T_{2}$	hle	IY	-40
- 1 2		. 1 ^	

1 4010 171											
№	$\mathbb{R}^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
IX-40-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-40-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-40-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-40-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-40-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-40-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-40-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-40-8	p-I-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table IX-41.

No No		<b>p</b> 2	<b>D</b> 3a	D3p	<b>D</b> <sup>4</sup>	<b>p</b> 5	R <sup>6</sup>	v	V	$\mathbf{p}^7$	D8
745	K	K	K	K	К	K	K	Λ	I	K	K
IX-41-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	H
IX-41-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-41-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-41-4	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-41-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-41-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н
IX-41-7	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-41-8	$CH_3$	*	Н	*	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Та	hle	IX.	.42

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
IX-42-1	Et	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	H
IX-42-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	OH	H	Н
IX-42-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	H
IX-42-4	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-42-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-42-6	Et	Н	H	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-42-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-42-8	Et	*	H	*	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$T_{\Delta}$	h	i_	ĭν	12
13	n	ıe	ΙX	-4 1

I auto IA											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
IX-43-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н				CH <sub>3</sub>				_
IX-43-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Ħ
IX-43-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н
IX-43-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-43-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-43-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н
IX-43-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-43-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Bz	H	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н

10 \*R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table IX-44

1 4010 17											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	$R^8$
IX-44-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	H
IX-44-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н
IX-44-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н
IX-44-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н
IX-44-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н
IX-44-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-44-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-44-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	IX-45.

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
IX-45-1	Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-45-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н
IX-45-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-45-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-45-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	H	Н
IX-45-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-45-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-45-8	Ph	*	Н	*	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table IX-46.

№       R¹       R²       R³a       R³b       R⁴       R⁵       R⁶       X       Y       R⁷       R⁷         IX-46-1       p-Me-Ph       H       H       H       H       Bz       H       CH₃       F       OH       H       H         IX-46-2       p-Me-Ph       H       H       CH₃       Bz       H       CH₃       F       OH       H       H         IX-46-3       p-Me-Ph       H       H       CH₂CH(CH₃)₂       Bz       H       CH₃       F       OH       H       H         IX-46-5       p-Me-Ph       H       H       CH₂Ph       Bz       H       CH₃       F       OH       H       H         IX-46-6       p-Me-Ph       H       H       CH₂-indol-3-yl       Bz       H       CH₃       F       OH       H       H         IX-46-7       p-Me-Ph       H       H       CH₂-CH₂SCH₃       Bz       H       CH₃       F       OH       H       H	1 4010 171											
IX-46-2         p-Me-Ph         H         H         CH <sub>3</sub> Bz         H         CH <sub>3</sub> F         OH         H         H           IX-46-3         p-Me-Ph         H         H         CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> Bz         H         CH <sub>3</sub> F         OH         H         H           IX-46-4         p-Me-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> Bz         H         CH <sub>3</sub> F         OH         H         H           IX-46-5         p-Me-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         Bz         H         CH <sub>3</sub> F         OH         H         H           IX-46-6         p-Me-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         Bz         H         CH <sub>3</sub> F         OH         H         H	№	$\mathbb{R}^1$	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	$R^5$	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
IX-46-3       p-Me-Ph       H       H $CH(CH_3)_2$ Bz       H $CH_3$ F       OH       H       H         IX-46-4       p-Me-Ph       H       H $CH_2CH(CH_3)_2$ Bz       H $CH_3$ F       OH       H       H         IX-46-5       p-Me-Ph       H       H $CH_2$ -indol-3-yl       Bz       H $CH_3$ F       OH       H       H         IX-46-6       p-Me-Ph       H       H $CH_2$ -indol-3-yl       Bz       H $CH_3$ F       OH       H       H	IX-46-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-46-4 p-Me-Ph H H $H$ CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> Bz H CH <sub>3</sub> F OH H H IX-46-5 p-Me-Ph H H CH <sub>2</sub> Ph Bz H CH <sub>3</sub> F OH H H IX-46-6 p-Me-Ph H H CH <sub>2</sub> -indol-3-yl Bz H CH <sub>3</sub> F OH H H	IX-46-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-46-5 p-Me-Ph H H CH <sub>2</sub> Ph Bz H CH <sub>3</sub> F OH H H IX-46-6 p-Me-Ph H H CH <sub>2</sub> -indol-3-yl Bz H CH <sub>3</sub> F OH H H	IX-46-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-46-6 p-Me-Ph H H CH <sub>2</sub> -indol-3-yl Bz H CH <sub>3</sub> F OH H H	IX-46-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
•	IX-46-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-46-7 n-Me-Ph H H CH2CH2SCH2 Bz H CH2 F OH H H	IX-46-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
	IX-46-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-46-8 p-Me-Ph * H * Bz H CH <sub>3</sub> F OH H H	IX-46-8	p-Me-Ph	*	Н	*	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table IX-47.

1 4010 121											
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	$R^5$	R <sup>6</sup>	X	Y	$\mathbf{R}^7$	R <sup>8</sup>
IX-47-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	H
IX-47-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-47-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	H	$CH_3$	F	OH	Н	Н
IX-47-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-47-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-47-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-47-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-47-8	p-F-Ph	*	Н	*	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

٦	Γa	h	ے	IY	-48	•
	_			1 ^	-40	٠.

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
IX-48-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н
IX-48-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-48-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н
IX-48-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-48-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н
IX-48-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-48-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н
IX-48-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tabl	le IX-4	19.

	4010 171											
$N_{\underline{0}}$	2	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
IX	K-49-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX	<b>X-49-2</b>	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н
IX	<b>ζ-49-3</b>	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX	<b>K-49-4</b>	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX	<b>K-49-5</b>	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	F	OH	Н	Н
IX	<b>K-49-6</b>	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX	ζ-49-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IJ	<b>ζ-49-8</b>	p-Br-Ph	*	Н	*	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table IX-50.

1 4010 171											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
IX-50-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	Н	Н
IX-50-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-50-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-50-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-50-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН	Н	Н
IX-50-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-50-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н
IX-50-8	p-I-Ph	*	Н	*	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$$R^{3a} \xrightarrow{R^{3b}} N \xrightarrow{R^2} O \xrightarrow{Q} O \xrightarrow{R^7} N \xrightarrow{N} O$$

 $\mathbf{X}$ 

Table.											
Nº	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	$R^5$	$R^6$	X	Y	$R^7$	$R^8$
X-1-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-1-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	OH	Н	Н
X-1-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	OH	Н	Н
X-1-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-1-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-1-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-1-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-1-8	$CH_3$	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### 5 Table X-2.

Table A-2.												
	№	R¹	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
	X-2-1	Et	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	Н
	X-2-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н
	X-2-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н
	X-2-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	Н
	X-2-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н
	X-2-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н
	X-2-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н
	X-2-8	Et	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	X-3.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
X-3-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-3-2	<sup>i</sup> Pr	Н	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-3-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-3-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-3-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-3-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-3-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-3-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

П	Га	h	ما	Υ.	7_4
	- 71				

Table											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
X-4-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	OH	Н	Н
X-4-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-4-3	'Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-4-4	'Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-4-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-4-6	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-4-7	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-4-8	'Bu	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table X-5. 5

Table .											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	$R^5$	$R^6$	X	Y	$R^7$	$R^8$
X-5-1	Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	OH	Н	Н
X-5-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-5-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-5-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-5-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-5-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-5-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-5-8	Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

_	r_1.	۱.	7.7	_
	lah	-	- X -	.n

1 4010											
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
X-6-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-6-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-6-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-6-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-6-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH₂Ph	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-6-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-6-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-6-8	p-Me-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tr 1 1		<b>T</b> 7	$\overline{}$
Tab!	9	Υ.	-7
I au	·	/X-	- /

Table A											
Nº	$R^{I}$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
X-7-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	H
X-7-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	H
X-7-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-7-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-7-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	H	F	F	ОН	Н	Н
X-7-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-7-8	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-7-20	p-F-Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## 5 Table X-8.

Table											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	$R^8$
X-8-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-8-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	H
X-8-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-8-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	H
X-8-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	H
X-8-6	p-Cl-Ph	Н	Η	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-8-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-8-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

00 1 1		* 7	$\sim$
Tah.	Δ	· Y .	_U
Tabl	ı	$\Delta$	· 7 .

										-	
№	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	R3a	R <sup>36</sup>	R⁴	R³	Rº	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
X-9-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	OH	Н	Н
X-9-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	H	F	F	OH	H	Н
X-9-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	OH	Н	Н
X-9-4	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-9-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH₂Ph	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-9-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-9-8	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-9-20	p-Br-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

00 1 1		~ 7	•	$\sim$
Tab!	Δ	- Y		11
I au	·	_A-	Ι.	υ

No No		R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
X-10-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	H
	-			CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-10-3	p-I-Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-10-4	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-10-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-10-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-10-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-10-8	p-I-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table X-11.

1 4010 21											
№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
X-11-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	OH	Н	Н
X-11-2	$CH_3$	Н	H	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-11-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-11-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-11-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-11-6	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-11-7	$CH_3$	Н	Н	CH₂CH₂SCH₃	Et	Н	F	F	OH	Н	Н
X-11-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Т	ab	le	<b>Y</b> .	1	2
	an	יטו	Λ-	. I	<b>∠</b> .

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
X-12-1	Et	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-12-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-12-3	Et	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-12-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-12-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-12-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-12-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-12-8	Et	*	Н	*	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table X-13.

No No		$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
X-13-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-13-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-13-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-13-4	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-13-5	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-13-6	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-13-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-13-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table X-14

1 able X											
№	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	R	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
			3a								
X-14-1	'Bu	H	H	H	Et	Н	F	F	OH	Η	Н
X-14-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН	Η	Н
X-14-3	'Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-14-4	'Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	ОН	Η	Н
X-14-5	'Bu	H	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-14-6	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	F	OH	Н	Н
X-14-7	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН	H	Н
X-14-8	'Bu	*	Н	*	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$T_{\alpha}$	L	۱,	$\mathbf{v}$	1	5
- 12	ıhi	e	Х-		`

Nº	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
X-15-1	Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-15-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	OH	Н	Н
X-15-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-15-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-15-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	F	ОН	H	Н
X-15-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	F	ОН	H	Н
X-15-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-15-8	Ph	*	Н	*	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table X-16.

Mo	R <sup>1</sup>	<b>D</b> <sup>2</sup>	<b>D</b> 3a	D 3b	$\mathbf{p}^4$	D <sup>5</sup>	D6	Y	Y	$\mathbf{p}^7$	D8
745	K	K	K	K	K	1	IX.	Λ	1	K	IX.
X-16-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-16-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-16-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Η	F	F	ОН	Н	Н
X-16-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-16-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-16-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-16-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-16-8	p-Me-Ph	*	Н	*	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# Table X-17.

1 4010 11											
No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
X-17-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	ОН	Н	H
X-17-2	p-F-Ph	H	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-17-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	OH	Н	Н
X-17-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-17-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	F	OH	Н	Н
X-17-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-17-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-17-8	p-F-Ph	*	Н	*	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
X-18-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-18-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-18-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-18-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-18-5	p-Cl-Ph	H	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-18-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-18-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-18-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table X-19

rable 2											
Nº	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup> .	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
X-19-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-19-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-19-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-19-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-19-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH₂Ph	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-19-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-19-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-19-8	p-Br-Ph	*	Н	*	Et	Н	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table X-20.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$
X-20-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	ОН	Н
X-20-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН	Н
X-20-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	ОН	Н
X-20-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	ОН	Н
X-20-5	p-I-Ph	Н	Н	CH₂Ph	Et	Н	F	F	ОН	Н
X-20-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	F	ОН	Н
X-20-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН	Н
X-20-8	p-I-Ph	*	Н	*	Et	Н	F	F	ОН	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

T	h	٦	$\mathbf{v}$	21	ŀ
12	ın	æ	х.	- /.	١.

No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
X-21-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-21-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-21-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-21-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-21-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-21-6	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-21-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-21-8	$CH_3$	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table X-22

1 auto A	-22.										
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
X-22-1	Et	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-22-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-22-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-22-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-22-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-22-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-22-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$^{i}$ Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-22-8	Et	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# 5 Table X-23.

№	R¹	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
X-23-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-23-2	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-23-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-23-4	$^{i}$ Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-23-5	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-23-6	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-23-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-23-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

an a	1 .		37	0.4	
- 1 2	ì١	le.	х.	-24	

140101											
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
X-24-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-24-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-24-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-24-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-24-5	<sup>t</sup> Bu	Н	H	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-24-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-24-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-24-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table X-25.

1 4010 11											
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	$R^5$	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
X-25-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH	Н	Н
X-25-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-25-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-25-4	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-25-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	H
X-25-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-25-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-25-8	Ph	*	Н	*	'Pr	H	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table X-26. 5

№	R <sup>1</sup>	$\mathbb{R}^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$\mathbb{R}^7$	R <sup>8</sup>
X-26-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-26-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH	Н	Н
X-26-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-26-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-26-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-26-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-26-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-26-8	p-Me-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

OP 1 1		37	$\sim$	,
Tab	le.	х.	-7.1	

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
X-27-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-27-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-27-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-27-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-27-5	p-F-Ph	Н	Н	CH₂Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-27-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-27-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-27-8	p-F-Ph	*	Н	*	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table X-28

1 able A											
No	$\mathbb{R}^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
X-28-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	H
X-28-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Η	F	F	ОН	Н	Н
X-28-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-28-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-28-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-28-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-28-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-28-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table X-29.

№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
X-29-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-29-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-29-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-29-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-29-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-29-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-29-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-29-8	p-Br-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table X											
№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
X-30-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-30-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH	Н	Н
X-30-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-30-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-30-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	F	F	ОН	Н	H
X-30-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	Н	Н

X-30-7 p-I-Ph H H CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub> <sup>i</sup>Pr H F F OH H H

Pr H F F OH H H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

<b>7D</b> 1	1	* 7	$^{\circ}$	
Tab	ne	х.	- 3 I	

**X-30-8** p-I-Ph \* H

No No	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
X-31-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH	Н	Н
X-31-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	H
X-31-3	$CH_3$	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-31-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-31-5	$CH_3$	Н	Н	CH₂Ph	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-31-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	H
X-31-7	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-31-8	$CH_3$	*	Н	*	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table X-32. 5

No	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
X-32-1	Et	H	H	Н	"Bu	Н	F	F	OH	Н	Н
X-32-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-32-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-32-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	H	Н
X-32-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-32-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-32-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	H
X-32-8	Et	*	Н	*	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

٦	$\Gamma_{\alpha}$	h	م1	X.	.2	2	
	ıи	n	œ	Α.	- I	1	

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
X-33-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-33-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-33-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH	Н	Н
X-33-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-33-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	H	Н
X-33-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-33-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	H	F	F	ОН	Н	Н
X-33-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table X-34

I auto A											
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
X-34-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-34-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH	Н	Н
X-34-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-34-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-34-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-34-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-34-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-34-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	"Bu	Н	F	F	ОН	H	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table X-35. 5

No	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
X-35-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-35-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-35-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-35-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-35-5	Ph	Н	Н	CH₂Ph	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-35-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-35-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-35-8	Ph	*	Н	*	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table X											
Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
X-36-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH	Н	Н
X-36-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	OH	Η	Н
X-36-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH	Н	Н
X-36-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-36-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-36-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	F	OH	Н	Н
X-36-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-36-8	p-Me-Ph	*	Н	*	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tab	1	37	$\sim -$	
เฉก	ıA	Χ.	_ 4 /	
1 au	ı	ZX-		

<u>No</u>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
X-37-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-37-2	p-F-Ph	Н	H	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-37-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-37-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	H	Н
X-37-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-37-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-37-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-37-8	p-F-Ph	*	Н	*	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table X-38.

1001011											
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
X-38-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-38-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH	Н	Н
X-38-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	H	F	F	ОН	Н	Н
X-38-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-38-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-38-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	F	OH	Н	Н
X-38-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-38-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	H	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tabl	le	Х-	3	9	
Iau		/ X =	J	_	۰

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
X-39-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-39-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-39-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-39-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-39-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-39-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-39-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-39-8	p-Br-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## Table X-40.

14010 21	$R^1$	<b>D</b> 2	D 3a	To 3b	D4	D.5	<b>D</b> 6	3.7	Y	<b>D</b> 7	D8
No	K.	K <sup>2</sup>	R	R	K.	K'	K*	Х	Y	K.	K-
X-40-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-40-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-40-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-40-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-40-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-40-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	F	OH	Н	Н
X-40-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-40-8	p-I-Ph	*	H	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table X-41. 5

№	R¹	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R°	R°	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
X-41-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-41-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	OH	Н	Н
X-41-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-41-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	OH	Н	H
X-41-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-41-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-41-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-41-8	$CH_3$	*	Н	*	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tal	ole	X-	42.

1 4010 23											
Nº	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
X-42-1	Et	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	OH	Н	Н
X-42-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-42-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-42-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-42-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-42-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-42-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-42-8	Et	*	Н	*	Bz	H	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Ta	1 1		37	40
1 2	nı	ρ.	х.	-4.4
14	. L / L	•	/1.	-TJ

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
X-43-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-43-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН	Н	ħ
X-43-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-43-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-43-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-43-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Η	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-43-7	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-43-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н

10 \*R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table X-44.

Table A											
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	$R^8$
X-44-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-44-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН	Н	H
X-44-3	'Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	OH	Н	Н
X-44-4	'Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-44-5	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-44-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-44-7	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-44-8	'Bu	*	Н	*	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table X											
No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
X-45-1	Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-45-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-45-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-45-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	H	F	F	ОН	H	Н
X-45-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н

X-45-6 Ph H H CH<sub>2</sub>-indol-3-yl Bz H F F OH H H X-45-7 Ph H H CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub> Bz H F F OH H H X-45-8 Ph \* H \* Bz H F F OH H H

7	ο-	1. 1	1 _	37	4	-
	1 71	n	œ	х	-4	n.

1 4010 2											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
X-46-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-46-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-46-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-46-4	p-Me-Ph	H	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-46-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-46-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-46-7	p-Me-Ph	Н	H	CH₂CH₂SCH₃	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-46-8	p-Me-Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# 5 Table X-47.

<u>No</u>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
X-47-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	OH	Н	Н
X-47-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	OH	Н	Н
X-47-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-47-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-47-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-47-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-47-7	p-F-Ph	H	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-47-8	p-F-Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table X-48

1 4010	ZX-TU.										
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>

2983472-1

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

№	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
X-48-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	OH	Н	Н
X-48-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	OH	Н	H
X-48-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-48-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-48-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-48-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-48-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-48-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

TO.	1	1	37	40	
12	าก	ıe.	Х.	-49	

№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
X-49-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-49-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-49-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН	H	Н
X-49-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-49-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-49-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-49-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-49-8	p-Br-Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table X-50.

1401017											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
X-50-1	p-I-Ph	H	Н	Н	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-50-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-50-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-50-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	OH	Н	Н
X-50-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-50-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-50-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н
X-50-8	p-I-Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	F	ОН	Н	Н

<sup>5 \*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$$R^{3a}$$
  $R^{2}$   $R^{2}$   $R^{2}$   $R^{3a}$   $R^{3$ 

XI

Table X											
№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XI-1-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-1-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-1-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-1-4	$\text{CH}_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-1-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-1-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-1-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-1-8	$CH_3$	*	Н	*	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

_	Table	<b>VI</b> 2
7	Tanie	X 1-/

14010 1											
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XI-2-1	Et	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-2-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-2-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-2-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$\text{CH}_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-2-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-2-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-2-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-2-8	Et	*	Н	*	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

2983472-1

Docket No. 60137.0034WOU1

Table X											
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°
XI-3-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-3-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	OH	Н	H
XI-3-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-3-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-3-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	H	Н
XI-3-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-3-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-3-8	$^{i}$ Pr	*	Н	*	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table Y	Ι <b>-</b> 4.										
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	R٥	X	Y	R'	R°
XI-4-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-4-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-4-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-4-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	OH	H	Н
XI-4-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-4-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-4-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-4-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table	XI-5.

Table A										- 7	- 0
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>3</sup>	Rº	X	Y	R'	R°
XI-5-1	Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-5-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-5-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	H
XI-5-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-5-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-5-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	H
XI-5-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-5-8	Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table 3											
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$\mathbf{R}^7$	R <sup>8</sup>
XI-6-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-6-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-6-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-6-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-6-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-6-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-6-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-6-8	p-Me-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XI											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XI-7-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-7-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	H	Н	F	ОН	Н	Н
XI-7-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-7-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-7-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	H	Н	F	ОН	Н	Н
XI-7-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-7-8	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-7-20	p-F-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	H	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table	VIQ

Table A											
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XI-8-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-8-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	H	Н	F	ОН	Н	Н
XI-8-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	OH	Н	H
XI-8-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	<b>F</b> .	ОН	Н	Н
XI-8-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-8-6	p-Cl-Ph	Н	H	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-8-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-8-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table X											
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XI-9-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-9-2	p-Br-Ph	Н	H	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-9-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	H
XI-9-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-9-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-9-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-9-8	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-9-20	p-Br-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table X											
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XI-10-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-10-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-10-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-10-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-10-5	p-I-Ph	Н	Н	CH₂Ph	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	H
XI-10-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-10-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-10-8	p-I-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

_	T-1-1-	XI-11
_	Fanie	: XI-II

Table Al											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XI-11-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-11-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-11-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-11-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	ОН	H	H
XI-11-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-11-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	Н	F	ОН	Н	H
XI-11-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН	Н	H
XI-11-8	$CH_3$	*	Н	*	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	IX e	-12
1 aun	<i>-</i> / X.I.	-12,

№       R¹       R²       R³a       R³b       R⁴       R⁵       R⁶       X       Y       R³       R³         XI-12-1       Et       H       H       H       H       Et       H       H       F       OH       H       H         XI-12-2       Et       H       H       CH₃       Et       H       H       F       OH       H       H         XI-12-3       Et       H       H       CH₂CH(CH₃)₂       Et       H       H       F       OH       H       H         XI-12-4       Et       H       H       CH₂CH(CH₃)₂       Et       H       H       F       OH       H       H         XI-12-5       Et       H       H       CH₂CH₂CH₂       Et       H       H       F       OH       H       H         XI-12-6       Et       H       H       CH₂CH₂CH₂SCH₃       Et       H       H       F       OH       H       H         XI-12-8       Et       *       H       *       Et       H       H       F       OH       H       H	Table Al											
XI-12-2         Et         H         H         CH <sub>3</sub> Et         H         H         F         OH         H         H           XI-12-3         Et         H         H         CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> Et         H         H         F         OH         H         H           XI-12-4         Et         H         H         CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> Et         H         H         F         OH         H         H           XI-12-5         Et         H         H         CH <sub>2</sub> Ph         Et         H         H         F         OH         H         H           XI-12-6         Et         H         H         CH <sub>2</sub> cH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> Et         H         H         F         OH         H         H	№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XI-12-3       Et       H       H       CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> Et       H       H       F       OH       H       H         XI-12-4       Et       H       H       CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> Et       H       H       F       OH       H       H         XI-12-5       Et       H       H       CH <sub>2</sub> Ph       Et       H       H       F       OH       H       H         XI-12-6       Et       H       H       CH <sub>2</sub> cH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> Et       H       H       F       OH       H       H         XI-12-7       Et       H       H       CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> Et       H       H       F       OH       H       H	XI-12-1	Et	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-12-4       Et       H       H $CH_2CH(CH_3)_2$ Et       H       H       F       OH       H       H         XI-12-5       Et       H       H $CH_2Ph$ Et       H       H       F       OH       H       H         XI-12-6       Et       H       H $CH_2-indol-3-yl$ Et       H       H       F       OH       H       H         XI-12-7       Et       H       H $CH_2CH_2SCH_3$ Et       H       H       F       OH       H       H	XI-12-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-12-5 Et H H CH <sub>2</sub> Ph Et H H F OH H H $\times$ XI-12-6 Et H H $\times$ CH <sub>2</sub> -indol-3-yl Et H H F OH H H XI-12-7 Et H H CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> Et H H F OH H H	XI-12-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-12-6 Et H H CH <sub>2</sub> -indol-3-yl Et H H F OH H H XI-12-7 Et H H CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> Et H H F OH H H	XI-12-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-12-7 Et H H CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> Et H H F OH H H	XI-12-5	Et	Н	Н	CH₂Ph	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н
	XI-12-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н
<b>XI-12-8</b> Et * H * Et H H F OH H H	XI-12-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н
	XI-12-8	Et	*	Н	*	Et	Н	Н	F	ОН	Н	H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tah	la	$\mathbf{v}$	[1	12

Table A											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$\mathbf{R}'$	R <sup>8</sup>
XI-13-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-13-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-13-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-13-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-13-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-13-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-13-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-13-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XI-14. 5

14010 711 111											
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XI-14-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-14-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-14-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-14-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-14-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-14-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-14-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	OH	H	Н
XI-14-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Et	Н	Н	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$T_{\alpha}$	hl	٠,	ZΤ_	1	5
Iа	ble	5 /	<b>\ I</b> -		.).

				~1		- 2					
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R3	R°	X	Y		
XI-15-1	Ph	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-15-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-15-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-15-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-15-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-15-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-15-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН	H	Н
XI-15-8	Ph	*	Н	*	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

7	Га	h	م1	X	<b>[</b> _1	6
	ıи	11		_	-	

Table Al											
No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XI-16-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-16-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-16-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-16-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-16-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-16-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-16-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-16-8	p-Me-Ph	*	Н	*	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XI-17. 5

№	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XI-17-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-17-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-17-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-17-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	OH	Н	$\mathbf{H}_{\cdot}$
XI-17-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-17-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-17-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-17-8	p-F-Ph	*	Н	*	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XI-18.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$											
№	R¹	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XI-18-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-18-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-18-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-18-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-18-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-18-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-18-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-18-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XI-19.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$											
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XI-19-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-19-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-19-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-19-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-19-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	H	F	ОН	Н	Н
XI-19-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-19-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-19-8	p-Br-Ph	*	Н	*	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table XI-20.
J	1 4010 711 20.

14010 711											
No	$R^1$	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R⁴	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XI-20-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-20-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-20-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-20-4	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-20-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-20-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-20-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-20-8	p-I-Ph	*	Н	*	Et	Н	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	XI-2.1	

Table Al											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
XI-21-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-21-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-21-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-21-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-21-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-21-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Η	Н
XI-21-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-21-8	$CH_3$	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tab	16	XI	-22
i au	ľ	$\Lambda$ 1	-44

I auto A											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	$R^5$	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XI-22-1	Et	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-22-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	Н	Н	F	ОН	Н	H
XI-22-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-22-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-22-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-22-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$^{i}$ Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-22-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-22-8	Et	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table XI-23.

1 4010 711											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XI-23-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	'Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-23-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-23-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-23-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-23-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$^{i}$ Pr.	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-23-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-23-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-23-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	'Pr	Н	Н	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	XI-24
No	$R^1$

14010 733											- 0
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R۶	R	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
XI-24-1	'Bu	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-24-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-24-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-24-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-24-5	<sup>t</sup> Bu	Ή	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-24-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	H	Н
XI-24-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-24-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

OD 1 1		TYT	~ ~	
Tab!	0	ΧI	_/\	
1 au		<b>∠X</b> I	-20	•

Table Al											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XI-25-1	Ph	Н	Н	Н	'Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-25-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-25-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-25-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$^{i}$ Pr	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-25-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-25-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-25-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-25-8	Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	Η	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table XI-26.

1 4010 1 1				A1							0
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R⁴	R³	R <sup>δ</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
XI-26-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-26-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-26-3	p-Me-Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-26-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-26-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-26-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Η.
XI-26-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-26-8	p-Me-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

on 1 :		<b>471</b>	~~
Tah	l۵	ΧI	-27

Nº	$\mathbb{R}^1$	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XI-27-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	'Pr	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-27-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-27-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Η	Η	F	OH	Н	Н
XI-27-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-27-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH	Η	Н
XI-27-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-27-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-27-8	p-F-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

•	$\Gamma_{\sim}$	ᆸ	۱.	V	[-28
	ι и	гъ	-		I = / A

Table A.											
№	$\mathbb{R}^1$	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XI-28-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH	Н	H
XI-28-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-28-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Η
XI-28-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-28-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH₂Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-28-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-28-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-28-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	'Pr	Н	Н	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# 5 Table XI-29.

$\mathbb{R}^1$	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$\mathbf{R}^{7}$	R <sup>8</sup>
p-Br-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH	Н	Н
p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH	Н	Н
p-Br-Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н
p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Η
p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н
p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н
p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н
p-Br-Ph	*	Н	*	'Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н
	p-Br-Ph p-Br-Ph p-Br-Ph p-Br-Ph p-Br-Ph p-Br-Ph	p-Br-Ph H p-Br-Ph H p-Br-Ph H p-Br-Ph H p-Br-Ph H p-Br-Ph H	p-Br-Ph H H	p-Br-Ph H H CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> p-Br-Ph H H CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> p-Br-Ph H H CH <sub>2</sub> Ph p-Br-Ph H H CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	p-Br-Ph         H         H         H         'Pr           p-Br-Ph         H         H         CH <sub>3</sub> 'Pr           p-Br-Ph         H         H         CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> 'Pr           p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> 'Pr           p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> Ph         'Pr           p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         'Pr           p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> 'Pr	p-Br-Ph         H         H         H         H         Pr         H           p-Br-Ph         H         H         CH <sub>3</sub> Pr         H           p-Br-Ph         H         H         CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> Pr         H           p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> Pr         H           p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> Ph         Pr         H           p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         Pr         H           p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> Pr         H	p-Br-Ph         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H </th <th>p-Br-Ph         H         H         H         H         F           p-Br-Ph         H         H         CH<sub>3</sub>         'Pr         H         H         F           p-Br-Ph         H         H         CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>         'Pr         H         H         F           p-Br-Ph         H         H         CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>         'Pr         H         H         F           p-Br-Ph         H         H         CH<sub>2</sub>-indol-3-yl         'Pr         H         H         F           p-Br-Ph         H         H         CH<sub>2</sub>-indol-3-yl         'Pr         H         H         F           p-Br-Ph         H         H         CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>         'Pr         H         H         F</th> <th>p-Br-Ph H H H CH<sub>3</sub> 'Pr H H F OH p-Br-Ph H H CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> 'Pr H H F OH p-Br-Ph H H CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> 'Pr H H F OH p-Br-Ph H H CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> 'Pr H H F OH p-Br-Ph H H CH<sub>2</sub>-indol-3-yl 'Pr H H F OH p-Br-Ph H H CH<sub>2</sub>-indol-3-yl 'Pr H H F OH p-Br-Ph H H CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub> 'Pr H H F OH</th> <th>p-Br-Ph         H         H         H         H         F         OH         H           p-Br-Ph         H         H         CH<sub>3</sub>         Pr         H         H         F         OH         H           p-Br-Ph         H         H         CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>         Pr         H         H         F         OH         H           p-Br-Ph         H         H         CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>         Pr         H         H         F         OH         H           p-Br-Ph         H         H         CH<sub>2</sub>-indol-3-yl         Pr         H         H         F         OH         H           p-Br-Ph         H         H         CH<sub>2</sub>-indol-3-yl         Pr         H         H         F         OH         H           p-Br-Ph         H         H         CH<sub>2</sub>-indol-3-yl         Pr         H         H         F         OH         H</th>	p-Br-Ph         H         H         H         H         F           p-Br-Ph         H         H         CH <sub>3</sub> 'Pr         H         H         F           p-Br-Ph         H         H         CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> 'Pr         H         H         F           p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> 'Pr         H         H         F           p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         'Pr         H         H         F           p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         'Pr         H         H         F           p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> 'Pr         H         H         F	p-Br-Ph H H H CH <sub>3</sub> 'Pr H H F OH p-Br-Ph H H CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> 'Pr H H F OH p-Br-Ph H H CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> 'Pr H H F OH p-Br-Ph H H CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> 'Pr H H F OH p-Br-Ph H H CH <sub>2</sub> -indol-3-yl 'Pr H H F OH p-Br-Ph H H CH <sub>2</sub> -indol-3-yl 'Pr H H F OH p-Br-Ph H H CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> 'Pr H H F OH	p-Br-Ph         H         H         H         H         F         OH         H           p-Br-Ph         H         H         CH <sub>3</sub> Pr         H         H         F         OH         H           p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> Pr         H         H         F         OH         H           p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> Pr         H         H         F         OH         H           p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         Pr         H         H         F         OH         H           p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         Pr         H         H         F         OH         H           p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         Pr         H         H         F         OH         H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

1 4010 711											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XI-30-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-30-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-30-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	H	F	ОН	Н	Н
XI-30-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	H	Н	F	OH	Н	Н
XI-30-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-30-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-30-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-30-8	p-I-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

<b>Table</b>	VI	2 1	
Table	$\Delta \mathbf{J}$	-51	

Table Al											
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XI-31-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	"Bu	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-31-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-31-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH	Н	Н.
XI-31-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Η	Н	F	OH	Н	Н
XI-31-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-31-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-31-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-31-8	$CH_3$	*	Н	*	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### 5 Table XI-32.

1 4010 711											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XI-32-1	Et	Н	Н	Н	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-32-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-32-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-32-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-32-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-32-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-32-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-32-8	Et	*	Н	*	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Η Η

OH H H

ОН Н

ОН Н

Η

Η F

Η

<sup>n</sup>Bu H

<sup>n</sup>Bu H

R<sup>8</sup> Н

Η Η

Η

Η

**XI-33-8** <sup>i</sup>Pr \*

Table X										
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$
XI-33-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH	Н
XI-33-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	Н	F	OH	Н
XI-33-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н
XI-33-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н
XI-33-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н

XI-33-6 <sup>i</sup>Pr H H CH<sub>2</sub>-indol-3-yl <sup>n</sup>Bu H

XI-33-7 <sup>i</sup>Pr H H CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table X											
Nº	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XI-34-1	'Bu	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-34-2	'Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-34-3	'Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-34-4	'Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-34-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-34-6	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-34-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-34-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table XI-35.

1 4010 711											
No	$R^{1}$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XI-35-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-35-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-35-3	Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-35-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-35-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-35-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-35-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-35-8	Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table X											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XI-36-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-36-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	H
XI-36-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-36-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-36-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-36-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-36-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-36-8	p-Me-Ph	*	Н	*	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tab	l۵	$\mathbf{X}$	1_3	7
1 41)		$\Delta$	- 1	•

Table 71											o
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
XI-37-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-37-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-37-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	OH	Н	H
XI-37-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-37-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-37-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-37-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-37-8	p-F-Ph	*	Н	*	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XI-38. 5

Table A										<u>-</u>	
Nº	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XI-38-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-38-2	p-Cl-Ph	Н	Ή	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-38-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-38-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-38-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-38-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-38-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-38-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	XI-39.

Table Al					,						
No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
XI-39-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-39-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-39-3	p-Br-Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Η	Н
XI-39-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-39-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-39-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-39-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-39-8	p-Br-Ph	*	Н	*	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tab	م1	Y	r_4∩
1 aD	ı	Λ	I=4W.

Table Al											
Nº	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XI-40-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-40-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-40-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-40-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-40-5	p-I-Ph	Н	Н	CH₂Ph	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-40-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-40-7	p-I-Ph	Н	Н	CH₂CH₂SCH₃	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-40-8	p-I-Ph	*	Н	*	"Bu	Н	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XI-41 5

1 4010 711											
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
XI-41-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-41-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-41-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-41-4	$\mathrm{CH}_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-41-5	$CH_3$	Н	Н	CH₂Ph	Bz	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-41-6	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-41-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-41-8	$CH_3$	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

XI-42-8 Et \*

Н

Table X											
№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XI-42-1	Et	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-42-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-42-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-42-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-42-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	H	Н	F	ОН	Н	Н
XI-42-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	H
XI-42-7	Et	Н	Н	CH₂CH₂SCH₃	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Bz H H F OH H

Table X	Table XI-43.										
№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XI-43-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-43-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Á
XI-43-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-43-4	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-43-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-43-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-43-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-43-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н

10 \*R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table X											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XI-44-1	'Bu	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-44-2	'Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-44-3	'Bu	Н	H	$CH(CH_3)_2$	Bz	Η	Н	F	OH	Н	H
XI-44-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-44-5	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-44-6	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-44-7	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-44-8	'Bu	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

_	1 1	E	371	
a	n	$\boldsymbol{\Delta}$	×	[-45
ıa			Z\.	-72

1 4010 711											
№	R¹	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XI-45-1	Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-45-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	H	Н	F	OH	Η .	Н
XI-45-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	OH	H	Н
XI-45-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	ОН	H	Н
XI-45-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	Н	F	OH	H	Н
XI-45-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	Н	F	ОН	H	Н
XI-45-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-45-8	Ph	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

T-1-	1.	373	r 11	
Tah	10	X	1_46	٦

1 4010 713				21	- 4	-				7	
№	$\mathbb{R}^1$	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	R <sup>36</sup>	R <sup>4</sup>	R³	R <sup>o</sup>	X	Y	R'	R°
XI-46-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-46-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-46-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-46-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-46-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-46-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-46-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-46-8	p-Me-Ph	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table XI-47.

1 4010 711											
Nº	$\mathbb{R}^1$	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$\mathbb{R}^7$	R <sup>8</sup>
XI-47-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-47-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-47-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-47-4	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-47-5	p-F-Ph	Н	Н	CH₂Ph	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-47-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-47-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-47-8	p-F-Ph	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

7	Га	h	ما	$\mathbf{V}$	[-48]
	11	D		$\Delta$	I-40.

Mo	$R^1$	$\mathbf{p}^2$	$\mathbf{p}^{3a}$	$\mathbf{p}^{3b}$	$\mathbb{R}^4$	$\mathbf{R}^{5}$	$\mathbb{R}^6$	Y	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
745	K	IX	K	K	IX	1	1		1	10	
XI-48-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-48-2	p-Cl-Ph	H	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-48-3	p-Cl-Ph	H	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	H	Н	F	ОН	Н	Н
XI-48-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	H	Н	F	ОН	Н	Н
XI-48-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	H	Н	F	OH	Н	Н
XI-48-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	Н	F	ОН	H	H
XI-48-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH	Н	Н
XI-48-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tal	hle	X	[-49]

~ <del>~</del> 7).										
R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
p-Br-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н
p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH	Н	Н
p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н
p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	OH	Н	Н
p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н
p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	Н	F	OH	Н	Н
p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	H	F	ОН	Н	Н
p-Br-Ph	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н
	p-Br-Ph p-Br-Ph p-Br-Ph p-Br-Ph p-Br-Ph p-Br-Ph p-Br-Ph	P-Br-Ph H	R¹ R² R³a  p-Br-Ph H H  p-Br-Ph H H	R¹         R²         R³a         R³b           p-Br-Ph         H         H         H           p-Br-Ph         H         H         CH <sub>3</sub> p-Br-Ph         H         H         CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> Ph           p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl           p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴           p-Br-Ph         H         H         H         Bz           p-Br-Ph         H         H         CH₃         Bz           p-Br-Ph         H         H         CH(CH₃)₂         Bz           p-Br-Ph         H         H         CH₂CH(CH₃)₂         Bz           p-Br-Ph         H         H         CH₂-indol-3-yl         Bz           p-Br-Ph         H         H         CH₂-CH₂SCH₃         Bz	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴         R⁵           p-Br-Ph         H         H         H         Bz         H           p-Br-Ph         H         H         CH₃         Bz         H           p-Br-Ph         H         H         CH(CH₃)₂         Bz         H           p-Br-Ph         H         H         CH₂CH(CH₃)₂         Bz         H           p-Br-Ph         H         H         CH₂-indol-3-yl         Bz         H           p-Br-Ph         H         H         CH₂-CH₂SCH₃         Bz         H	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴         R⁵         R⁶           p-Br-Ph         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         P         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴         R⁵         R6         X           p-Br-Ph         H         H         H         H         H         F           p-Br-Ph         H         H         CH3         Bz         H         H         F           p-Br-Ph         H         H         CH(CH3)2         Bz         H         H         F           p-Br-Ph         H         H         CH2CH(CH3)2         Bz         H         H         F           p-Br-Ph         H         H         CH2Ph         Bz         H         H         F           p-Br-Ph         H         H         CH2-indol-3-yl         Bz         H         H         F           p-Br-Ph         H         H         CH2CH2SCH3         Bz         H         H         F	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴         R⁵         R⁶         X         Y           p-Br-Ph         H         H         H         H         Bz         H         H         F         OH           p-Br-Ph         H         H         CH(CH₃)₂         Bz         H         H         F         OH           p-Br-Ph         H         H         CH₂CH(CH₃)₂         Bz         H         H         F         OH           p-Br-Ph         H         H         CH₂-indol-3-yl         Bz         H         H         F         OH           p-Br-Ph         H         H         CH₂-cH₂-SCH₃         Bz         H         H         F         OH	R1       R2       R3a       R3b       R4       R5       R6       X       Y       R7         p-Br-Ph       H       H       H       H       Bz       H       H       F       OH       H         p-Br-Ph       H       H       CH(CH3)2       Bz       H       H       F       OH       H         p-Br-Ph       H       H       CH2CH(CH3)2       Bz       H       H       F       OH       H         p-Br-Ph       H       H       CH2Ph       Bz       H       H       F       OH       H         p-Br-Ph       H       H       CH2-indol-3-yl       Bz       H       H       F       OH       H         p-Br-Ph       H       H       CH2CH2SCH3       Bz       H       H       F       OH       H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### 5 Table XI-50.

No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XI-50-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-50-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	H	F	ОН	Н	Н
XI-50-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	H
XI-50-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-50-5	p-I-Ph	Н	Н	CH₂Ph	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-50-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-50-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	ОН	Н	Н
XI-50-8	p-I-Ph	*	Н	*	Bz	H	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$$R^{3a}$$
  $R^{2}$   $R^{2}$   $R^{2}$   $R^{3a}$   $R^{3$ 

XII

Table X											
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XII-1-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	N <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н
XII-1-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-1-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-1-4	$\text{CH}_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-1-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-1-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-1-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-1-8	$CH_3$	*	Н	*	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

-	Table XII-2	

	Table A11-2.										
№	R¹	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XII-2-1	Et	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	N <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н
XII-2-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-2-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-2-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-2-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-2-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-2-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-2-8	Et	*	Н	*	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	VII	2

I dolo 71											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
XII-3-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$N_3$	F	F	ОН	Н	H
XII-3-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-3-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-3-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-3-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-3-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-3-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-3-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	$CH_3$	$N_3$	F	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

٦	Га	h	اما	$\mathbf{X}$	n	-4
	11	IJ.	ľ	$\Delta$		-4

Table A.											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	Ro	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
XII-4-1	'Bu	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	N <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XII-4-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-4-3	'Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-4-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-4-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2Ph$	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-4-6	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-4-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-4-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## 5 Table XII-5.

Taule A.											
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XII-5-1	Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	N <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XII-5-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-5-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-5-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-5-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-5-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-5-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-5-8	Ph	*	Н	*	$CH_3$	$N_3$	F	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table X											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XII-6-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-6-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-6-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-6-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-6-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-6-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-6-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	H	Н
XII-6-8	p-Me-Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	$N_3$	F	F	OH	Н	Н

XII-6-8 p-Me-Ph \* H \*  $CH_3$  N<sub>3</sub> F F OH H H

\* $R^2$  and  $R^{3b}$  joined together by  $(CH_2)_3$  to form five-membered ring.

Table XI											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$\mathbb{R}^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XII-7-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	N <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XII-7-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-7-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-7-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-7-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	$N_3$	F	F	OH	H	Н
XII-7-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	H	Н
XII-7-8	p-F-Ph	Н	Н	CH₂CH₂SCH₃	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-7-20	p-F-Ph	*	Н	*	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	⊤ഹ	hla	VI	1-X

Taule A	11-0.										
№	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XII-8-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-8-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	H	Н
XII-8-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-8-4	p-Cl-Ph	H	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	H	Н
XII-8-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-8-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-8-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-8-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	$CH_3$	$N_3$	F	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

_	4 4		~ ~ ~ ~	 ^
10	h	_	XI	 0
10	ıbl		$\Delta$	 • 7 .

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XII-9-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	N <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XII-9-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-9-3	p-Br-Ph	H	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-9-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-9-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-9-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	CH <sub>3</sub>	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-9-8	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Η	Н
XII-9-20	p-Br-Ph	*	Н	*	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Т	ab	10	VI	Τ.	1	ሰ	
- 1	an	10	$\Delta$			u	

Table All											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XII-10-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	N <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н
XII-10-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-10-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-10-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-10-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-10-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-10-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	H
XII-10-8	p-I-Ph	*	Н	*	$CH_3$	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### 5 Table XII-11

No No		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
XII-11-1	CH <sub>3</sub>	Н	H	Н	Et	N <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	<u>H</u>
XII-11-2					Et	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-11-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-11-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-11-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-11-6	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-11-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-11-8	$CH_3$	*	Н	*	Et	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-11-5 XII-11-6 XII-11-7	CH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	H H H	H H H	CH <sub>2</sub> Ph CH <sub>2</sub> -indol-3-yl CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et Et Et	$\begin{array}{c} N_3 \\ N_3 \\ N_3 \end{array}$	F F F	F F F	OH OH	Н Н Н	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

700 1 1		X7T	T 1	_
าลท	ıe	X I	I - I	

№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XII-12-1	Et	Н	Н	Н	Et	N <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н
XII-12-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-12-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	$N_3$	F	F	ОН	Н	H
XII-12-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	$N_3$	F	F	ОН	H	Н
XII-12-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	$N_3$	F	F	OH	H	Н
XII-12-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$N_3$	F	F	OH	H	Н
XII-12-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-12-8	Et	*	Н	*	Et	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XII-13.	Tab	le	XII	[-]	3.
---------------	-----	----	-----	-----	----

14010 7111											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$\mathbb{R}^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XII-13-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Et	N <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XII-13-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-13-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-13-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-13-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-13-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-13-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-13-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Et	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XII-14. 5

30	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	n	R <sup>3b</sup>	<b>D</b> 4	R <sup>5</sup>	n6	X	Y	<b>p</b> 7	R <sup>8</sup>
№	K <sup>-</sup>	K-	K	K**	K	K	K	Χ	Y	K	K
			3a								
XII-	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	Et	N	F	F	OH	H	Н
14-1						3					
XII-	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	N	F	F	ОН	Н	Н
14-2						3					
XII-	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	N	F	F	ОН	Н	Н
14-3						3					
XII-	'Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	N	F	F	ОН	Н	$\mathbf{H}_{\mathbf{u}}$
14-4						3					
XII-	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	N	F	F	OH	Н	Н
14-5						3					

№	R¹	R <sup>2</sup>	R	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
			3a								
XII-	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	N	F	F	OH	Н	Н
14-6						3					
XII-	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	N	F	F	OH	Н	Н
14-7						3					
XII-	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Et	N	F	F	OH	Н	Н
14-8						3					

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	XII-	15	
-------	------	----	--

1 4010 1111											
N₂	R¹	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XII-15-1	Ph	Н	Н	Н	Et	N <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н
XII-15-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-15-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-15-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-15-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	$N_3$	F	F	ОН	H	Н
XII-15-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-15-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-15-8	Ph	*	Н	*	Et	$N_3$	F	F	ОН	H	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XII-16.

No.	R <sup>1</sup>	$\mathbb{R}^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
XII-16-1	p-Me-Ph	H	H	Н	Et	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-16-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	F	F	ОН	H	Н
XII-16-3	p-Me-Ph	H	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-16-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-16-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-16-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$N_3$	F	F	ОН	H	Н
XII-16-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-16-8	p-Me-Ph	*	Н	*	Et	$N_3$	F	F	OH	H	Н

5  $R^2$  and  $R^{3b}$  joined together by  $(CH_2)_3$  to form five-membered ring.

Table XII-17.

1 4010 111											
№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XII-17-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Et	N <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XII-17-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	F	F	ОН	H	Н

№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XII-17-3	p-F-Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	N <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XII-17-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-17-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	$N_3$	F	F	ОН	H	Н
XII-17-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-17-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-17-8	p-F-Ph	*	Н	*	Et	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	VII	-1Ω

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XII-18-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Et	N <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н
XII-18-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	F	F	ОĤ	Н	Н
XII-18-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-18-4	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-18-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-18-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$N_3$	F	F	ОН	H	Н
XII-18-7	p-Cl-Ph	H	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-18-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	Et	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# Table XII-19.

	Taule VII											
-	Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	$R^5$	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
-	XII-19-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Et	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
	XII-19-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
	XII-19-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
	XII-19-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
	XII-19-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
	XII-19-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$N_3$	F	F	ОН	H	Н
	XII-19-7	p-Br-Ph	H	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	F	F	ОН	H	Н
	XII-19-8	p-Br-Ph	*	Н	*	Et	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н

<sup>5 \*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XII-20

I aule All										
№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$
XII-20-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Et	$N_3$	F	F	ОН	Н
XII-20-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	F	F	ОН	Н
XII-20-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	$N_3$	F	F	ОН	Н

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$
XII-20-4	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	N <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н
XII-20-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	$N_3$	F	F	ОН	Н
XII-20-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$N_3$	F	F	ОН	Н
XII-20-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	F	F	ОН	Н
XII-20-8	p-I-Ph	*	Н	*	Et	$N_3$	F	F	ОН	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

7	$\Gamma_{\sim}$	L	ı؞	X	ſŦ	2	1	
	ıа	n	ıe.	X	ш	- /.	ı	

Table All											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XII-21-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	N <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н
XII-21-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-21-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-21-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-21-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-21-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-21-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	ОН	Н	H
XII-21-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# Table XII-22.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XII-22-1	Et	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	N <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XII-22-2	Et	H	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-22-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-22-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-22-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-22-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-22-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-22-8	Et	*	Н	*	'Pr	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table XII-23.

1 4010 1111											
No	R¹	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XII-23-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	N <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н
XII-23-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-23-3	$^{i}$ Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-23-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	OH	Н	Н

Nº	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XII-23-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-23-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-23-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-23-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Ta	ble	XI	<b>1-2</b> 4	ŀ
3.0			7	Г

Nº	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	$R^5$	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XII-24-1	'Bu	Н	Н	Н	'Pr	N <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XII-24-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-24-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-24-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-24-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-24-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-24-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$^{i}$ Pr	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-24-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	N <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$T_{\alpha}$	L	ما	VII	7.5
1 11	bl	ı	$\Delta \mathbf{I}$	L-ZJ.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XII-25-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	N <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XII-25-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-25-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	'Pr	$N_3$	F	F	ОН	Η	Н
XII-25-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	OH	H	Н
XII-25-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-25-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-25-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-25-8	Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	OH	Н	Н

<sup>5</sup>  $R^2$  and  $R^{3b}$  joined together by  $(CH_2)_3$  to form five-membered ring.

Table XII-26

I able All	l-∠0.										
No	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XII-26-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-26-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-26-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-26-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-26-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н

№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XII-26-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-26-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-26-8	p-Me-Ph	*	Н	*	'Pr	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XI	Table XII-27. $ N_{2}  R^{1}  R^{2}  R^{3a}  R^{3b}  R^{4}  R^{5}  R^{6}  X  Y  R^{7}  R^{8} $											
N₂	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	
XII-27-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	N <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н	
XII-27-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	$N_3$	F	F	OH	Н	Н	
XII-27-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	OH	Н	Н	
XII-27-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	OH	Н	Н	
XII-27-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	$N_3$	F	F	OH	Н	Н	
XII-27-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	$N_3$	F	F	OH	H	H	
XII-27-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	OH	Н	Н	
XII-27-8	p-F-Ph	*	Н	*	'Pr	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XI	I-28.										
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XII-28-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	'Pr	N <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н
XII-28-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-28-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-28-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-28-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-28-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-28-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-28-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н

<sup>5</sup>  $R^2$  and  $R^{3b}$  joined together by  $(CH_2)_3$  to form five-membered ring.

Table XI	[-29.										
№	$\mathbb{R}^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
XII-29-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	'Pr	N <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XII-29-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-29-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-29-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-29-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-29-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н

№	$\mathbb{R}^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
XII-29-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	N <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XII-29-8	p-Br-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tah	le	XI	ſΤ.	-3(	1
I au		$\Delta$	П.	/\	,

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XII-30-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	N <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н
XII-30-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	OH	Η	H
XII-30-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	OH	Η	H
XII-30-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-30-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-30-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-30-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-30-8	p-I-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	N <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	H 

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XII-31.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
XII-31-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	N <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XII-31-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-31-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-31-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-31-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-31-6	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-31-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-31-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	"Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н

 $<sup>^{*}</sup>R^{2}$  and  $R^{3b}$  joined together by  $(CH_{2})_{3}$  to form five-membered ring.

Table XII-32

Taule All											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XII-32-1	Et	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-32-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-32-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-32-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-32-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-32-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-32-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
XII-32-8	Et	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	N <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tab	e	ΧI	1-33	

No	R¹	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
XII-33-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	N <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	H
XII-33-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-33-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-33-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-33-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-33-6	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-33-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-33-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	N <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XII-34.

№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XII-34-1	′Bu	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-34-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-34-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-34-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-34-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-34-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-34-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-34-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	H

<sup>5</sup>  $R^2$  and  $R^{3b}$  joined together by  $(CH_2)_3$  to form five-membered ring.

Table XII-35

Table All											
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
XII-35-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-35-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	H
XII-35-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-35-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-35-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-35-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-35-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-35-8	Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	N <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н

\*R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	XII-36.

No No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
XII-36-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	N <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XII-36-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-36-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-36-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-36-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-36-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-36-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-36-8	p-Me-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	N <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# Table XII-37.

14010 1111											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
XII-37-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	N <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н
XII-37-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-37-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-37-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-37-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-37-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-37-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-37-8	p-F-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н

<sup>5 \*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# Table XII-38.

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XII-38-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	N <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XII-38-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-38-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-38-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	$N_3$	F	F	OH	H	Н
XII-38-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-38-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-38-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-38-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	"Bu	N <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Η

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tal			

No	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XII-39-1	p-Br-Ph	Н	H	Н	<sup>n</sup> Bu	N <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
	•			CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
	•										
	•			CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
	•			CH₂Ph							
	•			CH <sub>2</sub> -indol-3-yl							
	•			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>							
	•			*					ОН		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table XII-40.

Table All	<del>-1</del> 0.										
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XII-40-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	N <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XII-40-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-40-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-40-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-40-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-40-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-40-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-40-8	p-I-Ph	*	Н	*	"Bu	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### 5 Table XII-41.

No No		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XII-41-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Bz	N <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XII-41-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-41-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-41-4	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-41-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-41-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-41-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-41-8	$CH_3$	*	Н	*	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

т	ر ما ما	1.	VI	T	12
	ลท	Ie.	х і		.4. /

№	R¹	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XII-42-1	Et	Н	Н	Н	Bz	N <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н
XII-42-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-42-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-42-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Η	Н
XII-42-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-42-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-42-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	F	F	OH	H	Н
XII-42-8	Et	*	H	*	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

_	_			* * *			
. 1	ı. ب	h	$\sim$	v	II-4	1 2	
	12	111				+ 7	ŧ.

	Table All-43.										
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
XII-43-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н		-			OH		
XII-43-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Н	Ħ
XII-43-3	$^{i}$ Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	F	F	ОН	H	Н
XII-43-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-43-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-43-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$N_3$	F	F	ОН	H	Н
XII-43-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-43-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н

10 \*R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XII-44.

Table All-44.										
$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
'Bu	Н	Н	Н	Bz	N <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
'Bu	H	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
<i>t</i> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
<i>t</i> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Н	H
<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Н	H
<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Bz	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
	'Bu 'Bu 'Bu 'Bu 'Bu 'Bu 'Bu 'Bu 'Bu	R¹ R²  'Bu H  'Bu H	R¹       R²       R³a         'Bu       H       H         'Bu       H       H	R¹         R²         R³a         R³b           'Bu         H         H         H           'Bu         H         H         CH3           'Bu         H         H         CH(CH3)2           'Bu         H         H         CH2CH(CH3)2           'Bu         H         H         CH2Ph           'Bu         H         H         CH2-indol-3-yl	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴           'Bu         H         H         H         Bz           'Bu         H         H         CH₃         Bz           'Bu         H         H         CH(CH₃)₂         Bz           'Bu         H         H         CH₂CH(CH₃)₂         Bz           'Bu         H         H         CH₂-indol-3-yl         Bz           'Bu         H         H         CH₂-CH₂SCH₃         Bz	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴         R⁵           'Bu         H         H         H         Bz         N₃           'Bu         H         H         CH₃         Bz         N₃           'Bu         H         H         CH(CH₃)₂         Bz         N₃           'Bu         H         H         CH₂CH(CH₃)₂         Bz         N₃           'Bu         H         H         CH₂-indol-3-yl         Bz         N₃           'Bu         H         H         CH₂-CH₂SCH₃         Bz         N₃	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴         R⁵         R²           'Bu         H         H         H         Bz         N₃         F           'Bu         H         H         CH₃         Bz         N₃         F           'Bu         H         H         CH(CH₃)₂         Bz         N₃         F           'Bu         H         H         CH₂CH(CH₃)₂         Bz         N₃         F           'Bu         H         H         CH₂-indol-3-yl         Bz         N₃         F           'Bu         H         H         CH₂-CH₂SCH₃         Bz         N₃         F	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴         R⁵         R6         X           'Bu         H         H         H         Bz         N₃         F         F           'Bu         H         H         CH₃         Bz         N₃         F         F           'Bu         H         H         CH₂CH(CH₃)₂         Bz         N₃         F         F           'Bu         H         H         CH₂Ph         Bz         N₃         F         F           'Bu         H         H         CH₂-indol-3-yl         Bz         N₃         F         F           'Bu         H         H         CH₂-CH₂SCH₃         Bz         N₃         F         F	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴         R⁵         R⁶         X         Y           'Bu         H         H         H         Bz         N₃         F         F         OH           'Bu         H         H         CH(CH₃)₂         Bz         N₃         F         F         OH           'Bu         H         H         CH₂CH(CH₃)₂         Bz         N₃         F         F         OH           'Bu         H         H         CH₂-indol-3-yl         Bz         N₃         F         F         OH           'Bu         H         H         CH₂-cH₂SCH₃         Bz         N₃         F         F         OH	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴         R⁵         R⁶         X         Y         R²           'Bu         H         H         H         Bz         N₃         F         F         OH         H           'Bu         H         H         CH(CH₃)₂         Bz         N₃         F         F         OH         H           'Bu         H         H         CH₂CH(CH₃)₂         Bz         N₃         F         F         OH         H           'Bu         H         H         CH₂-indol-3-yl         Bz         N₃         F         F         OH         H           'Bu         H         H         CH₂-cH₂SCH₃         Bz         N₃         F         F         OH         H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XII											
№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XII-45-1	Ph	Н	Н	Н	Bz	N <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н
XII-45-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-45-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-45-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-45-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-45-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-45-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII_45_8	Ph	*	Н	*	R <sub>7</sub>	N₂	F	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	XI.	l-46.
		_ 1

№	$\mathbb{R}^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XII-46-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	Bz	N <sub>3</sub>	·F	F	ОН	Н	Н
XII-46-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-46-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-46-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-46-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$N_3$	F	F	ОН	H	Н
XII-46-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-46-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-46-8	p-Me-Ph	*	Н	*	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# 5 Table XII-47.

20010 1211											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XII-47-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Bz	N <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XII-47-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-47-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	F	F	OH	H	Н
XII-47-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-47-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-47-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-47-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-47-8	p-F-Ph	*	Н	*	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	XII-48.	

Table All	No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$										
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	Rº	X	Y	R'	R°
XII-48-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Bz	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-48-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-48-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-48-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	F	F	ОН	H	H
XII-48-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$N_3$	F	F	ОН	H	Н
XII-48-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$N_3$	F	F	ОН	H	Н
XII-48-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Н	H
XII-48-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	Bz	$N_3$	F	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

٦	Γa	h	16	$\mathbf{X}$	IT.	49	
	-		10	$\sim$		-47	_

	No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$										
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R۶	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
XII-49-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Bz	N <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н
XII-49-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-49-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	F	F	OH	Н	H
XII-49-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-49-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH₂Ph	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-49-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-49-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-49-8	p-Br-Ph	*	Н	*	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### 5 Table XII-50.

Table All	. 50.										
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R⁴	R5	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
XII-50-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Bz	N <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XII-50-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	F	F	OH	Н	Н
XII-50-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	F	F	ОН	H	Н
XII-50-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Н	H
XII-50-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-50-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-50-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	F	F	ОН	Н	Н
XII-50-8	p-I-Ph	*	Н	*	Bz	$N_3$	F	F	ОН	·H	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

XIII

]	la	ble	Э.	ΧJ	Ш	-1	

Table A1											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$\mathbb{R}^7$	R <sup>8</sup>
XIII-1-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	N <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-1-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-1-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-1-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-1-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-1-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-1-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-1-8	$CH_3$	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XIII-2. 5

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$\mathbb{R}^7$	R <sup>8</sup>
XIII-2-1	Et	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	N <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-2-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-2-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-2-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-2-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-2-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-2-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-2-8	Et	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

WO 2008/121634 PCT/US2008/058183

Docket No. 60137.0034WOU1

Tab]	ما	Y	m	_3
1 (11)		$\Delta$		<b></b> .7.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XIII-3-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	N <sub>3</sub>	Н	F	OH	Н	Н
XIII-3-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-3-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-3-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-3-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH₂Ph	$CH_3$	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-3-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-3-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-3-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIII-4.

Nº		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XIII-4-1	'Bu	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	N <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-4-2	'Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-4-3	'Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-4-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-4-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-4-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-4-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-4-8	'Bu	*	Н	*	$CH_3$	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# 5 Table XIII-5.

№         R¹         R²         R³a         R³b         R⁴         R⁵         R⁶         X         Y         R³         R³           XIII-5-1         Ph         H         H         H         CH3         N₃         H         F         OH         H         H           XIII-5-2         Ph         H         H         CH₃         CH₃         N₃         H         F         OH         H         H           XIII-5-3         Ph         H         H         CH(CH₃)₂         CH₃         N₃         H         F         OH         H         H           XIII-5-4         Ph         H         H         CH₂Ph         CH₃         N₃         H         F         OH         H         H           XIII-5-5         Ph         H         H         CH₂-indol-3-yl         CH₃         N₃         H         F         OH         H         H           XIII-5-7         Ph         H         H         CH₂-CH₂-CH₂-CH₃         CH₃         N₃         H         F         OH         H         H           XIII-5-8         Ph         *         H         *         CH₃         N₃         H         F			- 3		21						- 7	
XIII-5-2         Ph         H         H         CH3         CH3         N3         H         F         OH         H         H           XIII-5-3         Ph         H         H         CH(CH3)2         CH3         N3         H         F         OH         H         H           XIII-5-4         Ph         H         H         CH2CH(CH3)2         CH3         N3         H         F         OH         H         H           XIII-5-5         Ph         H         H         CH2-Ph         CH3         N3         H         F         OH         H         H           XIII-5-6         Ph         H         H         CH2-Ph         CH3         N3         H         F         OH         H         H           XIII-5-6         Ph         H         H         CH2-Ph         CH3         N3         H         F         OH         H         H	№	R¹	$R^2$	R3a	R <sup>30</sup>	R <sup>4</sup>	R³	R°	X	Y	R'	R°
XIII-5-3         Ph         H         H         CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> N <sub>3</sub> H         F         OH         H         H           XIII-5-4         Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> N <sub>3</sub> H         F         OH         H         H           XIII-5-5         Ph         H         H         CH <sub>2</sub> Ph         CH <sub>3</sub> N <sub>3</sub> H         F         OH         H         H           XIII-5-6         Ph         H         H         CH <sub>2</sub> Ph         CH <sub>3</sub> N <sub>3</sub> H         F         OH         H         H           XIII-5-6         Ph         H         H         CH <sub>2</sub> Ph         CH <sub>3</sub> N <sub>3</sub> H         F         OH         H         H	XIII-5-1	Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$N_3$	Н	F	ОН	Н	H
XIII-5-4         Ph         H         CH2CH(CH3)2         CH3         N3         H         F         OH         H         H           XIII-5-5         Ph         H         H         CH2Ph         CH3         N3         H         F         OH         H         H           XIII-5-6         Ph         H         H         CH2-indol-3-yl         CH3         N3         H         F         OH         H         H           XIII-5-7         Ph         H         H         CH2CH2SCH3         CH3         N3         H         F         OH         H         H	XIII-5-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-5-5         Ph         H         H         CH <sub>2</sub> Ph         CH <sub>3</sub> N <sub>3</sub> H         F         OH         H         H           XIII-5-6         Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         CH <sub>3</sub> N <sub>3</sub> H         F         OH         H         H           XIII-5-7         Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> N <sub>3</sub> H         F         OH         H         H	XIII-5-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-5-6         Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         CH <sub>3</sub> N <sub>3</sub> H         F         OH         H         H           XIII-5-7         Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> N <sub>3</sub> H         F         OH         H         H	XIII-5-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-5-7 Ph H H CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> N <sub>3</sub> H F OH H H	XIII-5-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
	XIII-5-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	$N_3$	H	F	ОН	Н	Н
XIII-5-8 Ph * H * CH <sub>3</sub> N <sub>3</sub> H F OH H H	XIII-5-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
	XIII-5-8	Ph	*	Н	*	$CH_3$	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Docket No. 60137.0034WOU1

_	_				~~~	•	_	
٠.	ا م` ا	h	$\sim$	$\mathbf{X}$			4	
	1			$\Delta$		-		

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	
XIII-6-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-6-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-6-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-6-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-6-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-6-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	$N_3$	Н	F	ОН	H	Н
XIII-6-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	H	F	ОН	H	Н
XIII-6-8	p-Me-Ph	*	Н	*	$CH_3$	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tah	le.	XI	П.	-7

Nº	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	$R^5$	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XIII-7-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	N <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-7-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-7-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	Н	F	OH	H	Н
XIII-7-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	Н	F	ОН	H	Н
XIII-7-6	p-F-Ph	Н	H	CH <sub>2</sub> Ph	$\text{CH}_3$	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-7-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	$N_3$	Н	F	ОН	H	Н
XIII-7-8	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-7-20	p-F-Ph	*	Н	*	$CH_3$	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# 5 Table XIII-8.

No No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XIII-8-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	N <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	H
XIII-8-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-8-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	Н	F	OH	H	Н
XIII-8-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	H	F	OH	H	Н
XIII-8-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	$N_3$	Н	F	ОН	H	Н
XIII-8-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-8-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	H	F	ОН	Н	Н
XIII-8-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

WO 2008/121634 PCT/US2008/058183

Docket No. 60137.0034WOU1

Table XIII											
№	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$\mathbf{R}^{7}$	R <sup>8</sup>
XIII-9-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	N <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-9-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	Н	F	ОН	H	Н
XIII-9-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-9-4	p <b>-</b> Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$CH_3$	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-9-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-9-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-9-8	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-9-20	n-Br-Ph	*	Н	*	$CH_3$	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

№         R¹         R²         R³a         R³b         R⁴         R⁵         R⁶         X         Y         R³         R³           XIII-10-1         p-I-Ph         H         H         H         CH₃         N₃         H         F         OH         H         H           XIII-10-2         p-I-Ph         H         H         CH(CH₃)₂         CH₃         N₃         H         F         OH         H         H           XIII-10-4         p-I-Ph         H         H         CH₂CH(CH₃)₂         CH₃         N₃         H         F         OH         H         H           XIII-10-5         p-I-Ph         H         H         CH₂Ph         CH₃         N₃         H         F         OH         H         H           XIII-10-6         p-I-Ph         H         H         CH₂-indol-3-yl         CH₃         N₃         H         F         OH         H         H           XIII-10-8         p-I-Ph         H         H         CH₂-cH₂-cH₂-cH₃         CH₃         N₃         H         F         OH         H         H	Table XIII	[-10.										
XIII-10-2         p-I-Ph         H         H         CH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> N <sub>3</sub> H         F         OH         H         H           XIII-10-3         p-I-Ph         H         H         CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> N <sub>3</sub> H         F         OH         H         H           XIII-10-4         p-I-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> N <sub>3</sub> H         F         OH         H         H           XIII-10-5         p-I-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> Ph         CH <sub>3</sub> N <sub>3</sub> H         F         OH         H         H           XIII-10-6         p-I-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> cH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> N <sub>3</sub> H         F         OH         H         H	№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
XIII-10-3         p-I-Ph         H         H         CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> N <sub>3</sub> H         F         OH         H         H           XIII-10-4         p-I-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> N <sub>3</sub> H         F         OH         H         H           XIII-10-5         p-I-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> Ph         CH <sub>3</sub> N <sub>3</sub> H         F         OH         H         H           XIII-10-6         p-I-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> cH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> N <sub>3</sub> H         F         OH         H         H           XIII-10-7         p-I-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> N <sub>3</sub> H         F         OH         H         H	XIII-10-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	N <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-10-4         p-I-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> N <sub>3</sub> H         F         OH         H         H           XIII-10-5         p-I-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> Ph         CH <sub>3</sub> N <sub>3</sub> H         F         OH         H         H           XIII-10-6         p-I-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         CH <sub>3</sub> N <sub>3</sub> H         F         OH         H         H           XIII-10-7         p-I-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> N <sub>3</sub> H         F         OH         H         H	XIII-10-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-10-5         p-I-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> Ph         CH <sub>3</sub> N <sub>3</sub> H         F         OH         H         H           XIII-10-6         p-I-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         CH <sub>3</sub> N <sub>3</sub> H         F         OH         H         H           XIII-10-7         p-I-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> N <sub>3</sub> H         F         OH         H         H	XIII-10-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$\mathrm{CH}_3$	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-10-6 p-I-Ph H H CH <sub>2</sub> -indol-3-yl CH <sub>3</sub> N <sub>3</sub> H F OH H H XIII-10-7 p-I-Ph H H CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> N <sub>3</sub> H F OH H H	XIII-10-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	H	F	ОН	Н	Н
XIII-10-7 p-I-Ph H H CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> N <sub>3</sub> H F OH H H	XIII-10-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
•	XIII-10-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-10-8 p-I-Ph * H * CH <sub>3</sub> N <sub>3</sub> H F OH H H	XIII-10-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
	XIII-10-8	p-I-Ph	*	Н	*	$CH_3$	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

№	R¹	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R
XIII-11-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Et	N <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-11-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-11-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-11-4	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	$N_3$	Н	F	ОН	Η	H
XIII-11-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	$N_3$	Н	F	ОН	H	ŀ
XIII-11-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$N_3$	Н	F	ОН	Н	ŀ
XIII-11-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	Н	F	ОН	Н	F
XIII-11-8	CH <sub>3</sub>	*	$\mathbf{H}^{-1}$	*	Et	$N_3$	Н	F	ОН	Н	F

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

WO 2008/121634 PCT/US2008/058183

 $R^7 R^8$ 

F OH H H

Н

Docket No. 60137.0034WOU1

Table XIII										
No	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$\mathbb{R}^4$	$R^5$	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>
XIII-12-1	Et	Н	Н	Н	Et	$N_3$	Н	F	OH	Н

**XIII-12-2** Et H H CH<sub>3</sub> Et N<sub>3</sub> H F OH H H **XIII-12-3** Et H H CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> Et N<sub>3</sub> H F OH H H

XIII-12-4 Et H H  $CH_2CH(CH_3)_2$  Et  $N_3$  H F OH H H

XIII-12-5 Et H H  $CH_2Ph$  Et  $N_3$  H F OH H H XIII-12-6 Et H H  $CH_2$ -indol-3-yl Et  $N_3$  H F OH H H

XIII-12-6 Et H H CH<sub>2</sub>-indol-3-yl Et  $N_3$  H F OH H H XIII-12-7 Et H H CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub> Et  $N_3$  H F OH H H

Et N<sub>3</sub> H

\*R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Η

Table XIII-13

XIII-12-8 Et \*

No No		R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XIII-13-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Et	N <sub>3</sub>	Н	F	OH	Н	Н
XIII-13-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	Н	F	OH	H	Н
XIII-13-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-13-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	$N_3$	Н	F	OH	Η	Н
XIII-13-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-13-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-13-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-13-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Et	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5 Table XIII-14.

N₂	$\mathbb{R}^1$	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	$R^5$	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
XIII-14-1	'Bu	Н	Н	Н	Et	N <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-14-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	Н	F	OH	Η	Н
XIII-14-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	$N_3$	H	F	ОН	Н	Н
XIII-14-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-14-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	$N_3$	$\mathbf{H}_{\mathbf{u}}$	F	OH	Н	Н
XIII-14-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-14-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-14-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Et	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Docket No. 60137.0034WOU1

Table XIII											
No	R¹	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
XIII-15-1	Ph	Н	Н	Н	Et	N <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-15-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-15-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	$N_3$	Н	F	OH	H	Н
XIII-15-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	$N_3$	Н	F	OH	H	Н
XIII-15-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-15-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-15-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-15-8	Ph	*	Н	*	Et	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIII	[-16.										
Nº	$R^{1}$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R⁴	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R
XIII-16-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	Et	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-16-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-16-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-16-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-16-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	$N_3$	H	F	OH	Н	Н
XIII-16-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-16-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-16-8	p-Me-Ph	*	Н	*	Et	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table XIII											
•	Nº	$R^{I}$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
	XIII-17-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Et	N <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
	XIII-17-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
	XIII-17-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
	XIII-17-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	$N_3$	Н	F	ОН	H	Н
	XIII-17-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
	XIII-17-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
	XIII-17-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
	XIII-17-8	p-F-Ph	*	Н	*	Et	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Docket No. 60137.0034WOU1

Table XIII	[-18.										
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R3	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°
XIII-18-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Et	N <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-18-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-18-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-18-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-18-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH₂Ph	Et	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-18-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-18-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-18-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	Et	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIII	[-19.										
No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R۶	R°	X	Y	R'	R°
XIII-19-1	p-Br-Ph	Н	Н	H	Et	N <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-19-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	Н	F	ОН	Η	H
XIII-19-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	$N_3$	Н	F	OH	Н	H
XIII-19-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-19-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH₂Ph	Et	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-19-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-19-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-19-8	p-Br-Ph	*	Н	*	Et	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

	T'alala	$\sim$ 111	7711
•	Table		-/11

l able XIII	-20.									_ 7	_ 0
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R۶	R°	X	Y	R'	R°
XIII-20-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Et	N <sub>3</sub>	Н	F	OH	Н	Н
XIII-20-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-20-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-20-4	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-20-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	$N_3$	Н	F	ОН	H	Н
XIII-20-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-20-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	H	F	ОН	Н	Н
XIII-20-8	p-I-Ph	*	Н	*	Et	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIII	-21.										- 0
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R۶	R°	X	Y	R'	R°
XIII-21-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	N <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-21-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	Н	F	OH	H	Н
XIII-21-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	'Pr	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-21-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-21-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-21-6	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-21-7	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-21-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIII										- 7	
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	R°	X	Y	R'	R°
XIII-22-1	Et	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	N <sub>3</sub>	Н	F	OH	Н	Н
XIII-22-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	Н	F	ОН	Н	H
XIII-22-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	Н	F	OH	Н	H
XIII-22-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-22-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	Н	F	ОН	H	H
XIII-22-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	Н	F	ОН	Н	H
XIII-22-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-22-8	Et	*	Н	*	'Pr	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table XIII-23	

Table Alli		2	- 30	- 3h	<b>D</b> 4	D.5	D6	37	Y	$\mathbf{p}^7$	D8
№	R'	R²	$R^{3a}$	R <sup>30</sup>	K.	K	K	Х	ĭ	K	K
XIII-23-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	'Pr	N <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-23-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-23-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-23-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	H	F	ОН	Н	Н
XIII-23-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-23-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-23-7	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-23-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIII-24										
	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>

Docket No. 60137.0034WOU1

Table XIII-25.

№	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XIII-24-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	N <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-24-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	$N_3$	Н	F	OH	Η	Н
XIII-24-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	'Pr	$N_3$	Η	F	OH	Н	Н
XIII-24-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	$N_3$	Н	F	OH	Η	Н
XIII-24-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-24-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-24-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-24-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$					Y	
XIII-25-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	Н	F	OH	Η
XIII-25-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	Н	F	ОН	Н

<sup>i</sup>Pr N<sub>3</sub> H F OH H H XIII-25-3 Ph H H CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>  $CH_2CH(CH_3)_2$  <sup>i</sup>Pr  $N_3$  H F он н н XIII-25-4 Ph H ОН Н Η Pr N<sub>3</sub> H XIII-25-5 Ph H H CH<sub>2</sub>Ph F OH H Η CH<sub>2</sub>-indol-3-yl <sup>i</sup>Pr N<sub>3</sub> H F XIII-25-6 Ph H Η <sup>i</sup>Pr N<sub>3</sub> H F OH H Η CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub> XIII-25-7 Ph H

XIII-25-8 Ph \* H \*  $^{\prime}$ Pr N<sub>3</sub> H F OH H H \*  $^{\ast}$ R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table !	XIII-26.								
No	$\mathbb{R}^1$	$\mathbb{R}^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y

XIII-26-1	p-Me-Ph	Н	H	H	'Pr	$N_3$	H	F	OH	Н	Н
XIII-26-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-26-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	Η	F	OH	Н	Н
XIII-26-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	$N_3$	Н	F	ОН	Н	H
XIII-26-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH₂Ph	'Pr	$N_3$	Н	F	OH	Η	Η
XIII-26-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-26-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-26-8	p-Me-Ph	*	Н	*	'Pr	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>5 \*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

R<sup>8</sup> H H

 $R^7 R^8$ 

Docket No. 60137.0034WOU1

Table XIII	-27.									<del>-</del> 7	
No	R <sup>1</sup>	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	R°	X	Y	R'	R°
XIII-27-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-27-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	Η	F	OH	H	Н
XIII-27-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	Н	F	OH	Н	H
				CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-27-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-27-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-27-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-27-8									OH		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIII	[-28.									7	8
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	Rº	X	Y	R'	R°
XIII-28-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	N <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-28-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-28-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-28-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-28-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH₂Ph	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-28-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	Н	F	OH	Η	Н
XIII-28-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-28-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	'Pr	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table X	III-29.
		D.

No No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XIII-29-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	N <sub>3</sub>	Н	F	OH	Н	Н
XIII-29-2	-				'Pr	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
	_			$CH(CH_3)_2$	'Pr	$N_3$	Н	F	ОН	H	Н
	-			CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	Н	F	ОН	Н	H
XIII-29-5					<sup>i</sup> Pr	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
	=			CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-29-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-29-8									ОН		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

	ζIII-30.									_ 7	
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R۶	Rº	X	Y	$R^7$	R°

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
XIII-30-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-30-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	Н	F	OH	H	H
				$CH(CH_3)_2$	'Pr	$N_3$	H	F	OH	H	Н
				CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	H	F	OH	H	Н
				CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	$N_3$	Н	F	ОН	H	Н
	· <del>-</del>			CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-30-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-30-8									ОН		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIII	Table XIII-31.  No. $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R5	R	X	Y	R'	R°	
XIII-31-1	CH <sub>3</sub>	H	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	N <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н	
XIII-31-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	$N_3$	H	F	OH	H	H	
XIII-31-3				$CH(CH_3)_2$	"Bu	$N_3$	H	F	ОН	Н	Н	
XIII-31-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	H	F	OH	Н	Н	
XIII-31-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н	
XIII-31-6	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	$N_3$	H	F	OH	Н	Н	
XIII-31-7	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	Н	F	OH	H	Н	
XIII-31-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	"Bu	$N_3$	H	F	OH	Н	H	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIII-32. $R^1 R^2 R^{3a} R^{3b}$ $R^4 R^5 R^6 X Y R^7 R^8$												
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>ο</sup>	X	Y	R'	R°	
XIII-32-1	Et	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н	
XIII-32-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	H	F	OH	Н	H	
XIII-32-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	Н	F	ОН	H	H	
XIII-32-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н	
XIII-32-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	Н	F	ОН	Н	H	
XIII-32-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н	
XIII-32-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н	
XIII-32-8	Et	*	Н	*	"Bu	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н	

<sup>5</sup>  $R^2$  and  $R^{3b}$  joined together by  $(CH_2)_3$  to form five-membered ring.

Table XIII	[-33.										
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°
XIII-33-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	N <sub>3</sub>	Н	F	OH	Н	H

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XIII-33-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-33-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-33-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	$N_3$	Н	F	OH	Η	Н
XIII-33-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	$N_3$	H	F	ОН	Н	Н
XIII-33-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-33-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-33-8	$^{i}$ Pr	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIII	Table XIII-34.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$												
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°		
XIII-34-1	'Bu	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	N <sub>3</sub>	Н	F	OH	Н	Н		
XIII-34-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н		
XIII-34-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н		
XIII-34-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<i>"</i> Bu	$N_3$	Н	F	ОН	Н	H		
XIII-34-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<i>"</i> Bu	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н		
XIII-34-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н		
XIII-34-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н		
XIII-34-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIII-35. $R^{1}$ $R^{2}$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^{4}$ $R^{5}$ $R^{6}$ $X$ $Y$ $R^{7}$ $R^{8}$												
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>	
XIII-35-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	N <sub>3</sub>	Н	F	OH	Н	Н	
XIII-35-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	Н	F	OH	Н	Ή	
XIII-35-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	Н	F	OH	Н	H	
XIII-35-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	Н	F	ОН	H	Н	
XIII-35-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н	
XIII-35-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н	
XIII-35-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н	
XIII-35-8	Ph	*	Н	*	"Bu	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н	

 $<sup>^{*}</sup>R^{2}$  and  $R^{3b}$  joined together by  $(CH_{2})_{3}$  to form five-membered ring.

Table XIII	[-36.										
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R5	R	X	Y	R'	R°
XIII-36-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	N <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	H
XIII-36-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	H	F	OH	Н	H

No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	$\mathbb{R}^5$	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XIII-36-3	p-Me-Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
				$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
	-			CH <sub>2</sub> Ph							
	-			CH <sub>2</sub> -indol-3-yl							
				CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>							
	p-Me-Ph				<sup>n</sup> Bu						

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIII-37.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$												
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R³	R°	X	Y	R'	R°	
XIII-37-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	N <sub>3</sub>	Н	F	OH	Н	Н	
XIII-37-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	$N_3$	H	F	OH	Н	Н	
XIII-37-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н	
XIII-37-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н	
XIII-37-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н	
				CH <sub>2</sub> -indol-3-yl								
XIII-37-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	Н	F	OH	Η	Н	
XIII-37-8	p-F-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIII-38.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$												
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	Rº	X	Y	R'	R°	
XIII-38-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	N <sub>3</sub>	Н	F	OH	Н	Н	
XIII-38-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	Н	F	OH	H	Н	
XIII-38-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н	
XIII-38-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н	
XIII-38-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	$N_3$	Н	F	ОН	Н	H	
XIII-38-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	Н	F	ОН	Н	H	
				CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>								
XIII-38-8									ОН			

 $<sup>^{*}</sup>$ R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIII	-39.										_ 0
No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R5	Ro	X	Y	R'	R°
XIII-39-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-39-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-39-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	$N_3$	H	F	OH	Н	H

<u>№</u>	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XIII-39-4	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	N <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
				CH <sub>2</sub> Ph					OH		
	-			CH <sub>2</sub> -indol-3-yl		$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-39-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-39-8									OH		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIII	Table XIII-40.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$													
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R³	Rº	X	Y	R'	R°			
XIII-40-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	N <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н			
XIII-40-2					"Bu	$N_3$	Н	F	OH	H	Н			
	-			$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н			
	_			CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н			
				CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н			
XIII-40-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н			
XIII-40-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н			
XIII-40-8									ОН					

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIII	Table XIII-41. $ \underline{No}  R^1  R^2  R^{3a}  R^{3b} \qquad \qquad R^4  R^5  R^6  X  Y  R^7  R^8 $												
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R3	R	X	Y	R'	R*		
XIII-41-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Bz	N <sub>3</sub>	Н	F	OH	Н	Н		
XIII-41-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н		
XIII-41-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	Н	F	OH	Н	H		
XIII-41-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н		
XIII-41-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н		
				CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н		
XIII-41-7			Н							Н	Н		
XIII-41-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	Bz	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н		

<sup>5 \*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIII	-42.										- 0
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
XIII-42-1	Et	Н	Н	Н	Bz	N <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	H
XIII-42-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	Н	F	ОН	H	Н
XIII-42-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-42-4	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XIII-42-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-42-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-42-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-42-8	Et	*	Н	*	Bz	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIII	Table XIII-43.  No $R^1 R^2 R^{3a} R^{3b}$ $R^4 R^5 R^6 X Y R^7 R^8$													
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	R°	X	Y	R'	R°			
XIII-43-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Bz	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н			
XIII-43-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н			
XIII-43-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	Н	F	OH	Н	H 5			
XIII-43-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	Н	F	ОН	Н	H			
XIII-43-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н			
XIII-43-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н			
XIII-43-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н			
XIII-43-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Bz	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н			

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

10	Table XIII	-44.										
	№	$\mathbb{R}^1$	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°
	XIII-44-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	Bz	N <sub>3</sub>	Н	F	OH	Н	H
	XIII-44-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
	XIII-44-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
	XIII-44-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
	XIII-44-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
	XIII-44-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
	XIII-44-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	Н	F	OH	Н	H
	XIII-44-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Bz	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIII	Table XIII-45.  No. $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$												
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	Rº	X	Y	R'	R°		
XIII-45-1	Ph	Н	Н	Н	Bz	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н		
XIII-45-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н		
XIII-45-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н		

Nº	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XIII-45-4	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	N <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-45-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-45-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-45-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-45-8	Ph	*	Н	*	Bz	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIII	Table XIII-46. $N_{2} \qquad R^{1} \qquad R^{2}  R^{3a}  R^{3b} \qquad \qquad R^{4}  R^{5}  R^{6}  X  Y  R^{7}  R^{8}$												
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	R°	X	Y	R'	R°		
XIII-46-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	Bz	N <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	H		
XIII-46-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н		
XIII-46-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н		
				CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н		
	p-Me-Ph								OH				
XIII-46-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н		
				CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>									
	p-Me-Ph			*					OH				

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIII	Table XIII-47. $R^{0} = R^{1} = R^{2} = R^{3a} = R^{3b} = R^{4} = R^{5} = R^{6} = X = Y = R^{7} = R^{8}$													
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	Ro	X	Y	R'	R°			
XIII-47-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Bz	N <sub>3</sub>	Н	F	OH	Н	Н			
XIII-47-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	H	F	OH	H	Н			
XIII-47-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	Н	F	OH	Н	H			
XIII-47-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	Н	F	ОН	Н	H			
XIII-47-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н			
XIII-47-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н			
XIII-47-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н			
XIII-47-8	p-F-Ph	*	Н	*	Bz	$N_3$	Н	F	OH	Н	H			

<sup>5 \*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIII	[-48.										
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°
XIII-48-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Bz	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XIII-48-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н
XIII-48-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	Н	F	ОН	H	Н
XIII-48-4	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	$N_3$	Н	F	OH	Н	Н

<u>№</u>	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XIII-48-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	N <sub>3</sub>	Н	F	OH	Н	Н
XIII-48-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$N_3$	Н	F	OH	H	H
XIII-48-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	Н	F	OH	H	Н
XIII-48-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	Bz	$N_3$	Н	F	OH	Н	H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIII-49. $R^{1}$ $R^{2}$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^{4}$ $R^{5}$ $R^{6}$ $X$ $Y$ $R^{7}$ $R^{8}$												
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	R°	X	Y	R'	R°	
XIII-49-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Bz	N <sub>3</sub>	Н	F	OH	Н	Н	
XIII-49-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	Н	F	OH	H	Н	
XIII-49-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	H	F	OH	H	Н	
				$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	Н	F	ОН	H	Н	
XIII-49-5									ОН			
				CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н	
				CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	Н	F	OH	H	Н	
	p-Br-Ph								ОН			

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIII-50. $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$												
No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R³	R°	X	Y	R'	R°	
XIII-50-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Bz	N <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н	
XIII-50-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	H	F	OH	H	Н	
				$CH(CH_3)_2$		$N_3$	H	F	OH	H	Н	
				$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	Н	F	ОН	Н	Н	
XIII-50-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$N_3$	Н	F	OH	H	H	
				CH <sub>2</sub> -indol-3-yl		$N_3$	Н	F	OH	Н	H	
				CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>								
XIII-50-8									OH			

<sup>5</sup>  $R^2$  and  $R^{3b}$  joined together by  $(CH_2)_3$  to form five-membered ring.

XIV

Table XI	Table XIV-1.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$												
№	$R^1$	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	R°	X	Y	R'	R°		
XIV-1-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	N <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н		
XIV-1-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	F	Н	OH	H	Н		
XIV-1-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н		
XIV-1-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н		
XIV-1-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н		
XIV-1-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	$N_3$	F	Н	ОН	Н	H		
XIV-1-7	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н		
XIV-1-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	$CH_3$	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table XI	V-2.										
-	№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
	XIV-2-1	Et	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	N <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
	XIV-2-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
	XIV-2-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	$N_3$	F	Н	OH	Н	H
	XIV-2-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
	XIV-2-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
	XIV-2-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
	XIV-2-7	Et	Н	Н	CH2CH2SCH3	$CH_3$	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

2983472-1

XIV-2-8 Et \*

- 331 -

CH<sub>3</sub> N<sub>3</sub> F H OH H H

I-MAK 1005

Table XI	Table XIV-3.  No $R^1 R^2 R^{3a} R^{3b}$ $R^4 R^5 R^6 X Y R^7 R^8$													
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	R°	X	Y	R'	R°			
XIV-3-1	¹Pr	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	N <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н			
XIV-3-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н			
XIV-3-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	$N_3$	F	Н	OH	Η	Н			
XIV-3-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н			
XIV-3-5	iPr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н			
XIV-3-6	i <sub>Pr</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н			
XIV-3-7	i Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н			
XIV-3-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	$N_3$	F	Н	ОН	Н	H			

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XI	Table XIV-4.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ X Y $R^7$ $R^8$													
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	R°	Х	Y	R'	R°			
XIV-4-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	N <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н			
XIV-4-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	F	Н	ОН	H	Н			
XIV-4-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	F	Η	OH	H	Н			
XIV-4-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н			
XIV-4-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н			
XIV-4-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	$N_3$	F	Н	ОН	Η	Н			
XIV-4-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	F	Н	OH	Η	Н			
XIV-4-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н			

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table XI										. 7	_ 0
	№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R³	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°
	XIV-5-1	Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
	XIV-5-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	F	Н	OH	Η	Н
	XIV-5-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
	XIV-5-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	$N_3$	F	Н	ОН	H	Н
	XIV-5-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
	XIV-5-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
	XIV-5-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
	XIV-5-8	Ph	*	Н	*	$CH_3$	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XI	Table XIV-6.  No. P <sup>1</sup> R <sup>2</sup> R <sup>3a</sup> R <sup>3b</sup> R <sup>4</sup> R <sup>5</sup> R <sup>6</sup> X Y R <sup>7</sup> R <sup>8</sup>												
<b>№</b>	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	R°	X	Y	R'	R°		
XIV-6-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н		
	p-Me-Ph				$CH_3$	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н		
	p-Me-Ph				$CH_3$	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н		
	_			CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$CH_3$	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н		
	p-Me-Ph				$CH_3$	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н		
				CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н		
				CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>									
	p-Me-Ph			*					OH				

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIV	Table XIV-7.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$												
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R⁴	R3	R°	X	Y	R'	K°		
XIV-7-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н		
XIV-7-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	F	Н	OH	H	H		
XIV-7-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н		
	_			$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н		
XIV-7-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н		
XIV-7-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	$N_3$	F	Η	ОН	Н	Н		
				CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>									
XIV-7-20	=								ОН				

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table XIV-8. $ N_{\underline{0}}  R^1  R^2  R^{3a}  R^{3b}  R^4  R^5  R^6  X  Y  R^7  R^8 $												
	No	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°	
	XIV-8-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	N <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н	
					CH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	F	H	OH	Н	Н	
					$CH(CH_3)_2$					OH			
		_			CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$CH_3$	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н	
					CH <sub>2</sub> Ph								
					CH <sub>2</sub> -indol-3-yl								
					CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>								
		p-Cl-Ph								ОН		Н	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIV	Table XIV-9.  No. R <sup>1</sup> R <sup>2</sup> R <sup>3a</sup> R <sup>3b</sup> R <sup>4</sup> R <sup>5</sup> R <sup>6</sup> X Y R <sup>7</sup> R <sup>8</sup>											
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°	
XIV-9-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	N <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н	
XIV-9-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	F	Н	ОН	H	Н	
	p-Br-Ph				$CH_3$	$N_3$	F	Н	ОН	Н	H	
	-			CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$CH_3$	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н	
XIV-9-6	=				$CH_3$	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н	
				CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н	
XIV-9-8	<del>-</del>							Н	ОН	Н	Н	
	p-Br-Ph			*	CH <sub>3</sub>	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIV-10. $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$													
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	Rº	X	Y	R'	R°		
XIV-10-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	N <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	H		
XIV-10-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	$N_3$	F	Н	OH	Н	H		
XIV-10-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$N_3$	F	Н	OH	Н	H		
				CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$CH_3$	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н		
				CH <sub>2</sub> Ph									
				CH <sub>2</sub> -indol-3-yl									
				CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>									
XIV-10-8									OH				

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIV №	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	$R^5$	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XIV-11-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Et	N <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-11-2				CH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	F	Н	ОН	H	Н
XIV-11-3				$CH(CH_3)_2$	Et	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-11-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-11-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-11-6	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-11-7	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	F	Н	ОН	Н	H
XIV-11-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	Et	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIV	Table XIV-12.  No $R^1 R^2 R^{3a} R^{3b}$ $R^4 R^5 R^6 X Y R^7 R^8$													
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	Rв	X	Y	R'	R°			
XIV-12-1	Et	Н	Н	Н	Et	N <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н			
XIV-12-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н			
XIV-12-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н			
XIV-12-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н			
XIV-12-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н			
XIV-12-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н			
XIV-12-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	F	Н	ОН	Н	H			
XIV-12-8	Et	*	Н	*	Et	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н			

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIV	Table XIV-13.  No $R^1 R^2 R^{3a} R^{3b}$ $R^4 R^5 R^6 X Y R^7 R^8$													
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R۶	R°	X	Y	R'	R°			
XIV-13-1	¹Pr	Н	Н	Н	Et	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н			
XIV-13-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н			
XIV-13-3	i <b>Pr</b>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н			
XIV-13-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н			
XIV-13-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н			
XIV-13-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н			
XIV-13-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н			
XIV-13-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Et	$N_3$	F	Н	OH	H	Н			

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table XIV	-14.				<u>.</u>						
	№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
	XIV-14-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	Et	N <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
	XIV-14-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	F	Н	ОН	Н	H
	XIV-14-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	$N_3$	F	H	OH	H	H
	XIV-14-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	$N_3$	F	H	OH	H	Н
	XIV-14-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	$N_3$	F	H	OH	H	Н
	XIV-14-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$N_3$	F	H	OH	Н	Н
	XIV-14-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH₂CH₂SCH₃	Et	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н
	XIV-14-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Et	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIV	Table XIV-15.  No $R^1 R^2 R^{3a} R^{3b}$ $R^4 R^5 R^6 X Y R^7 R^8$													
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R	R <sup>o</sup>	X	Y	R'	R°			
XIV-15-1	Ph	Н	Н	Н	Et	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н			
XIV-15-2	Ph	Н	Н	$CH_3$	Et	$N_3$	F	H	OH	H	Н			
XIV-15-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	$N_3$	F	Н	OH	H	Н			
XIV-15-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	$N_3$	F	Н	OH	H	Н			
XIV-15-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н			
XIV-15-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н			
XIV-15-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н			
XIV-15-8	Ph	*	Н	*	Et	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н			

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIV	Table XIV-16. $N_0 = R^1 = R^2 R^{3a} R^{3b} = R^4 R^5 R^6 X Y R^7 R^8$												
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>3</sup>	R°	X	Y	R'	R°		
XIV-16-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	Et	N <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н		
XIV-16-2	p-Me-Ph	Н	Η	CH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	F	H	OH	Н	Н		
				CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н		
XIV-16-4	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н		
XIV-16-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н		
XIV-16-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н		
XIV-16-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н		
	p-Me-Ph								OH				

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table XIV	-17.										
-	No	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
	XIV-17-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Et	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н
	XIV-17-2					Et	$N_3$	F	Н	OH	Н	Η
					$CH(CH_3)_2$	Et	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
		-			CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	$N_3$	F	Н	ОН	H	Н
		-					$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
					CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
					CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>							
	XIV-17-8									ОН		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

WO 2008/121634 Docket No. 60137.0034WOU1

Table XIV-18. $N_0 = R^1 = R^2 - R^{3a} - R^{3b} = R^4 - R^5 - R^6 - X - Y - R^7 - R^8$												
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	Rº	X	Y	R'	R°	
XIV-18-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Et	N <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н	
XIV-18-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	F	H	OH	Н	Н	
	-			$CH(CH_3)_2$	Et	$N_3$	F	Н	ОН	Н	H	
				CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н	
XIV-18-5									OH			
				CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н	
				CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>								
XIV-18-8									OH			

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIV-19.  No. $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$												
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	R°	X	Y	R'	R°	
XIV-19-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Et	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н	
XIV-19-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	F	H	OH	Н	Н	
				$CH(CH_3)_2$	Et	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н	
XIV-19-4	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н	
XIV-19-5									ОН			
				CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н	
				CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>								
	p-Br-Ph								OH			

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table XIV	-20.										
	№	$\mathbb{R}^1$	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
	XIV-20-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Et	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н
					CH <sub>3</sub>	Et	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н
					$CH(CH_3)_2$					ОН		
		=			CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н
					CH <sub>2</sub> Ph		$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
					CH <sub>2</sub> -indol-3-yl							
					CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>							

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

**XIV-20-8** p-I-Ph \* H \* Et N<sub>3</sub> F H OH H H

Table XIV	Table XIV-21.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$												
No	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R5	R <sup>ο</sup>	X	Y	R'	R°		
XIV-21-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н		
XIV-21-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	OH	Н	H		
XIV-21-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н		
XIV-21-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н		
XIV-21-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н		
XIV-21-6	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н		
				CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н		
XIV-21-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIV-22.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$												
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R	R°	X	Y	R'	R°	
XIV-22-1	Et	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	N <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	H	
XIV-22-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	OH	Н	H	
XIV-22-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н	
XIV-22-4	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Ή	
XIV-22-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н	
XIV-22-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н	
XIV-22-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н	
XIV-22-8	Et	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	ОН	Н	H 	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

-	Tabla	XIV-23	

No No		$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XIV-23-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	N <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-23-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	ОН	H	Н
XIV-23-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н
XIV-23-4	$^{i}$ Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н
XIV-23-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	OH	Н	H
XIV-23-6	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-23-7	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-23-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	ОН	Н	H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIV	<sup>7</sup> -24.									-	
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R⁴	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°
XIV-24-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-24-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Η	ОН	H	Н
XIV-24-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	OH	H	Н
XIV-24-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	iPr	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н
XIV-24-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH₂Ph	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	ОН	H	Н
XIV-24-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-24-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	ОН	H	Н
XIV-24-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIV-25.												
№	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R°	Rº	X	Y	R'	R°	
XIV-25-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	N <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н	
XIV-25-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н	
XIV-25-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н	
XIV-25-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н	
XIV-25-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н	
XIV-25-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	ОН	H	Н	
XIV-25-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н	
XIV-25-8	Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	OH	H	Н	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table Y	XIV-26.
	No	$\mathbf{p}^1$

<u>No</u>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XIV-26-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	N <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-26-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н
XIV-26-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	OH	H	Н
				$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н
				CH <sub>2</sub> Ph	iPr	$N_3$	F	Н	OH	H	Н
				CH <sub>2</sub> -indol-3-yl							
XIV-26-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
				*					ОН		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIV	<sup>7</sup> -27.										
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$					Y		
XIV-27-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	N <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	H
XIV-27-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Η	OH	H	H
XIV-27-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	H	ОН	Η	Н
				$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	ОН	Н	H
XIV-27-5	_				<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	ОН	Η	Н
				CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	H	ОН	Н	Н
				CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	H	ОН	Н	Н
XIV-27-8									ОН		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIV-28. $R^{1}$ $R^{2}$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^{4}$ $R^{5}$ $R^{6}$ $X$ $Y$ $R^{7}$ $R^{8}$											
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R۶	R°	X	Y	R'	R°
XIV-28-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н
XIV-28-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н
XIV-28-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Η	OH	Н	Н
XIV-28-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н
XIV-28-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	H	ОН	Н	Н
				CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	H	OH	Н	Н
				CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н
XIV-28-8						$N_3$	F	·H	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table XIV	′ <b>-</b> 29.									7	
	Nº	$R^{I}$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°
	XIV-29-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н
	XIV-29-2					<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Η	OH	H	Н
		-			$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	OH	H	Н
					CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н
	XIV-29-5	-					$N_3$	F	H	ОН	Н	Η
		=			CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	OH	Н	H
					CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>		$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
	XIV-29-8						$N_3$			ОН		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

WO 2008/121634

Table XIV	<b>7-30</b> .										_ 8
№	$R^{I}$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	R°	X	Y	R'	R°
XIV-30-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	'Pr	N <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-30-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	$N_3$	F	Н	OH	H	Н
XIV-30-3	p-I <b>-</b> Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н
	_			CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	ОН	Н	H
	_			CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н
	_			CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	H	ОН	Н	Н
				CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н
XIV-30-8				*					ОН		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIV-31.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R³	R°	X	Y	R'	R°
XIV-31-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	N <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н
XIV-31-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	Н	OH	H	Н
XIV-31-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-31-4	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	Н	ОН	H	H
XIV-31-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH₂Ph	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-31-6	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	H	ОН	Н	Н
XIV-31-7	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н
XIV-31-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table	XIV-32	,

No No		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XIV-32-1	Et	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	N <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н
XIV-32-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	H	OH	Н	H
XIV-32-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	Н	OH	H	Н
XIV-32-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	Н	OH	H	Н
XIV-32-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	H	ОН	Н	Н
XIV-32-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	H	ОН	Н	Н
XIV-32-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	H	ОН	Н	Н
XIV-32-8	Et	*	Н	*	"Bu	$N_3$	F	Н	ОН	Н	H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

WO 2008/121634

Table XIV	<i>I</i> -33.						- 6			-7	
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R3	R°	X	Y	R'	R
XIV-33-1	<sup>1</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	N <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-33-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	$N_3$	F	Н	ОН	H	Н
XIV-33-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	H	OH	Н	Н
XIV-33-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	$N_3$	F	Н	OH	Н	H
XIV-33-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н
XIV-33-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-33-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-33-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	Н	ОН	Н	H 

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIV-34. $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$											
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	R°	X	Y	R'	R°
XIV-34-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	N <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-34-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н
XIV-34-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н
XIV-34-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н
XIV-34-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-34-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-34-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н
XIV-34-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

-5	Table	XIV-35

Table XIV	-35.					-				- 7	
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>3</sup>	R°	X	Y	R'	R°
XIV-35-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	N <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-35-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н
XIV-35-3	Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н
XIV-35-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-35-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-35-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-35-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-35-8	Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

WO 2008/121634

Table XIV	7 <b>-</b> 36.										
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°
XIV-36-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	"Bu	$N_3$	F	Н	ОН	Н	H
XIV-36-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	$N_3$	F	H	OH	H	H
XIV-36-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	H	OH	Н	Н
XIV-36-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н
XIV-36-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	Н	ОН	H	Н
	p-Me-Ph								OH		
XIV-36-5 XIV-36-6 XIV-36-7	p-Me-Ph p-Me-Ph p-Me-Ph	Н Н Н	H H H	CH <sub>2</sub> Ph CH <sub>2</sub> -indol-3-yl CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu "Bu "Bu	$\begin{array}{c} N_3 \\ N_3 \\ N_3 \end{array}$	F F F	Н Н Н	OH OH	H H H	Н Н Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIV	<b>7-37.</b>									_ 7	- 8
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R³	Ro	X	Y	R'	R°
XIV-37-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	N <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-37-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	$N_3$	F	Н	ОН	H	Н
XIV-37-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н
XIV-37-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	$N_3$	F	Н	ОН	Н	H
XIV-37-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	$N_3$	F	Н	ОН	H	Н
XIV-37-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-37-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н
XIV-37-8	p-F-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	Н	ОН	Н	H 

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIV  №	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XIV-38-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	N <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-38-2	=				<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	Н	ОН	H	Н
	_			$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
	-			CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
	_			CH <sub>2</sub> Ph							
				CH <sub>2</sub> -indol-3-yl		$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
	-			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>							
	p-Cl-Ph								OH		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIV-39.								
№ R <sup>1</sup>	$R^2 R^{3a} R^{3b}$	$R^4$	$R^5$	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>

**WO 2008/121634**Docket No. 60137.0034WOU1

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	
XIV-39-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	Н	OH	Н	H
XIV-39-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	Н	OH	Н	H
XIV-39-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	$N_3$	F	Н	ОН	Н	H
XIV-39-4	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
				CH <sub>2</sub> Ph		$N_3$	F	Н	OH	Н	Н
				CH <sub>2</sub> -indol-3-yl		$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
	_			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>							
XIV-39-8	-								ОН		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIV	<sup>7</sup> -40.										
№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>					Y		
XIV-40-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н
XIV-40-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н
XIV-40-3	p-I-Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н
XIV-40-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-40-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-40-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-40-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	H	ОН	Н	Н
XIV-40-8	p-I-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIV											
No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XIV-41-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Bz	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н
XIV-41-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н
XIV-41-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-41-4	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-41-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-41-6	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-41-7	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-41-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	Bz	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>5 \*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

WO 2008/121634

Table XIV	Table XIV-42.  No. $R^1 R^2 R^{3a} R^{3b}$ $R^4 R^5 R^6 X Y R^7 R^8$											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R5	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°	
XIV-42-1	Et	Н	Н	Н	Bz	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н	
XIV-42-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н	
XIV-42-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	F	Н	ОН	H	H	
XIV-42-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н	
XIV-42-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н	
XIV-42-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н	
XIV-42-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	F	Н	OH	Н	H	
XIV-42-8	Et	*	Н	*	Bz	$N_3$	F	Н	OH	Н	H	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIV	Table XIV-43.  No R <sup>1</sup> R <sup>2</sup> R <sup>3a</sup> R <sup>3b</sup> R <sup>4</sup> R <sup>5</sup> R <sup>6</sup> X Y R <sup>7</sup> R <sup>8</sup>											
Nº	R¹	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$\mathbf{R}'$	R <sup>8</sup>	
XIV-43-1	¹Pr	Н	Н	Н	Bz	N <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	H	
XIV-43-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Ħ	
XIV-43-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н	
XIV-43-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	F	Н	OH	Н	H	
XIV-43-5	i <sub>Pr</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$N_3$	F	H	OH	Н	Н	
XIV-43-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н	
XIV-43-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н	
XIV-43-8	$^{i}$ Pr	*	Н	*	Bz	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н	

10 \*R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIV-44.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$											
№	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R³	R°	X	Y	R'	R°
XIV-44-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	Bz	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-44-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н
XIV-44-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	F	Н	OH	Н	H
XIV-44-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н
XIV-44-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-44-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-44-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-44-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Bz	N <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

WO 2008/121634

Table XIV-45.  No R <sup>1</sup> R <sup>2</sup> R <sup>3a</sup> R <sup>3b</sup> R <sup>4</sup> R <sup>5</sup> R <sup>6</sup> X Y R <sup>7</sup> R <sup>8</sup>											
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°
XIV-45-1	Ph	Н	Н	Н	Bz	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-45-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	F	Н	OH	H	Н
XIV-45-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н
XIV-45-4	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н
XIV-45-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-45-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$N_3$	F	H	OH	Н	Н
XIV-45-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-45-8	Ph	*	Н	*	Bz	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIV-46. $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$												
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>3</sup>	Rº	X	Y	R'	R°	
XIV-46-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	Bz	N <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н	
XIV-46-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	F	Η	OH	H	Н	
	p-Me-Ph				Bz	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н	
XIV-46-4	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	$N_3$	F	H	OH	Н	Н	
XIV-46-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$N_3$	F	Η	ОН	Η	Н	
				CH <sub>2</sub> -indol-3-yl								
	-			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>								
	p-Me-Ph								ОН			

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Tabl	e XI	V-4	47	Ι.

No No	71	D2	D3a	D3b	$\mathbf{D}^4$	D <sup>5</sup>	$\mathbf{p}^6$	Y	Y	$\mathbb{R}^7$	$R^8$
No	K,	K-	K	K	K	K	IV.	1	1	1	10
XIV-47-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Bz	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-47-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н
XIV-47-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	F	Η	OH	Н	Н
XIV-47-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-47-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$N_3$	F	H	OH	Н	Н
				CH <sub>2</sub> -indol-3-yl							
				CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>							
				*					ОН		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

WO 2008/121634

Table XIV	<sup>7</sup> -48.									7	0
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R⁴	R <sup>3</sup>	R <sup>o</sup>	X	Y	R'	R°
XIV-48-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Bz	N <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н
XIV-48-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	F	Н	OH	Η	Н
XIV-48-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н
XIV-48-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	F	Н	ОН	H	Н
XIV-48-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$N_3$	F	Н	ОН	Н	H
XIV-48-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XIV-48-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н
XIV-48-8	_								ОН		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIV-49.												
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R۶	Ro	X	Y	R'	R°	
XIV-49-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Bz	N <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н	
XIV-49-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н	
XIV-49-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	F	H	ОН	H	Н	
XIV-49-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н	
XIV-49-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$N_3$	F	H	OH	Н	Н	
XIV-49-6	p-Br-Ph	Н	Н .	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$N_3$	F	Н	OH	H	Н	
XIV-49-7	p-Br-Ph	Н	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н	
XIV-49-8	p-Br-Ph	*	Н	*	Bz	$N_3$	F	Н	OH	Н	Н	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Tai	ble	XI	V-	50.

No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
				Н		N <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н
				CH <sub>3</sub>	Bz	$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
	-			$CH(CH_3)_2$		$N_3$	F	Н	ОН	Н	Н
	-			CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	$N_3$	·F	Н	ОН	Н	H
	-			CH <sub>2</sub> Ph							
	_			CH <sub>2</sub> -indol-3-yl							
	-			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>							
				*					ОН		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$$R^{3a}$$
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{3b}$ 

XV

Table X											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°
XV-1-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-1-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-1-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-1-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-1-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-1-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-1-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-1-8	$CH_3$	*	Н	*	$CH_3$	F	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5 Table XV-2.

Table A											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R³	R°	X	Y	R'	R°
XV-2-1	Et	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-2-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	F	Н	OH	H	Н
XV-2-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	F	Н	OH	H	Н
XV-2-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	F	Н	ОН	H	Н
XV-2-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-2-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-2-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-2-8	Et	*	Н	*	$CH_3$	F	F	Н	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$T_{2}$	hl	Δ.	V	M.	.2

Table A										_ 7	2
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R	Rº	X	Y	R'	R°
XV-3-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-3-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	F	Н	ОН	H	Н
XV-3-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	F	Η	ОН	Н	Н
XV-3-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-3-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH₂Ph	$CH_3$	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-3-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	F	F	Н	OH	Н	H
XV-3-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-3-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	$CH_3$	F	F	Н	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Та	h	م[	XV	1_4	1
14	11)	15	$\Delta$	v	r

Table A										7	
№	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	R°	X	Y	R'	R°
XV-4-1	'Bu	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-4-2	'Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-4-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	F	Н	OH	H	H
XV-4-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-4-5	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	F	F	Н	ОН	H	Н
XV-4-6	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	F	F	Н	ОН	Н	H
XV-4-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-4-8	'Bu	*	Н	*	$CH_3$	F	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## Table XV-5 5

Table A										7	- 0
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	R°	X	Y	R'	R°
XV-5-1	Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-5-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-5-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	F	F	Н	ОН	Н	H
XV-5-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	F	Н	ОН	H	H
XV-5-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-5-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	F	F	Н	ОН	Н	H
XV-5-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-5-8	Ph	*	Н	*	$CH_3$	F	F	Н	ОН	Н	H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

WO 2008/121634

Table X	V-6.										
No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R
XV-6-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	F	F	Н	OH	Н	Η
XV-6-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	F	Η	OH	Н	Н
XV-6-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-6-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	F	Н	ОН	Н	Η
XV-6-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-6-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-6-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-6-8	p-Me-Ph	*	Н	*	$CH_3$	F	F	Н	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XV	<i>'</i> -7.										
№	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R5	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°
XV-7-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-7-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-7-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	F	Н	ОН	H	Н
XV-7-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-7-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-7-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-7-8	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-7-20	p-F-Ph	*	Н	*	$CH_3$	F	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

_	Ta	<b>L</b> 10	VI	7-8.
`	เล	nie	- X 1	/ <del>-</del> A.

Mo	P <sup>1</sup>	$\mathbb{R}^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	$R^5$	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XV-8-1	p-Cl-Ph	Н	Н	H	$CH_3$	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-8-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-8-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	F	Н	OH	Н	H
XV-8-4	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$CH_3$	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-8-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-8-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-8-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-8-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	$CH_3$	F	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

WO 2008/121634 Docket No. 60137.0034WOU1

Table XV	<sup>7</sup> -9.										
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XV-9-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-9-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	F	Н	OH	Н	H
XV-9-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-9-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-9-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-9-7	p-Br <b>-</b> Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-9-8	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	F	Н	ОН	Н	Н
	n-Br-Ph			*	CH <sub>3</sub>				ОН		

XV-9-20 p-Br-Ph \* H \*  $CH_3$  F F H OF  $^*R^2$  and  $R^{3b}$  joined together by  $(CH_2)_3$  to form five-membered ring.

Table XV	Table XV-10.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ X Y $R^7$ $R^8$										
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
XV-10-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-10-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-10-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-10-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-10-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-10-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-10-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-10-8	p-I-Ph	*	Н	*	$CH_3$	F	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table XV-11.

No No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XV-11-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Et	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-11-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-11-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	F	F	Н	OH	Η	Н
XV-11-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-11-5	$CH_3$	Н	Н	CH₂Ph	Et	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-11-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-11-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-11-8	$CH_3$	*	Н.	*	Et	F	F	Н	ОН	Η	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XV-12. R<sup>8</sup>  $R^4$   $R^5$   $R^6$ XY  $R^1$   $R^2$   $R^{3a}$ Н F н он н XV-12-1 Et H Η Et F Η н он н Η Et F F  $CH_3$ XV-12-2 Et H Η н он н Η Et F  $CH(CH_3)_2$ XV-12-3 Et H H CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> Et F H OH H F XV-12-4 Et H CH<sub>2</sub>Ph Et F F H OH H Η XV-12-5 Et H Η H OH H CH<sub>2</sub>-indol-3-yl Et F XV-12-6 Et H H F H OH H CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub> Et F XV-12-7 Et H H H OH H H Et F F XV-12-8 Et \* Η

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XV											
N₂	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
XV-13-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Et	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-13-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-13-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-13-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-13-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-13-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-13-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	F	F	Н	ОН	Н	Н
VV_13_8	$i_{\mathbf{Pr}}$	*	н	*	Et	F	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table XV-14.
J	Table A V-14.

No	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$\mathbb{R}^7$	R <sup>8</sup>
XV-14-1	<sup>t</sup> Bu		Н	Н	Et	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-14-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-14-3	'Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	F	F	Н	OH	Н	H
XV-14-4	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-14-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-14-6	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-14-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH₂CH₂SCH₃	Et	F	F	Н	ОН	Н	H
XV-14-8	'Bu	*	Н	*	Et	F	F	Н	OH	Н	H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

WO 2008/121634 Docket No. 60137.0034WOU1

	Ta	ıbl	e X	V-	15
--	----	-----	-----	----	----

No No		R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XV-15-1	Ph	Н	Н	Н	Et	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-15-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-15-3	Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-15-4	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-15-5	Ph	Н	Н	CH₂Ph	Et	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-15-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-15-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-15-8	Ph	*	Н	*	Et	F	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Ta	1 1	•	771	7	-1	_
1 0	h	0	X,	<b>W</b> -	. 1	h
1 (1			71	v -	- 1	v.

1 abic A v		-2	- 3a	73h	D4	n.5	D6	37	Y	<b>D</b> 7	D8
$\mathcal{N}_{\overline{0}}$	$R^1$	R <sup>2</sup>	R	R	K.	K	K	Х	Y	K	K
XV-16-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	Et	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-16-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-16-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-16-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	F	F	Н	ОН	Н	H
XV-16-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-16-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-16-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	F	F	Н	ОН	Н	Η .
XV-16-8	p-Me-Ph	*	Н	*	Et	F	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## 5 Table XV-17.

1 auto A v	-17.										
№	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	R٥	X	Y	R'	R°
XV-17-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Et	F	F	Н	ОН	Н	H
XV-17-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	F	F	Н	OH	H	Н
XV-17-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	F	F	Н	ОН	H	Н
XV-17-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	F	F	Н	ОН	H	Н
XV-17-5	p-F-Ph	Н	Н	CH₂Ph	Et	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-17-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	F	F	Н	ОН	Н	H
XV-17-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-17-8	p-F-Ph	*	Н	*	Et	F	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

WO 2008/121634

Table XV	Table XV-18.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ X Y $R^7$ $R^8$											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R⁴	R <sup>5</sup>	R°	X	Y	R'	R°	
XV-18-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Et	F	F	Н	ОН	Н	H	
XV-18-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	F	F	Н	OH	Н	Н	
XV-18-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	F	F	Н	ОН	Н	H	
XV-18-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	F	F	Н	ОН	Н	H	
XV-18-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH₂Ph	Et	F	F	Н	ОН	Н	Н	
XV-18-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	F	F	Н	ОН	Н	Н	
XV-18-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	F	F	Н	ОН	Н	Н	
XV-18-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	Et	F	F	Н	OH	Η	Н	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XV	7-19.										
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R⁴	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°
XV-19-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Et	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-19-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	F	F	Η	OH	Н	Н
XV-19-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-19-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	F	F	Η	OH	Н	Н
XV-19-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH₂Ph	Et	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-19-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-19-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	F	F	Н	ОН	Η	Н
XV-19-8	p-Br-Ph	*	Н	*	Et	F	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

_		~		^
5	Tahl	e XV	V -20	1.

No No		$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XV-20-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Et	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-20-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	F	F	Н	ОН	Η	Н
XV-20-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	F	F	Н	OH	H	Н
XV-20-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-20-5	p-I-Ph	Н	Н	CH₂Ph	Et	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-20-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-20-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-20-8	p-I-Ph	*	Н	*	Et	F	F	Н	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XV	7-21.										
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R5	Ro	X	Y	R'	R°
XV-21-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-21-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-21-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-21-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-21-5	$CH_3$	Н	Н	CH₂Ph	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-21-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-21-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	F	F	Н	ОН	Η	Н
XV-21-8	$CH_3$	*	Н	*	'Pr	F	F	Н	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XV	Table XV-22.  No $R^1 R^2 R^{3a} R^{3b}$ $R^4 R^5 R^6 X Y R^7 R^8$										
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R
XV-22-1	Et	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-22-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-22-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	'Pr	F	F	Н	ОН	Н	H
XV-22-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	F	F	Ή	ОН	Н	Н
XV-22-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	F	F	Η	ОН	Н	Н
XV-22-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-22-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-22-8	Et	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table XV-23.
J	1 auto A V -23.

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XV-23-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-23-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	F	F	Η	ОН	Η.	Н
XV-23-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	'Pr	F	F	Н	OH	H	H
XV-23-4	$^{i}$ Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-23-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-23-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-23-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-23-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XV											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°
XV-24-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-24-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	OH	Н	H
XV-24-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-24-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	ОН	Н	H
XV-24-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	ОН	Н	H
XV-24-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-24-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-24-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	F	F	Η	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XV										_ 7	
Nº	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>3</sup>	R°	X	Y	R'	R°
XV-25-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-25-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	OH	Η	Н
XV-25-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	OH	Н	H
XV-25-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-25-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-25-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-25-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	F	F	Η	OH	Н	Н
XV-25-8	Ph	*	Н	*	'Pr	F	F	Н	OH	H	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Tabl	e XV-26.
٦.	าสกเ	E A V-ZU.

No No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XV-26-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	'Pr	F	F	Н	ОН	Н	Н
	p-Me-Ph				<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	OH	Η	H
XV-26-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	F	F	H	OH	Н	H
XV-26-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	OH	Н	H
XV-26-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	OH	Н	H
XV-26-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	F	F	Н	ОН	Н	Н
	_			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	F	F	Η	ОН	Η	Н
	p-Me-Ph				'Pr		F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

WO 2008/121634

Table XV	<i>I</i> -27.									_ 7	_ 2
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R³	Rº	X	Y	R'	R°
XV-27-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-27-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	OH	H	Н
XV-27-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	OH	H	H
XV-27-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-27-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-27-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	F	F	H	ОН	Η	Н
	_			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	ОН	Н	Н
	p-F-Ph					F	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XV										7	
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R5	R°	X	Y	R'	R°
XV-28-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	'Pr	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-28-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	F	F	Η	OH	Н	Н
XV-28-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	OH	H	Н
XV-28-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	OH	Н	Н
	p-Cl-Ph				<sup>i</sup> Pr		F	Н	ОН	Н	Н
XV-28-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	ОН	Н	Η
	_			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	OH	Н	Н
	p-Cl-Ph				<sup>i</sup> Pr		F	Н	ОН	H	H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table XV	-29.										
•	№	R <sup>1</sup>	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
•	XV-29-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	OH	Н	Н
	XV-29-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	F	F	Н	OH	Н	Н
	XV-29-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	OH	Н	H
	XV-29-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	OH	H	H
	XV-29-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	F	F	Н	OH	Н	Н
	XV-29-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	ОН	Н	Н
		p-Br-Ph				'Pr	F	F	Н	ОН	Н	Н
		p-Br-Ph		Н	*	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

WO 2008/121634

Table XV	7-30.									_ 7	
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	R <sup>o</sup>	X	Y	R'	R°
XV-30-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	'Pr	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-30-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-30-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	F	F	H	OH	Н	H
XV-30-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-30-5	p-I-Ph	Н	Н	CH₂Ph	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-30-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-30-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-30-8	p-I-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	F	F	Н	ОН	Н	H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XV	7-31.									- 7	<u> </u>
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R۶	R°	X	Y	R'	R°
XV-31-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	"Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-31-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-31-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-31-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-31-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-31-6	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	F	F	Н	ОН	Н	H
XV-31-7	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-31-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Tabl	le X	V-32.

1 able A v						5	-6			<del>-</del> 7	D8
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	R°	X	Y	R'	R°
XV-32-1	Et	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-32-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	F	F	H	OH	H	Н
XV-32-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	F	F	H	OH	Η	Н
XV-32-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	F	F	Н	ОН	H	Н
XV-32-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-32-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	ОН	Н	H
XV-32-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-32-8	Et	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

WO 2008/121634

Table XV	7-33.										
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°
XV-33-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-33-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	ОН	Н	H
XV-33-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-33-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-33-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-33-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-33-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-33-8	$^{i}\mathrm{Pr}$	*	Н	*	"Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XV											- •
No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>3</sup>	R٥	X	Y	R'	R°
XV-34-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-34-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-34-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-34-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-34-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-34-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-34-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	ОН	Н	H
XV-34-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5.

Table A v										_ 7	-8
No	$R^{I}$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R۶	R°	X	Y	R'	R°
XV-35-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-35-2	Ph	Н	H	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	F	F	Η	OH	H	Н
XV-35-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-35-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-35-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-35-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	F	F	Н	ОН	H	H
XV-35-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-35-8	Ph	*	Н	*	"Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XV-36.												
No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	
XV-36-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	OH	Н	Н	
XV-36-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	OH	Н	H	
XV-36-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	F	F	Н	OH	Н	Н	
XV-36-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	F	F	Н	OH	Н	Н	
XV-36-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH₂Ph	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н	
XV-36-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н	
XV-36-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н	
XV-36-8	p-Me-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XV-37.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$												
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	$R^8$	
XV-37-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н	
XV-37-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	F	F	H	OH	Н	Н	
XV-37-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н	
XV-37-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н	
XV-37-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	ОН	H	Н	
XV-37-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н	
XV-37-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н	
XV-37-8	p-F-Ph	*	Н	*	"Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Tabla	XV-38.

No No	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XV-38-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н
	-			CH <sub>3</sub>	"Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-38-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-38-4	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-38-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-38-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-38-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	F	F	Н	ОН	H	Н
XV-38-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	"Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Docket No. 6013/.0034W
------------------------

Table XV	7 <b>-</b> 39.										
№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
XV-39-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-39-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-39-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-39-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-39-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-39-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	ОН	H	Н
XV-39-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-39-8	p-Br-Ph	*	Н	*	"Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XV-40.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$												
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>	
XV-40-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н	
XV-40-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н	
XV-40-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н	
XV-40-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н	
XV-40-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	F	F	Н	OH	Н	Н	
XV-40-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	F	F	Н	OH	Н	Н	
XV-40-7	p-I <b>-</b> Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	F	F	Н	ОН	Н	Н	
XV-40-8	p-I-Ph	*	Н	*	"Bu	F	F	Н	OH	Н	Н	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Tabl	a VI	V-41.
7	1 adi	ヒハ	v <del>-4</del> 1.

I able A v											_ 0
No	$R^{i}$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R	R°	X	Y	R'	R°
XV-41-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Bz	F	F	Н	ОН	Н	H
XV-41-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-41-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	F	F	Н	ОН	Н	H
XV-41-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-41-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-41-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-41-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-41-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	Bz	F	F	Н	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

WO 2008/121634

Table XV	<sup>7</sup> -42.										
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R۶	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°
XV-42-1	Et	Н	Н	Н	Bz	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-42-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	F	F	Н	ОН	H	Н
XV-42-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	F	F	Н	OH	H	H
XV-42-4	Eŧ	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	F	F	Н	OH	H	Н
XV-42-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	F	F	Н	OH	H	Н
XV-42-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	F	F	H	ОН	Н	Н
XV-42-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-42-8	Et	*	Н	*	Bz	F	F	Н	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XV-43. $R^1 R^2 R^{3a} R^{3b}$ $R^4 R^5 R^6 X Y R^7 R^8$													
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>		
XV-43-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Bz	F	F	Н	OH	Н	H		
XV-43-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	F	F	Н	ОН	Н	Ħ		
XV-43-3	<sup>i</sup> Pr	H	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	F	F	Н	OH	H	Н		
XV-43-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	F	F	Н	OH	Н	Н		
XV-43-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	F	F	Н	OH	H	Н		
XV-43-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	F	F	Н	OH	Н	Н		
XV-43-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	F	F	Н	OH	Н	Н		
XV-43-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Bz	F	F	Н	ОН	Н	H		

\*R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

<sup>7</sup> -44.									. 7	. 0
$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R۶	Rº	X	Y	R'	R°
<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	Bz	F	F	Н	OH	Н	Н
<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	F	F	Н	ОН	Н	Н
<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	F	F	Н	OH	H	Н
<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	F	F	Н	OH	H	Н
<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	F	F	Н	OH	Н	Н
<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	F	F	Н	OH	Η	H
<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	F	F	Н	ОН	Н	Н
<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Bz	F	F	Н	ОН	Н	H
	Bu 'Bu 'Bu 'Bu 'Bu 'Bu 'Bu 'Bu 'Bu 'Bu	R¹ R²  'Bu H  'Bu H  'Bu H  'Bu H  'Bu H  'Bu H	R¹ R² R³a  ¹Bu H H	R¹         R²         R³a         R³b           'Bu         H         H         H           'Bu         H         H         CH3           'Bu         H         H         CH(CH3)2           'Bu         H         H         CH2CH(CH3)2           'Bu         H         H         CH2Ph           'Bu         H         H         CH2-indol-3-yl           'Bu         H         H         CH2CH2SCH3	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴           'Bu         H         H         H         Bz           'Bu         H         H         CH3         Bz           'Bu         H         H         CH(CH3)2         Bz           'Bu         H         H         CH2CH(CH3)2         Bz           'Bu         H         H         CH2Ph         Bz           'Bu         H         H         CH2-indol-3-yl         Bz           'Bu         H         H         CH2CH2SCH3         Bz	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴         R⁵           ¹Bu         H         H         H         Bz         F           ¹Bu         H         H         CH₃         Bz         F           ¹Bu         H         H         CH(CH₃)₂         Bz         F           ¹Bu         H         H         CH₂CH(CH₃)₂         Bz         F           ¹Bu         H         H         CH₂Ph         Bz         F           ¹Bu         H         H         CH₂-indol-3-yl         Bz         F           ¹Bu         H         H         CH₂-CH₂SCH₃         Bz         F	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴         R⁵         R²           ¹Bu         H         H         H         Bz         F         F           ¹Bu         H         H         CH₃         Bz         F         F           ¹Bu         H         H         CH₂CH(CH₃)₂         Bz         F         F           ¹Bu         H         H         CH₂Ph         Bz         F         F           ¹Bu         H         H         CH₂-indol-3-yl         Bz         F         F           ¹Bu         H         H         CH₂-CH₂SCH₃         Bz         F         F	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴         R⁵         R6         X           ¹Bu         H         H         H         Bz         F         F         H           ¹Bu         H         H         CH₃         Bz         F         F         H           ¹Bu         H         H         CH₂CH(CH₃)₂         Bz         F         F         H           ¹Bu         H         H         CH₂CH(CH₃)₂         Bz         F         F         H           ¹Bu         H         H         CH₂-indol-3-yl         Bz         F         F         H           ¹Bu         H         H         CH₂-CH₂SCH₃         Bz         F         F         H	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴         R⁵         R⁶         X         Y           ¹Bu         H         H         H         Bz         F         F         H         OH           ¹Bu         H         H         CH(CH₃)₂         Bz         F         F         H         OH           ¹Bu         H         H         CH₂CH(CH₃)₂         Bz         F         F         H         OH           ¹Bu         H         H         CH₂-Indol-3-yl         Bz         F         F         H         OH           ¹Bu         H         H         CH₂-CH₂-SCH₃         Bz         F         F         H         OH	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴         R⁵         R6         X         Y         R²           ¹Bu         H         H         H         Bz         F         F         H         OH         H           ¹Bu         H         H         CH(CH₃)₂         Bz         F         F         H         OH         H           ¹Bu         H         H         CH₂CH(CH₃)₂         Bz         F         F         H         OH         H           ¹Bu         H         H         CH₂-Indol-3-yl         Bz         F         F         H         OH         H           ¹Bu         H         H         CH₂-CH₂-SCH₃         Bz         F         F         H         OH         H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

T-1.1.	7777	15	

I able A v										7	0
Nº	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	R°	X	Y	R'	R°
XV-45-1	Ph	Н	Н	Н	Bz	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-45-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-45-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-45-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-45-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-45-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-45-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-45-8	Ph	*	Н	*	Bz	F	F	Н	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tal	sle	X	$I_{-4}$	6
1 41	,,,	/ <b>1</b>		v.

Nº	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XV-46-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	Bz	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-46-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-46-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-46-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	F	F	Н	OH	Н	H
	p-Me-Ph										
XV-46-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-46-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	F	F	H	ОН	Н	Н
XV-46-8	p-Me-Ph	*	Н	*	Bz	F	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### 5 Table XV-47.

-	Nº	<del></del>	<b>D</b> 2	D 3a	D.3b	D4	D <sup>5</sup>	D6	v	Y	$\mathbf{p}^7$	P8
	№	R*	K.	K	K**	K	K	K	Λ	1	I	1
-	XV-47-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Bz	F	F	Н	OH	Н	Н
	XV-47-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	F	F	Н	OH	H	H
	XV-47-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	F	F	Н	ОН	Н	Н
	XV-47-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	F	F	H	OH	H	H
	XV-47-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	F	F	Н	ОН	Н	Н
	XV-47-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	F	F	Н	OH	Н	Н
	XV-47-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	F	F	Н	ОН	Н	Н
	XV-47-8	p-F-Ph	*	Н	*	Bz	F	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

WO 2008/121634 Docket No. 60137.0034WOU1

Table 1	XV-48.				
No	$\mathbf{p}^1$	$\mathbb{R}^2$	$\mathbb{R}^{3a}$	$\mathbf{R}^{3b}$	

No No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XV-48-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Bz	F	F	Н	ОН	Н	Н
	-			CH <sub>3</sub>	Bz	F	F	Н	ОН	H	H
XV-48-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	F	F	Н	OH	Н	H
				CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	F	F	Н	OH	Н	Н
				CH <sub>2</sub> Ph							
				CH <sub>2</sub> -indol-3-yl							
XV-48-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	F	F	Н	OH	Н	H
XV-48-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	Bz	F	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XV	Table XV-49. $R^{1}$ $R^{2}$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^{4}$ $R^{5}$ $R^{6}$ $X$ $Y$ $R^{7}$ $R^{8}$										
No	$R^{I}$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	R <sup>o</sup>	X	Y	R'	R°
XV-49-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Bz	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-49-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	F	F	Н	OH	Н	Н
XV-49-3	p-Br-Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	F	F	Η	OH	H	H
XV-49-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	F	F	Н	OH	H	Н
XV-49-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	F	F	H	ОН	Н	Н
XV-49-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	F	F	Н	ОН	Н	Н
XV-49-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	F	F	H	ОН	Н	Н
	p-Br-Ph				Bz	F	F	Н	OH	Н	Н
$*R^2$ and	*R <sup>2</sup> and R <sup>3b</sup> joined together by (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> to form five-membered ring.										

~	TC-1.1-	XV-50.	
``	Lanie	X V - 3U.	

No No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XV-50-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Bz	F	F	Н	OH	Н	H
XV-50-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	F	F	Н	OH	H	Н
XV-50-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	F	F	H	ОН	H	Н
XV-50-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	F	F	Н	OH	H	Н
XV-50-5	p-I-Ph	Н	Н	CH₂Ph	Bz	F	F	H	ОН	Н	Н
XV-50-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	F	F	Η	ОН	Н	H
XV-50-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	F	F	H	ОН	Н	Н
XV-50-8	p-I-Ph	*	Н	*	Bz	F	F	Н	ОН	Н	H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

PCT/US2008/058183

Docket No. 60137.0034WOU1

$$R^{3a}$$
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3a}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3a}$ 
 $R^{3a}$ 

XVI

Table XV										_ 7	_ 0
N₂	$R^1$	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R°	X	Y	R'	R°
XVI-1-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	F	F	F	ОН	Н	H
XVI-1-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-1-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-1-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-1-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	F	F	F	ОН	Н	H
XVI-1-6	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-1-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-1-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	$CH_3$	F	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table XV	1.7

Table A v				- AL	/	~5	6	3.7	* 7	<b>n</b> 7	D8
№	$R^{1}$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R	R	Х	Y	K.	K
XVI-2-1	Et	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-2-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-2-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$\mathrm{CH}_3$	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-2-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-2-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-2-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	F	F	F	OH	Н	H
XVI-2-7	Et	Н	Н	CH₂CH₂SCH₃	$CH_3$	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-2-8	Et	*	Н	*	$CH_3$	F	F	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

2983472-1

Table XVI-3. $R^{1} R^{2} R^{3a} R^{3b}$ $R^{4} R^{5} R^{6} X Y R^{7} R^{8}$												
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>3</sup>	R°	X	Y	R'	R°	
XVI-3-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	F	F	F	ОН	Н	Н	
XVI-3-2	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	F	F	OH	Н	Н	
XVI-3-3	$^{i}$ Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	F	F	OH	Н	·H	
XVI-3-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	F	F	OH	Н	Н	
XVI-3-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	F	F	F	ОН	Н	Н	
XVI-3-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	F	F	F	OH	Н	Н	
XVI-3-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	F	F	ОН	Н	Н	
XVI-3-8	$^{i}$ Pr	*	Н	*	$CH_3$	F	F	F	ОН	Н	Н	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVI-4.  No. $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$													
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R۶	Rº	X	Y	R'	R°		
XVI-4-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	F	F	F	ОН	Н	Н		
XVI-4-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	F	F	ОН	Н	H		
XVI-4-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	F	F	ОН	H	Н		
XVI-4-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Η	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	F	F	OH	Н	Н		
XVI-4-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	F	F	F	ОН	Н	Н		
XVI-4-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	F	F	F	ОН	H	Н		
XVI-4-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	F	F	OH	Н	Н		
XVI-4-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	$CH_3$	F	F	F	ОН	Н	Н		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table XV	/I-5.										
	№	$R^{I}$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$\mathbf{R}^{7}$	R <sup>8</sup>
	XVI-5-1	Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	F	F	F	ОН	Н	Н
	XVI-5-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	F	F	OH	Н	Н
	XVI-5-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	F	F	ОН	Η	Н
	XVI-5-4	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$CH_3$	F	F	F	ОН	Н	Н
	XVI-5-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	F	F	F	OH	Н	Н
	XVI-5-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	F	F	F	ОН	Н	Н
	XVI-5-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	F	F	ОН	Н	Н
	XVI-5-8	Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	F	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

**WO 2008/121634**Docket No. 60137.0034WOU1

Table XVI-6.  No. $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$													
No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$									
XVI-6-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	F	F	F	OH	H	Н		
XVI-6-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	F	F	OH	Н	Н		
XVI-6-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	F	F	ОН	Н	Н		
XVI-6-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	F	F	F	ОН	Н	Н		
XVI-6-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	F	F	F	ОН	Н	Н		
XVI-6-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	F	F	F	ОН	Н	Н		
XVI-6-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	F	F	ОН	Н	Н		
XVI-6-8	p-Me-Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	F	F	F	ОН	Н	Н		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVI	Table XVI-7.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ X Y $R^7$ $R^8$													
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°			
XVI-7-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	F	F	F	OH	Н	Н			
XVI-7-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	F	F	OH	Н	Н			
XVI-7-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	F	F	ОН	Н	Н			
XVI-7-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	F	F	ОН	Н	Н			
XVI-7-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	F	F	F	ОН	Н	H			
XVI-7-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	F	F	F	ОН	Н	Н			
XVI-7-8	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	F	F	OH	Н	Н			
XVI-7-20	p-F-Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	F	F	F	ОН	Н	Н			

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table XV	/I-8.										
	№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
	XVI-8-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	F	F	F	ОН	Н	Н
	XVI-8-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	F	F	OH	Н	Н
	XVI-8-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	F	F	OH	Н	Н
	XVI-8-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	F	F	ОН	Н	Н
	XVI-8-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	F	F	F	ОН	Н	Н
	XVI-8-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	F	F	F	ОН	Н	Н
	XVI-8-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	F	F	ОН	Н	Н
		p-Cl-Ph			*					ОН		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVI	Table XVI-9.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ X Y $R^7$ $R^8$													
No	$\mathbb{R}^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R5	Ro	X	Y	R'	R°			
XVI-9-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	F	F	F	ОН	Н	Н			
XVI-9-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	F	F	OH	Н	Н			
XVI-9-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	F	F	OH	Н	H			
XVI-9-4	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$CH_3$	F	F	F	ОН	Н	Н			
XVI-9-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	F	F	F	ОН	Н	Н			
XVI-9-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	F	F	F	OH	Н	Н			
XVI-9-8	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	F	F	ОН	Н	Н			
XVI-9-20	p-Br-Ph	*	Н	*	$CH_3$	F	F	F	ОН	Н	Н			

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVI-10. $N_{2}$ R <sup>1</sup> R <sup>2</sup> R <sup>3a</sup> R <sup>3b</sup> R <sup>4</sup> R <sup>5</sup> R <sup>6</sup> X Y R <sup>7</sup> R <sup>8</sup>													
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R۶	R°	X	Y	R'	R°		
XVI-10-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	F	F	F	ОН	Н	Н		
XVI-10-2	p-I-Ph	H	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	F	F	ОН	Н	Н		
XVI-10-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	F	F	ОН	Н	Н		
XVI-10-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	F	F	ОН	Н	Н		
XVI-10-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	F	F	F	OH	Н	Н		
XVI-10-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	F	F	F	OH	Н	Н		
				CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>									
XVI-10-8				*	$CH_3$				ОН				

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	Rº	X	Y	R'	R'
XVI-11-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Et	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-11-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-11-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	F	F	F	ОН	Н	H
XVI-11-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	F	F	F	ОН	Н	ŀ
XVI-11-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	F	F	F	ОН	Н	ŀ
XVI-11-6	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	F	F	F	OH	Н	ŀ
XVI-11-7	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	F	F	F	OH	Н	F
XVI-11-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	Et	F	F	F	OH	Н	ŀ

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

WO 2008/121634

Table XVI-12.  No. $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$													
N₂	$R^1$	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R۶	Ro	X	Y	R'	R°		
XVI-12-1	Et	Н	Н	Н	Et	F	F	F	ОН	Н	Н		
XVI-12-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	F	F	F	ОН	Н	Н		
XVI-12-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	F	F	F	ОН	Н	Н		
XVI-12-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	F	F	F	ОН	Η	Н		
XVI-12-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	F	F	F	ОН	Н	Н		
XVI-12-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	F	F	F	OH	Н	Н		
XVI-12-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	F	F	F	OH	Н	Н		
XVI-12-8	Et	*	Н	*	Et	F	F	F	OH	Н	Η		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVI-13.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$													
No	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°		
XVI-13-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Et	F	F	F	ОН	Н	Н		
XVI-13-2	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	F	F	F	OH	Н	Н		
XVI-13-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	F	F	F	ОН	Н	H		
XVI-13-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	F	F	F	ОН	H	Н		
XVI-13-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH₂Ph	Et	F	F	F	ОН	Н	Н		
XVI-13-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	F	F	F	OH	Н	Н		
XVI-13-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	F	F	F	OH	Η	Н		
XVI-13-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Et	F	F	F	OH	Н	Н		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

_	11 7	Y TY 4 4	
5	Table X	VI-14.	

No No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XVI-14-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	Et	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-14-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	F	F	F	OH	H	Н
XVI-14-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	F	F	F	ОН	H	H
XVI-14-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	F	F	F	OH	H	H
XVI-14-5	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-14-6	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-14-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-14-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Et	F	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

WO 2008/121634

Table XV										7	0
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R5	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°
XVI-15-1	Ph	Н	Н	Н	Et	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-15-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	F	F	F	OH	H	Н
XVI-15-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-15-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-15-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	F	F	F	ОН	Н	H
XVI-15-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-15-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-15-8	Ph	*	Н	*	Et	F	F	F	ОН	Н	H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XV	I-16.									_ 7	
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R⁴	R³	R°	X	Y	R'	R°
XVI-16-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	Et	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-16-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	F	F	F	ОН	Н	Η
XVI-16-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-16-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	F	F	F	ОН	Н	H
XVI-16-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-16-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-16-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	F	F	F	OH	H	Н
XVI-16-8	p-Me-Ph	*	Н	*	Et	F	F	F	OH	Н	H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

_	Table	VIII	17
_	Lanie	A V 1-	- 1 /

No No	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XVI-17-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Et	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-17-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	F	F	F	OH	H	Н
XVI-17-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	F	F	F	OH	H	H
XVI-17-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-17-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-17-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	F	F	F	ОН	Η	Н
XVI-17-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-17-8	p-F-Ph	*	Н	*	Et	F	· <b>F</b>	F	ОН	H	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XV	[-18.						<del></del>			-71	
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R⁴	R <sup>3</sup>	R	X	Y	R'	R°
XVI-18-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Et	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-18-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-18-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	F	F	F	ОН	H	Н
XVI-18-4	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-18-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH₂Ph	Et	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-18-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-18-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-18-8									ОН		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XV	I-19.									- 4-	
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R5	R	X	Y	R'	R°
XVI-19-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Et	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-19-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	F	F	F	OH	H	Н
XVI-19-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-19-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	F	F	F	ОН	H	Н
XVI-19-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-19-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-19-7	p-Br <b>-</b> Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-19-8	p-Br-Ph	*	Н	*	Et	F	F	F	ОН	Ή	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table XVI	[-20.									
	N₂	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'
	XVI-20-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Et	F	F	F	OH	Н
	XVI-20-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	F	F	F	OH	Н
	XVI-20-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	F	F	F	ОН	Н
	XVI-20-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	F	F	F	OH	Н
	XVI-20-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	F	F	F	ОН	Н
	XVI-20-6	_			CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	F	F	F	ОН	Н
	XVI-20-7	_				Et	F	F	F	ОН	Н
	XVI-20-8	_		Н	*	Et	F	F	F	ОН	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## WO 2008/121634

Table XV										7	0
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R	Rº	X	Y	R'	R°
XVI-21-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	'Pr	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-21-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-21-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-21-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-21-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-21-6	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	ОН	H	Н
XVI-21-7	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-21-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	'Pr	F	F	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVI										- 7	8
№	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R3	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
XVI-22-1	Et	Н	Н	Н	'Pr	F	F	F	ОН	Н	H
XVI-22-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-22-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	OH	Н	H
XVI-22-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-22-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-22-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-22-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	F	F	·F	ОН	$\mathbf{H}_{\cdot}$	Н
XVI-22-8	Et	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	OH	Н	H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table	XVI-23	

Table AV			20	3h	<b>D</b> 4	73.5	<b>D</b> 6	37	37	D7	D8
№	R¹	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>30</sup>	R.	R	K.	Х	Y	K	K
XVI-23-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-23-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	F	F	F	OH	H	Н
XVI-23-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-23-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-23-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-23-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-23-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-23-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

WO 2008/121634

Table XVI-24.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$											
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R	R°	X	Y	R'	R°
XVI-24-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-24-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	OH	Η	Н
XVI-24-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$^{i}$ Pr	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-24-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$^{i}$ Pr	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-24-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	ОН	Н	H
XVI-24-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-24-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-24-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	'Pr	F	F	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XV											
Nº	R1	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°
XVI-25-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-25-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-25-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	'Pr	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-25-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-25-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	ОН	Н	H
XVI-25-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-25-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-25-8	Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table 7	KVI-26.
	No	$R^1$

No No	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
XVI-26-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	'Pr	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-26-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	ОН	Η	Н
XVI-26-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-26-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-26-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-26-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-26-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	ОН	Н	Н
	p-Me-Ph					F	F	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

WO 2008/121634 Docket No. 60137.0034WOU1

Table XVI-27.  No. $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$											
No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R5	R	X	Y	R'	R°
XVI-27-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-27-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-27-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	ОН	H	H
XVI-27-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	ОН	Н	H
XVI-27-5	p-F-Ph	Н	Н	CH₂Ph	<sup>i</sup> Pr	$^{1}\mathbf{F}$	F	F	ОН	H	Н
XVI-27-6	p-F <b>-</b> Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-27-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-27-8	p-F-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	OH	Η	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XV	I-28.									7	-
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°
XVI-28-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-28-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-28-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-28-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-28-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	ОН	Η	H
XVI-28-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	F	F	F	ОН	Η	Н
XVI-28-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-28-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

_	Tob1	~ VI	/I-29.
7	- rani	елі	/ I-Z9.

No No	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XVI-29-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	'Pr	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-29-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	ОН	Η	Н
XVI-29-3	p-Br-Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	OH	Н	H
XVI-29-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-29-5	p-Br-Ph	Ή	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	ОН	H	Н
XVI-29-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	F	F	F	OH	Η	Н
XVI-29-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-29-8	p-Br-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

WO 2008/121634

Table XV	[-30.										
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
XVI-30-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	'Pr	F	F	F	OH	Н	H
XVI-30-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	ОН	Н	H
XVI-30-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	ОН	Н	·H
XVI-30-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	ОН	Η	Н
XVI-30-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-30-6	p-I <b>-</b> Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	ОН	Η	Н
XVI-30-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	F	F	F	ОН	Η	Н
XVI-30-8					<sup>i</sup> Pr		F	F	ОН	Н	H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XV										7	_ •
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	Rв	X	Y	R'	R°
XVI-31-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	"Bu	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-31-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-31-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	ОН	Н	H
XVI-31-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-31-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-31-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-31-7	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-31-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

_	Table	WILLIAM	22
_	1 anie	$\mathbf{x} \mathbf{v} \mathbf{i}$	- 7 /

I able A VI							_ 6			-7	T 8
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R3	R°	X	Y	R'	R°
XVI-32-1	Et	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-32-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-32-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-32-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-32-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-32-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-32-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-32-8	Et	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

WO 2008/121634

Table XVI-33. $R^{1}$ $R^{2}$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^{4}$ $R^{5}$ $R^{6}$ $X$ $Y$ $R^{7}$ $R^{8}$											
№	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R	Rº	X	Y	R'	R°
XVI-33-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-33-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	OH	Η	Н
XVI-33-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-33-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-33-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-33-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-33-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-33-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XV	Table XVI-34.  No R <sup>1</sup> R <sup>2</sup> R <sup>3a</sup> R <sup>3b</sup> R <sup>4</sup> R <sup>5</sup> R <sup>6</sup> X Y R <sup>7</sup> R <sup>8</sup>										
№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	$R^5$	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°
XVI-34-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-34-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-34-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-34-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	OH	H	Н
XVI-34-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-34-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-34-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-34-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

_	Tr. 1.1.	3/3/11/2	_
``	Lanie	XVI-3	Э.

No		R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XVI-35-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-35-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-35-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-35-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-35-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-35-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-35-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-35-8	Ph	*	Н	*	"Bu	F	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	YVI_36

lable XV										_ 7	8_
No	$R^{1}$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R	R°	X	Y	R'	R°
XVI-36-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-36-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	OH	H	Н
XVI-36-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-36-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-36-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	F	F	F	OH	Н	H
XVI-36-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-36-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-36-8	p-Me-Ph	*	Н	*	"Bu	F	F	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tah	ما.	$\mathbf{X}\mathbf{V}$	I-37
1 411		/\ V	1,,,

Table A V	L-3/.					- 5	_ 6			77	-8
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R3	R	X	Y	R'	R°
XVI-37-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-37-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-37-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-37-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-37-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-37-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-37-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-37-8									ОН		
XVI-37-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	F	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# 5 Table XVI-38.

Nº	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XVI-38-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	"Bu	F	F	F	OH	Н	H
XVI-38-2	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_3$	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	OH	Η	Н
XVI-38-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-38-4	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	F	F	F	ОН	Н	H
XVI-38-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-38-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-38-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	ОН	Н	Н
				*							

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

WO 2008/121634

Table XV	Table XVI-39.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$										
№	R <sup>1</sup>	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R⁴	R³	Ro	X	Y	R'	R°
XVI-39-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-39-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-39-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-39-4	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	ОН	H	Н
XVI-39-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-39-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	ОН	Н	H
XVI-39-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	ОН	Н	H
XVI-39-8	p-Br-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XV	Table XVI-40.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$											
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R٥	R	X	Y	R'	R°	
XVI-40-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	OH	Н	Н	
XVI-40-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	OH	Η	Н	
XVI-40-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	OH	Н	H	
XVI-40-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	F	F	F	ОН	Н	Н	
XVI-40-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	F	F	F	OH	Н	Н	
				CH <sub>2</sub> -indol-3-yl								
XVI-40-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	OH	Н	Н	
XVI-40-8	p-I-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	F	F	F	OH	Н	Н	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table	$\mathbf{v}_{\mathbf{W}}$	_41

No No	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XVI-41-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Bz	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-41-2	CH <sub>3</sub>	Η	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	F	F	F	ОН	Н	H
XVI-41-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	F	F	F	OH	Н	Н
XVI-41-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-41-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH₂Ph	Bz	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-41-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	F	F	F	ОН	Η	Н
XVI-41-7	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	F	F	F	ОН	Н	Н
XVI-41-8	$CH_3$	*	Н	*	Bz	F	F	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XV	Table XVI-42.  No R <sup>1</sup> R <sup>2</sup> R <sup>3a</sup> R <sup>3b</sup> R <sup>4</sup> R <sup>5</sup> R <sup>6</sup> X Y R <sup>7</sup> R <sup>8</sup>												
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°		
XVI-42-1	Et	Н	Н	Н	Bz	F	F	F	OH	Н	Н		
XVI-42-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	F	F	F	OH	Н	Н		
XVI-42-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	F	F	F	OH	Н	Н		
XVI-42-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	F	F	F	ОН	H	H		
XVI-42-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	F	F	F	ОН	Н	H		
XVI-42-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	F	F	F	ОН	Н	Н		
XVI-42-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	F	F	F	OH	Н	Н		
XVI-42-8	Et	*	Н	*	Bz	F	F	F	OH	Н	Н		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVI	Table XVI-43.  No $R^1 R^2 R^{3a} R^{3b}$ $R^4 R^5 R^6 X Y R^7 R^8$													
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R°	X	Y	R'	R°			
XVI-43-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Bz	F	F	F	ОН	Н	H			
XVI-43-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	F	F	F	OH	Н	Ħ			
XVI-43-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	F	F	F	OH	H	Н			
XVI-43-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	F	F	F	OH	Н	Н			
XVI-43-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	F	F	F	OH	Н	Н			
XVI-43-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	F	F	F	ОН	Н	Н			
XVI-43-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	F	F	F	ОН	Н	Н			
XVI-43-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Bz	F	F	F	ОН	Н	Н			

\*R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVI-44.												
No	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°	
XVI-44-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	Bz	F	F	F	OH	Н	Н	
XVI-44-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	F	F	F	OH	H	Н	
XVI-44-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	F	F	F	OH	Н	H	
XVI-44-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	F	F	F	OH	H	Н	
XVI-44-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	F	F	F	OH	H	Н	
XVI-44-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	F	F	F	ОН	Н	Н	
XVI-44-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	F	F	F	OH	Н	Н	
XVI-44-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Bz	F	F	F	ОН	Н	H	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

F OH H H

Table XVI-45.  No $R^1 R^2 R^{3a} R^{3b}$ $R^4 R^5 R^6 X Y R^7 R^8$													
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°		
XVII-45-1	Ph	Н	Н	Н	Bz	F	F	F	ОН	Н	Н		
XVII-45-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	F	F	F	OH	H	Н		
XVII-45-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	F	F	F	OH	H	Н		
XVII-45-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	F	F	F	ОН	Н	Н		
XVII-45-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	F	F	F	ОН	H	Н		
XVII-45-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	F	F	F	OH	Н	Н		
XVII-45-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	F	F	F	ОН	Н	H		
XVII-45-8	Ph	*	Н	*	Bz	F	F	F	OH	Н	H		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVI-	Table XVI-46.  No R <sup>1</sup> R <sup>2</sup> R <sup>3a</sup> R <sup>3b</sup> R <sup>4</sup> R <sup>5</sup> R <sup>6</sup> X Y R <sup>7</sup> R <sup>8</sup>												
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$\mathbf{R}^{7}$	R <sup>8</sup>		
XVII-46-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	Bz	F	F	F	ОН	Н	Н		
XVII-46-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	F	F	F	OH	H	H		
XVII-46-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	F	F	F	OH	Н	Н		
XVII-46-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	F	F	F	OH	H	H		
XVII-46-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	F	F	F	ОН	H	Н		
XVII-46-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	F	F	F	OH	Н	Н		

XVII-46-7 p-Me-Ph H H CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub> Bz F F F OH H H

Bz F

## 5 Table XVI-47.

XVII-46-8 p-Me-Ph \* H

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XVII-47-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Bz	F	F	F	OH	Н	Н
XVII-47-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	F	F	F	OH	Η	H
XVII-47-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	F	F	F	OH	Н	Н
XVII-47-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	F	F	F	ОН	Н	Н
XVII-47-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	F	F	F	ОН	Н	Н
XVII-47-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	F	F	F	OH	Н	Н
XVII-47-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	F	F	F	OH	Н	Н
XVII-47-8	p-F-Ph	*	Н	*	Bz	F_	F	F	ОН	Н	H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVI-48.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ X Y $R^7$ $R^8$											
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R	R	X	Y	R'	R°
XVII-48-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Bz	F	F	F	ОН	Н	Н
XVII-48-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	F	F	F	ОН	Н	Н
XVII-48-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	F	F	F	OH	H	Н
XVII-48-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	F	F	F	OH	H	Н
XVII-48-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	F	F	F	OH	Н	Н
XVII-48-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	F	F	F	ОН	Н	Н
XVII-48-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	F	F	F	OH	Η	Н
XVII-48-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	Bz	F	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVI	Table XVI-49. $R^{1}$ $R^{2}$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^{4}$ $R^{5}$ $R^{6}$ $X$ $Y$ $R^{7}$ $R^{8}$												
No	$R^{T}$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R	R	X	Y	R'	R°		
XVII-49-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Bz	F	F	F	ОН	Н	Н		
XVII-49-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	F	F	F	OH	H	H		
XVII-49-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	F	F	F	ОН	Н	Н		
XVII-49-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	F	F	F	ОН	Н	Н		
XVII-49-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH₂Ph	Bz	F	F	F	OH	Н	Н		
XVII-49-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	F	F	F	OH	Н	Н		
XVII-49-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	F	F	F	OH	Н	Н		
XVII-49-8	p-Br-Ph	*	Н	*	Bz	F	F	F	OH	Н	H		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table XVI-	-50.										
	No	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
	XVII-50-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Bz	F	F	F	ОН	Н	Н
	XVII-50-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	F	F	F	OH	Н	Н
	XVII-50-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	F	F	F	OH	Н	Н
	XVII-50-4	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	F	F	F	OH	Н	Н
	XVII-50-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	F	F	F	ОН	Н	Н
	XVII-50-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	F	F	F	OH	Н	Н
	XVII-50-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	F	F	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

**XVII-50-8** p-I-Ph \* H \*

Bz F F

F OH H H

$$R^{3a}$$
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{3b}$ 

XVII

Table XV	II-1.										
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	Ro	X	Y	R'	R°
XVII-1-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-1-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	H	F	OH	Н	Н
XVII-1-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-1-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-1-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-1-6	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-1-7	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-1-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	$CH_3$	F	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tal	ole	$\mathbf{X}$	٧J	[I-2.
-----	-----	--------------	----	-------

R <sup>7</sup>	
Н	T Y
	Н
Н	Н
Н	Н
Н	Н
Н	Н
н н	Н
Н	Н
Н	Н
	H H H H H H H H H H H H

<sup>5 \*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

2983472-1

Table XV	Table XVII-3.  No. $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>ο</sup>	X	Y	R'	R°	
XVII-3-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	F	Н	F	OH	Н	Н	
XVII-3-2	<sup>i</sup> Pr	Н	$\mathbf{H}^{\mathbf{T}}$	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	Н	F	OH	Н	H	
XVII-3-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	Н	F	OH	Н	Н	
XVII-3-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$CH_3$	F	Н	F	OH	Н	Н	
XVII-3-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	F	Н	F	OH	Н	Н	
XVII-3-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	F	Н	F	ОН	Н	Н	
XVII-3-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	Н	F	ОН	Н	Н	
XVII-3-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	$CH_3$	F	Н	F	OH	Н	Н	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XV	Table XVII-4.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$										
No	$R^1$	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R°	X	Y	R'	R°
XVII-4-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-4-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	Н	F	OH	H	Н
XVII-4-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-4-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-4-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-4-6	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-4-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-4-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	$CH_3$	F	Н	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table XV							_				
	№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
	XVII-5-1	Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	F	Н	F	OH	Н	Н
	XVII-5-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	H	F	OH	Н	Н
	XVII-5-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	Н	F	ОН	Н	Н
	XVII-5-4	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$CH_3$	F	Н	F	OH	Н	Н
	XVII-5-5	Ph	Н	H	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	F	Н	F	ОН	Н	Н
	XVII-5-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	F	Н	F	ОН	Н	Н

XVII-5-8 Ph \* \*R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

XVII-5-7 Ph H H CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub> CH<sub>3</sub> F

Н

H F OH H H

CH<sub>3</sub> F H F OH H H

WO 2008/121634

Table XV	II-6.										
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°
XVII-6-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-6-2	p-Me-Ph	Н	H	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	Н	F	OH	Н	H
XVII-6-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	H	F	OH	Н	Н
XVII-6-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-6-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	F	Н	F	ОН	Н	Н
				CH <sub>2</sub> -indol-3-yl							
XVII-6-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	Н	F	ОН	Н	Н
	p-Me-Ph				CH <sub>3</sub>				ОН		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVII-7. $ \frac{R^{1}}{R^{0}} $ $ \frac{R^{2}}{R^{3a}} $ $ \frac{R^{3a}}{R^{3b}} $ $ \frac{R^{4}}{R^{5}} $ $ \frac{R^{6}}{R^{6}} $ $ \frac{R^{7}}{R^{8}} $											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R۶	Ro	X	Y	R'	R°
XVII-7-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-7-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	H	F	ОН	Н	Н
XVII-7-3	p-F-Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$CH_3$	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-7-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-7-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-7-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-7-8	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-7-20	p-F-Ph	*	Н	*	$CH_3$	F	Н	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table	VVII	[_Ω
٦.	ranie	$\lambda V \Pi$	<b>-</b> Δ.

No No	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XVII-8-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-8-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-8-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-8-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-8-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-8-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-8-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	Н	F	OH	Н	Н
				*					ОН		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Docket No.	60137.0034WOU1
- DOCKELINO.	00137.0034WOUL

Table XVII	Table XVII-9.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$										
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
XVII-9-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-9-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	H	F	OH	Н	Н
XVII-9-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	Н	F	OH	Η	Н
XVII-9-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	Н	F	ОН	H	Н
XVII-9-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-9-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	F	Η	F	ОН	H	Н
XVII-9-8	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-9-20	p-Br-Ph	*	Н	*	$\text{CH}_3$	F	Н	F	OH	Η	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVII-10. $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$											
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°
XVII-10-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-10-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	Н	F	OH	Н	Η
XVII-10-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-10-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-10-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	F	Н	F	ОН	Н	H
XVII-10-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	F	Н	F	OH	Н	Η
XVII-10-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	F	Н	F	OH	Н	H
XVII-10-8	p-I-Ph	*	Н	*	$CH_3$	F	Н	F	OH	Н	H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table XVII										-	
	№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R5	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°
	XVII-11-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Et	F	Н	F	ОН	Н	Н
	XVII-11-2	CH <sub>3</sub>	Н	Η	CH <sub>3</sub>	Et	F	Н	F	OH	Η	H
	XVII-11-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	F	Н	F	ОН	H	H
	XVII-11-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	F	Н	F	ОН	Н	H
	XVII-11-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	F	Н	F	ОН	Н	Н
	XVII-11-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	F	Н	F	OH	Н	Н
	XVII-11-7	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	F	Н	F	OH	Н	Н
	XVII-11-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	Et	F	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

WO 2008/121634

Table XVII	Table XVII-12.  No $R^1 R^2 R^{3a} R^{3b}$ $R^4 R^5 R^6 X Y R^7 R^8$												
N₂	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°		
XVII-12-1	Et	Н	Н	Н	Et	F	Н	F	ОН	Н	Н		
XVII-12-2	Et	Η	Н	CH <sub>3</sub>	Et	F	Н	F	OH	Н	Н		
XVII-12-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	F	Н	F	OH	H	Н		
XVII-12-4	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	F	Н	F	ОН	Н	Н		
XVII-12-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	F	Н	F	ОН	Н	Н		
XVII-12-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	F	Н	F	ОН	Н	Н		
XVII-12-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	F	Н	F	ОН	Н	Н		
XVII-12-8	Et	*	Н	*	Et	F	Н	F	ОН	Н	Н		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVII-13. $R^{1}$ $R^{2}$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^{4}$ $R^{5}$ $R^{6}$ $X$ $Y$ $R^{7}$ $R^{8}$												
No	$R^{1}$	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R⁴	R۶	R°	X	Y	R'	R°	
XVII-13-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Et	F	Н	F	ОН	Н	Н	
XVII-13-2	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	F	Η -	F	OH	Н	Н	
XVII-13-3	$^{i}$ Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	F	Н	F	ОН	Н	Н	
XVII-13-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	F	Н	F	ОН	Н	Н	
XVII-13-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	F	Н	F	ОН	Н	Н	
XVII-13-6	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	F	Н	F	ОН	Н	Н	
XVII-13-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	F	Н	F	ОН	Н	Н	
XVII-13-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Et	F	Н	F	ОН	Н	Н	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table XVII	-14.									7	8
	№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>3</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
	XVII-14-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	Et	F	Н	F	OH	Н	Н
	XVII-14-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	F	H	F	ОН	Н	Н
	XVII-14-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	F	Н	F	ОН	Н	Н
	XVII-14-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	F	Н	F	OH	Н	H
	XVII-14-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	F	Н	F	OH	Н	Н
	XVII-14-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	F	Н	F	ОН	Н	Н
	XVII-14-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	F	Н	F	OH	Н	Н
	XVII-14-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Et	F	Н	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

WO 2008/121634

Docket No. 60137.0034WOU1

Table XVII-15.  No $R^1 R^2 R^{3a} R^{3b}$ $R^4 R^5 R^6 X Y R^7 R^8$													
№	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R۶	R°	X	Y	R'	R°		
XVII-15-1	Ph	Н	Н	Н	Et	F	Н	F	OH	Н	Н		
XVII-15-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	F	Н	F	OH	H	Η		
XVII-15-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	F	Н	F	ОН	H	H		
XVII-15-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	F	Н	F	OH	Н	Н		
XVII-15-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	F	Н	F	ОН	Н	Н		
XVII-15-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	F	Н	F	ОН	Н	Н		
XVII-15-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	F	Н	F	ОН	Н	H		
XVII-15-8	Ph	*	Н	*	Et	F	Н	F	ОН	Н	Н		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVII-16. $R^{1}$ $R^{2}$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^{4}$ $R^{5}$ $R^{6}$ $X$ $Y$ $R^{7}$ $R^{8}$												
№	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	R°	X	Y	R'	R°	
XVII-16-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	Et	F	Н	F	ОН	Н	Н	
XVII-16-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	F	Н	F	OH	Н	Н	
XVII-16-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	F	Н	F	OH	Н	Н	
XVII-16-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	F	Н	F	ОН	Н	Н	
XVII-16-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH₂Ph	Et	F	Н	F	OH	Н	Н	
XVII-16-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	F	Н	F	OH	Н	H	
XVII-16-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	F	Н	F	OH	Н	Н	
XVII-16-8	p-Me-Ph	*	Н	*	Et	F	Н	F	OH	Н	Н	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVII-17.

№	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°
XVII-17-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Et	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-17-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-17-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-17-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-17-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	F	Н	F	ОН	Н	Н
	-			CH2-indol-3-yl							

XVII-17-7 p-F-Ph H H CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub> Et F H F OH H H \* Et F H F OH H H XVII-17-8 p-F-Ph \* H \*R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5

WO 2008/121634

Table XVII-18.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$												
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°	
XVII-18-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Et	F	Н	F	OH	Н	Н	
XVII-18-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	F	Н	F	ОН	Н	Н	
XVII-18-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	F	Н	F	OH	Н	H	
				CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	F	Н	F	ОН	Н	Н	
XVII-18-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	F	Н	F	ОН	Н	Н	
XVII-18-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	F	Н	F	OH	Н	Н	
XVII-18-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	F	Н	F	OH	Н	Н	
XVII-18-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	Et	F	Н	F	ОН	Н	Н	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVII-19. $R^{1}$ $R^{2}$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^{4}$ $R^{5}$ $R^{6}$ $X$ $Y$ $R^{7}$ $R^{8}$											
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R3	R°	X	Y	R'	R°
XVII-19-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Et	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-19-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	F	Н	F	ОН	H	H
XVII-19-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-19-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	F	H	F	OH	Н	Н
XVII-19-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	F	Н	F	ОН	Н	H
XVII-19-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-19-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-19-8	p-Br-Ph	*	Н	*	Et	F	Н	F	ОН	H	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

_	on 1 1	T 7 T 7 T	T 00
5	Table	XVI	1-20.

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
XVII-20-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Et	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-20-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	F	Н	F	OH	H	Н
XVII-20-3	p-I <b>-</b> Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-20-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-20-5	p-I-Ph	Н	Н	CH₂Ph	Et	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-20-6	p-I <b>-</b> Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$\mathbf{F}$	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-20-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	F	H	F	ОН	Н	Н
XVII-20-8											

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

WO 2008/121634

Table XVI	[-21										
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	R	X	Y	R'	R°
XVII-21-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	'Pr	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-21-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	ОН	H	Н
XVII-21-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	'Pr	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-21-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	ОН	H	Н
XVII-21-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-21-6	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-21-7	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-21-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVII-22. $R^1 R^2 R^{3a} R^{3b}$ $R^4 R^5 R^6 X Y R^7 R^8$											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°
XVII-22-1	Et	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-22-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	OH	Н	H
XVII-22-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	'Pr	F	Н	F	OH	H	Н
XVII-22-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	OH	H	Н
XVII-22-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-22-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-22-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-22-8	Et	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table XVII-23.

1 able A v II				21.	_ 1	_ 5	-6		3.7	D.7	D8
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R	К°	Х	Y	К′	K°
XVII-23-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-23-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	OH	H	Н
XVII-23-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$^{i}$ Pr	F	Н	F	OH	Н	H
XVII-23-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-23-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-23-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-23-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-23-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	F	H	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVII-24.  R <sup>1</sup> R <sup>2</sup> R <sup>3a</sup> R <sup>3b</sup> R <sup>4</sup> R <sup>5</sup> R <sup>6</sup> X Y R <sup>7</sup> R <sup>8</sup>											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°
XVII-24-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-24-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	OH	H	Н
XVII-24-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	'Pr	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-24-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	OH	Н	H
XVII-24-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-24-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-24-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-24-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tal	ole	XV	711	-25
1 21	110	$\wedge$ v		-4.3.

-23.				- 1	_ 5				<b>D</b> 7	8
$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R	R°	Х	Y	K'	K*
Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	OH	Н	Н
Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	OH	H	Н
Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	F	H	F	OH	Н	H
Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	F	H	F	OH	H	Н
Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	F	H	F	OH	Н	Н
Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	ОН	Н	Н
Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	ОН	Н	Н
Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	OH	Н	Н
	R <sup>1</sup> Ph Ph Ph Ph Ph Ph Ph	R <sup>1</sup> R <sup>2</sup> Ph H	R¹         R²         R³a           Ph         H         H           Ph         H         H	R¹         R²         R³a         R³b           Ph         H         H         H           Ph         H         H         CH <sub>3</sub> Ph         H         H         CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> Ph         H         H         CH <sub>2</sub> Ph           Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl           Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴           Ph         H         H         H         'Pr           Ph         H         H         CH <sub>3</sub> 'Pr           Ph         H         H         CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> 'Pr           Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> 'Pr           Ph         H         H         CH <sub>2</sub> Ph         'Pr           Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         'Pr           Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> 'Pr	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴         R³           Ph         H         H         H         'Pr         F           Ph         H         H         CH3         'Pr         F           Ph         H         H         CH(CH3)2         'Pr         F           Ph         H         H         CH2CH(CH3)2         'Pr         F           Ph         H         H         CH2Ph         'Pr         F           Ph         H         H         CH2-indol-3-yl         'Pr         F           Ph         H         H         CH2CH2SCH3         'Pr         F	R1       R2       R3a       R3b       R4       R5       R6         Ph       H       H       H       H       H       Fr       F       H         Ph       H       H       CH3       Pr       F       H         Ph       H       H       CH(CH3)2       Pr       F       H         Ph       H       H       CH2CH(CH3)2       Pr       F       H         Ph       H       H       CH2Ph       Pr       F       H         Ph       H       H       CH2-indol-3-yl       Pr       F       H         Ph       H       H       CH2CH2SCH3       Pr       F       H	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴         R⁵         R⁶         X           Ph         H         H         H         H         F         H         F           Ph         H         H         CH₃         'Pr         F         H         F           Ph         H         H         CH₂CH(CH₃)₂         'Pr         F         H         F           Ph         H         H         CH₂Ph         'Pr         F         H         F           Ph         H         H         CH₂-indol-3-yl         'Pr         F         H         F           Ph         H         H         CH₂-CH₂-CH₂-CH₃         'Pr         F         H         F	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴         R⁵         R⁶         X         Y           Ph         H         H         H         H         Fr         F         H         F         OH           Ph         H         H         CH(CH₃)₂         Pr         F         H         F         OH           Ph         H         H         CH₂CH(CH₃)₂         Pr         F         H         F         OH           Ph         H         H         CH₂Ph         Pr         F         H         F         OH           Ph         H         H         CH₂CH₂SCH₃         Pr         F         H         F         OH	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴         R³         R⁶         X         Y         R³           Ph         H         H         H         H         Fr         F         H         F         OH         H           Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> Pr         F         H         F         OH         H           Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> Pr         F         H         F         OH         H           Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         Pr         F         H         F         OH         H           Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> Pr         F         H         F         OH         H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# 5 Table XVII-26.

No No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XVII-26-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-26-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	OH	H	H
XVII-26-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-26-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-26-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-26-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-26-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	OH	Н	H
XVII-26-8					<sup>i</sup> Pr				ОН		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

~	1	1	777	7TT	$^{2}$	

Table AVII	1-27.									- 7	- 8
№	R¹	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°
XVII-27-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-27-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-27-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-27-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-27-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-27-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-27-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-27-8	p-F-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	ОН	H	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tak	10	XV	ſΤ	20
1281	ne	$\mathbf{x} \mathbf{v}$	н	-20.

No	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XVII-28-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	'Pr	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-28-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	ОН	H	H
XVII-28-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-28-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	F	H	F	OH	Н	Н
XVII-28-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	F	H	F	OH	Н	Н
XVII-28-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-28-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-28-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	'Pr	F	Н	F	OH	Н	H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## 5 Table XVII-29.

No No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XVII-29-1	p-Br-Ph	Н	Н	H	'Pr	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-29-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-29-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	F	H	F	ОН	Н	Н
XVII-29-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$^{i}$ Pr	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-29-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	F	Н	F	ОН	Н	H
XVII-29-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-29-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-29-8	p-Br-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

WO 2008/121634 Docket No. 60137.0034WOU1

Table XVII-30.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ X Y $R^7$ $R^8$													
№	$R^1$	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R°	X	Y	R'	R°		
XVII-30-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	'Pr	F	Н	F	ОН	Н	Н		
XVII-30-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	F	Н	F	ОН	Н	Н		
XVII-30-3	p-I <b>-</b> Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	ОН	Н	Н		
XVII-30-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	ОН	Н	H		
XVII-30-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	ОН	Н	Н		
XVII-30-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	OH	Н	Н		
XVII-30-7	p-I <b>-</b> Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	OH	Н	Н		
XVII-30-8	p-I-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	F	Н	F	OH	Н	Н		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVII-31. $R^1 = R^2 = R^{3a} = R^{3b}$ $R^4 = R^5 = R^6 = X = Y = R^7 = R^8$												
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R۶	Ro	X	Y	R'	R°	
XVII-31-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	F	Н	F	OH	Н	Н	
XVII-31-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	F	H	F	OH	Н	Н	
XVII-31-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	F	Н	F	OH	Н	Н	
XVII-31-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	F	Н	F	OH	Н	H	
XVII-31-5	$CH_3$	Н	Н	CH₂Ph	<sup>n</sup> Bu	F	Н	F	ОН	Н	Н	
XVII-31-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	F	Н	F	OH	H	Н	
XVII-31-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	F	Н	F	OH	Н	Н	
XVII-31-8	$CH_3$	*	Н	*	"Bu	F	Н	F	OH	Н	Н	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table	VVI	11_32
•	Lanie	$\mathbf{x} \mathbf{v}$	п-э∠.

I able X V II										7	
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R۶	Ro	X	Y	R'	R°
XVII-32-1	Et	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-32-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-32-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	F	Н	F	ОН	Н	H
XVII-32-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	F	Н	F	OH	H	Н
XVII-32-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-32-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-32-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-32-8	Et	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	F	Н	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVII-33.  No $R^1 R^2 R^{3a} R^{3b}$ $R^4 R^5 R^6 X Y R^7 R^8$												
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>	
XVII-33-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	"Bu	F	Н	F	OH	Н	Н	
XVII-33-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	F	Н	F	OH	Н	H	
XVII-33-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	F	Н	F	OH	Н	Н	
XVII-33-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	F	Н	F	ОН	Н	H	
XVII-33-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	F	Н	F	OH	Н	Н	
XVII-33-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	F	Н	F	OH	Н	Н	
XVII-33-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	F	Н	F	ОН	Н	Н	
XVII-33-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	F	Н	F	ОН	Н	Н	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVII-34.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$													
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>		
XVII-34-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	F	Н	F	ОН	Н	H		
XVII-34-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	F	Н	F	ОН	Н	Н		
XVII-34-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	F	Н	F	ОН	Н	Н		
XVII-34-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	F	Н	F	ОН	Н	Н		
XVII-34-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	F	Н	F	ОН	Н	H		
XVII-34-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	F	Н	F	ОН	Н	Н		
XVII-34-7	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	F	Н	$\mathbf{F}$	ОН	Н	Н		
XVII-34-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	F	Н	F	OH	Н	H		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table	XV	'II-:	35.

	Table A VII										_ 7	_ 0
•	№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	R°	X	Y	R'	R°
	XVII-35-1	Ph	Н	Н	Н	"Bu	F	Н	F	OH	Н	Н
	XVII-35-2	Ph	Н	H	CH <sub>3</sub>	"Bu	F	Н	F	OH	Η	H
	XVII-35-3	Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	F	Н	F	OH	Н	Н
	XVII-35-4	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	F	Н	F	ОН	Н	H
	XVII-35-5	Ph	Н	Н	CH₂Ph	<sup>n</sup> Bu	F	Н	F	ОН	Н	Н
	XVII-35-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	F	Н	F	ОН	Н	Н
	XVII-35-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	F	Н	F	ОН	Н	Н
	XVII-35-8	Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	F	Н	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVII-36.  No. $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$													
No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R۶	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°		
XVII-36-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	F	Н	F	OH	H	Н		
XVII-36-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	F	Н	F	OH	Н	H		
XVII-36-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	F	Н	F	OH	Н	Н		
XVII-36-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	F	Н	F	ОН	Н	H		
				CH <sub>2</sub> Ph									
XVII-36-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	F	Н	F	ОН	Н	H		
				CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>									
XVII-36-8					<sup>n</sup> Bu				OH				

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVII-37. $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$													
No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°		
XVII-37-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	F	Н	F	ОН	Н	Н		
XVII-37-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	F	Н	F	ОН	Н	Н		
XVII-37-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	F	Н	F	ОН	Н	Н		
XVII-37-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	F	Н	F	ОН	Н	Н		
XVII-37-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	F	Н	F	ОН	Н	Н		
XVII-37-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	F	Н	F	ОН	Н	Н		
XVII-37-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	F	Н	F	OH	Н	Н		
XVII-37-8	p-F-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	F	Н	F	ОН	Н	Н		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table XVII	[-38.										
	№	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$\mathbb{R}^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
. ,	XVII-38-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	F	Н	F	ОН	Н	Н
	XVII-38-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	F	Н	F	ОН	Н	Н
	XVII-38-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	F	H	F	ОН	Н	Н
		_			CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	F	Н	F	ОН	Н	Н
	XVII-38-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	F	Н	F	ОН	Н	Н
					CH <sub>2</sub> -indol-3-yl							
					CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>							
	XVII-38-8					<sup>n</sup> Bu				ОН		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVII-39. $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$											
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°
XVII-39-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-39-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-39-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-39-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-39-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-39-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	F	Н	F	OH	Н	Н
				CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>							
XVII-39-8				*	"Bu				OH		
	1										

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVII-40. $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$											
№	$R^{1}$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	Ro	X	Y	R'	R°
XVII-40-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-40-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-40-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-40-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-40-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-40-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	F	Н	F	ОН	Н	Н
				CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>							
XVII-40-8	p-I-Ph	*	Н	*	"Bu	F	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table XVII										-	
•	№	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R	X	Y	R'	R°
	XVII-41-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Bz	F	Н	F	ОН	Н	Н
	XVII-41-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	F	Н	F	OH	Н	Н
	XVII-41-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	F	Н	F	ОН	Н	Н
	XVII-41-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	F	Н	F	ОН	Н	Н
	XVII-41-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	F	Н	F	ОН	Н	Н
	XVII-41-6	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	F	Н	F	OH	Н	H
	XVII-41-7	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	F	Н	F	OH	Н	Н
	XVII-41-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	Bz	F	Н	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVI										_ 7	
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R	Ro	X	Y	R'	R°
XVII-42-1	Et	Н	Н	Н	Bz	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-42-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	F	H	F	OH	H	Н
XVII-42-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	F	H	F	OH	H	Н
XVII-42-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-42-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-42-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-42-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-42-8	Et	*	Н	*	Bz	F	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVII										_ 7	_ 8
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	R°	X	Y	R'	R°
XVII-43-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Bz	F	Н	F	ОН	Н	H
XVII-43-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	F	Н	F	OH	Н	Ą
XVII-43-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-43-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-43-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-43-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-43-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-43-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Bz	F	Н	F	OH	Н	H

10 \*R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVII-44. $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$											
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°
XVII-44-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	Bz	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-44-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-44-3	'Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-44-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-44-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-44-6	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-44-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-44-8	'Bu	*	Н	*	Bz	F	Н	F	OH	Н	H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

WO 2008/121634 Docket No. 60137.0034WOU1

Table XVII	[-45.									_ 1	
№	R1	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°
XVII-45-1	Ph	Н	Н	Н	Bz	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-45-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-45-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-45-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-45-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-45-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-45-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-45-8	Ph	*	Н	*	Bz	F	Н	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVII-46.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	R <sup>o</sup>	X	Y	R'	R°
XVII-46-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	Bz	F	Н	F	ОН	Н	H
XVII-46-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	F	Н	F	OH	Н	H
XVII-46-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	F	Н	F	ОН	Н	H
				CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-46-5											
				CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	F	Н	F	OH	Н	Η
	p-Me-Ph										
	p-Me-Ph			*	Bz	F	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

№	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R3	Rº	X	Y	R'	R°
XVII-47-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Bz	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-47-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	F	Н	F	ОН	H	Н
XVII-47-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	F	Н	F	ОН	Н	Н
YVII_47_4	n-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	F	Н	F	OH	H	Н

XVII-47-4 p-F-Ph H H CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> Bz F H F OH H CH<sub>2</sub>Ph Bz F H F OH H XVII-47-5 p-F-Ph H H Η CH<sub>2</sub>-indol-3-yl Bz F H F OH H XVII-47-6 p-F-Ph H H CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub> Bz F H F OH H XVII-47-7 p-F-Ph H H Bz F H F OH H H

Н

Table XVII-47.

**XVII-47-8** p-F-Ph \*

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

WO 2008/121634

Table XVII-48. $R^{1}$ $R^{2}$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^{4}$ $R^{5}$ $R^{6}$ $X$ $Y$ $R^{7}$ $R^{8}$											
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	R°	X	Y	R'	R°
XVII-48-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Bz	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-48-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-48-3	_				Bz	F	Н	F	OH	Н	Н
	-			CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-48-5											
				CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	F	Н	F	ОН	Н	H
				CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>							
XVII-48-8					Bz				ОН		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVII-49. $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R۶	R°	X	Y	R'	R°
XVII-49-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Bz	F	Н	F	OH	H	Н
XVII-49-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	F	H	F	OH	Н	Н
XVII-49-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	F	Н	F	OH	Н	Н
XVII-49-4	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	F	Н	F	OH	Н	H
XVII-49-5									OH		
				CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	F	Н	F	OH	Н	Н
				CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>							Н
XVII-49-8				*	Bz				OH		Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5 Tabl	le X	VI.	L-50	
--------	------	-----	------	--

No	R <sup>1</sup>	$\overline{R}^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XVII-50-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Bz	F	Н	F	ОН	Н	H
XVII-50-2					Bz	F	Н	F	ОН	Н	Н
XVII-50-3					Bz	F	Н	F	ОН	Н	H
				CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	F	Н	F	ОН	Н	Н
				CH <sub>2</sub> Ph							
				CH <sub>2</sub> -indol-3-yl							
				CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>							
XVII-50-8									ОН		
<b>ALVII 20 0</b>	P * * *										

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

XVIII

Table XVI	II-1.									- 7	
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	$R^5$	R°	X	Y	R'	R°
XVIII-1-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-1-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-1-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	H
XVIII-1-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	H
XVIII-1-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-1-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-1-7	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-1-8	$CH_3$	*	Н	*	$CH_3$	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

~	Table	373 7TT	r 🔿
٦.	Table	$\lambda V \Pi$	-/

No 1 abic X v I	$\frac{R^1}{R^1}$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
XVIII-2-1	Et	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-2-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-2-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-2-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Н
XVIII-2-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	$OCH_3$	F	Η	OH	Н	Н
XVIII-2-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	$OCH_3$	F	H	OH	H	Н
XVIII-2-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-2-8	Et	*	Н	*	$CH_3$	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

2983472-1

- 399 -

Table XVI											<del>- 0</del>
№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°
XVIII-3-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	H
XVIII-3-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	$OCH_3$	F	Н	OH	H	Н
XVIII-3-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-3-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-3-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	$OCH_3$	F	H	ОН	Н	Н
XVIII-3-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	$OCH_3$	F	H	ОН	Η	H
XVIII-3-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-3-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	$CH_3$	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVI											
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R°	X	Y	R'	R°
XVIII-4-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-4-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	H
XVIII-4-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-4-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-4-5	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	H
XVIII-4-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	CH <sub>3</sub>	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-4-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-4-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	$CH_3$	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table	XVIII-5.
3	rame	A VIII-J.

Table AVI.										_ 7	0
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R°	X	Y	R'	R°
XVIII-5-1	Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н
XVIII-5-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Η
XVIII-5-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-5-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$OCH_3$	F	Н	ОН	H	Н
XVIII-5-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	$OCH_3$	F	Н	ОН	H	Н
XVIII-5-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	OCH <sub>3</sub>	F	H	ОН	Н	Н
XVIII-5-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Н
XVIII-5-8	Ph	*	Н	*	$CH_3$	$OCH_3$	F	$_{_{I}}H$	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XV	III-6.									- 7	
No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
XVIII-6-	p-Me- Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-6- 2	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-6-	p-Me- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH₃	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-6-	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-6- 5	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-6- 6	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-6- 7	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н
XVIII-6- 8	p-Me- Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVII	I-7.										
No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R°	X	Y	R'	R°
XVIII-7-1	p-F- Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-7-2		Н	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	H	Н
XVIII-7-3		Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н
XVIII-7-4		Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-7-6	p-F-	Н	Н	CH₂Ph	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-7-7	Ph p <b>-</b> F- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
	1 11			yl							
XVIII-7-8	p-F- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н
XVIII-7-		*	Н	*	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	H	ОН	Н	Н
20	rii										

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XV	III-8.										
№	$R^1$	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R°	X	Y	R'	R°
XVIII-8-		Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
1	Ph										
XVIII-8-		Н	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н
2	Ph										
XVIII-8-	p-Cl-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	H
3	Ph										
XVIII-8-	p-Cl-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$CH_3$	OCH <sub>3</sub>	F	Η	ОН	Н	Н
4	Ph										
XVIII-8-	p-Cl-	Н	Н	CH₂Ph	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н
5	Ph										
XVIII-8-	p-Cl-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	$CH_3$	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Н
6	Ph			yl							
XVIII-8-	p-Cl-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	H
7	Ph										
XVIII-8-	p-Cl-	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
8	Ph										
-								_			

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVI	III-9.									- 7	
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R°	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
XVIII-9-	p-Br-	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н
1	Ph										
XVIII-9-	p-Br-	Н	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н
2	Ph										
XVIII-9-	p-Br-	H	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
3	Ph										
XVIII-9-	p-Br-	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	H
4	Ph										
XVIII-9-	p-Br-	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Н
6	Ph										
XVIII-9-	p-Br-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	$CH_3$	$OCH_3$	F	Н	OH	Η	H
7	Ph			yl							
XVIII-9-	p-Br-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
8	Ph										
XVIII-9-	p-Br-	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	H	Н

№	$R^1$	$R^2 R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	 R <sup>4</sup>	$R^5$	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
20	Ph									

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVII	II-10.										
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>			Y		R°
XVIII-10-	p-I- Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-10- 2	p-I- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н
XVIII-10- 3	p-I- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	, <b>F</b>	Н	ОН	Н	Н
XVIII-10-	p-I- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-10- 5	p-I- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-10-	p-I- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-10-	p-I- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-10- 8	p-I- Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVIII							,				
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
XVIII-11-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Et	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н
XVIII-11-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	H
XVIII-11-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-11-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-11-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-11-6	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Н
XVIII-11-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	H
XVIII-11-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	Et	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	H

<sup>5 \*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

WO 2008/121634

Table XVIII-12.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$												
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>	
XVIII-12-1	Et	Н	Н	Н	Et	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н	
XVIII-12-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Н	
XVIII-12-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Н	
XVIII-12-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н	
XVIII-12-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н	
XVIII-12-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н	
XVIII-12-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Н	
XVIII-12-8	Et	*	Н	*	Et	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVIII	Table XVIII-13.  No R¹ R² R³a R³b R⁴ R⁵ R⁶ X Y Rⁿ R²													
Nº	$R^1$	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>3</sup>	R°	X	Y	R'	R°			
XVIII-13-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Et	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н			
XVIII-13-2	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н			
XVIII-13-3	$^{i}$ Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Η			
XVIII-13-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н			
XVIII-13-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH₂Ph	Et	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Н			
XVIII-13-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$OCH_3$	F	H	OH	Н	Н			
XVIII-13-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	F	Η	ОН	Н	Н			
XVIII-13-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Et	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Н			

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table XVIII-	-14.									
	№	$\mathbb{R}^1$	R R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
			2								
	XVIII-14-1	<sup>t</sup> Bu	н н	Н	Et	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н
	XVIII-14-2	<sup>t</sup> Bu	н н	CH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	F	H	OH	Н	H
	XVIII-14-3	<sup>t</sup> Bu	н н	$CH(CH_3)_2$	Et	$OCH_3$	F	H	OH	Н	Н
	XVIII-14-4	<sup>t</sup> Bu	н н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	$OCH_3$	F	Н	OH	H	H
	XVIII-14-5	<sup>t</sup> Bu	н н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	$OCH_3$	F	H	OH	Н	Н
	XVIII-14-6	<sup>t</sup> Bu	н н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	OCH <sub>3</sub>	F	H	OH	Н	H
	XVIII-14-7	<sup>t</sup> Bu	н н	CH₂CH₂SCH₃	Et	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Н
	XVIII-14-8	'Bu	* H	*	Et	$OCH_3$	F	H	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# WO 2008/121634

Docket No. 60137.0034WOU1

Table XVIII	Table XVIII-15.  No $R^1 R^2 R^{3a} R^{3b}$ $R^4 R^5 R^6 X Y R^7 R^8$													
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	$R^5$	Rº	X	Υ	R'	R°			
XVIII-15-1	Ph	Н	Н	Н	Et	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	H	H			
XVIII-15-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	F	Н	ОН	H	Н			
XVIII-15-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Н			
XVIII-15-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	H			
XVIII-15-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Н			
XVIII-15-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Н			
XVIII-15-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	F	H	ОН	Η	H			
XVIII-15-8	Ph	*	Н	*	Et	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н			

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVII	Table XVIII-16.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$												
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R°	X	Y	R'	R°		
XVIII-16-	p-Me- Ph	Н	Н	Н	Et	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н		
XVIII-16- 2	p-Me- Ph	Н	H	CH <sub>3</sub>	Et	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н		
XVIII-16- 3	p-Me- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н		
XVIII-16- 4	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н		
XVIII-16- 5	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н		
XVIII-16- 6	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	Et	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н		
XVIII-16- 7	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н		
XVIII-16- 8	p-Me- Ph	*	Н	*	Et	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	H	Н		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table XVIII	[-17.										
	№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R°	X	Y	R'	R°
	XVIII-17-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Et	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	H
	XVIII-17-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	F	H	ОН	H	Н
	XVIII-17-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	$OCH_3$	F	Н	OH	H	Н

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XVIII-17-4	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-17-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Н
XVIII-17-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-17-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-17-8	-					$OCH_3$					

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVII	Table XVIII-18.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ X Y $R^7$ $R^8$												
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>ο</sup>	X	Y	R'	R°		
XVIII-18-	p-Cl-	Н	Н	Н	Et	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н		
1	Ph												
XVIII-18-	p-Cl-	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Н		
2	Ph												
XVIII-18-	p-Cl-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Н		
3	Ph												
XVIII-18-	p-Cl-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н		
4	Ph												
XVIII-18-	p-Cl-	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н		
5	Ph												
XVIII-18-	p-Cl-	Н	H	CH <sub>2</sub> -indol-3-	Et	$OCH_3$	F	Н	OH	H	Н		
6	Ph			yl									
XVIII-18-	p-Cl-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н		
7	Ph												
XVIII-18-	p-Cl-	*	Н	*	Et	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	H	Н		
8	Ph												

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVII	Table XVIII-19.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$												
№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	$R^4$	$R^5$	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>		
XVIII-19-	p-Br- Ph	Н	Н	Н	Et	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н		
XVIII-19- 2	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н		
XVIII-19- 3	p-Br- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н		
XVIII-19-	p-Br- Ph	Н	H	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	OCH <sub>3</sub>	F	H	ОН	Н	Н		

WO 2008/121634 Docket No. 60137.0034WOU1

No	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
4 XVIII-19- 5	p-Br- Ph	Н	Н	CH₂Ph	Et	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-19- 6	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	Et	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н
XVIII-19-	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н
XVIII-19- 8	p-Br- Ph	*	Н	*	Et	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVIII-20.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$											
Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°
XVIII-20-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Et	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-20-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	F	Н	OH	H	Н
XVIII-20-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Н
XVIII-20-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-20-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	$OCH_3$	F	Н	ОН	H	Н
XVIII-20-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-20-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Н
XVIII-20-8	p-I-Ph	*	Н	*	Et	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVIII-21.  Mo $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ X Y $R^7$ $R^8$												
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R۶	R°	X	Y	R'	R°	
XVIII-21-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	'Pr	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н	
XVIII-21-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	OCH <sub>3</sub>	F	H	OH	Н	Н	
XVIII-21-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н	
XVIII-21-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$^{i}$ Pr	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	H	
XVIII-21-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Н	
XVIII-21-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н	
XVIII-21-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Н	
XVIII-21-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	H	

<sup>&</sup>lt;sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

WO 2008/121634

Table XVIII										7	
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R°	X	Y	R'	R°
XVIII-22-1	Et	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-22-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-22-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-22-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-22-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-22-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-22-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	Н	OH	H	Н
XVIII-22-8	Et	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVIII	[-23.										-
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	Ro	X	Y	R'	R°
XVIII-23-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-23-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	$OCH_3$	F	Н	OH	Η	Н
XVIII-23-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-23-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	Η	OH	Н	Н
XVIII-23-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-23-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-23-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-23-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table	YVI	11_24
•	Lanie	$\mathbf{X} \mathbf{V} \mathbf{H}$	11-24.

Table XVIII	-24.										
No	$R^{I}$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°
XVIII-24-1	'Bu	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	H
XVIII-24-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Н
XVIII-24-3	'Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-24-4	'Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-24-5	'Bu	Н	Н	CH₂Ph	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-24-6	'Bu	Н	H	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-24-7	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	Н	ОН	Η	Н
XVIII-24-8	'Bu	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	Н	OH	Η	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

**WO 2008/121634**Docket No. 60137.0034WOU1

XVIII-25-7 Ph H H

XVIII-25-8 Ph \*

Table XVIII	-25.									- <del>1</del>	
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	Ro	X	Y	R'	R°
XVIII-25-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-25-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	Н	ОН	H	H
XVIII-25-3	Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	'Pr	OCH <sub>3</sub>	F	H	OH	Н	Н
XVIII-25-4	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	H	Н
XVIII-25-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	Н	OH	H	Н
XVIII-25-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	$OCH_3$	F	Н	ОН	H	Н

CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub> <sup>i</sup>Pr OCH<sub>3</sub> F H OH H H

<sup>i</sup>Pr OCH<sub>3</sub> F H OH H H

Н

Table XVI	II-26.										
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
XVIII-26-	p-Me- Ph	Н	Н	Н	'Pr	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-26- 2	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н
XVIII-26-	p-Me- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н
XVIII-26- 4	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н
XVIII-26- 5	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н
XVIII-26- 6	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	'Pr	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н
XVIII-26- 7	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-26- 8	p-Me- Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>		Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table XVII №		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
	XVIII-27-	p-F- Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н
	XVIII-27-	p-F- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

**WO 2008/121634**Docket No. 60137.0034WOU1

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
2 XVIII-27-	p-F- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
		Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
4 XVIII-27-		Н	Н	CH₂Ph	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
5 XVIII-27-		Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
6 XVIII-27-		Н	Н	-	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-27- 8	p-F- Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVII	I-28.										
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R*
XVIII-28-	-	Н	Н	Н	'Pr	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
1	Ph										
XVIII-28-		Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	H	OH	H	Н
2	Ph										
XVIII-28-		Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н
3	Ph										
XVIII-28-		Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
4	Ph										
XVIII-28-	_	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н
5	Ph										
XVIII-28-		Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н
6	Ph			yl							
XVIII-28-	1	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н
7	Ph										
XVIII-28-	•	*	Н	*	'Pr	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	H	Н
8	Ph										

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVII	II-29.										
No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$\mathbb{R}^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$\mathbf{R}^{\prime}$	R <sup>8</sup>
XVIII-29-	p-Br- Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н
XVIII-29- 2	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-29-	p-Br-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н

1											
XVIII-29-		Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
2	Ph										
XVIII-29-		Н	H	$CH(CH_3)_2$	'Pr	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н
3	Ph										
XVIII-29-		Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н
4	Ph										
XVIII-29-	_	Н	Н	CH₂Ph	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	H
5	Ph										
XVIII-29-		Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	'Pr	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
6	Ph			yl							
XVIII-29-	1	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н
7	Ph										
XVIII-29-	P	*	Н	*	'Pr	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Η	Н
0	Ph										

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVIII	Table XVIII-30.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ X Y $R^7$ $R^8$												
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R٥	X	Y	R'	R°		
XVIII-30-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	'Pr	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н		
XVIII-30-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$^{i}$ Pr	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Н		
XVIII-30-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н		
				$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н		
XVIII-30-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$^{i}$ Pr	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н		
XVIII-30-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н		
XVIII-30-7	=				<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н		
XVIII-30-8	_			*	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	H		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table XVIII											
	N₂	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	Rº	X	Y	R'	R°
	XVIII-31-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н
	XVIII-31-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	F	Н	ОН	H	Н
	XVIII-31-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Н

**WO 2008/121634**Docket No. 60137.0034WOU1

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XVIII-31-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н
XVIII-31-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	F	Н	OH	H.	Н
XVIII-31-6	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	$OCH_3$	F	Η	OH	Н	Н
XVIII-31-7	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	F	Н	ОН	H	H
XVIII-31-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	F	Н	OH	H	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVIII-32.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$													
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	R°	X	Y	R'	K°		
XVIII-32-1	Et	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н		
XVIII-32-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	F	Н	OH	Η	H		
XVIII-32-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	H		
XVIII-32-4	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н		
XVIII-32-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н		
XVIII-32-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	F	H	ОН	Н	Н		
XVIII-32-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Н		
XVIII-32-8	Et	*	Н	*	"Bu	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	H 		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVIII-33.													
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R°	Rº	X	Y	R'	R°		
XVIII-33-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	H		
XVIII-33-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	F	Η	OH	Н	Н		
XVIII-33-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Н		
XVIII-33-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	H		
XVIII-33-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н		
XVIII-33-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н		
XVIII-33-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	F	H	OH	Н	Н		
XVIII-33-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н		
XVIII-33-4 XVIII-33-5 XVIII-33-6 XVIII-33-7	<sup>i</sup> Pr <sup>i</sup> Pr <sup>i</sup> Pr <sup>i</sup> Pr	Н Н Н	Н Н Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph CH <sub>2</sub> -indol-3-yl CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu "Bu "Bu "Bu	OCH <sub>3</sub> OCH <sub>3</sub> OCH <sub>3</sub>	F F F	H H H	OH OH OH	H H H			

<sup>5 \*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVIII	Table XVIII-34.													
No	$R^{I}$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>3</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°			
XVIII-34-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	OCH₃	F	Н	OH	Н	Н			
XVIII-34-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Н			
XVIII-34-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н			
XVIII-34-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	H			

No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XVIII-34-5	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н
XVIII-34-6	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Н
XVIII-34-7	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	F	H	ОН	H	Н
XVIII-34-8	'Bu	*	Н	*	"Bu	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVIII-35.  No $R^1 R^2 R^{3a} R^{3b}$ $R^4 R^5 R^6 X Y R^7 R^8$												
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R°	X	Y	R'	R°	
XVIII-35-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н	
XVIII-35-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	H	
XVIII-35-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н	
XVIII-35-4	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н	
XVIII-35-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н	
XVIII-35-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Н	
XVIII-35-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Н	
XVIII-35-8	Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Η	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVIII-36.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ X Y $R^7$ $R^8$													
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R°	R°	X ——	Y	R'			
XVIII-	p-Me-	Н	Н	Н	"Bu	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	H		
36-1	Ph												
XVIII-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н		
36-2	Ph												
XVIII-	p-Me-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н		
36-3	Ph												
XVIII-	p-Me-	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	OCH <sub>3</sub>	F	H	OH	H	Н		
36-4	Ph												
XVIII-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н		
36-5	Ph												
XVIII-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н		
36-6	Ph			yl									
XVIII-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н		
36-7	Ph												
XVIII-	p-Me-	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	OCH₃	F	Н	OH	H	Н		
36-8	Ph												

\*R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tab	م1،	V	VI	TT.	2	7	
Tat	סונ	Λ	VI.	IT.	-)	1	

Table A VII				31							
№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	Rº	X	Y	R'	R°
XVIII-37-	•	Н	Н	Н	"Bu	OCH <sub>3</sub>	F	H	OH	H	H
1	Ph										
XVIII-37-	-	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н
2	Ph										
XVIII-37-	-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	F	H	OH	Н	Н
3	Ph										
XVIII-37-	p-F-	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
4	Ph										
XVIII-37-	p-F-	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
5	Ph										
XVIII-37-	p-F-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
6	Ph			yl							
XVIII-37-	p-F-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
7	Ph										
XVIII-37-	p-F-	*	Н	*	"Bu	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
8	Ph										

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVIII-38.

No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XVIII-38-	p-Cl- Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-38- 2	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-38- 3	p-Cl- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-38- 4	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-38- 5	p-Cl- Ph	Н	Н	CH₂Ph	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-38-	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-38-	p <b>-</b> Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н

N₂	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
7 XVIII-38- 8	p-Cl- Ph	*	Н	*	"Bu	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$T_{\alpha}$	h	1	V	<b>7T</b> 1	T	2	O	
เล	D	e	$\Lambda$	/ II	ı٠	٠.٦	7	

Table XVI				21						_ 7	- 8
No	$\mathbb{R}^1$	$\mathbb{R}^2$	R <sup>3a</sup>	R³º	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>			Y		
XVIII-39-	-	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н
1	Ph										
XVIII-39-		Н	H	CH <sub>3</sub>	"Bu	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	H	Н
2	Ph										
XVIII-39-	-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Н
3	Ph										
XVIII-39-	-	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
4	Ph										
XVIII-39-	-	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Н
5	Ph										
XVIII-39-	-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	"Bu	$OCH_3$	F	H	ОН	Н	Н
6	Ph			yl							
XVIII-39-	p-Br-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
7	Ph										
XVIII-39-	p-Br-	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
8	Ph										

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XVIII-40.

I able A VII											
№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
XVIII-40-	p-I- Ph	Н	Н	Н	"Bu	OCH₃	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-40-	p-I- Ph	Н	Н	CH₃	"Bu	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н
XVIII-40-	p-I- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-40-	p-I- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-40-	p-I- Ph	Н	Н	CH₂Ph	"Bu	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
5			,								
XVIII-40-	p-I-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	"Bu	$OCH_3$	F	H	OH	Н	Н
6	Ph			yl							
XVIII-40-	p-I-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
7	Ph										
XVIII-40-	p-I-	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
8	Ph										

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tah	10	VI	7TT	I / 1 1	i
เหก	пе	$\sim$	/ I I	1-4	

No		R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
XVIII-41-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-41-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Н
XVIII-41-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-41-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Н
XVIII-41-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-41-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-41-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-41-8	$CH_3$	*	Н	*	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table XVIII-42.

<u>No</u>		$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
XVIII-42-1	Et	Н	Н	Н	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н
XVIII-42-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Н
XVIII-42-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-42-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-42-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-42-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-42-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-42-8	Et	*	Н	*	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	H

 $<sup>^{*}</sup>$ R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XVIII-43

No		$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XVIII-43-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	H
XVIII-43-2	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н

XVIII-43-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н
XVIII-43-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-43-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH₂Ph	Bz	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Н
XVIII-43-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-43-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-43-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Bz	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

n	D. 1.	1 _	373	7 T T	<b>I-44</b>	
	เลก	ıe.	х 1	/ I I	1-44	

Table A VIII		- 2	- 30	~ 3h	<b>~</b> 4	25.5	206	37	3.7	n 7	70.8
No	R¹	R²	R3a	R	K'	R <sup>5</sup>	K°	Х	Y	K'	K°
XVIII-44-1	'Bu	Н	Н	Н	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н
XVIII-44-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	F	Н	OH	H	Н
XVIII-44-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Н
XVIII-44-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-44-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Н
XVIII-44-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-44-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-44-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Bz	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## Table XVIII-45.

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XVIII-45-1	Ph	Н	Н	Н	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-45-2	Ph	H	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	F	Н	OH	Η	Н
XVIII-45-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Н
XVIII-45-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Н
XVIII-45-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$OCH_3$	F	Н	ОН	H	Н
XVIII-45-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-45-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-45-8	Ph	*	Н	*	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н

 $<sup>^{*}</sup>$ R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVIII-46

Table XVI											
No	R <sup>1</sup>	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XVIII-46- 1	p-Me- Ph	Н	Н	Н	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н
XVIII-46- 2	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$\mathbb{R}^7$	R <sup>8</sup>
XVIII-46- 3	p-Me- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-46- 4	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-46- 5	p-Me- Ph	Н	Н	CH₂Ph	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	H
XVIII-46- 6	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-46-	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-46- 8	p-Me- Ph	*	Н	*	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	XVIII-47.
3.4	- n1

No No	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
XVIII-47-	p-F- Ph	Н	Н	Н .	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-47- 2	p-F- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н
XVIII-47- 3	p-F- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-47- 4	p-F- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-47- 5	p-F- Ph	Н	Н	CH₂Ph	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-47- 6	p-F- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-47-	p-F- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н
XVIII-47- 8	p-F- Ph	*	Н	*	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVIII-48.

 $R^2$   $R^{3a}$   $R^{3b}$ 

№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
XVIII-48-	p-Cl- Ph	Н	Н	Н	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-48- 2	p <b>-</b> Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-48- 3	p-Cl- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-48- 4	p <b>-</b> Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-48- 5	p-Cl- Ph	Н	Н	CH₂Ph	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-48-	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-48-	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-48- 8	p-Cl- Ph	*	Н	*	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVIII-49.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$											
№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
XVIII-49-	p-Br- Ph	Н	Н	Н	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-49- 2	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-49-	p-Br- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-49-	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-49-	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-49-	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-49-	p-Br- Ph	Н	Н	•	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-49- 8	p-Br- Ph	*	Н	*	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	Н

\*R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XVIII	Table XVIII-50.										
No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$\mathbf{R}^{\prime}$	R <sup>8</sup>
XVIII-50-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	Н	ОН	Н	H
XVIII-50-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	Н	OH	Н	Н
XVIII-50-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Н
XVIII-50-4	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	Н
XVIII-50-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$OCH_3$	F	Н	OH	Н	H
XVIII-50-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$OCH_3$	F	Н	ОН	H	Н
XVIII-50-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н
XVIII-50-8	p-I-Ph	*	Н	*	Bz	$OCH_3$	F	Н	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$$R^{3a} \xrightarrow{R^{3b}} N \xrightarrow{R^{2}} O \xrightarrow{Q} O \xrightarrow{R^{5}WW} O \xrightarrow{R^{6}} R^{6}$$

₹7	<b>- X</b> Z	
x	ı x	

				7 MAX M							
Table XI											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$\mathbf{R}'$	R <sup>8</sup>
XIX-1-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н
XIX-1-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	$OCH_3$	F	F	OH	H	Н
XIX-1-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$OCH_3$	F	F	OH	Н	H
XIX-1-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-1-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	$OCH_3$	F	F	ОН	H	Н
XIX-1-6	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	H
XIX-1-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-1-8	$CH_3$	*	Н	*	$CH_3$	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIX-2.

2983472-1

- 420 -

5

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
XIX-2-1	Et	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XIX-2-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н
XIX-2-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-2-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-2-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-2-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-2-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-2-8	Et	*	Н	*	$CH_3$	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XI											
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XIX-3-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XIX-3-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-3-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н
XIX-3-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-3-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-3-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-3-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-3-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	$CH_3$	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XI									****		
No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XIX-4-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XIX-4-2	'Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-4-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$CH_3$	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-4-4	'Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-4-5	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-4-6	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XIX-4-7	<sup>t</sup> Bu	H	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-4-8	'Bu	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	H

<sup>5 \*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

X-5.							·			
R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	$R^4$	$R^5$	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н
Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$OCH_3$	F	F	OH	H	Н
Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н
Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	H
Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	CH <sub>3</sub>	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н
Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	$OCH_3$	F	F	ОН	H	Н
Ph	*	Н	*	$CH_3$	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	H
	R <sup>1</sup> Ph Ph Ph Ph Ph Ph	R¹ R² Ph H	R <sup>1</sup> R <sup>2</sup> R <sup>3a</sup> Ph H H  Ph H H	R¹         R²         R³a         R³b           Ph         H         H         H           Ph         H         H         CH <sub>3</sub> Ph         H         H         CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> Ph         H         H         CH <sub>2</sub> Ph           Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl           Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴           Ph         H         H         H         CH₃           Ph         H         H         CH₃         CH₃           Ph         H         H         CH(CH₃)₂         CH₃           Ph         H         H         CH₂CH(CH₃)₂         CH₃           Ph         H         H         CH₂Ph         CH₃           Ph         H         H         CH₂-indol-3-yl         CH₃           Ph         H         H         CH₂CH₂SCH₃         CH₃	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴         R⁵           Ph         H         H         H         CH₃         OCH₃           Ph         H         H         CH₃         CH₃         OCH₃           Ph         H         H         CH(CH₃)₂         CH₃         OCH₃           Ph         H         H         CH₂CH(CH₃)₂         CH₃         OCH₃           Ph         H         H         CH₂Ph         CH₃         OCH₃           Ph         H         H         CH₂-indol-3-yl         CH₃         OCH₃           Ph         H         H         CH₂CH₂CH₂CH₃         CH₃         OCH₃	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴         R⁵         R⁶           Ph         H         H         H         CH₃         OCH₃         F           Ph         H         H         CH₃         CH₃         OCH₃         F           Ph         H         H         CH(CH₃)₂         CH₃         OCH₃         F           Ph         H         H         CH₂CH(CH₃)₂         CH₃         OCH₃         F           Ph         H         H         CH₂Ph         CH₃         OCH₃         F           Ph         H         H         CH₂-indol-3-yl         CH₃         OCH₃         F           Ph         H         H         CH₂CH₂CH₂CH₃         CH₃         OCH₃         F	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴         R⁵         R d         X           Ph         H         H         H         CH₃         OCH₃         F         F           Ph         H         H         CH₃         CH₃         OCH₃         F         F           Ph         H         H         CH₂CH(CH₃)₂         CH₃         OCH₃         F         F           Ph         H         H         CH₂Ph         CH₃         OCH₃         F         F           Ph         H         H         CH₂-indol-3-yl         CH₃         OCH₃         F         F           Ph         H         H         CH₂-CH₂SCH₃         CH₃         OCH₃         F         F	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴         R⁵         R⁶         X         Y           Ph         H         H         H         CH₃         OCH₃         F         F         OH           Ph         H         H         CH₃         CH₃         OCH₃         F         F         OH           Ph         H         H         CH₂CH(CH₃)₂         CH₃         OCH₃         F         F         OH           Ph         H         H         CH₂Ph         CH₃         OCH₃         F         F         OH           Ph         H         H         CH₂-indol-3-yl         CH₃         OCH₃         F         F         OH           Ph         H         H         CH₂CH₂CH₂SCH₃         CH₃         OCH₃         F         F         OH	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴         R⁵         R⁶         X         Y         R³           Ph         H         H         H         CH3         OCH3         F         F         OH         H           Ph         H         H         CH3         OCH3         F         F         OH         H           Ph         H         H         CH(CH3)2         CH3         OCH3         F         F         OH         H           Ph         H         H         CH2CH(CH3)2         CH3         OCH3         F         F         OH         H           Ph         H         H         CH2Ph         CH3         OCH3         F         F         OH         H           Ph         H         H         CH2-indol-3-yl         CH3         OCH3         F         F         OH         H           Ph         H         H         CH2-indol-3-yl         CH3         OCH3         F         F         OH         H           Ph         H         H         CH2-CH2SCH3         CH3         OCH3         F         F         OH         H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table X	[X-6.										
Nº	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XIX-6-	p-Me-	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н
1	Ph										
XIX-6-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н
2	Ph										
XIX-6-	p-Me-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н
3	Ph										
XIX-6-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$CH_3$	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
4	Ph										
XIX-6-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
5	Ph										
XIX-6-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	$CH_3$	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н
6	Ph			yl							
XIX-6-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
7	Ph										
XIX-6-	p-Me-	*	Н	*	$CH_3$	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н
8	Ph										

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table XIX	₹-7.										
	Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
	XIX-7-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н
	XIX-7-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
	XIX-7-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$OCH_3$	$\mathbf{F}_{\cdot}$	F	ОН	Н	Н

Nº	R <sup>I</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XIX-7-4	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н
XIX-7-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-7-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XIX-7-8	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XIX-7-20	p-F-Ph	*	Н	*	$CH_3$	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

T	`ab	le	$\mathbf{X}$	ĮΧ	-8	
_					_	_

Nº	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
XIX-8-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н
XIX-8-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	H	Н
XIX-8-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н
XIX-8-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-8-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	CH <sub>3</sub>	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-8-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-8-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XIX-8-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XIX-9

I able XI	X-9.										
No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
XIX-9-1	p-Br- Ph	Н	Н	Н		OCH <sub>3</sub>					Н
XIX-9-2	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	_	OCH <sub>3</sub>					Н
XIX-9-3	p-Br- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н
XIX-9-4	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XIX-9-6	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	H
XIX-9-7	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н
XIX-9-8	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XIX-9- 20	p <b>-</b> Br- Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIX	K-10.										
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
XIX-10-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н
XIX-10-2	p-I <b>-</b> Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	$OCH_3$	F	F	OH	H	Н
XIX-10-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н
XIX-10-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-10-5	p-I-Ph	Н	Н	CH₂Ph	$CH_3$	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н
XIX-10-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	CH <sub>3</sub>	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-10-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-10-8	p-I-Ph	*	Н	*	$CH_3$	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIX											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XIX-11-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Et	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н
XIX-11-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-11-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	$OCH_3$	F	F	ОН	H	Н
XIX-11-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-11-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-11-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-11-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-11-8	$\mathrm{CH}_3$	*	Н	*	Et	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R°	X	Y	R'	R
XIX-12-1	Et	Н	Н	Н	Et	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н
XIX-12-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Η
XIX-12-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Η
XIX-12-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-12-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-12-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-12-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-12-8	Et	*	Н	*	Et	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5

Table XIX											
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$\mathbf{R}^{\prime}$	R <sup>8</sup>
XIX-13-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Et	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XIX-13-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н
XIX-13-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-13-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	$OCH_3$	F	F	OH	H	Н
XIX-13-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-13-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-13-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-13-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Et	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIX											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XIX-14-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	Et	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	H
XIX-14-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	H
XIX-14-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	$OCH_3$	F	F	ОН	Η	Н
XIX-14-4	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	$OCH_3$	F	F	ОН	H	Н
XIX-14-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-14-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-14-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-14-8	'Bu	*	Н	*	Et	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R
XIX-15-1	Ph	Н	Н	Н	Et	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н
XIX-15-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н
XIX-15-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	$OCH_3$	F	F	OH	Н	H
XIX-15-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	F
XIX-15-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	F
XIX-15-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	F
XIX-15-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	F
XIX-15-8	Ph	*	Н	*	Et	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	F

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIX	Table XIX-16.  No R <sup>1</sup> $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$											
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>	
XIX-16- 1	p-Me- Ph	Н	Н	Н	Et	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н	
XIX-16- 2	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н	
XIX-16- 3	p-Me- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н	
XIX-16-	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	OCH₃	F	F	ОН	Н	Н	
XIX-16- 5	p-Me- Ph	Н	Н	CH₂Ph	Et	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н	
XIX-16- 6	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	Et	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н	
XIX-16- 7	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н	
XIX-16- 8	p-Me- Ph	*	Н	*	Et	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIX	Table XIX-17.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$												
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>		
XIX-17-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Et	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н		
XIX-17-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н		
XIX-17-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н		
XIX-17-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н		
XIX-17-5	p-F-Ph	Н	Н	CH₂Ph	Et	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н		
XIX-17-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н		
XIX-17-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	F	F	ОН	Η	Н		
XIX-17-8	p-F-Ph	*	Н	*	Et	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	H 		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table XIX	(-18.										
	Nº	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$\mathbf{R}'$	R <sup>8</sup>
	XIX-18-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Et	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н
	XIX-18-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	F	F	ОН	H	Н
	XIX-18-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н

№	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
XIX-18-4	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н
XIX-18-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	$OCH_3$	F	F	ОН	H	Н
XIX-18-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XIX-18-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-18-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	Et	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

	Table XIX-19. $R^{1}$ $R^{2}$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^{4}$ $R^{5}$ $R^{6}$ $X$ $Y$ $R^{7}$ $R^{8}$											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$\mathbf{R}^7$	R <sup>8</sup>	
XIX-19-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Et	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н	
XIX-19-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н	
XIX-19-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	H	
XIX-19-4	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н	
XIX-19-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	H	
XIX-19-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н	
XIX-19-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н	
XIX-19-8	p-Br-Ph	*	Н	*	Et	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Η	Н	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

	Table XIX-20.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'		
XIX-20-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Et	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н		
XIX-20-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	F	F	OH	Н		
XIX-20-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н		
XIX-20-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	$OCH_3$	F	F	ОН	Н		
XIX-20-5	p-I-Ph	Н	Н	CH₂Ph	Et	$OCH_3$	F	F	ОН	Н		
XIX-20-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$OCH_3$	F	F	ОН	Н		
XIX-20-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н		
XIX-20-8	p-I-Ph	*	Н	*	Et	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н		

<sup>5 \*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIX	<b>-21</b> .										
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XIX-21-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н
XIX-21-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н
XIX-21-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-21-4	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	'Pr	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н

**WO 2008/121634**Docket No. 60137.0034WOU1

№	R <sup>1</sup>	$\mathbb{R}^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
XIX-21-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н
XIX-21-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-21-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-21-8	$CH_3$	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

	Table XIX-22.  No $R^1 R^2 R^{3a} R^{3b}$ $R^4 R^5 R^6 X Y R^7 R^8$												
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	$R^5$	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>		
XIX-22-1	Et	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н		
XIX-22-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н		
XIX-22-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н		
XIX-22-4	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н		
XIX-22-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н		
XIX-22-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н		
XIX-22-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н		
VIV.22-8	Et	*	н	*	<sup>j</sup> Pr	OCH <sub>2</sub>	F	F	ОН	Н	Н		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIX	Table XIX-23.  No $R^1 R^2 R^{3a} R^{3b}$ $R^4 R^5 R^6 X Y R^7 R^8$												
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>		
XIX-23-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н		
XIX-23-2	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н		
XIX-23-3	<sup>i</sup> Pr	Н	H	$CH(CH_3)_2$	'Pr	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н		
XIX-23-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н		
XIX-23-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH₂Ph	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н		
XIX-23-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н		
XIX-23-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н		
XIX-23-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н		

5  $R^2$  and  $R^{3b}$  joined together by  $(CH_2)_3$  to form five-membered ring.

Table XIX	Table XIX-24. $ \underline{N} \circ \qquad $												
Nº	R¹	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	$R^5$	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>		
XIX-24-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	'Pr	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н		
XIX-24-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н		
XIX-24-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	'Pr	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н		
XIX-24-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	F	ОН	$\mathbf{H}_{\mathbf{u}}$	Н		
XIX-24-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н		

No	R¹	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XIX-24-6	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XIX-24-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н
XIX-24-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	'Pr	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>36</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIX-25.												
No	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$\mathbf{R}^{\prime}$	R <sup>8</sup>	
XIX-25-1	Ph	Н	Н	Н	'Pr	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н	
XIX-25-2	Ph	Н	Н	$CH_3$	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	F	OH	Н	H	
XIX-25-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н	
XIX-25-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н	
XIX-25-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н	
XIX-25-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н	
XIX-25-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н	
XIX-25-8	Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIX	Table XIX-26.										
№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
XIX-26- 1	p-Me- Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XIX-26- 2	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н
XIX-26- 3	p-Me- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	'Pr	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XIX-26- 4	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XIX-26- 5	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XIX-26-	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	<sup>i</sup> Pr	OCH₃	F	F	ОН	Н	Н
XIX-26- 7	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XIX-26- 8	p-Me- Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н

<sup>5 \*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

70 - 1-1	1 .	77	177	2	7
Tab	ıe	А	I A	-2.	Ι.

Table AIA				21.			_ 6			_ 7	- 8
Nº	R <sup>1</sup>	$R^2$	R3a	R <sup>36</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R°	X	Y	R'	R°
XIX-27-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XIX-27-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н
XIX-27-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-27-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$^{i}$ Pr	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	H
XIX-27-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-27-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-27-7	p-F-Ph	H	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-27-8	p-F-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tala	1	V	IV	20
Tab	10	Λ.	ľΛ	-20.

No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$								<del></del>			
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	R°	X	Y	R'	R°
XIX-28-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XIX-28-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н
XIX-28-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-28-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	$OCH_3$	F	F	OH	H	Н
XIX-28-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-28-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	H
XIX-28-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	H
XIX-28-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table XIX-29.

1 4010 71171	L-2,										
Nº	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>o</sup>	X	Y	R'	R°
XIX-29-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н
XIX-29-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	F	OH	Н	H
XIX-29-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	'Pr	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н
XIX-29-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н
XIX-29-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н
XIX-29-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н
XIX-29-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-29-8	p-Br-Ph	*	H	*	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIX	<b>Z-30.</b>										
№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XIX-30-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	'Pr	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н
XIX-30-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	F	OH	H	H
XIX-30-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	F	OH	H	Н
XIX-30-4	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	F	OH	H	Н
XIX-30-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	$OCH_3$	F	F	OH	Н	H
XIX-30-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н
XIX-30-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-30-8	p-I-Ph	*	Н	*	$^{i}$ Pr	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup> $R^2$  and  $R^{3b}$  joined together by  $(CH_2)_3$  to form five-membered ring.

Table XIX-31.											
No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	$R^5$	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
XIX-31-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	"Bu	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н
XIX-31-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	F	F	OH	Н	H
XIX-31-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Η
XIX-31-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	F	F	ОН	Η	Н
XIX-31-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-31-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	$OCH_3$	F	F	ОН	H	Н
XIX-31-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	H
XIX-31-8	$CH_3$	*	Н	*	"Bu	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table XIX											
	No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
	XIX-32-1	Et	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н
	XIX-32-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	$OCH_3$	F	F	ОН	Η	Н
	XIX-32-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н
	XIX-32-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н
	XIX-32-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	$OCH_3$	F	F	ОН	Η	Н
	XIX-32-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
	XIX-32-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
	VIV 32 Q	Et	*	ц	*	$n_{\mathbf{R}\mathbf{u}}$	$OCH_2$	F	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIX-33.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$											
No	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$\mathbf{R}^{7}$	R <sup>8</sup>
XIX-33-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XIX-33-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	F	F	ОН	H	Н
XIX-33-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-33-4	$^{i}$ Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-33-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-33-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XIX-33-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XIX-33-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIX-34.  No. $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$											
№	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^{7}$	R <sup>8</sup>
XIX-34-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XIX-34-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	H
XIX-34-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	H
XIX-34-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	$OCH_3$	F	F	ОН	H	Н
XIX-34-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	F	F	ОН	H	H
XIX-34-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	H
XIX-34-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	H
XIX-34-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	"Bu	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

	25	ľV	V	Table	_
١		IV.	Y	lable	5

No		$\mathbb{R}^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$\mathbb{R}^7$	
XIX-35-1	Ph	Н	H	Н	"Bu	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н
XIX-35-2	Ph	Н	H	CH <sub>3</sub>	"Bu	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-35-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	$OCH_3$	F	F	ОН	H	Н
XIX-35-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	$OCH_3$	F	F	ОН	H	H
XIX-35-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-35-6	Ph	H	H	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-35-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-35-8	Ph	*	Н	*	"Bu	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIX	Table XIX-36.  No R <sup>1</sup> $R^2 R^{3a} R^{3b}$ $R^4 R^5 R^6 X Y R^7 R^8$												
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>					R°		
XIX-36-	p-Me-	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	OCH₃	F	F	OH	Н	Н		
1	Ph												
XIX-36-	p-Me-	Н	H	CH <sub>3</sub>	"Bu	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	H		
2	Ph												
XIX-36-	p-Me-	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	$OCH_3$	F	F	OH	Н	H		
3	Ph												
XIX-36-	p-Me-	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<i>"</i> Bu	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н		
4	Ph												
XIX-36-	p-Me-	Н	Н	CH₂Ph	"Bu	$OCH_3$	F	F	OH	Н	H		
5	Ph												
XIX-36-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	"Bu	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н		
6	Ph			yl									
XIX-36-	p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н		
7	Ph												
XIX-36-	p-Me-	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н		
8	Ph												

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIX	Table XIX-37.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$										
N₂	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	Ro	X	Y	R'	R°
XIX-37-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н
XIX-37-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	$OCH_3$	F	F	OH	Н	H
XIX-37-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н
XIX-37-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н
XIX-37-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-37-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XIX-37-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-37-8	p-F-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table XIX											
	№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$\mathbf{R}^{7}$	R <sup>8</sup>
	XIX-38-	p-Cl- Ph	Н	Н	Н	"Bu	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	H
	XIX-38-	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
2	<b>C1</b>	**	**	CH(CH)	n <sub>D</sub> .	OCII	E	Б	ОП	ш	Н
XIX-38- 3	p-CI- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Вu	ОСП3	Г	Г	ОП	11	11
XIX-38-	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XIX-38- 5		Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XIX-38-	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XIX-38-	p-Cl- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XIX-38- 8	p-Cl- Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIX	Table XIX-39.  No R <sup>1</sup> $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$												
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>		
XIX-39-	p-Br- Ph	Н	Н	Н	"Bu	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н		
XIX-39-	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<i>"</i> Bu	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н		
2 XIX-39-	p-Br-	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н		
3 XIX-39-	Ph p-Br-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<i>"</i> Bu	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н		
4 XIX-39-	Ph n-Br-	Н	Н	CH₂Ph	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н		
5	Ph	11	**										
XIX-39- 6	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н		
XIX-39-	p-Br- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	OCH₃	F	F	ОН	Н	Н		
XIX-39- 8	p-Br- Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIX	Table XIX-40.											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>	
XIX-40-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н	
XIX-40-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	$OCH_3$	F	F	OH	H	Н	
XIX-40-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н	
XIX-40-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н	
XIX-40-5	p-I-Ph	Н	Н	CH₂Ph	"Bu	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н	
XIX-40-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н	
XIX-40-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н	
XIX-40-8	p-I-Ph	*	Н	*	"Bu	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIX-41.											
No	R¹	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XIX-41-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Bz	OCH <sub>3</sub> .	F	F	ОН	Н	Н
XIX-41-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-41-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$OCH_3$	F	F	OH	H	H
XIX-41-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	$OCH_3$	F	F	ОН	H	H
XIX-41-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н
XIX-41-6	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-41-7	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	F	F	ОН	H	H
XIX-41-8	$CH_3$	*	Н	*	Bz	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table XIX	-42.										
	№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
	XIX-42-1	Et	Н	Н	Н	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н
	XIX-42-2	Et	H	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	F	F	OH	Н	H
	XIX-42-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$OCH_3$	F	F	OH	H	H
	XIX-42-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	H	Н
	XIX-42-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	H
	XIX-42-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
	XIX-42-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	F	F	OH	H	Н
	XIX-42-8	Et	*	Н	*	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIX	<b>C-43</b> .										
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
XIX-43-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XIX-43-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-43-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-43-4	$^{i}$ Pr	Η	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-43-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-43-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н
XIX-43-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-43-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Bz	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIX-44.												
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>	
XIX-44-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н	
XIX-44-2	'Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н	
XIX-44-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н	
XIX-44-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н	
XIX-44-5	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н	
XIX-44-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н	
XIX-44-7	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н	
XIX-44-8	'Bu	*	Н	*	Bz	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table	XIX-45.

Table AIA											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
XIX-45-1	Ph	Н	Н	Н	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XIX-45-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н
XIX-45-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н
XIX-45-4	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	$OCH_3$	F	F	ОН	H	Н
XIX-45-5	Ph	Н	Н	$CH_2Ph$	Bz	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н
XIX-45-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-45-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н
XIX-45-8	Ph	*	Н	*	Bz	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Η

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIX	X-46.										
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
XIX-46-	p-Me- Ph	Н	Н	Н	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н
XIX-46-	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
2 XIX-46-	p-Me-	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
3 XIX-46-	Ph p-Me-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
4 XIX-46-	Ph p-Me-	Н	Н	CH₂Ph	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
5	Ph										
XIX-46- 6	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XIX-46-	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XIX-46-	p-Me- Ph	*	Н	*	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XIX	<b>C-47.</b>										
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
XIX-47-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н
XIX-47-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	F	F	OH	H	Н
XIX-47-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н
XIX-47-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-47-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$OCH_3$	F	F	ОН	H	H
XIX-47-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$OCH_3$	F	F	ОН	H	Н
XIX-47-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-47-8	p-F-Ph	*	Н	*	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table XIX											
	№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
	XIX-48-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	H
	XIX-48-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	F	F	ОН	H	Н
	XIX-48-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$OCH_3$	F	F	OH	Η	Н

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
XIX-48-4	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	F	ОН	Н	Н
XIX-48-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$OCH_3$	F	F	OH	Н	H
XIX-48-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$OCH_3$	F	F	OH	Н	H
XIX-48-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	F	F	ОН	Η	H
XIX-48-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	Bz	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tabl	e X	[X-49.

Nº	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XIX-49-1	p-Br-Ph	Н	Н	H	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н
XIX-49-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	F	F	OH	Η	Η
XIX-49-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$OCH_3$	F	F	ОН	Η	Н
XIX-49-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	H
XIX-49-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-49-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н
XIX-49-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-49-8	p-Br-Ph	*	Н	*	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# Table XIX-50.

№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
XIX-50-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Bz	OCH <sub>3</sub>	F	F	OH	Н	Н
XIX-50-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	F	F	OH	H	Н
XIX-50-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$OCH_3$	F	F	OH	Н	H
XIX-50-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н
XIX-50-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-50-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н
XIX-50-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	F	F	ОН	Н	Н
XIX-50-8	p-I-Ph	*	Н	*	Bz	$OCH_3$	F	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$$R^{3a}$$
 $CO_2R^4$ 
 $CO_2R^4$ 

XX

Table X											
№	R¹	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
XX-1-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-1-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н
XX-1-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-1-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-1-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-1-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-1-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-1-8	$CH_3$	*	Н	*	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XX-2 5

Table A.											
N₂	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R°	X	Y	R'	R°
XX-2-1	Et	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-2-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	OH	H	H
XX-2-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н
XX-2-4	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-2-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-2-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-2-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н
XX-2-8	Et	*	Н	*	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Ţ	al	ole	X	X.	-3.

I able A											- 0
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R°	X	Y	R'	R°
XX-3-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	Н	F	OH	Н	Н
XX-3-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-3-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н
XX-3-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-3-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н
XX-3-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	CH <sub>3</sub>	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-3-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-3-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

7	ີຈໍ	hl	۵	$\mathbf{X}\mathbf{X}$	_4
	n	. , ,		$\Lambda \Lambda$	-4

$R^7 R^8$
Н
н н
н н
н н
Н
н н
н н
н н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table XX-5. 5

Table A.											<del></del>
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
XX-5-1	Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	Н	F	OH	Н	Н
XX-5-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	OCH <sub>3</sub>	Н	F	OH	H	Н
XX-5-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н
XX-5-4	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-5-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-5-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-5-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	$OCH_3$	H	F	ОН	Н	Н
XX-5-8	Ph	*	Н	*	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table X	X-6.										
No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
XX-6-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-6-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-6-3	p-Me-Ph	Н	Η	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	OH	H	Н
XX-6-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н
XX-6-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-6-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-6-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-6-8	n-Me-Ph	*	Н	*	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н

**<sup>\*</sup>XX-6-8** p-Me-Ph \* H \* CH<sub>3</sub> OCH<sub>3</sub> H F  $^*$ R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XX	<b>-</b> 7.										
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R٥	X	Y	R'	R°
XX-7-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-7-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-7-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	H
XX-7-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	H
XX-7-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-7-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	H
XX-7-8	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	$OCH_3$	Η	F	OH	Н	Н
XX-7-20	p-F-Ph	*	Н	*	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Tabla	XX

Table XX-8.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ X Y $R^7$ $R^8$											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R۶	R٥	X	Y	R'	R°
XX-8-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-8-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-8-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-8-4	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-8-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-8-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-8-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-8-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XX	X-9.										
No	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
XX-9-1	p-Br- Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	F	ОН	Н	Н
XX-9-2	p-Br-	Н	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-9-3	Ph p-Br-	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$CH_3$	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-9-4	Ph p-Br-	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-9-6	Ph p-Br-	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-9-7	Ph p-Br-	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-9-8	Ph p-Br-	·H	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-9-	Ph p-Br-	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
20	Ph										

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XX-10.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$											
Nº	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R°	X	Y	R'	R°
XX-10-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	Н	F	OH	Н	Н
XX-10-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-10-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-10-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-10-5	p-I <b>-</b> Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-10-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-10-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-10-8	p-I-Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XX											
№	$\mathbb{R}^1$	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XX-11-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Et	OCH <sub>3</sub>	Н	F	OH	Н	Н
XX-11-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н
XX-11-3	$CH_3$	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	$OCH_3$	Н	F	ОН	Η	Н
XX-11-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-11-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-11-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-11-7	СН	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н

No	R¹	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XX-11-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	Et	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XX-12

No No		$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XX-12-1	Et	Н	Н	Н	Et	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-12-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н
XX-12-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н
XX-12-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	$OCH_3$	Н	F	OH	Η	Н
XX-12-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	$OCH_3$	Н	F	ОН	Η	Н
XX-12-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-12-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-12-8	Et	*	Н	*	Et	OCH <sub>3</sub>	Н	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XX-13.

Nº		$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XX-13-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Et	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	H
XX-13-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-13-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-13-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-13-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-13-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-13-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-13-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Et	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	H

 $<sup>^{*}</sup>$ R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XX-	14.										
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
XX-14-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	Et	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-14-2	<sup>t</sup> Bu	H	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н
XX-14-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	$OCH_3$	H	F	OH	Н	H
XX-14-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	H
XX-14-5	<sup>t</sup> Bu	H	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н
XX-14-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-14-7	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н
XX-14-8	<sup>t</sup> Bu	*	H	*	Et	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XX											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
XX-15-1	Ph	Н	Н	Н	Et	OCH <sub>3</sub>	Н	F	OH	Н	H
XX-15-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	OCH <sub>3</sub>	Н	F	OH	H	Н
XX-15-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	$OCH_3$	Н	F	ОН	H	Н
XX-15-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	$OCH_3$	H	F	ОН	Н	Н
XX-15-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	$OCH_3$	Н	F	OH	H	H
XX-15-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$OCH_3$	Н	F	ОН	H	H
XX-15-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-15-8	Ph	*	Н	*	Et	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table XX											
•	№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
	XX-16-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	Et	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
	XX-16-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н
	XX-16-3	p-Me-Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н
	XX-16-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	$OCH_3$	H	F	OH	Н	Н
	XX-16-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH₂Ph	Et	$OCH_3$	Н	F	ОН	H	Н
	XX-16-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Η
	XX-16-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
	XX-16-8	p-Me-Ph	*	Н	*	Et	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XX											
No	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XX-17-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Et	OCH <sub>3</sub>	Н	F	OH	Н	Н
XX-17-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н
XX-17-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н
XX-17-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-17-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н
XX-17-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-17-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	Н	F	ОН	H	Н
XX-17-8	p-F-Ph	*	Н	*	Et	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XX	ζ-18.										
Nº	$R^1$	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°
XX-18-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Et	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-18-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	Н	F	OH	H	Н
XX-18-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-18-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-18-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH₂Ph	Et	$OCH_3$	H	F	ОН	Н	Н
XX-18-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н
XX-18-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	Н	F	ОН	Η	Н
XX-18-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	Et	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table	XX-19.
	3.0	- D1

	Table AA										_ 7	
	№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	Rº	X	Y	R'	R°
•	XX-19-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Et	OCH <sub>3</sub>	Н	F	OH	Н	Н
	XX-19-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	Н	F	OH	$\mathbf{H}_{\mathbf{u}}$	Н
	XX-19-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	$OCH_3$	Н	F	OH	H	Н
	XX-19-4	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н
	XX-19-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH₂Ph	Et	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н
	XX-19-6	p-Br-Ph	H	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
	XX-19-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
	XX-19-8	p-Br-Ph	*	Н	*	Et	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XX	ζ <b>-</b> 20.										
№	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
XX-20-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Et	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-20-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н
XX-20-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	$OCH_3$	Н	F	ОН	H	Н
XX-20-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-20-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-20-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-20-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н
XX-20-8	p-I-Ph	*	Н	*	Et	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XX										7	o
No	$R^1$	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°
XX-21-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-21-2	CH <sub>3</sub>	Н	H	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	H	F	OH	Н	Н
XX-21-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	'Pr	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-21-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н
XX-21-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-21-6	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	Н	F	OH	Н	Н
XX-21-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-21-8	$CH_3$	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5 Table XX-22	42.
---------------	-----

Taule AA										7	
No	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R°	X	Y	R'	R°
XX-22-1	Et	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	Н	F	OH	Н	Н
XX-22-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	$OCH_3$	Н	F	ОН	H	Н
XX-22-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н
XX-22-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-22-5	Et	Н	Н	CH₂Ph	$^{i}$ Pr	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-22-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н
XX-22-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-22-8	Et	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XX											
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°
XX-23-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-23-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н
XX-23-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-23-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-23-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-23-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-23-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-23-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XX	ζ-24.					-				7	
No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	$R^5$	R°	X	Y	R'	R°
XX-24-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-24-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	$OCH_3$	H	F	ОН	Н	Н
XX-24-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-24-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-24-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH₂Ph	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-24-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н
XX-24-7	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	OCH <sub>3</sub>	Н	F	OH	Н	Н
XX-24-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XX-25-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-25-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-25-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-25-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-25-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-25-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	H
XX-25-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-25-8	Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XX	<b>ζ-26.</b>										
No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
XX-26-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	'Pr	OCH <sub>3</sub>	Н	F	OH	Н	Н
XX-26-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	Н	F	OH	H	H
XX-26-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	H	F	ОН	H	H
XX-26-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	H
XX-26-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	Н	F	ОН	H	H
XX-26-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	H	Η
XX-26-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-26-8	p-Me-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XX	K <b>-</b> 27.										
№	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°
XX-27-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-27-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	H
XX-27-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	'Pr	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	H
XX-27-4	p-F-Ph	H	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-27-5	p-F-Ph	Н	Н	CH₂Ph	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	H	F	ОН	Н	H
XX-27-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	H
XX-27-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	H	F	OH	Η	H
XX-27-8	p-F-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R٥	X	Y	R'	R
XX-28-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	'Pr	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-28-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	Н	F	OH	Н	H
XX-28-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Η
XX-28-4	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	H
XX-28-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-28-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	H	F	ОН	Н	Н
XX-28-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-28-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

<b>(-29.</b>										
$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>8</sup>
p-Br-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	Н	F	OH	Η	Н
p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н
p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	H	F	OH	Н	Н
p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	H	F	ОН	Н	Н
p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	H	F	OH	Н	Н
p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	$OCH_3$	Н	F	ОН	Η	Н
p-Br-Ph	*	Н	*	'Pr	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
	p-Br-Ph p-Br-Ph p-Br-Ph p-Br-Ph p-Br-Ph p-Br-Ph p-Br-Ph	R¹ R² p-Br-Ph H p-Br-Ph H p-Br-Ph H p-Br-Ph H p-Br-Ph H p-Br-Ph H	P-Br-Ph H H	R¹         R²         R³a         R³b           p-Br-Ph         H         H         H           p-Br-Ph         H         H         CH <sub>3</sub> p-Br-Ph         H         H         CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> Ph           p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl           p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴           p-Br-Ph         H         H         H         'Pr           p-Br-Ph         H         H         CH3         'Pr           p-Br-Ph         H         H         CH(CH3)2         'Pr           p-Br-Ph         H         H         CH2CH(CH3)2         'Pr           p-Br-Ph         H         H         CH2Ph         'Pr           p-Br-Ph         H         H         CH2-indol-3-yl         'Pr           p-Br-Ph         H         H         CH2CH2SCH3         'Pr	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴         R⁵           p-Br-Ph         H         H         H         'Pr         OCH₃           p-Br-Ph         H         H         CH₃         'Pr         OCH₃           p-Br-Ph         H         H         CH(CH₃)₂         'Pr         OCH₃           p-Br-Ph         H         H         CH₂CH(CH₃)₂         'Pr         OCH₃           p-Br-Ph         H         H         CH₂-indol-3-yl         'Pr         OCH₃           p-Br-Ph         H         H         CH₂-cH₂-cCH₃         'Pr         OCH₃           p-Br-Ph         H         H         CH₂-cH₂-cCH₃         'Pr         OCH₃	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴         R⁵         R⁶           p-Br-Ph         H         H         H         'Pr         OCH₃         H           p-Br-Ph         H         H         CH₃         'Pr         OCH₃         H           p-Br-Ph         H         H         CH(CH₃)₂         'Pr         OCH₃         H           p-Br-Ph         H         H         CH₂CH(CH₃)₂         'Pr         OCH₃         H           p-Br-Ph         H         H         CH₂-indol-3-yl         'Pr         OCH₃         H           p-Br-Ph         H         H         CH₂-cH₂-cSCH₃         'Pr         OCH₃         H	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴         R⁵         X           p-Br-Ph         H         H         H         H         F           p-Br-Ph         H         H         CH₃         Pr         OCH₃         H         F           p-Br-Ph         H         H         CH(CH₃)₂         Pr         OCH₃         H         F           p-Br-Ph         H         H         CH₂CH(CH₃)₂         Pr         OCH₃         H         F           p-Br-Ph         H         H         CH₂-Indol-3-yl         Pr         OCH₃         H         F           p-Br-Ph         H         H         CH₂-CH₂-CH₂-CH₃         Pr         OCH₃         H         F           p-Br-Ph         H         H         CH₂-CH₂-CH₂-CH₃         Pr         OCH₃         H         F	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴         R⁵         R⁶         X         Y           p-Br-Ph         H         H         H         H         OCH₃         H         F         OH           p-Br-Ph         H         H         CH₃         Pr         OCH₃         H         F         OH           p-Br-Ph         H         H         CH₂CH(CH₃)₂         Pr         OCH₃         H         F         OH           p-Br-Ph         H         H         CH₂Ph         Pr         OCH₃         H         F         OH           p-Br-Ph         H         H         CH₂-indol-3-yl         Pr         OCH₃         H         F         OH           p-Br-Ph         H         H         CH₂-indol-3-yl         Pr         OCH₃         H         F         OH           p-Br-Ph         H         H         CH₂-indol-3-yl         Pr         OCH₃         H         F         OH           p-Br-Ph         H         H         CH₂-indol-3-yl         Pr         OCH₃         H         F         OH	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴         R⁵         R⁶         X         Y         R⁵           p-Br-Ph         H         H         H         H         OCH₃         H         F         OH         H           p-Br-Ph         H         H         CH₃         Pr         OCH₃         H         F         OH         H           p-Br-Ph         H         H         CH₂CH(CH₃)₂         Pr         OCH₃         H         F         OH         H           p-Br-Ph         H         H         CH₂Ph         Pr         OCH₃         H         F         OH         H           p-Br-Ph         H         H         CH₂-indol-3-yl         Pr         OCH₃         H         F         OH         H           p-Br-Ph         H         H         CH₂-indol-3-yl         Pr         OCH₃         H         F         OH         H           p-Br-Ph         H         H         CH₂-indol-3-yl         Pr         OCH₃         H         F         OH         H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XX	ζ-30.										
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R°	X	Y	R'	R°
XX-30-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	Н	F	OH	Н	Н
XX-30-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	$OCH_3$	Н	F	OH	H	Н
XX-30-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н
XX-30-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	Н	F	OH	H	Н
XX-30-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-30-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-30-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-30-8	p-I-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R°	X	Y	R'	R
XX-31-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-31-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	H	F	OH	H	Н
XX-31-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	I
XX-31-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	F
XX-31-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	ŀ
XX-31-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	ŀ
XX-31-7	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	Н	F	ОН	Η	ŀ
XX-31-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	Н	F	OH	Η	I

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XX	ζ-32.										
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R°
XX-32-1	Et	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	Н	F	OH	Н	H
XX-32-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-32-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	H
XX-32-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-32-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н
XX-32-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н
XX-32-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н
YY_32_8	Ft	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	H	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XX-33.  No. $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$ $R^7$ $R^8$												
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R'	R <sup>*</sup>	
XX-33-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	Н	F	OH	Н	Н	
XX-33-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	H	
XX-33-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	H	
XX-33-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	$OCH_3$	Н	F	OH	H	Н	
XX-33-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н	
XX-33-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н	
XX-33-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	$OCH_3$	Н	F	ОН	H	Н	
XX-33-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XX											
No	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XX-34-1	'Bu	Н	Н	Н	"Bu	OCH <sub>3</sub>	Н	F	OH	Н	Н
XX-34-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	$OCH_3$	Н	F	OH	H	Н
XX-34-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н
XX-34-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	$OCH_3$	H	F	OH	Н	Н
XX-34-5	<sup>t</sup> Bu	Н	H	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н
XX-34-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	H	F	ОН	H	Н
XX-34-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-34-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table X	XX-35.										
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>

№	R¹	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XX-35-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-35-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-35-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-35-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-35-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	$OCH_3$	Н	F	ЮH	Н	Н
XX-35-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-35-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-35-8	Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$T_{\alpha}L_{\alpha}$	۱.	$\mathbf{v}\mathbf{v}$	26
Tab!	le	$\Lambda\Lambda$	-90.

No No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
XX-36- 1	p-Me- Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	Н	F	OH	Н	Н
XX-36- 2	p-Me- Ph	Н	H	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-36- 3	p-Me- Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-36-	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-36- 5	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-36-	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3- yl	"Bu	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-36- 7	p-Me- Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-36- 8	p-Me- Ph	*	Н	*	"Bu	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XX-37.

№	R¹	$\mathbb{R}^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XX-37-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	Н	F	OH	Н	Н
XX-37-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н
XX-37-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-37-4	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	Н	F	ОН	H	Н

No	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
XX-37-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-37-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-37-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-37-8	p-F-Ph	*	Н	*	"Bu	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tabl	ما	XX	-38

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
XX-38-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	"Bu	OCH <sub>3</sub>	Н	F	OH	Н	H
XX-38-2	p-Cl-Ph	H	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-38-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-38-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-38-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-38-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-38-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-38-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	"Bu	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# Table XX-39.

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XX-39-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	Н	F	OH	Н	Н
XX-39-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-39-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-39-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-39-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-39-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-39-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-39-8	p-Br-Ph	*	Н	*	"Bu	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XX-40

Table AA											
Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
XX-40-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-40-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-40-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	$OCH_3$	Η.	F	ОН	Н	Н
XX-40-4	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-40-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н

№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XX-40-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	OCH <sub>3</sub>	Н	F	OH	Н	Н
XX-40-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-40-8	p-I-Ph	*	Н	*	"Bu	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tab	le	XX-4	. 1
Iau	·	Z X Z X = T	

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
XX-41-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Bz	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-41-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-41-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$OCH_3$	H	F	ОН	Н	Н
XX-41-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	$OCH_3$	$\mathbf{H}_{\mathbf{u}}$	F	OH	Н	Н
XX-41-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-41-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-41-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-41-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	Bz	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

7	Γя	h	le	X	X.	42
	a		167	$\sim$	$\sim$	· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·

1 4010 717											
No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XX-42-1	Et	Н	Н	Н	Bz	OCH <sub>3</sub>	Н	F	OH	Н	Н
XX-42-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-42-3	Et	Н	H	$CH(CH_3)_2$	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-42-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-42-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-42-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-42-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-42-8	Et	*	Н	*	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XX-43.

1 4010 717											
№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XX-43-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Bz	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-43-2	<sup>i</sup> Pr	Н	H	CH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	H	F	ОН	Н	Н
XX-43-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-43-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-43-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX=43=6	Pr	Ħ	Ħ	CH3CH48CH31	₿ž	0€H₃	Ħ	F	<b>9</b> H	Ħ	Ħ

XX-43-8	<sup>i</sup> Pr	*	Η	*	Bz	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XX-44.

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XX-44-1	'Bu	Н	Н	Н	Bz	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-44-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	Н	F	OH	H	Н
XX-44-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-44-4	<sup>t</sup> Bu	H	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-44-5	<sup>t</sup> Bu	H	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	H	Н
XX-44-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-44-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-44-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Bz	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XX-45.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
XX-45-1	Ph	Н	Н	Н	Bz	OCH <sub>3</sub>	Н	F	OH	Н	Н
XX-45-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-45-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-45-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-45-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-45-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-45-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-45-8	Ph	*	Н	*	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XX											
№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XX-46-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	Bz	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-46-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Η
XX-46-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$OCH_3$	Н	F	OH	Η	Н
XX-46-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н
XX-46-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н

XX-46-6 p-Me-Ph H H CH<sub>2</sub>-indol-3-yl Bz OCH<sub>3</sub> H F OH H H XX-46-7 p-Me-Ph H H CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub> Bz OCH<sub>3</sub> H F OH H H

Bz OCH<sub>3</sub> H F OH H H

\*R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

T	ab	le	XX	<b>X-</b> 4	1	7	•
					_	•	

XX-46-8 p-Me-Ph \* H \*

Nº		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
XX-47-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Bz	OCH <sub>3</sub>	Н	F	OH	Н	Н
XX-47-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н
XX-47-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-47-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	OCH <sub>3</sub>	Н	F	OH	Н	Н
XX-47-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н
XX-47-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$OCH_3$	Н	F	OH	Н	Н
XX-47-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-47-8	p-F-Ph	*	Н	*	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н

\*R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table XX-48.

1 4010 111											
№	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	$R^7$	R <sup>8</sup>
XX-48-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Bz	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-48-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-48-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-48-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-48-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-48-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-48-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-48-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н

\*R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tabl	le	YY.	_40
I au		$\Delta \Delta$	ザナフ、

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
XX-49-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Bz	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-49-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-49-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-49-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н
XX-49-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-49-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-49-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-49-8	p-Br-Ph	*	Н	*	Bz	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# Table XX-50.

1 4010 717											
N₂	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
XX-50-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Bz	OCH <sub>3</sub>	Н	F	ОН	Н	H
XX-50-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-50-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-50-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-50-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-50-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	$OCH_3$	H	F	ОН	Н	Н
XX-50-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	$OCH_3$	Н	F	ОН	Н	Н
XX-50-8	p-I-Ph	*	Н	*	Bz	$OCH_3$	H	F	ОН	Н	Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5

$$R^{3a}$$
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{3b}$ 

XXI

	1	****		
l a l	าเอ	XX	l I	
1 41	ж	$\Delta \Delta \Delta$	I – I	

№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXI-1-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXI-1-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-1-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-1-4	$CH_3$	H	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-1-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	H	$CH_3$	F	ОН
XXI-1-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-1-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-1-8	$CH_3$	*	Н	*	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# Table XXI-2.

14010 717									
No	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXI-2-1	Et	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-2-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-2-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-2-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-2-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-2-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-2-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-2-8	Et	*	Н	*	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table XXI-3. 5

№	R¹	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXI-3-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXI-3-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_3$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-3-3	<sup>i</sup> Pr	Η.	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-3-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-3-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-3-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-3-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-3-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tahl	le.	XX	[_4
1 (11)		$\Delta \Delta \Delta$	

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXI-4-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-4-2	'Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-4-3	'Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-4-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-4-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-4-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-4-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-4-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# Table XXI-5.

14010 111	** **								
№	$\mathbb{R}^1$	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXI-5-1	Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXI-5-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-5-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-5-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-5-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-5-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-5-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-5-8	Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# 5 Table XXI-6.

14010 717									
No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXI-6-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-6-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-6-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-6-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-6-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-6-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-6-7	p-Me-Ph	Н	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-6-8	p-Me-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tabl	حا	$\mathbf{V}\mathbf{V}$	7
Tab	œ	$\lambda \lambda$	I <b>-</b> / .

	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXI-7-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-7-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$\mathrm{CH}_3$	F	ОН
XXI-7-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-7-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-7-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-7-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-7-8	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-7-20	p-F-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table XXI-8.

1 4010 717		<b>D</b> 2	T 3a	T 3h	D4	<b>D</b> 5	ъ6	37	3.7
Nº	$R^1$	K <sup>2</sup>	K <sup>su</sup>	K	K'	K'	R <sup>6</sup>	X	Y
XXI-8-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-8-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-8-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-8-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-8-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-8-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-8-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$\text{CH}_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-8-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### 5 Table XXI-9.

1 4010 7171									
№	$R^1$	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXI-9-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXI-9-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-9-3	p-Br-Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$CH_3$	Н	$\text{CH}_3$	F	ОН
XXI-9-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-9-6	p-Br-Ph	H	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-9-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-9-8	p-Br-Ph	H	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-9-20	p-Br-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	$\text{CH}_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	XXI-10.

No		$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXI-10-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-10-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-10-3	p-I-Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-10-4	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-10-5	p-I-Ph	Н	Н	CH₂Ph	$CH_3$	Н	$\text{CH}_3$	F	OH
XXI-10-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$\text{CH}_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-10-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$\mathrm{CH}_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-10-8	p-I-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	$\mathrm{CH}_3$	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table XXI-11

Table AA									
No	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXI-11-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXI-11-2	$CH_3$	Н	H	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-11-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-11-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-11-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-11-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-11-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-11-8	$CH_3$	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table XXI-12. 5

				â1					
Nº	R¹	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXI-12-1	Et	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXI-12-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-12-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-12-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-12-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-12-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-12-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-12-8	Et	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

_			
$T_{\sim}$	Ll <sub>a</sub>	$\mathbf{v}\mathbf{v}$	12
11	nie	_ ^ _ ^ I	- I 7

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXI-13-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-13-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-13-3	$^{i}$ Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-13-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-13-5	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-13-6	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-13-7	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-13-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXI-14.

1 4010 7 17 11	. 1								
№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXI-14-1	'Bu	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXI-14-2	<sup>t</sup> Bu	H	Н	CH <sub>3</sub>	Et	H	$CH_3$	F	OH
XXI-14-3	'Bu	H	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	H	$CH_3$	F	OH
XXI-14-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-14-5	<sup>t</sup> Bu	H	Н	CH₂Ph	Et	H	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXI-14-6	<sup>t</sup> Bu	H	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	H	$CH_3$	F	OH
XXI-14-7	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-14-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# Table XXI-15.

14010 2 221									
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXI-15-1	Ph	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-15-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-15-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-15-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-15-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-15-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-15-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-15-8	Ph	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$\mathbf{T}$	1 1		37	37	г 1	•	
1.8	ın	le.	Х	Х	-	Ιn	ı.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXI-16-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-16-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-16-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-16-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-16-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-16-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-16-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-16-8	p-Me-Ph	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXI-17

		Y
XXI-17-1 p-F-Ph H H H Et H CH	F	OH
XXI-17-2 p-F-Ph H H CH <sub>3</sub> Et H CH	s F	OH
XXI-17-3 p-F-Ph H H CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> Et H CH	<sub>s</sub> F	OH
XXI-17-4 p-F-Ph H H CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> Et H CH	<sub>s</sub> F	OH
XXI-17-5 p-F-Ph H H CH <sub>2</sub> Ph Et H CH	s F	ОН
XXI-17-6 p-F-Ph H H CH <sub>2</sub> -indol-3-yl Et H CH	<sub>s</sub> F	ОН
XXI-17-7 p-F-Ph H H CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> Et H CH	F	ОН
XXI-17-8 p-F-Ph * H * Et H CH	<sub>s</sub> F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### 5 Table XXI-18.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXI-18-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-18-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-18-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-18-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-18-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-18-6	p-Cl-Ph	Н	H	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-18-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-18-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	XXI-	19	١.
-------	------	----	----

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXI-19-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXI-19-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$\text{CH}_3$	F	ОН
XXI-19-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-19-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-19-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-19-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-19-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-19-8	p-Br-Ph	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXI-20.

Taule AA.									
<b>№</b>	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R⁵	R <sup>6</sup>	X	Y
XXI-20-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXI-20-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-20-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-20-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-20-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-20-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-20-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-20-8	p-I-Ph	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table XXI-21. 5

			٠.						
No	R¹	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>30</sup>	R <sup>4</sup>	R³	R <sup>6</sup>	X	Y
XXI-21-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	'Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-21-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-21-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-21-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-21-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-21-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-21-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-21-8	$CH_3$	*	Н	*	'Pr	Н	$CH_3$	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$T_{-1}$	l. 1 .	. 377	C/T	$\sim$
- I ai	nie	$\mathbf{X}$	XI-	ZZ.

No	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXI-22-1	Et	Н	Н	Н	'Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXI-22-2	Et	H	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-22-3	Et	H	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-22-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-22-5	Et	H	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-22-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-22-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-22-8	Et	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table XXI-23.

Table AA.									
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXI-23-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-23-2	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-23-3	<sup>i</sup> Pr	Н	. H	$CH(CH_3)_2$	'Pr	H	$CH_3$	F	ОН
XXI-23-4	$^{i}$ Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-23-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-23-6	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-23-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-23-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table XXI-24. 5

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXI-24-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXI-24-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-24-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-24-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-24-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-24-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-24-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-24-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

T .	1 1		77	<b>77</b> T	^	_
Ta	n	ıe	х	ΧІ	-/	``

№	R¹	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXI-25-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-25-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-25-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$^{i}$ Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-25-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-25-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-25-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-25-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-25-8	Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXI-26.

Table AA.									
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXI-26-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-26-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-26-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-26-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-26-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-26-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-26-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-26-8	p-Me-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# 5 Table XXI-27.

1 4010 7171									
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXI-27-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXI-27-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-27-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-27-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-27-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$^{i}$ Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-27-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-27-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-27-8	p-F-Ph	*	Н	*	$^{i}$ Pr	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$T_{-1}$	l_ 1 _	ww	า าด
1 a	nie	XX	I-28.

<u>No</u>		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXI-28-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	'Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-28-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-28-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-28-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	H	$CH_3$	F	OH
XXI-28-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	H	$CH_3$	F	ОН
XXI-28-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-28-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-28-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXI-29.

Table AAI-29.										
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	
XXI-29-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	
XXI-29-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH	
XXI-29-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	$CH_3$	F	OH	
XXI-29-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH	
XXI-29-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH	
XXI-29-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH	
XXI-29-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH	
XXI-29-8	p-Br-Ph	*	Н	*	'Pr	Н	$CH_3$	F	OH	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# 5 Table XXI-30.

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXI-30-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	'Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-30-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXI-30-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-30-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-30-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-30-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-30-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-30-8	p-I-Ph	*	Н	*	'Pr	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Ta	L	۱.	XX	T 2 1	ı
1 4	1)	ı	$\Lambda \Lambda$	17	ŀ.

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXI-31-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXI-31-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-31-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-31-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-31-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-31-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-31-7	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-31-8	$CH_3$	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

П	г_	L	۱.	v	X۱	ເາ	$^{\circ}$
	- 24	n	18	- Х	- Х I	- 1	

14010 7741-32.										
No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	$R^5$	$R^6$	X	Y	
XXI-32-1	Et	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	
XXI-32-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	
XXI-32-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	
XXI-32-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	
XXI-32-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	
XXI-32-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	
XXI-32-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	
XXI-32-8	Et	*	Н	*	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### 5 Table XXI-33.

14010 71311 55.										
No	$\mathbb{R}^1$	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	
XXI-33-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH	
XXI-33-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	
XXI-33-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	$\mathrm{CH}_3$	F	ОН	
XXI-33-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	
XXI-33-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	
XXI-33-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН	
XXI-33-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	
XXI-33-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Docket No. 60137.0034WOU1

m 1 '		XXI	^ 1
Lah	Δ	$\mathbf{x} \mathbf{x} \mathbf{i}$	- 4/1
I av	•	$\Delta \Delta $	

№	$\mathbb{R}^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXI-34-1	'Bu	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-34-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-34-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	H	$CH_3$	F	OH
XXI-34-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-34-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	H	$CH_3$	F	ОН
XXI-34-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-34-7	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-34-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

_	n - 1	1 1	1.	37	371	ra	_
	เลเ	n	ıe.	х	Χl	- 1	,

Table AA									
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXI-35-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-35-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-35-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-35-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-35-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-35-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-35-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-35-8	Ph	*	Н	*	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXI-36. 5

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXI-36-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-36-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Η	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXI-36-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	H	$CH_3$	F	OH
XXI-36-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	$\text{CH}_3$	F	OH
XXI-36-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-36-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	$\text{CH}_3$	F	ОН
XXI-36-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-36-8	p-Me-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Docket No. 60137.0034WOU1

OD 1 1		X 7 X 7 1	~~
Tab	Δ	- Y Y I	47
$\mathbf{I}$ $\mathbf{a}$ $\mathbf{D}$		$\Delta \Delta$	I <b>-</b> . ) / .

Table AA.									
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXI-37-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXI-37-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	$\text{CH}_3$	F	OH
XXI-37-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	$\text{CH}_3$	F	ОН
XXI-37-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-37-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-37-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-37-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-37-8	p-F-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	$\mathrm{CH}_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXI-38

lable XX									
№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	$R^5$	R <sup>6</sup>	X	Y
XXI-38-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-38-2	p-Cl-Ph	Н	H	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-38-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-38-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-38-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-38-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-38-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-38-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## 5 Table XXI-39.

No No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXI-39-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-39-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	$\text{CH}_3$	F	ОН
XXI-39-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	H	$\mathrm{CH}_3$	F	OH
XXI-39-4	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-39-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-39-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-39-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-39-8	p-Br-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tabl	ما	VV	[-40.
Tab	Ю	$\Delta \Delta$	I-4U.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXI-40-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-40-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-40-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	H	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXI-40-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-40-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-40-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-40-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-40-8	p-I-Ph	*	Н	*	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tah	ام	XX	[_41
1 417	1	$\Delta \Delta$	+ 1

Table AA									
Nº	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXI-41-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-41-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-41-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-41-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-41-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-41-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-41-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-41-8	$CH_3$	*	Н	*	Bz	Н	$CH_3$	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>36</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXI-42. 5

14010 7171									
Nº	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXI-42-1	Et	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-42-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-42-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXI-42-4	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-42-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-42-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-42-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-42-8	Et	*	Н	*	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

п	D. 1.	1.	32321	1.2
	∣ar	ne	XX	-4.5.

No No		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXI-43-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-43-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	H	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-43-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-43-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-43-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	F	ОĦ
XXI-43-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-43-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-43-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXI-44.

Table AA									
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXI-44-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXI-44-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-44-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-44-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-44-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-44-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-44-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-44-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXI-45.

No No		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXI-45-1	Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-45-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-45-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	H	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-45-4	Ph	Н	H	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-45-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-45-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-45-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-45-8	Ph	*	Н	*	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

WO 2008/121634

Docket No. 60137.0034WOU1

7	ີຼ	1_1	١.,	W	V	[-4	~
- 1	и	Di	10	_ ^	$\Delta$	-4	()

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXI-46-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-46-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-46-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-46-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-46-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-46-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-46-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-46-8	p-Me-Ph	*	Н	*	Bz	Н	$CH_3$	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXI-47

	Table AAI-47.								
№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXI-47-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXI-47-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-47-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-47-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-47-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-47-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-47-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-47-8	p-F-Ph	*	Н	*	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5 Table XXI-48.

14010 7171									
№	$R^{I}$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$\mathbb{R}^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXI-48-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXI-48-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-48-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-48-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXI-48-5	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2Ph$	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-48-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-48-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXI-48-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XX	I-49.								
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R5	R <sup>6</sup>	X	Y
XXI-49-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXI-49-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXI-49-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$\text{CH}_3$	F	OH
XX1-49-4	n-Br-Ph	Н	H	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	OH

XXI-49-5 p-Br-Ph H H CH<sub>2</sub>Ph Bz H CH<sub>3</sub> F OH

XXI-49-6 p-Br-Ph H H CH<sub>2</sub>-indol-3-yl Bz H CH<sub>3</sub> F OH

**XXI-49-7** p-Br-Ph H H CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub> Bz H CH<sub>3</sub> F OH **XXI-49-8** p-Br-Ph \* H \* Bz H CH<sub>3</sub> F OH

*R <sup>2</sup> and R <sup>3b</sup> joined	d together by (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub>	to form	five-membered ring.
--------------------------------------------	-----------------------------------------------	---------	---------------------

Table XX	Table XXI-50.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$											
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R3	R <sup>6</sup>	X	Y			
XXI-50-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH			
XXI-50-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$\text{CH}_3$	F	OH			
XXI-50-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	OH			
XXI-50-4	p-I <b>-</b> Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	H	$\text{CH}_3$	F	OH			
XXI-50-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$\text{CH}_3$	F	ОН			
XXI-50-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	F	OH			
XXI-50-7	p-I <b>-</b> Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН			

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5

**XXI-50-8** p-I-Ph \*

$$R^{3a}$$
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{3b$ 

Bz H CH<sub>3</sub> F OH

XXII

Y OH
OH
ОН
ОН
ОН
OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXII-2. $ \underline{N}_{2} \qquad R^{1}  R^{2}  R^{3a}  R^{3b} \qquad \qquad R^{4}  R^{5}  R^{6}  X  Y $												
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R'	R°	X	Y			
XXII-2-1	Et	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	OH			
XXII-2-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	H	F	Н	ОН			
XXII-2-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	OH			
XXII-2-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	OH			
XXII-2-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	H	F	Н	OH			
XXII-2-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	H	F	H	OH			
XXII-2-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	OH			
XXII-2-8	Et	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	Н	OH			

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table XXII-3.
	1 4010 1 41 444 0 .

No No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXII-3-1	iPr	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	OH
XXII-3-2					CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН
				CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН
				$CH_2CH(CH_3)_2$	_				ОН
XXII-3-4 XXII-3-5					CH <sub>3</sub>				
				CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	_				ОН
				CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>					ОН
			Н	*	CH <sub>3</sub>		F		ОН
XXII-3-8	Pr	-4"	п	•					

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XX	Table XXII-4.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$										
No	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R5	Rº	X	Y		
XXII-4-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	OH		
XXII-4-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Η	OH		
XXII-4-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	OH		
XXII-4-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	H	OH		
XXII-4-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	H	F	H	OH		
XXII-4-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	H	F	Н	OH		
XXII-4-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	OH		
XXII-4-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	Н	ОН		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXII-5.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$												
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y			
XXII-5-1	Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	OH			
XXII-5-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	OH			
XXII-5-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	H	F	Н	OH			
XXII-5-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	OH			
XXII-5-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$\text{CH}_3$	Н	F	Н	OH			
XXII-5-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	Н	OH			
XXII-5-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	ОН			
XXII-5-8	Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	Н	OH			

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table	XXII-6.
	N.C.	D1

Table AA.	11-0.			_ 5	6				
No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>				
XXII-6-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	OH
XXII-6-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	H	F	Н	OH
XXII-6-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	H	F	Н	OH
XXII-6-4	p-Me-Ph	Н	H	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	H	F	Н	OH
XXII-6-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	H	OH
XXII-6-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	Н	OH
XXII-6-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	OH
XXII-6-8	p-Me-Ph	*	Н	*	$CH_3$	H	F	Н	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

٦	[ab]	ما	XXI	n	-7
	1111	•	$\Delta \Delta$		-/.

Taule AATI	No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$									
№	R¹	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>36</sup>	R <sup>4</sup>	R³	R°	X	Y	
XXII-7-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН	
XXII-7-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	
XXII-7-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	OH	
XXII-7-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	
<b>XXII-7-6</b>	p-F-Ph	Н	Н	CH₂Ph	$CH_3$	Н	F	Н	OH	
<b>XXII-7-7</b>	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$\mathbf{F}$	Н	OH	
XXII-7-8	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	OH	
XXII-7-20	p-F-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	Н	ОН	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

٦	$\Gamma_{\sim}$	L	۱,	XX	TI	[ (	0
	ıи	n	œ	$\Lambda \Lambda$		-	Λ.

I aute AA	11-0.								
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXII-8-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН
XXII-8-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	OH
XXII-8-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	OH
XXII-8-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	OH
XXII-8-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	Η	OH
XXII-8-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	Н	OH
<b>XXII-8-7</b>	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	ОН
XXII-8-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### 5 Table XXII-9.

Table AMI									
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R°	X	Y
XXII-9-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	OH
XXII-9-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	OH
XXII-9-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	ОН
XXII-9-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН
XXII-9-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	Н	ОН
<b>XXII-9-7</b>	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	Н	ОН
XXII-9-8	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	ОН
XXII-9-20	p-Br-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Т	a	h	ما	Y	X)	II.	.1	U	١
	1			$^{\Lambda}$	$\Delta$			١,	

No No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXII-10-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	OH
XXII-10-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	ОН
XXII-10-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	H	F	Н	ОН
XXII-10-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	ОН
XXII-10-5	p-I <b>-</b> Ph	Н	Н	CH₂Ph	$CH_3$	Н	F	Н	OH
XXII-10-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	Н	OH
XXII-10-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	OH
XXII-10-8	p-I-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

- 1	1	37371	TT 1		
Lab	le.	XXI	-	11	١.

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXII-11-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	ОН
XXII-11-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН
XXII-11-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	ОН
XXII-11-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	ОН
XXII-11-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	Н	OH .
XXII-11-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	Н	ОН
XXII-11-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	OH
XXII-11-8	$CH_3$	*	Н	*	Et	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### 5 Table XXII-12.

1 4010 71711									
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXII-12-1	Et	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	OH
XXII-12-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	OH
XXII-12-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	ОН
XXII-12-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	OH
XXII-12-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	Н	OH
XXII-12-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	Н	OH
XXII-12-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	OH
XXII-12-8	Et	*	Н	*	Et	Н	F	Н	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	VVI	T_1	12
Tanie	XXI	II I	١٦.

14010 71711									
№	R¹	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>30</sup>	R <sup>4</sup>	R³	R°	X	Y
XXII-13-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	OH
XXII-13-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН
XXII-13-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	ОН
XXII-13-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	H	ОН
XXII-13-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	Н	OH
XXII-13-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	Н	ОН
XXII-13-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	OH
XXII-13-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Et	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXII-14

Table AAII-I			3-	71-	_ /	- 5	-6		
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXII-14-1	'Bu	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	OH
XXII-14-2	<sup>t</sup> Bu	Н	H	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	H	OH
XXII-14-3	<sup>t</sup> Bu	H	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Ή	F	H	OH
XXII-14-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	H	F	H	OH
XXII-14-5	<sup>t</sup> Bu	H	Н	CH₂Ph	Et	Н	F	Н	OH
XXII-14-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	H	F	Н	ОН
XXII-14-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	H	F	Н	OH
XXII-14-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Et	H	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## 5 Table XXII-15.

№	$\mathbb{R}^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXII-15-1	Ph	H	Н	Н	Et	H	F	Н	OH
XXII-15-2	Ph	H	Η	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН
XXII-15-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	ОН
XXII-15-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	ОН
XXII-15-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	H	F	Н	ОН
XXII-15-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	Н	ОН
XXII-15-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	OH
XXII-15-8	Ph	*	Н	*	Et	Н	F	Н	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

1 2	10	$\mathbf{v} \cdot \mathbf{v}$		
1 24 (	110	XX	11-1	

No No	$\frac{1-10.}{R^1}$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXII-16-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	OH
XXII-16-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН
XXII-16-3	p-Me-Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	F	Н	OH
XXII-16-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	OH
XXII-16-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	Н	OH
XXII-16-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	Н	OH
XXII-16-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	OH
XXII-16-8	p-Me-Ph	*	Н	*	Et	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tah	А	X	$\mathbf{X}$	11_1	17

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXII-17-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	ОН
XXII-17-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН
XXII-17-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	ОН
XXII-17-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	ОН
XXII-17-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	Н	OH
XXII-17-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	Н	ОН
XXII-17-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН
XXII-17-8	p-F-Ph	*	Н	*	Et	Н	F	Н	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table XXII-18.

No	<b>D</b> <sup>1</sup>	$\mathbf{P}^2$	$\mathbf{P}^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$\mathbb{R}^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
145	IX	1	1	1					
XXII-18-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	OH
XXII-18-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Η	ОН
XXII-18-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	ОН
XXII-18-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	ОН
XXII-18-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	Н	ОН
XXII-18-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	Н	OH
XXII-18-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН
XXII-18-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	Et	Н	F	Н	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tai	h	ما	XX	T	<b>[_1</b>	Q
11	. ,		$\Lambda \Lambda$		-	7.

No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXII-19-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	OH
XXII-19-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН
XXII-19-3	p-Br-Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	F	Н	ОН
XXII-19-4	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	F	Н	ОН
XXII-19-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	Н	OH
XXII-19-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	Н	ОН
XXII-19-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН
XXII-19-8	p-Br-Ph	*	Н	*	Et	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

п	_പ	٦1	Δ	$\mathbf{X}$	VI	12	0	
	lal	)		Λ.	$\Delta I$	1-2	w	١.

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXII-20-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	OH
XXII-20-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН
XXII-20-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	OH
XXII-20-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	OH
XXII-20-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	Н	ОН
XXII-20-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	Н	ОН
XXII-20-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	OH
XXII-20-8	p-I-Ph	*	Н	*	Et	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### 5 Table XXII-21.

14010 71711		- 2	- 30	3h	-4	75.5	<b>75</b> 6	37	3.7
$\mathcal{N}_{\overline{0}}$	$R^1$	R²	K <sup>3</sup>	R	ΚŤ	K <sup>3</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXII-21-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXII-21-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXII-21-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXII-21-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXII-21-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	F	Н	ОН
XXII-21-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXII-21-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	F	Н	OH
XXII-21-8	$CH_3$	*	Н	*	'Pr	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

7	r - 1	1. 1	ı _	37	373	rΥ	.22	
1	าล	hΙ	6	X	ΧI	11-	. ,	

Nº		$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXII-22-1	Et	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH
XXII-22-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXII-22-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	F	Н	ОН
XXII-22-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXII-22-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXII-22-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXII-22-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXII-22-8	Et	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	e XXII	-23

1 4010 21211									
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R⁴	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXII-23-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXII-23-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXII-23-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH
XXII-23-4	$^{i}$ Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXII-23-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH₂Ph	'Pr	Н	F	Н	OH
XXII-23-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$^{i}$ Pr	Н	F	Н	ОН
XXII-23-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXII-23-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	'Pr	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table XXII-24.

1 4010 21211									
№	R¹	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXII-24-1	'Bu	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXII-24-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXII-24-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXII-24-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXII-24-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$^{i}$ Pr.	Н	F	Н	ОН
XXII-24-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXII-24-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	F	Н	ОН
XXII-24-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

OD 1	1	37371	ľ	25
Iah	10	XXI	ш	- ノヿ

Nº		$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXII-25-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXII-25-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXII-25-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXII-25-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXII-25-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXII-25-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXII-25-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXII-25-8	Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXII-26.

	No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$									
No	$R^1$	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	
XXII-26-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH	
XXII-26-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH	
XXII-26-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH	
XXII-26-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH	
XXII-26-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH₂Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH	
XXII-26-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	F	Н	ОН	
XXII-26-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH	
XXII-26-8	p-Me-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### 5 Table XXII-27.

<u>Nº</u>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXII-27-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH
XXII-27-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXII-27-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXII-27-4	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXII-27-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXII-27-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXII-27-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXII-27-8	p-F-Ph	*	Н	*	'Pr	Н	F	Н	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

XXII-28-7 p-Cl-Ph H H

**XXII-28-8** p-Cl-Ph \* H

Table XXII	Table XXII-28. $ \underline{N} = R^1 \qquad R^2 \qquad R^{3a} \qquad R^{3b} \qquad \qquad R^4 \qquad R^5 \qquad R^6 \qquad X \qquad Y $									
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	
XXII-28-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH	
XXII-28-2	p-Cl-Ph	H	H	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH	
XXII-28-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH	
XXII-28-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	F	Н	OH	
XXII-28-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	
XXII-28-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub> <sup>i</sup>Pr H F H OH

Pr H F

н он

Table XXII-29. $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$									
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXII-29-1	p-Br <b>-</b> Ph	Н	Н	Н	'Pr	Н	F	Н	ОН
XXII-29-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH
XXII-29-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXII-29-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXII-29-5	p-Br <b>-</b> Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXII-29-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH
XXII-29-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	F	Н	ОН
XXII-29-8	p-Br-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

_	7C - 1-1 -	XXII-30	
`	Table	X X 11-30	

	14010 77711 50.									
№	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	
XXII-30-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH	
XXII-30-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	
XXII-30-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH	
XXII-30-4	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH	
XXII-30-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	F	Η	OH	
XXII-30-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH	
XXII-30-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН	
XXII-30-8	p-I-Ph	*	Н	*	'Pr	Н	F	Н	ОН	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

	- 1	1	<b>T</b> 7	T 71	r٧	_	-	
1	Րab	0	X	X	ı	- 4	1	

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXII-31-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH
XXII-31-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Η	F	Н	OH
XXII-31-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН
XXII-31-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Η	F	Н	ОН
XXII-31-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН
XXII-31-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH
XXII-31-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH
XXII-31-8	$CH_3$	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXII-32.

1 4010 73711									
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXII-32-1	Et	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН
XXII-32-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН
XXII-32-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН
XXII-32-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH
XXII-32-5	Et	Н	H	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH
XXII-32-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH
XXII-32-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	OH
XXII-32-8	Et	*	Н	*	"Bu	Н	F	Н	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table XXII-33.

No No		$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXII-33-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH
XXII-33-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН
XXII-33-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXII-33-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН
XXII-33-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	F	Н	OH
XXII-33-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXII-33-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH
XXII-33-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

٦	ച	h	۵	X	VΙ	Τ.	-3	Λ	
	- 21	n		Λ	ΛІ	1-	- 🥆	4.	

		- 1		26	1	5	- 6		
№	R¹	$\mathbf{R}^2$	R³a	R <sup>36</sup>	R*	R <sup>3</sup>	R°	Х	Y
XXII-34-1	'Bu	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH
XXII-34-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	OH
XXII-34-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	Н	OH
XXII-34-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXII-34-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXII-34-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH
XXII-34-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	OH
XXII-34-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	"Bu	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tah	le	XXI	1-3	5
-1au		$\Delta \Delta I$	ı	. J .

No No		R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXII-35-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH
XXII-35-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	OH
XXII-35-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXII-35-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	Н	OH
XXII-35-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXII-35-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН
XXII-35-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН
XXII-35-8	Ph	*	Н	*	"Bu	Н	F	Н	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## 5 Table XXII-36.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXII-36-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН
XXII-36-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	OH
XXII-36-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	Н	OH
XXII-36-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	Н	OH
XXII-36-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH₂Ph	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXII-36-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	Н	OH
XXII-36-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXII-36-8	p-Me-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

			3737	TT	_		
10	nı	_	X X	1	-4		
1 a	נט	•	XX	IJ		•	٠

Nº	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXII-37-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXII-37-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	OH
XXII-37-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	Н	OH
XXII-37-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXII-37-5	p-F-Ph	Н	Н	CH₂Ph	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXII-37-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	Н	OH
XXII-37-7	p-F-Ph	Н	Н	CH₂CH₂SCH₃	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXII-37-8	p-F-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXII-38.

No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$										
Nº	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	R٥	X	Y	
XXII-38-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	
XXII-38-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	OH	
XXII-38-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН	
XXII-38-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	Н	ОН	
XXII-38-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH₂Ph	"Bu	Н	F	Н	ОН	
XXII-38-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	Н	ОН	
XXII-38-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	ОН	
XXII-38-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table XXII-39.

Taule AAI	1-37.			31.		5	6		
Nº	$R^{i}$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>30</sup>	R <sup>4</sup>	R³	R°	X	Y
XXII-39-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH
XXII-39-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH
XXII-39-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	Н	OH
XXII-39-4	p-Br <b>-</b> Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН
XXII-39-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH₂Ph	"Bu	Н	F	Н	OH
XXII-39-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН
XXII-39-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН
XXII-39-8	p-Br-Ph	*	Н	*	"Bu	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

חר - ו	J_ 1	_	XX	rr a	ın
1 2	n	0	X X	1 -4	
ıuı	U.		/ X / X		

No No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXII-40-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXII-40-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXII-40-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН
XXII-40-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН
XXII-40-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН
XXII-40-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH
XXII-40-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXII-40-8	p-I-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

TAL	- I -	$\mathbf{v}\mathbf{v}$	[]-41
1 71	116	$\Delta \Delta$	I I <del> (1</del>   1

rable AAI							,		
№	$R^{I}$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXII-41-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	OH
XXII-41-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	H	F	Н	OH
XXII-41-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН
XXII-41-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН
XXII-41-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	Н	OH
XXII-41-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	Н	ОН
XXII-41-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН
XXII-41-8	$CH_3$	*	Н	*	Bz	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table XXII-42.

1 auto AAII						-			
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R⁴	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXII-42-1	Et	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	ОН
XXII-42-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	OH
XXII-42-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН
XXII-42-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН
XXII-42-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	Н	OH
XXII-42-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	Н	ОН
XXII-42-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	H	F	Н	ОН
XXII-42-8	Et	*	Н	*	Bz	Н	F	Н	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

~			~ ~ ~ ~		
Tа	h!	e	XX	H.	43.

Table AAL									
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R5	R°	X	Y
XXII-43-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	OH
XXII-43-2	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	H	F	H	OH
XXII-43-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН
XXII-43-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН
XXII-43-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	Н	OH
XXII-43-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	Н	OH
XXII-43-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН
XXII-43-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Bz	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXII-44.

Table AAL									
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXII-44-1	'Bu	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	OH
XXII-44-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	OH
XXII-44-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	OH
XXII-44-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН
XXII-44-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	Н	ОН
XXII-44-6	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	Н	ОН
XXII-44-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН
XXII-44-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Bz	H	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## Table XXII-45.

No	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXII-45-1	Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	ОН
XXII-45-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Η	ОН
XXII-45-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН
XXII-45-4	Ph	H	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	OH
XXII-45-5	Ph	Н	Н	$CH_2Ph$	Bz	Н	F	Н	ОН
XXII-45-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	Η	OH
XXII-45-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН
XXII-45-8	Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

	1 1		X7X7T1	r 4	_
I a	n	9	XXI	_/	רחו
1 a	U:	·	7 1 2 1 1	L	rv.

No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXII-46-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	ОН
XXII-46-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН
XXII-46-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН
XXII-46-4	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН
XXII-46-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	Н	ОН
XXII-46-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	Н	ОН
XXII-46-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН
XXII-46-8	p-Me-Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXII-47.

1 4010 73731									
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXII-47-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	OH
XXII-47-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	OH
XXII-47-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН
XXII-47-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН
XXII-47-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	Н	ОН
XXII-47-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	Н	ОН
XXII-47-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН
XXII-47-8	p-F-Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXII-48. 5

1 4010 2 22 22									
No	$R^{I}$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXII-48-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	OH
XXII-48-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	OH
XXII-48-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	OH
XXII-48-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН
XXII-48-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	Н	ОН
XXII-48-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	Н	OH
XXII-48-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН
XXII-48-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	Н	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Docket No. 60137.0034WOU1

, ,	۰, –	1_ 1	_	$\mathbf{v}$	 -49.
	· 21	n		х х	 -44

No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$											
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	R٥	X	Y		
XXII-49-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	ОН		
XXII-49-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН		
XXII-49-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	H	F	Н	OH		
XXII-49-4	p-Br-Ph	Н	H	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	OH		
XXII-49-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	H	OH		
XXII-49-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	H	OH		
XXII-49-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	OH		
XXII-49-8	p-Br-Ph	*	Н	*	Bz	H	F	Н	ОН		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$T_{al}$	h	ما	$\mathbf{v}$	V	T	. 5	'n	١
1 21	n	-				-	ш	,

	No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$										
№	$R^{i}$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>30</sup>	R*	R	R	X	Y		
XXII-50-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	OH		
XXII-50-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	OH		
XXII-50-3	p-I-Ph	Н	H	$CH(CH_3)_2$	Bz	H	F	Н	OH		
XXII-50-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	OH		
XXII-50-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	H	OH		
XXII-50-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	H	F	Н	OH		
XXII-50-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	H	OH		
XXII-50-8	p-I-Ph	*	Н	*	Bz	H	F	Н	OH		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5

$$R^{3a}$$
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{3b}$ 

XXIII

No No		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIII-1-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	OH

2983472-1

- 490 -

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIII-1-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН
XXIII-1-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	H	F	F	ОН
XXIII-1-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXIII-1-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXIII-1-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXIII-1-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXIII-1-8	$CH_3$	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$T_{2}$	ble	XXI	11_2
1 2	1111		11-2.

Table 74741									
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R۶	R٥	X	Y
XXIII-2-1	Et	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	OH
XXIII-2-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXIII-2-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXIII-2-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXIII-2-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXIII-2-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXIII-2-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXIII-2-8	Et	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table XXIII-3.

No No		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIII-3-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН
XXIII-3-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXIII-3-3	$^{i}$ Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXIII-3-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXIII-3-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXIII-3-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXIII-3-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXIII-3-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	F	ОН

\*R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIII-4.

*****									
No	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIII-4-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН
XXIII-4-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_3$	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	OH

№	R¹	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIII-4-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	OH
XXIII-4-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXIII-4-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXIII-4-6	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXIII-4-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXIII-4-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$T_{2}$	h	٦	v	V	m	5
	n	-				- 1

			30	4	5	- 6		
R¹	$\mathbb{R}^2$	R³a	R <sup>30</sup>	R*	R'	R°	X	Y
Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	OH
Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	OH
Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	OH
Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН
Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	F	ОН
Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	F	ОН
Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	OH
Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	F	ОН
	Ph Ph Ph Ph Ph Ph	Ph H Ph H Ph H Ph H Ph H Ph H	Ph H H	Ph H H CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Ph         H         H         H         CH <sub>3</sub> Ph         H         H         CH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> Ph         H         H         CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> Ph         H         H         CH <sub>2</sub> Ph         CH <sub>3</sub> Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         CH <sub>3</sub> Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         CH <sub>3</sub> Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	Ph         H         H         H         CH <sub>3</sub> H           Ph         H         H         CH <sub>3</sub> H           Ph         H         H         CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> H           Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> H           Ph         H         H         CH <sub>2</sub> Ph         CH <sub>3</sub> H           Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         CH <sub>3</sub> H           Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> H	Ph         H         H         H         CH3         H         F           Ph         H         H         CH3         H         F           Ph         H         H         CH(CH3)2         CH3         H         F           Ph         H         H         CH2CH(CH3)2         CH3         H         F           Ph         H         H         CH2Ph         CH3         H         F           Ph         H         H         CH2-indol-3-yl         CH3         H         F           Ph         H         H         CH2CH2SCH3         CH3         H         F	Ph         H         H         H         CH3         H         F         F           Ph         H         H         CH3         H         F         F           Ph         H         H         CH(CH3)2         CH3         H         F         F           Ph         H         H         CH2CH(CH3)2         CH3         H         F         F           Ph         H         H         CH2Ph         CH3         H         F         F           Ph         H         H         CH2-indol-3-yl         CH3         H         F         F           Ph         H         H         CH2CH2SCH3         CH3         H         F         F

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIII-6.

No No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIII-6-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН
XXIII-6-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXIII-6-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	OH
XXIII-6-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXIII-6-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXIII-6-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXIII-6-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXIII-6-8	p-Me-Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table YYIII-7

I able AAII									
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIII-7-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	OH
XXIII-7-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXIII-7-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН

Docket No. 60137.0034WOU1

№	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIII-7-4	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	OH
XXIII-7-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXIII-7-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXIII-7-8	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXIII-7-20	p-F-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

П	โลไ	h	حا	Y	V.	m	ſ_!	Q	
	11	וו		$^{\Lambda}$	$^{\Lambda}$			(7)	_

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXIII-8-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	OH
XXIII-8-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	H	F	F	ОН
XXIII-8-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXIII-8-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXIII-8-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXIII-8-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXIII-8-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXIII-8-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	$\mathrm{CH}_3$	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIII-9.

No Table AXIII	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXIII-9-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	OH
XXIII-9-2	p-Br <b>-</b> Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXIII-9-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXIII-9-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXIII-9-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH₂Ph	$CH_3$	Н	F	F	OH
<b>XXIII-9-7</b>	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	F	ОН
<b>XXIII-9-8</b>	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXIII-9-20	p-Br-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	F	ОН

 $<sup>^{*}</sup>$ R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIII-10

Table XXIII	L-10.								
№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIII-10-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	OH
XXIII-10-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXIII-10-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXIII-10-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIII-10-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН
XXIII-10-6	p-I <b>-</b> Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXIII-10-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXIII-10-8	p-I-Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIII									
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIII-11-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	OH
XXIII-11-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН
XXIII-11-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	ОН
XXIII-11-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	OH
XXIII-11-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	F	OH
<b>XXIII-11-6</b>	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	F	ОН
XXIII-11-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	OH
XXIII-11-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	Et	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXII									
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIII-12-1	Et	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	ОН
XXIII-12-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	OH
XXIII-12-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	OH
XXIII-12-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	OH
XXIII-12-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	F	OH
XXIII-12-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	F	OH
XXIII-12-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	OH
XXIII-12-8	Et	*	Н	*	Et	Н	F	F	ОН

<sup>5 \*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXII	Table XXIII-13.											
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y			
XXIII-13-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	OH			
XXIII-13-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	OH			
XXIII-13-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	ОН			
XXIII-13-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	F	F	OH			
XXIII-13-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	F	ОН			

№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIII-13-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	F	ОН
XXIII-13-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	OH
XXIII-13-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Et	Н	F	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIII	Table XXIII-14.										
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y		
XXIII-14-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	OH		
XXIII-14-2	'Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	OH		
XXIII-14-3	'Bu	Ή	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	H	F	F	OH		
<b>XXIII-14-4</b>	'Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	OH		
XXIII-14-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	F	OH		
<b>XXIII-14-6</b>	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	F	OH		
XXIII-14-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	OH		
XXIII-14-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Et	Н	F	F	OH		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIII-15.										
№	R¹	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	
XXIII-15-1	Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	OH	
XXIII-15-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	OH	
XXIII-15-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	OH	
XXIII-15-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	OH	
XXIII-15-5	Ph	Н	Н	CH₂Ph	Et	Н	F	F	OH	
XXIII-15-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	F	OH	
<b>XXIII-15-7</b>	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	OH	
XXIII-15-8	Ph	*	Н	*	Et	Н	F	F	OH	

<sup>5 \*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIII-16.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$											
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	$R^5$	R <sup>6</sup>	X	Y		
XXIII-16-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	OH		
XXIII-16-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	OH		
XXIII-16-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	ОН		
<b>XXIII-16-4</b>	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	OH		
XXIII-16-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	F	OH		
XXIII-16-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	F	OH		

O 2008/121634 PCT/US2008/058183

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIII-16-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН
XXIII-16-8	p-Me-Ph	*	Н	*	Et	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIII-17.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIII-17-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	ОН
XXIII-17-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	OH
XXIII-17-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	H	F	F	OH
XXIII-17-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	ОН
XXIII-17-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	F	OH
XXIII-17-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	F	ОН
XXIII-17-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	OH
XXIII-17-8	p-F-Ph	*	Н	*	Et	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIII-18.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIII-18-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	ОН
XXIII-18-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН
XXIII-18-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	OH
XXIII-18-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	ОН
XXIII-18-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	F	OH
XXIII-18-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	H	F	F	ОН
XXIII-18-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН
XXIII-18-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	Et	Н	F	F	ОН

 $<sup>^{*}</sup>$ R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIII	l-19.								
№	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIII-19-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	ОН
XXIII-19-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	OH
XXIII-19 <b>-3</b>	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	OH
XXIII-19-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	ОН
XXIII-19-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH₂Ph	Et	Н	F	F	OH
XXIII-19-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	F	ОН
XXIII-19-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

**XXIII-19-8** p-Br-Ph \* H \* Et H F F OH

Table XXIII-20.											
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y		
XXIII-20-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	ОН		
XXIII-20-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	OH		
XXIII-20-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	OH		
XXIII-20-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	OH		
XXIII-20-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	F	OH		
XXIII-20-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	F	OH		
XXIII-20-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	OH		
XXIII-20-8	p-I-Ph	*	Н	*	Et	Н	F	F	OH		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table YYIII_21	

No	R <sup>i</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIII-21-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXIII-21-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXIII-21-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXIII-21-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXIII-21-5	$CH_3$	H	Н	CH₂Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXIII-21-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXIII-21-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXIII-21-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	'Pr	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIII-22.

Table AAIII									
№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R5	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIII-22-1	Et	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXIII-22-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXIII-22-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXIII-22-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXIII-22-5	Et	Н	Н	CH₂Ph	'Pr	Н	F	F	OH
XXIII-22-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXIII-22-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXIII-22-8	Et	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

	•		
Tah	le.	XXII	11-23

No         R¹         R²         R³a         R³b         R⁴         R⁵         R6         X         Y           XXIII-23-1 $^{i}$ Pr         H         H         H         H $^{i}$ Pr         H         F         F         OH           XXIII-23-2 $^{i}$ Pr         H         H         CH <sub>3</sub> $^{i}$ Pr         H         F         F         OH           XXIII-23-3 $^{i}$ Pr         H         H         CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> $^{i}$ Pr         H         F         F         OH           XXIII-23-5 $^{i}$ Pr         H         H         CH <sub>2</sub> Ph $^{i}$ Pr         H         F         F         OH           XXIII-23-6 $^{i}$ Pr         H         H         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> $^{i}$ Pr         H         F         F         OH           XXIII-23-8 $^{i}$ Pr         H         H         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> $^{i}$ Pr         H         F         F         OH	Table AAIII									
XXIII-23-2 ${}^{1}$ Pr         H         H         CH <sub>3</sub> ${}^{1}$ Pr         H         F         F         OH           XXIII-23-3 ${}^{1}$ Pr         H         H         CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ${}^{1}$ Pr         H         F         F         OH           XXIII-23-4 ${}^{1}$ Pr         H         H         CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ${}^{1}$ Pr         H         F         F         OH           XXIII-23-5 ${}^{1}$ Pr         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl ${}^{1}$ Pr         H         F         F         OH           XXIII-23-7 ${}^{1}$ Pr         H         H         CH <sub>2</sub> -cH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> ${}^{1}$ Pr         H         F         F         OH	№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIII-23-3 $^{1}$ Pr         H         H         CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> $^{1}$ Pr         H         F         F         OH           XXIII-23-4 $^{1}$ Pr         H         H         CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> $^{1}$ Pr         H         F         F         OH           XXIII-23-5 $^{1}$ Pr         H         H         CH <sub>2</sub> Ph $^{1}$ Pr         H         F         F         OH           XXIII-23-6 $^{1}$ Pr         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl $^{1}$ Pr         H         F         F         OH           XXIII-23-7 $^{1}$ Pr         H         H         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> $^{1}$ Pr         H         F         OH	XXIII-23-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXIII-23-4 ${}^{1}$ Pr         H         H         CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ${}^{1}$ Pr         H         F         F         OH           XXIII-23-5 ${}^{1}$ Pr         H         H         CH <sub>2</sub> Ph ${}^{1}$ Pr         H         F         F         OH           XXIII-23-6 ${}^{1}$ Pr         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl ${}^{1}$ Pr         H         F         F         OH           XXIII-23-7 ${}^{1}$ Pr         H         H         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> ${}^{1}$ Pr         H         F         F         OH	XXIII-23-2	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	Н	F	F	OH
XXIII-23-5 ${}^{i}$ Pr       H       H       CH <sub>2</sub> Ph ${}^{i}$ Pr       H       F       F       OH         XXIII-23-6 ${}^{i}$ Pr       H       H       CH <sub>2</sub> -indol-3-yl ${}^{i}$ Pr       H       F       F       OH         XXIII-23-7 ${}^{i}$ Pr       H       H       CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> ${}^{i}$ Pr       H       F       F       OH	XXIII-23-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
<b>XXIII-23-6</b> ${}^{i}$ Pr H H CH <sub>2</sub> -indol-3-yl ${}^{i}$ Pr H F F OH <b>XXIII-23-7</b> ${}^{i}$ Pr H H CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> ${}^{i}$ Pr H F F OH	XXIII-23-4	$^{i}$ Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXIII-23-7 <sup>i</sup> Pr H H CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> <sup>i</sup> Pr H F F OH	XXIII-23-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH₂Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
	XXIII-23-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
<b>XXIII-23-8</b> <sup>i</sup> Pr * H * <sup>i</sup> Pr H F F OH	XXIII-23-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	F	F	OH
	XXIII-23-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## 5 Table XXIII-24.

1 auto AAIII		D <sup>2</sup>	D 3a	R <sup>3b</sup>	$\mathbf{p}^4$	D <sup>5</sup>	<b>D</b> 6	Y	<u>Y</u>
№	K	K	K	K	I	1/	IV.	Λ	1
XXIII-24-1	'Bu	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXIII-24-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXIII-24-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXIII-24-4	'Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	F	F	OH
XXIII-24-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH₂Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
<b>XXIII-24-6</b>	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
<b>XXIII-24-7</b>	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXIII-24-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	'Pr	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Docket No. 60137.0034WOU1

7	โล	h	le	$\mathbf{X}^{T}$	VΤ	n	[_25	
	1	.,,		$\Delta$	<b>~ 1</b>		-4	, .

Table AAIII			20	2h	4	-5	206	77	7.7
№	R¹	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>30</sup>	R⁺	R	R°	Х	Y
XXIII-25-1	Ph	Н	Н	Н	'Pr	Н	F	F	OH
XXIII-25-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	H	F	F	OH
XXIII-25-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXIII-25-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	F	F	OH
XXIII-25-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	F	F	ЮН
XXIII-25-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXIII-25-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXIII-25-8	Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

OD 1 1		37371	T	20
lah	ρ	XXI		- /n

Table AAIII	R <sup>1</sup>	D2	D3a	D3b	D <sup>4</sup>	D <sup>5</sup>	<b>D</b> 6	v	Y
№	K'	K	K	K	K	K	K	Λ	1
XXIII-26-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	H	F	F	OH
XXIII-26-2	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_3$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXIII-26-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	F	F	ОН
XXIII-26-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	F	F	ОН
XXIII-26-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
<b>XXIII-26-6</b>	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	F	F	OH
<b>XXIII-26-7</b>	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
<b>XXIII-26-8</b>	p-Me-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Ή	F	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### 5 Table XXIII-27.

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIII-27-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXIII-27-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXIII-27-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXIII-27-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXIII-27-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$^{i}$ Pr	Н	F	F	OH
XXIII-27-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXIII-27-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXIII-27-8	p-F-Ph	*	Н	*	'Pr	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

_		-	* * *	7 1 7	**	~ ~
1 3	hI.	_	X)	( II		-28.
14	יוכו	┖.	$\Delta Z$	<b>VI</b>	ш	-40.

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIII-28-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXIII-28-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Η	F	F	OH
XXIII-28-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXIII-28-4	p-Cl <b>-</b> Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXIII-28-5	p-Cl-Ph	Н	Η	CH₂Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXIII-28-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXIII-28-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXIII-28-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

7	_പ	ء1ء	_	v	V	m	-29
	1 <i>1</i> 4 f	314	-	А	Λ.		-/.4

Table AAIII									
№	R¹	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIII-29-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	'Pr	Н	F	F	OH
XXIII-29-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	H	F	F	OH
XXIII-29-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXIII-29-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXIII-29-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH₂Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXIII-29-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXIII-29-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXIII-29-8	p-Br-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# 5 Table XXIII-30.

No	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIII-30-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	'Pr	Н	F	F	OH
XXIII-30-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXIII-30-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$\mathbf{F}$	F	OH
XXIII-30-4	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXIII-30-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXIII-30-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	F	F	ОН
XXIII-30-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	F	F	ОН
XXIII-30-8	p-I-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIII-31.

Table AAIII				31		_ 5	6		
№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>30</sup>	$R^4$	R <sup>3</sup>	R	X	Y
XXIII-31-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH
XXIII-31-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH
XXIII-31-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	OH
XXIII-31-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	OH
XXIII-31-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH
XXIII-31-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН
XXIII-31-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	ОН
XXIII-31-8	$CH_3$	*	Н	*	"Bu	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIII-32.

Table AAIII									
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	Rº	X	Y
XXIII-32-1	Et	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН
XXIII-32-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	OH
XXIII-32-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	OH
XXIII-32-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	OH
XXIII-32-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	F	F	OH
XXIII-32-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	F	OH
XXIII-32-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	OH
XXIII-32-8	Et	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5 Table XXIII-33.

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIII-33-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH
XXIII-33-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH
XXIII-33-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	OH
XXIII-33-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	OH
XXIII-33-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	F	F	ОН
XXIII-33-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH
XXIII-33-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	ОН
<b>XXIII-33-8</b>	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	"Bu	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIII-34

Table AAIII						-			
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIII-34-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН
XXIII-34-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	H	F	F	OH
XXIII-34-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH
XXIII-34-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH
XXIII-34-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH₂Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH
XXIII-34-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	F	OH
<b>XXIII-34-7</b>	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH₂CH₂SCH₃	"Bu	Н	F	F	ОН
XXIII-34-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

_			* * * T	**		_	
110	h	_	XX	11	1 4	. ^	
1 4.	ולו		$\Lambda \Lambda$				

Table AAIII									
№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R۶	Rº	X	Y
XXIII-35-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН
XXIII-35-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH
XXIII-35-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH
XXIII-35-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	OH
XXIII-35-5	Ph	Н	Н	CH₂Ph	"Bu	Н	F	F	ОН
XXIII-35-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	F	OH
XXIII-35-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	OH
XXIII-35-8	Ph	*	Н	*	"Bu	Н	F	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### 5 Table XXIII-36.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIII-36-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH
XXIII-36-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	OH
XXIII-36-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH
XXIII-36-4	p-Me-Ph	H	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	H	F	F	OH
XXIII-36-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH₂Ph	"Bu	Н	F	F	OH
<b>XXIII-36-6</b>	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	F	OH
<b>XXIII-36-7</b>	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH
XXIII-36-8	p-Me-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

_			T 7 T 7	T Y Y		•
10	h	_	XX		_ 4 .	,
1 4	IJ.		$\Delta \Delta$	ш	L- <i>J I</i>	

No No	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIII-37-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	"Bu	Н	F	F	OH
XXIII-37-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH
XXIII-37-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH
XXIII-37-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	ОН
XXIII-37-5	p-F-Ph	Н	Н	CH₂Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH
XXIII-37-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	F	OH
XXIII-37-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	ОН
XXIII-37-8	p-F-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIII-38

Table XXIII									
No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIII-38-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	"Bu	Н	F	F	OH
XXIII-38-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	OH
XXIII-38-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	OH
XXIII-38-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	OH
XXIII-38-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH₂Ph	"Bu	Н	F	F	OH
XXIII-38-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	F	OH
XXIII-38-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	OH
XXIII-38-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	"Bu	Н	F	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5 Table XXIII-39.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIII-39-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН
XXIII-39-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	H	F	F	OH
XXIII-39-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	OH
XXIII-39-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	OH
XXIII-39-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH₂Ph	"Bu	Н	F	F	ОН
XXIII-39-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН
XXIII-39-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	ОН
XXIII-39-8	p-Br-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

**WO 2008/121634**Docket No. 60137.0034WOU1

<b></b> 1	•	T7 T7	<b>'YY</b>	40
ได่เ	NΔ	$\mathbf{v} \cdot \mathbf{v}$		_///
ı aı	"	XX	ш	<del>-1</del> 0.

No No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIII-40-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH
XXIII-40-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	ОН
XXIII-40-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	ОН
XXIII-40-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН
XXIII-40-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН
XXIII-40-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH
XXIII-40-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	ОН
XXIII-40-8	p-I-Ph	*	Н	*	"Bu	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

7	<sup>r</sup> ah	12	$\mathbf{v}$	VI	ΥT	<b>11</b>	
	เมก	не.	А.	λІ	II-	41	

No 1 able AAIII	$\frac{1-41}{R^1}$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIII-41-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	ОН
XXIII-41-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН
XXIII-41-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	Н	F	F	ОН
XXIII-41-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	Н	F	F	ОН
XXIII-41-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH₂Ph	Bz	Н	F	F	ОН
XXIII-41-6	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	F	OH
XXIII-41-7	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН
XXIII-41-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	Bz	Н	F	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# 5 Table XXIII-42.

No	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIII-42-1	Et	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	ОН
XXIII-42-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	OH
XXIII-42-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН
XXIII-42-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	OH
XXIII-42-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	F	OH
XXIII-42-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	F	OH
XXIII-42-7	Et	Н	Н	CH₂CH₂SCH₃	Bz	Н	F	F	ОН
XXIII-42-8	Et	*	Н	*	Bz	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

T	ab	le	XY	ΚII	I-4	3.

Nº		R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIII-43-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	OH
XXIII-43-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	OH
XXIII-43-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	OH
XXIII-43-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	OH
XXIII-43-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	F	ОĦ
XXIII-43-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	F	OH
XXIII-43-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	OH
XXIII-43-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Bz	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIII-44.

Table AAIII									
No	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIII-44-1	'Bu	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	OH
XXIII-44-2	'Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	OH
XXIII-44-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	OH
<b>XXIII-44-4</b>	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	OH
XXIII-44-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH₂Ph	Bz	Н	F	F	OH
<b>XXIII-44-6</b>	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	F	OH
<b>XXIII-44-7</b>	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	OH
XXIII-44-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Bz	Н	F	F	OH

 $<sup>^{*}</sup>R^{2}$  and  $R^{3b}$  joined together by  $(CH_{2})_{3}$  to form five-membered ring.

Table XXIII-45.

Table XXIII									
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	Rº	X	Y
XXIII-45-1	Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	OH
XXIII-45-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	OH
XXIII-45-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	OH
XXIII-45-4	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	Н	F	F	OH
XXIII-45-5	Ph	Н	Н	CH₂Ph	Bz	Н	F	F	OH
XXIII-45-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	F	OH
XXIII-45-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	OH
XXIII-45-8	Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	XXI	111-46

Table XXIII									
№	R <sup>1</sup>	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R⁴	R	R°	X	Y
XXIII-46-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	OH
XXIII-46-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	OH
XXIII-46-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	OH
XXIII-46-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН
XXIII-46-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	F	OH
XXIII-46-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	F	ОН
XXIII-46-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН
XXIII-46-8	p-Me-Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

-	ام1	հ	_	v	V	rt1	[-47]	,
	1 21	าเ	$\boldsymbol{\epsilon}$	х	А.		1-4/	

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIII-47-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	OH
XXIII-47-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	OH
XXIII-47-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН
XXIII-47-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН
XXIII-47-5	p-F-Ph	Н	Н	CH₂Ph	Bz	Н	F	F	ОН
XXIII-47-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	F	OH
XXIII-47-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	OH
XXIII-47-8	p-F-Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXIII-48. 5

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXIII-48-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	OH
XXIII-48-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	OH
XXIII-48-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	OH
XXIII-48-4	p-Cl-Ph	H	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	OH
XXIII-48-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH₂Ph	Bz	H	F	F	OH
XXIII-48-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	F	OH
XXIII-48-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН
XXIII-48-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Docket No. 60137.0034WOU1

<b>T</b>	4 :		* 7 T T	TY	1 A A
10	h	_	Y Y		[-49.
			$\Lambda \Lambda$		I-+ /.

No Table AAIII	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIII-49-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	OH
XXIII-49-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Η	F	F	OH
XXIII-49-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	OH
XXIII-49-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	OH
XXIII-49-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	F	ОН
XXIII-49-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	F	ОН
XXIII-49-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	OH
XXIII-49-8	p-Br-Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$T_{\alpha}$	10	XX	TT	50	١.
าลเ	nie.	- X X		. 71	,

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIII-50-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	ОН
XXIII-50-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН
XXIII-50-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН
XXIII-50-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН
XXIII-50-5	p-I-Ph	Н	Н	CH₂Ph	Bz	Н	F	F	ОН
XXIII-50-6	p-I <b>-</b> Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	F	OH
XXIII-50-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	OH
XXIII-50-8	p-I-Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5

$$R^{3a}$$
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{3a}$ 
 $R^{3a}$ 

XXIV

Table XXIV-1.

Nº		R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIV-1-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН

2983472-1

- 507 -

Docket No. 60137.0034WOU1

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIV-1-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН
XXIV-1-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXIV-1-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXIV-1-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXIV-1-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXIV-1-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXIV-1-8	$CH_3$	*	Н	*	$CH_3$	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIV-2

I aule AAI									
No	R¹	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R5	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIV-2-1	Et	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	OH
XXIV-2-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXIV-2-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXIV-2-4	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXIV-2-5	Et	Н	Н	CH₂Ph	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXIV-2-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXIV-2-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXIV-2-8	Et	*	Н	*	$CH_3$	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIV-3

Nº		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIV-3-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	OH
XXIV-3-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXIV-3-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXIV-3-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXIV-3-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXIV-3-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXIV-3-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXIV-3-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	$CH_3$	Н	Н	F	ОН

<sup>5 \*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIV-4

Table AA									
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R	Rº	X	Y
XXIV-4-1	'Bu	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН
XXIV-4-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_3$	CH <sub>3</sub>	Н	H	F	ОН

No	R¹	$\mathbb{R}^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIV-4-3	¹Bu	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	OH
XXIV-4-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXIV-4-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXIV-4-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXIV-4-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXIV-4-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	$CH_3$	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tabl	۱_	XXI	117	- 5
I ab	le	$\Delta \Delta I$	V	-),

No No		$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXIV-5-1	Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН
XXIV-5-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	H	F	OH
XXIV-5-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXIV-5-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	H	Н	F	OH
XXIV-5-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXIV-5-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXIV-5-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXIV-5-8	Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIV-6

No No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIV-6-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН
XXIV-6-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	OH
XXIV-6-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXIV-6-4	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXIV-6-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXIV-6-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXIV-6-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	OH
	p-Me-Ph				CH <sub>3</sub>				

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table VVIV 7

I able X	<b>(1V-/.</b>								
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIV-7-	p-F-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН
XXIV-7-	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXIV-7-	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	OH

N₂	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIV-7-4	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	OH
<b>XXIV-7-6</b>	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXIV-7-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXIV-7-8	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXIV-7-20	p-F-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

7	างใ	ρle	VV	$IV_{-}$	R.
- 1	ar	HE	XX	ı v -	·۸.

1 4010 71711									
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIV-8-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	OH
XXIV-8-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН
XXIV-8-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXIV-8-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXIV-8-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXIV-8-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
<b>XXIV-8-7</b>	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Η	F	OH
XXIV-8-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table XXIV-9.

№         R¹         R²         R³a         R³b         R⁴         R⁵         R6         X         Y           XXIV-9-1         p-Br-Ph         H         H         H         H         H         F         OH           XXIV-9-2         p-Br-Ph         H         H         CH <sub>3</sub> H         H         F         OH           XXIV-9-3         p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> H         H         F         OH           XXIV-9-4         p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> Ph         CH <sub>3</sub> H         H         F         OH           XXIV-9-6         p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> Ph         CH <sub>3</sub> H         H         F         OH           XXIV-9-7         p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         CH <sub>3</sub> H         H         F         OH           XXIV-9-8         p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> H         H         F         OH           XXIV-9-20         p-Br-Ph         *         H         *         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> H         H <th>14010 71711 7</th> <th></th> <th></th> <th></th> <th></th> <th></th> <th></th> <th></th> <th></th> <th></th>	14010 71711 7									
XXIV-9-2         p-Br-Ph         H         H         CH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> H         H         F         OH           XXIV-9-3         p-Br-Ph         H         H         CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> H         H         F         OH           XXIV-9-4         p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> H         H         F         OH           XXIV-9-6         p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         CH <sub>3</sub> H         H         F         OH           XXIV-9-8         p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         CH <sub>3</sub> H         H         F         OH	Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIV-9-3         p-Br-Ph         H         H         CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> H         H         F         OH           XXIV-9-4         p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> H         H         F         OH           XXIV-9-6         p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> Ph         CH <sub>3</sub> H         H         F         OH           XXIV-9-7         p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         CH <sub>3</sub> H         H         F         OH           XXIV-9-8         p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         CH <sub>3</sub> H         H         F         OH	XXIV-9-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	OH
XXIV-9-4         p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> H         H         F         OH           XXIV-9-6         p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> Ph         CH <sub>3</sub> H         H         F         OH           XXIV-9-7         p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         CH <sub>3</sub> H         H         F         OH           XXIV-9-8         p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> H         H         F         OH	XXIV-9-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXIV-9-6         p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> Ph         CH <sub>3</sub> H         H         F         OH           XXIV-9-7         p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         CH <sub>3</sub> H         H         F         OH           XXIV-9-8         p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> H         H         F         OH	XXIV-9-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXIV-9-7         p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         CH <sub>3</sub> H         H         F         OH           XXIV-9-8         p-Br-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> H         H         F         OH	XXIV-9-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXIV-9-8 p-Br-Ph H H CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> H H F OH	<b>XXIV-9-6</b>	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
•	<b>XXIV-9-7</b>	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	Н	F	OH
<b>XXIV-9-20</b> p-Br-Ph * H * CH <sub>3</sub> H H F OH	XXIV-9-8	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	OH
	XXIV-9-20	p-Br-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	Н	F	OH

<sup>5</sup>  $R^2$  and  $R^{3b}$  joined together by  $(CH_2)_3$  to form five-membered ring.

Table XXIV-10

Table AATV									
No	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXIV-10-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	OH
XXIV-10-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXIV-10-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXIV-10-4	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	ОН

No	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXIV-10-5	p-I-Ph	H	Н	CH <sub>2</sub> Ph	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	OH
XXIV-10-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXIV-10-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXIV-10-8	p-I-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIV									
№	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R⁴	R	Ro	X	Y
XXIV-11-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	ОН
XXIV-11-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	OH
XXIV-11-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	OH
XXIV-11-4	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	Н	F	OH
XXIV-11-5	$CH_3$	Н	Н	CH₂Ph	Et	Н	Н	F	OH
XXIV-11-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	Н	F	OH
XXIV-11-7	CH <sub>3</sub>	Н	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	OH
XXIV-11-8	$CH_3$	*	Н	*	Et	Н	Н	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIV									
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R	R	X	Y
XXIV-12-1	Et	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	OH
XXIV-12-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН
XXIV-12-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	OH
XXIV-12-4	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	Н	F	OH
XXIV-12-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	Н	F	OH
XXIV-12-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	Н	F	OH
XXIV-12-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	OH
XXIV-12-8	Et	*	Н	*	Et	Н	Н	F	ОН

<sup>5 \*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIV-13.												
Nº	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R⁴	R5	Rº	X	Y			
XXIV-13-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	ОН			
XXIV-13-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	OH			
XXIV-13-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	OH			
XXIV-13-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	OH			
XXIV-13-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	Н	F	OH			

WO 2008/121634

Docket No. 60137.0034WOU1

Nº	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIV-13-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	Н	F	OH
XXIV-13-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	OH
XXIV-13-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Et	H	Н	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIV-14.											
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y		
XXIV-14-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	OH		
XXIV-14-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	H	F	OH		
XXIV-14-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	H	Н	F	OH		
XXIV-14-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	ОН		
XXIV-14-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	H	F	OH		
XXIV-14-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	Н	F	OH		
XXIV-14-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН		
XXIV-14-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Et	Н	Н	F	OH		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIV-15.  No. $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$												
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R۶	Rº	X	Y			
XXIV-15-1	Ph	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	OH			
XXIV-15-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	OH			
XXIV-15-3	Ph	Н	H	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	OH			
XXIV-15-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	OH			
XXIV-15-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	Н	F	OH			
XXIV-15-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	Н	F	OH			
XXIV-15-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	OH			
XXIV-15-8	Ph	*	Н	*	Et	Н	Н	F	ОН			

<sup>5 \*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIV-16. $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$												
No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y			
XXIV-16-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	ОН			
XXIV-16-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	OH			
XXIV-16-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	OH			
XXIV-16-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	OH			
XXIV-16-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	Н	F	OH			
XXIV-16-6	p-Me-Ph	Н	Η.	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	Н	F	OH			

**WO 2008/121634**Docket No. 60137.0034WOU1

№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIV-16-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	OH
XXIV-16-8	p-Me-Ph	*	Н	*	Et	Н	H	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIV-17.												
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y			
XXIV-17-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	OH			
XXIV-17-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	OH			
XXIV-17-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	ОН			
XXIV-17-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	OH			
XXIV-17-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	Н	F	OH			
XXIV-17-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	Н	F	OH			
XXIV-17-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	OH			
XXIV-17-8			Н	*	Et	Н		F	OH			

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIV-18.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$												
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y			
XXIV-18-1	p-Cl-Ph	Η.	Н	Н	Et	Н	Н	F	OH			
XXIV-18-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	OH			
XXIV-18-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	H	H	F	OH			
XXIV-18-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	OH			
XXIV-18-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	Н	F	OH			
XXIV-18-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	Н	F	ОН			
XXIV-18-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	OH			
XXIV-18-8					Et	Н			ОН			

<sup>5 \*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIV-19.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ X Y											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y		
XXIV-19-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	ОН		
XXIV-19-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	OH		
XXIV-19-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	OH		
XXIV-19-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	OH		
XXIV-19-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH₂Ph	Et	Н	Н	F	OH		
XXIV-19-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	Н	F	OH		
XXIV-19-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	OH		

Docket No. 60137.0034WOU1

№	$\mathbb{R}^1$	$\mathbb{R}^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIV-19-8	p-Br-Ph	*	Н	*	Et	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIV-20.

No	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIV-20-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	ОН
XXIV-20-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	OH
XXIV-20-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	OH
XXIV-20-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	OH
XXIV-20-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	Н	F	OH
XXIV-20-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	H	Н	F	OH
XXIV-20-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН
XXIV-20-8	p-I-Ph	*	Н	*	Et	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIV-21

Table AATV			- 1-	2L	1	- 5	- 6	~ -	7.7
№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>30</sup>	R <sup>4</sup>	R'	R°	X	Y
XXIV-21-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXIV-21-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-21-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-21-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-21-5	$CH_3$	Н	Н	CH₂Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-21-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	Н	F	ОН
XXIV-21-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-21-8	$CH_3$	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH

<sup>5 \*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIV-22.

Nº			R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIV-22-1	Et	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-22-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXIV-22-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-22-4	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXIV-22-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-22-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXIV-22-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-22-8	Et	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH

WO 2008/121634 Docket No. 60137.0034WOU1

\*R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

7	r_ 1.	.1.	VV	17.7	22	
Ί	Гяŀ	чe	XX	ıν٠	- 2. 5	٠.

Nº		R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXIV-23-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-23-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-23-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-23-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-23-5	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-23-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-23-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	Н	F	ОН
XXIV-23-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIV-24

Table AATV									
No	$R^{1}$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R³	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIV-24-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXIV-24-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-24-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-24-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-24-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH₂Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-24-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-24-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXIV-24-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIV-25

<i>-23.</i>								
$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R⁴	R <sup>3</sup>	Rº	X	Y
Ph	Н	Н	Н	'Pr	Н	Н	F	OH
Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	Н	Н	F	OH
Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
Ph	Н	Н	CH₂Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	Н	F	OH
Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	Н	F	OH
Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
	R <sup>1</sup> Ph Ph Ph Ph Ph Ph	R¹ R² Ph H	R¹ R² R³a  Ph H H  Ph H H	R¹         R²         R³a         R³b           Ph         H         H         H           Ph         H         H         CH <sub>3</sub> Ph         H         H         CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> Ph         H         H         CH <sub>2</sub> Ph           Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl           Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴           Ph         H         H         H         'Pr           Ph         H         H         CH3         'Pr           Ph         H         H         CH(CH3)2         'Pr           Ph         H         H         CH2CH(CH3)2         'Pr           Ph         H         H         CH2Ph         'Pr           Ph         H         H         CH2-indol-3-yl         'Pr           Ph         H         H         CH2CH2SCH3         'Pr	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴         R³           Ph         H         H         H         'Pr         H           Ph         H         H         CH₃         'Pr         H           Ph         H         H         CH(CH₃)₂         'Pr         H           Ph         H         H         CH₂CH(CH₃)₂         'Pr         H           Ph         H         H         CH₂Ph         'Pr         H           Ph         H         H         CH₂-indol-3-yl         'Pr         H           Ph         H         H         CH₂CH₂SCH₃         'Pr         H	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴         R⁵         R⁶           Ph         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H <td< th=""><th>R¹         R²         R³a         R³b         R⁴         R⁵         R⁶         X           Ph         H         H         H         H         F         H         H         F           Ph         H         H         CH3         'Pr         H         H         F           Ph         H         H         CH(CH3)2         'Pr         H         H         F           Ph         H         H         CH2CH(CH3)2         'Pr         H         H         F           Ph         H         H         CH2Ph         'Pr         H         H         F           Ph         H         H         CH2-indol-3-yl         'Pr         H         H         F           Ph         H         H         CH2CH2SCH3         'Pr         H         H         F</th></td<>	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴         R⁵         R⁶         X           Ph         H         H         H         H         F         H         H         F           Ph         H         H         CH3         'Pr         H         H         F           Ph         H         H         CH(CH3)2         'Pr         H         H         F           Ph         H         H         CH2CH(CH3)2         'Pr         H         H         F           Ph         H         H         CH2Ph         'Pr         H         H         F           Ph         H         H         CH2-indol-3-yl         'Pr         H         H         F           Ph         H         H         CH2CH2SCH3         'Pr         H         H         F

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIV	/ <b>-</b> 26.								
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIV-26-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-26-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-26-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-26-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXIV-26-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-26-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-26-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-26-8	p-Me-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIV	7-27.								
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R⁴	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIV-27-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXIV-27-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-27-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-27-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-27-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-27-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-27-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-27-8	p-F-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table XXIV-28.

No No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIV-28-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-28-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	H	H	F	OH
XXIV-28-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-28-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	H	F	OH
XXIV-28-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-28-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-28-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-28-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	XXIV	7-29
1 auto	~XXXX Y	-47.

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIV-29-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXIV-29-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-29-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-29-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-29-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	H	F	OH
XXIV-29-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-29-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	H	Н	F	OH
XXIV-29-8	p-Br-Ph	*	Н	*	'Pr	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIV-30.

Nº	R <sup>1</sup>	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXIV-30-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-30-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-30-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-30-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXIV-30-5	p-I-Ph	Н	Н	CH₂Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-30-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-30-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXIV-30-8	p-I-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table XXIV-31.

No No	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXIV-31-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH
XXIV-31-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	H	F	OH
XXIV-31-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	OH
XXIV-31-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	H	F	OH
XXIV-31-5	$CH_3$	Н	Н	CH₂Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	H	F	OH
XXIV-31-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	Н	F	OH
XXIV-31-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН
XXIV-31-8	$CH_3$	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Т	ah	ما	XX	717	7-32.
	an	ıc	$\Delta$	<b>''''</b>	72.

Nº		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIV-32-1	Et	H	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH
XXIV-32-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH
XXIV-32-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	ОН
XXIV-32-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	OH
XXIV-32-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	Н	F	ОН
XXIV-32-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	Н	F	ОН
XXIV-32-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	Н	F	OH
XXIV-32-8	Et	*	Н	*	"Bu	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIV-33

Table AAI v									
No	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIV-33-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH
XXIV-33-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	Н	F	OH
XXIV-33-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	H	H	F	OH
XXIV-33-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	OH
XXIV-33-5	<sup>i</sup> Pr	H	Н	CH₂Ph	"Bu	Н	Н	F	OH
XXIV-33-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH
XXIV-33-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH
XXIV-33-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table XXIV-34

Table AATV									
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIV-34-1	'Bu	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH
XXIV-34-2	'Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	Н	F	OH
XXIV-34-3	'Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	OH
XXIV-34-4	'Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	H	H	F	OH
XXIV-34-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH
XXIV-34-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	H	F	OH
XXIV-34-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH
XXIV-34-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	"Bu	Н	Н	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

OF 1	1	3737T	<b>T</b> 7	25
lar	ne	XXI	V٠	- 10.

Nº		$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIV-35-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH
XXIV-35-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	Н	F	OH
XXIV-35-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH
XXIV-35-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	ОН
XXIV-35-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH
XXIV-35-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	Н	F	ОН
XXIV-35-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH
XXIV-35-8	Ph	*	Н	*	"Bu	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

OD 11		37371	T 7	20	-
Tahl	ρ	$\mathbf{x} \mathbf{x}$	ıv.	. 4r	۱

No 1 able AAIV	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIV-36-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH
XXIV-36-2					"Bu	Н	Н	F	OH
XXIV-36-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	OH
XXIV-36-4	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH
XXIV-36-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	Н	F	ОН
XXIV-36-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	Н	F	OH
XXIV-36-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	Н	F	ОН
XXIV-36-8	p-Me-Ph	*	H	*	"Bu	Н	Н	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### 5 Table XXIV-37.

	14010 21211 1				25		_ 5	-6	~ -	<del></del>
	No	R	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>30</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>3</sup>	R°	X	Y
•	XXIV-37-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH
	XXIV-37-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	H	H	F	OH
	XXIV-37-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	H	Н	F	OH
	XXIV-37-4	p-F <b>-</b> Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	H	Н	F	OH
	XXIV-37-5	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2Ph$	"Bu	Н	Н	F	OH
	XXIV-37-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	Н	F	OH
	XXIV-37-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH
	XXIV-37-8	p-F-Ph	*	Н	*	"Bu	Н	Н	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	YYII	7_38
rabic	$\Delta \Delta \Gamma$	/ -DO.

Y
OH
ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIV-39

Table AATV						-			
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R³	Rº	X	Y
XXIV-39-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH
XXIV-39-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH
XXIV-39-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH
XXIV-39-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	OH
XXIV-39-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	Н	F	OH
XXIV-39-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	Н	F	OH
XXIV-39-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	Н	F	OH
XXIV-39-8	p-Br-Ph	*	Н	*	"Bu	Н	Н	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5 Table XXIV-40.

14010 71711 1	10.								
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R³	Rº	X	Y
XXIV-40-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН
XXIV-40-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	Н	F	ОН
XXIV-40-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	OH
XXIV-40-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	OH
XXIV-40-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	Н	F	OH
XXIV-40-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	Н	F	OH
XXIV-40-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH
XXIV-40-8	p-I-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

_	1	1	777	TTT		1
เฉ	h	Ie.	XX	. I V	-4	

No No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	$R^5$	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIV-41-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	ОН
XXIV-41-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH
XXIV-41-3	$CH_3$	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	Н	Н	F	OH
XXIV-41-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	OH
XXIV-41-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	Н	F	OH
XXIV-41-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	Н	F	OH
XXIV-41-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH
XXIV-41-8	$CH_3$	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tah	ام	XXI	$V_{-}$	42
ומט	ı	$\Delta \Delta I$	v -	44

Table AATV									
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIV-42-1	Et	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	OH
XXIV-42-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH
XXIV-42-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	OH
XXIV-42-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	OH
XXIV-42-5	Et	Н	Н	CH₂Ph	Bz	Н	H	F	OH
XXIV-42-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	Н	F	OH
XXIV-42-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH
XXIV-42-8	Et	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### 5 Table XXIV-43.

Table AATV									
№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>			Y
XXIV-43-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	OH
XXIV-43-2	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH
XXIV-43-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	H	Н	F	ОН
XXIV-43-4	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	H	Н	F	ОН
XXIV-43-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	Н	F	OH
XXIV-43-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	Н	F	OH
XXIV-43-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	ФФ
XXIV-43-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Ta	h	حا	YY	w	-44.
1 11	1)		$\Lambda \Lambda$	ıν	-44.

Nº		$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIV-44-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	OH
XXIV-44-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	H	Н	F	OH
XXIV-44-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	ОН
XXIV-44-4	<sup>t</sup> Bu	Н	H	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	OH
XXIV-44-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	Н	F	OH
XXIV-44-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	Н	F	OH
XXIV-44-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	H	F	OH
XXIV-44-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tahl	ے	XXI	$V_{-i}$	45

Table AATV									
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIV-45-1	Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	OH
XXIV-45-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH
XXIV-45-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	OH
XXIV-45-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	H	Н	F	OH
XXIV-45-5	Ph	Н	Н	CH₂Ph	Bz	Н	H	F	OH
XXIV-45-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	H	Н	F	OH
XXIV-45-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH
XXIV-45-8	Ph	*	H	*	Bz	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### 5 Table XXIV-46.

1 4010 71711 4	70.								
Nº	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R۶	R <sup>b</sup>	X	Y
XXIV-46-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	ОН
XXIV-46-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	H	F	ОН
XXIV-46-3	p-Me-Ph	H	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	H	Н	F	ОН
XXIV-46-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	H	Н	F	OH
XXIV-46-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	H	Н	F	OH
XXIV-46-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	Н	F	OH
XXIV-46-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	H	F	OH
XXIV-46-8	p-Me-Ph	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

<b>n</b> c 1	1 1	3737	TT 7	47
l a	nie	$\mathbf{X}\mathbf{X}$	E V/ _/	11
1 (1	$\cdots$	////	1 V	т/.

No No		D2	D 3a	D 3b	$\mathbf{p}^4$	<b>D</b> <sup>5</sup>	<b>D</b> 6	$\overline{\mathbf{v}}$	
7.45	K	K	K	K	K	K	IX	Λ	1
XXIV-47-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	ОН
XXIV-47-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH
XXIV-47-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	OH
XXIV-47-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	H	Н	F	OH
XXIV-47-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	Н	F	OH
XXIV-47-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	Н	F	OH
XXIV-47-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH
XXIV-47-8	p-F-Ph	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIV-48

Table AATV									
Nº	R¹	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIV-48-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	ОН
XXIV-48-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH
XXIV-48-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	OH
XXIV-48-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	OH
XXIV-48-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	Н	F	OH
XXIV-48-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	Н	F	OH
XXIV-48-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH
XXIV-48-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXIV-49. 5

<u>No</u>		$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIV-49-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	ОН
XXIV-49-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	ОН
XXIV-49-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	ОН
XXIV-49-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	OH
XXIV-49-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	Н	F	OH
XXIV-49-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	Н	F	ОН
XXIV-49-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH
XXIV-49-8	p-Br-Ph	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

**WO 2008/121634**Docket No. 60137.0034WOU1

Table XXIV-50.									
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIV-50-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	OH
XXIV-50-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	ОН
XXIV-50-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	ОН
XXIV-50-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	OH
XXIV-50-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	Н	F	OH
XXIV-50-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	Н	F	OH
XXIV-50-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH
XXIV-50-8	p-I-Ph	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

XXV

Table XX									
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$\mathbb{R}^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXV-1-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXV-1-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-1-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-1-4	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-1-5	$CH_3$	Н	Н	CH₂Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-1-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-1-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-1-8	$CH_3$	*	Н	*	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$T_{a}$	h	۾	$\mathbf{X}$	٧X	I.	. 🤈
1 1	17		$\Delta$	$^{\lambda}$ ,	, -	-∠

No No		$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXV-2-1	Et	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXV-2-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXV-2-3	Et	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXV-2-4	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXV-2-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXV-2-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXV-2-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-2-8	Et	*	Н	*	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tabl	e XX	V_3

Table AA									<del></del>
No	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXV-3-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXV-3-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXV-3-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-3-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-3-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-3-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-3-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-3-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table XXV-4.

1 4010 7 12 1									
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R³	R <sup>6</sup>	X	Y
XXV-4-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXV-4-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-4-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-4-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-4-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH₂Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-4-6	<sup>t</sup> Bu	Н	H	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-4-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-4-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	XX	V-5.
3.0		-

No		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXV-5-1	Ph	Н	Н	Н	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-5-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-5-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-5-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$\mathrm{CH}_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-5-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-5-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-5-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-5-8	Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

_						_
Та	·h	<u>ا</u> ما	$\mathbf{v}$	v	1/	4
1 2				^	· v	-11

R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
p-Me-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
				CH <sub>3</sub>	Н	$CH_3$	F	ОН
_				$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$CH_3$	Н	$\text{CH}_3$	F	ОН
p-Me-Ph	H	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
p-Me-Ph	*	Н	*	$\mathrm{CH}_3$	H	$CH_3$	F	ОН
	p-Me-Ph p-Me-Ph p-Me-Ph p-Me-Ph p-Me-Ph p-Me-Ph	p-Me-Ph H	p-Me-Ph H H	p-Me-Ph H H CH <sub>2</sub> Ph p-Me-Ph H H CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	p-Me-Ph         H         H         H         CH <sub>3</sub> p-Me-Ph         H         H         CH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> p-Me-Ph         H         H         CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> p-Me-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> p-Me-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> Ph         CH <sub>3</sub> p-Me-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         CH <sub>3</sub> p-Me-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         CH <sub>3</sub> p-Me-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	p-Me-Ph         H         H         H         CH <sub>3</sub> H           p-Me-Ph         H         H         CH <sub>3</sub> H           p-Me-Ph         H         H         CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> H           p-Me-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> H           p-Me-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> Ph         CH <sub>3</sub> H           p-Me-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         CH <sub>3</sub> H           p-Me-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         CH <sub>3</sub> H	p-Me-Ph         H         H         H         CH3         H         CH3           p-Me-Ph         H         H         CH3         CH3         H         CH3           p-Me-Ph         H         H         CH(CH3)2         CH3         H         CH3           p-Me-Ph         H         H         CH2CH(CH3)2         CH3         H         CH3           p-Me-Ph         H         H         CH2Ph         CH3         H         CH3           p-Me-Ph         H         H         CH2-indol-3-yl         CH3         H         CH3           p-Me-Ph         H         H         CH2CH2SCH3         CH3         H         CH3	p-Me-Ph         H         H         H         H         CH <sub>3</sub> H         CH <sub>3</sub> F           p-Me-Ph         H         H         CH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> H         CH <sub>3</sub> F           p-Me-Ph         H         H         CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> H         CH <sub>3</sub> F           p-Me-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> H         CH <sub>3</sub> F           p-Me-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> Ph         CH <sub>3</sub> H         CH <sub>3</sub> F           p-Me-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         CH <sub>3</sub> H         CH <sub>3</sub> F           p-Me-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> H         CH <sub>3</sub> F

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table XXV-7.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXV-7-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXV-7-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-7-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$\mathrm{CH}_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-7-4	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-7-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-7-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-7-8	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-7-20	p-F-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	XXV-8.
№	R <sup>1</sup>

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXV-8-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXV-8-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-8-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-8-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-8-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-8-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-8-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-8-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

T	<b>. 1.</b> 1	۱.	v	v	٦,	Ω	
$T_2$	าท	ıe	Х	х	v	-4	

No No	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXV-9-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXV-9-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXV-9-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-9-4	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-9-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$\text{CH}_3$	H	$CH_3$	F	ОН
XXV-9-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-9-8	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-9-20	p-Br-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# Table XXV-10.

No No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXV-10-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXV-10-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-10-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-10-4	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-10-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-10-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-10-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-10-8	p-I-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

1	Гаŀ	ءاد	3	X	X	V	_1	1	1
	(1)	711		/\	/\	v	- 1		

Nº	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXV-11-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXV-11-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-11-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-11-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXV-11-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-11-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$\text{CH}_3$	F	ОН
XXV-11-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$\text{CH}_3$	F	ОН
XXV-11-8	$CH_3$	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

			_	
Tabl	۾ا	XX	<i>.T_</i>	12

14010 7171 1									
Nº	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R	$R^6$	X	Y
XXV-12-1	Et	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXV-12-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>		Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-12-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-12-4	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		Н	$CH_3$	F	OH
XXV-12-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	$\text{CH}_3$	F	OH
XXV-12-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-12-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-12-8	Et	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### 5 Table XXV-13.

Nº		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXV-13-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXV-13-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-13-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-13-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-13-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-13-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-13-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Η.	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-13-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

7	La.	hl	۾	XX	71	Ϊ_΄	14
- 1	11			$\Lambda$	··	-	I <del></del> -

Table AA v	/ ~ I T.								
№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXV-14-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXV-14-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub> .	Et	H	$CH_3$	F	OH
XXV-14-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-14-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	H	$CH_3$	F	OH
XXV-14-5	<sup>t</sup> Bu	H	Н	CH₂Ph	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-14-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-14-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-14-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	YYI	7_1	15

$\frac{-13.}{R^1}$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
Ph	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	OH
Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	$\mathrm{CH}_3$	F	OH
Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	F	OH
Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	OH
Ph	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	F	OH
	R <sup>1</sup> Ph Ph Ph Ph Ph Ph	R¹ R² Ph H	R <sup>1</sup> R <sup>2</sup> R <sup>3a</sup> Ph H H  Ph H H	R¹         R²         R³a         R³b           Ph         H         H         H           Ph         H         H         CH <sub>3</sub> Ph         H         H         CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> Ph         H         H         CH <sub>2</sub> Ph           Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl           Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $Ph$ $H$ $H$ $H$ $Et$ $Ph$ $H$ $H$ $CH_3$ $Et$ $Ph$ $H$ $H$ $CH(CH_3)_2$ $Et$ $Ph$ $H$ $H$ $CH_2CH(CH_3)_2$ $Et$ $Ph$ $H$ $H$ $CH_2Ph$ $Et$ $Ph$	$R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $Ph$ $H$ $H$ $H$ $H$ $Ph$ $H$ $H$ $CH_3$ $Et$ $H$ $Ph$ $H$ $H$ $CH(CH_3)_2$ $Et$ $H$ $Ph$ $H$ $H$ $CH_2CH(CH_3)_2$ $Et$ $H$ $Ph$ $H$ $H$ $CH_2Ph$ $Et$ $H$ $Ph$ $H$ $H$ $CH_2-indol-3-yl$ $Et$ $H$ $Ph$	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴         R⁵         R⁶           Ph         H         H         H         Et         H         CH₃           Ph         H         H         CH₃         Et         H         CH₃           Ph         H         H         CH(CH₃)₂         Et         H         CH₃           Ph         H         H         CH₂CH(CH₃)₂         Et         H         CH₃           Ph         H         H         CH₂Ph         Et         H         CH₃           Ph         H         H         CH₂-indol-3-yl         Et         H         CH₃           Ph         H         H         CH₂-CH₂-CH₂-CH₃         Et         H         CH₃	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴         R⁵         R⁶         X           Ph         H         H         H         Et         H         CH₃         F           Ph         H         H         CH₃         Et         H         CH₃         F           Ph         H         H         CH₂CH(CH₃)₂         Et         H         CH₃         F           Ph         H         H         CH₂Ph         Et         H         CH₃         F           Ph         H         H         CH₂-indol-3-yl         Et         H         CH₃         F           Ph         H         H         CH₂CH₂SCH₃         Et         H         CH₃         F

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table XXV-16.

1 4010 7171 1	10.			- 31	4	_ 5	6		
No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>30</sup>	R <sup>4</sup>	R³	R <sup>6</sup>	X	Υ
XXV-16-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXV-16-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-16-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	H	$CH_3$	F	OH
XXV-16-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$\mathrm{CH}_3$	F	OH
XXV-16-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH₂Ph	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-16-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-16-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-16-8	p-Me-Ph	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	XXV-17.

Table AA V									
№	$R^{1}$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R4	R³	R <sup>6</sup>	X	Y
XXV-17-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXV-17-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-17-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-17-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-17-5	p-F-Ph	Н	Н	CH₂Ph	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-17-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-17-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$\mathrm{CH}_3$	F	OH
XXV-17-8	p-F-Ph	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXV-1	Q

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXV-18-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXV-18-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-18-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$\mathrm{CH}_3$	F	OH
XXV-18-4	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-18-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH₂Ph	Et	Н	$\text{CH}_3$	F	OH
XXV-18-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$\mathrm{CH}_3$	F	OH
XXV-18-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH₂CH₂SCH₃	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-18-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table XXV-19.

1 4010 7171 1	17.			- A1					
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R⁴	R³	R <sup>6</sup>	X	Y
XXV-19-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXV-19-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-19-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-19-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXV-19-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-19-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$\text{CH}_3$	F	OH
XXV-19-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-19-8	p-Br-Ph	*	Н	*	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	e XX	V-20.

No No		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXV-20-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXV-20-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-20-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-20-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-20-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Η	$CH_3$	F	OH
XXV-20-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-20-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-20-8	p-I-Ph	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	- XXV-21	

I able AA v									
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXV-21-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXV-21-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-21-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	$\text{CH}_3$	F	OH
XXV-21-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-21-5	$\text{CH}_3$	Н	Н	$CH_2Ph$	<sup>i</sup> Pr	Н	$\mathrm{CH}_3$	F	ОН
XXV-21-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-21-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-21-8	$CH_3$	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table XXV-22.

14010 7171 7				71.	= 1	-5	-6		<del></del>
№	R¹	R <sup>2</sup>	R³a	$R^{3b}$	R*	R <sup>3</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXV-22-1	Et	Н	Н	Н	'Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXV-22-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	H	$CH_3$	F	OH
XXV-22-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-22-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$\mathrm{CH}_3$	F	ОН
XXV-22-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-22-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-22-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-22-8	Et	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

n	$\Gamma \alpha$	h	6	V	V	17	-23	2
	ı	O	ш.			v.	<b>-</b> /. `	١.

No No		$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXV-23-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXV-23-2	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-23-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-23-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-23-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXV-23-6	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-23-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-23-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tah	۱۵	V	V	1	ာ.	1

No No		$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXV-24-1	'Bu	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXV-24-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	Н	$\text{CH}_3$	F	OH
XXV-24-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-24-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-24-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-24-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	$\text{CH}_3$	F	OH
XXV-24-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-24-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## Table XXV-25.

14010 7474 1		_ 2	30	- 3h	4	75.5	ъ6	77	37
№	R	R <sup>2</sup>	R3a	R <sup>3b</sup>	K*	K <sup>3</sup>	R <sup>6</sup>	Х	Y
XXV-25-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXV-25-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-25-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-25-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-25-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Η	$CH_3$	F	OH
XXV-25-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-25-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-25-8	Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXV	<i>I</i> -26.								
No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXV-26-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	'Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXV-26-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-26-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-26-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-26-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH₂Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-26-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-26-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-26-8	p-Me-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXV									
No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXV-27-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXV-27-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-27-3	p-F-Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-27-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-27-5	p-F-Ph	Н	Н	CH₂Ph	'Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-27-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-27-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-27-8	p-F-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

_	OD 11 373737	$\alpha$
`	Table XXV-	· 7.8.

No No	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXV-28-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXV-28-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-28-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-28-4	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$\text{CH}_3$	F	OH
XXV-28-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-28-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-28-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-28-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXV	/ <b>-</b> 29.								
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXV-29-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	'Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXV-29-2	p-Br-Ph	Н	H	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-29-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-29-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-29-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-29-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-29-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-29-8	p-Br-Ph	*	Н	*	'Pr	Н	$CH_3$	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXV	/-30.								
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXV-30-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	'Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXV-30-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-30-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-30-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-30-5	p-I-Ph	Н	Н	CH₂Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-30-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-30-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-30-8	p-I-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table	XXV-31	

<u>No</u>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXV-31-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXV-31-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-31-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-31-4	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-31-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-31-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-31-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-31-8	$CH_3$	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	XX	V-32	<u>.</u>
NC-		$\mathbf{p}^{\mathrm{I}}$	_

No No			R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXV-32-1	Et	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXV-32-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	H	$CH_3$	F	ОН
XXV-32-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXV-32-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXV-32-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-32-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXV-32-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-32-8	Et	*	Н	*	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

_				<b>T</b> 7	<b>T</b> 7 <b>Y</b>	~	22	
1	'n	hI	9	X	X١	√.	- 4 4	

1000 777		<b>D</b> 2	R <sup>3a</sup>	D3b	$\mathbf{p}^4$	<b>p</b> 5	R <sup>6</sup>	Y	v
№	K	K	Л	K	K	11	17	Λ.	
XXV-33-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXV-33-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXV-33-3	$^{i}$ Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-33-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	H	$CH_3$	F	OH
XXV-33-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-33-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-33-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	H	$CH_3$	F	OH
XXV-33-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table XXV-34.

No No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXV-34-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXV-34-2	'Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-34-3	'Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-34-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-34-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-34-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-34-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-34-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXV									
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXV-35-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXV-35-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-35-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	·H	$\mathrm{CH}_3$	F	OH
XXV-35-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-35-5	Ph	Н	Н	CH₂Ph	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-35-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-35-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-35-8	Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	e XX	V-36
1 au	$e_{\Lambda\Lambda}$	v -30.

No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$											
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R°	X	Y		
XXV-36-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH		
XXV-36-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH		
XXV-36-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	OH		
XXV-36-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH		
XXV-36-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	$\mathrm{CH}_3$	F	ОН		
XXV-36-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	OH		
XXV-36-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH₂CH₂SCH₃	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH		
XXV-36-8	p-Me-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	OH		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table XXV-37.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXV-37-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXV-37-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-37-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-37-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-37-5	p-F-Ph	Н	Н	CH₂Ph	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-37-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-37-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-37-8	p-F-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXV-38.											
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y		
XXV-38-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH		
XXV-38-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	H	CH <sub>3</sub>	F	OH		
XXV-38-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	OH		
XXV-38-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	H	$CH_3$	F	ОН		
XXV-38-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	OH		
XXV-38-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH		
XXV-38-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH		
XXV-38-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	OH		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXV	Table XXV-39. $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$												
N₂	R¹	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y				
XXV-39-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН				
XXV-39-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH				
XXV-39-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH				
XXV-39-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH				
XXV-39-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH				
XXV-39-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	H	$CH_3$	F	OH				
XXV-39-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH				
XXV-39-8	p-Br-Ph	*	Н	*	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH				

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

_	Table XXV-40	١
``	Lanie X X V -40	

Y
OH
ОН
ОН
ОН
OH
OH
ОН
OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXV-41.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$												
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	$R^5$	R <sup>6</sup>	X	Y			
XXV-41-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН			
XXV-41-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	H	$CH_3$	F	OH			
XXV-41-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	OH			
XXV-41-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	OH			
XXV-41-5	$CH_3$	Н	Н	CH₂Ph	Bz	Н	$CH_3$	F	OH			
XXV-41-6	$CH_3$	H	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	F	OH			
XXV-41-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	OH			
XXV-41-8	$CH_3$	*	Н	*	Bz	Н	$CH_3$	F	OH			

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXV-42. $R^{1}$ $R^{2}$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^{4}$ $R^{5}$ $R^{6}$ $X$ $Y$												
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y			
XXV-42-1	Et	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH			
XXV-42-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	H	$CH_3$	F	OH			
XXV-42-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН			
XXV-42-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	H	$CH_3$	F	OH			
XXV-42-5	Et	Н	Н	CH₂Ph	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН			
XXV-42-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	F	OH			
XXV-42-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	OH			
XXV-42-8	Et	*	Н	*	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН			

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXV-43-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	OF
XXV-43-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	OF
XXV-43-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	OF
XXV-43-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	OF
XXV-43-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	F	OF
XXV-43-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	F	OF
XXV-43-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	Ф
XXV-43-8	$^{i}$ Pr	*	Н	*	Bz	Н	$CH_3$	F	OF

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXV				
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$
XXV-44-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н
XXV-44-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$\mathrm{CH}_3$

No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXV-44-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXV-44-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-44-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-44-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-44-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH₂Ph	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-44-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-44-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-44-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	XXV-45.

No		$\mathbf{p}^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
745	K		IX.	IX					
XXV-45-1	Ph	Н	Н	H	Bz	H	$CH_3$	F	OH
XXV-45-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-45-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-45-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-45-5	Ph	Н	Н	CH₂Ph	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-45-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-45-7	Ph	Н	Н	CH₂CH₂SCH₃	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-45-8	Ph	*	Н	*	Bz	Н	$CH_3$	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table XXV-46.

1 4010 7171 1	10.	_ ~	- 2-	25	1	-5	56	37	× 7
Nº	R <sup>1</sup>	$R^2$	R³a	R <sup>30</sup>	R*	R <sup>3</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y 
XXV-46-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXV-46-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-46-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-46-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-46-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH₂Ph	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-46-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-46-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-46-8	p-Me-Ph	*	Н	*	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXV				<u> </u>					
Nº	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXV-47-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXV-47-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	H	$CH_3$	F	OH
XXV-47-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-47-4	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-47-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-47-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-47-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-47-8	p-F-Ph	*	Н	*	Bz	Н	$CH_3$	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table 1	XXV-48.
---------	---------

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXV-48-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXV-48-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-48-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-48-4	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-48-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH₂Ph	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-48-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-48-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH₂CH₂SCH₃	Bz	H	$CH_3$	F	OH
XXV-48-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXV-49. 5

№	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXV-49-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXV-49-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	H	$CH_3$	F	OH
XXV-49-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-49-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-49-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH₂Ph	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXV-49-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-49-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH₂CH₂SCH₃	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXV-49-8	p-Br-Ph	*	Н	*	Bz	Н	$CH_3$	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXV-50. R<sup>4</sup> R<sup>5</sup> R<sup>6</sup> Y R<sup>3b</sup> X  $R^1$  $R^2$  $R^{3a}$ CH<sub>3</sub> F OH Bz H XXV-50-1 p-I-Ph Н Η Η CH<sub>3</sub> F OHBz H XXV-50-2 p-I-Ph H Η  $CH_3$ CH<sub>3</sub> F OH  $CH(CH_3)_2$ Bz H XXV-50-3 p-I-Ph H Η CH<sub>3</sub> F OH $CH_2CH(CH_3)_2$ Bz H XXV-50-4 p-I-Ph H Η CH<sub>3</sub> F OH XXV-50-5 p-I-Ph H CH<sub>2</sub>Ph Bz H Η CH<sub>3</sub> F OH XXV-50-6 p-I-Ph H Η CH<sub>2</sub>-indol-3-yl Bz H OHCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub> Bz H CH<sub>3</sub> F XXV-50-7 p-I-Ph H Η Bz H CH<sub>3</sub> F OH XXV-50-8 p-I-Ph Η

XXVI

5

Table XXV									
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVI-1-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	OH
XXVI-1-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	OH
XXVI-1-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	OH
XXVI-1-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	OH
XXVI-1-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	Η	OH
XXVI-1-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	Н	OH
XXVI-1-7	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	OH
XXVI-1-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

2983472-1

- 541 -

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table 2	XXVI	[-2.
---------	------	------

No		$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVI-2-1	Et	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН
XXVI-2-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН
				$CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН
				CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН
XXVI-2-5					CH <sub>3</sub>				
				CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН
				CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>					
XXVI-2-8					CH <sub>3</sub>				
1111111	_,				_				

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tabl	٦	XXI	71	_2

14010 2121									
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	R°	X	Y
XXVI-3-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	OH
XXVI-3-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	OH
XXVI-3-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	ОН
XXVI-3-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	ОН
XXVI-3-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	Н	OH
XXVI-3-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	Н	OH
XXVI-3-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	OH
XXVI-3-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	Н	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table XXVI-4.

No		$\mathbf{D}^2$	<b>D</b> 3a	D3p	R <sup>4</sup>	$\mathbf{P}^{5}$	$\mathbf{R}^6$	Y	V
740	K	K	К	K	K	1	IX	<b>A</b>	1
XXVI-4-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	OH
XXVI-4-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	OH
XXVI-4-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	OH
XXVI-4-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	ОН
XXVI-4-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	Н	OH
XXVI-4-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	H	ОН
XXVI-4-7	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Η	ОН
XXVI-4-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	Н	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXV									
No	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R5	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVI-5-1	Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН
XXVI-5-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	OH
XXVI-5-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	H	F	Н	OH
XXVI-5-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	ОН
XXVI-5-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	Н	OH
XXVI-5-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$\mathrm{CH}_3$	Н	F	Н	OH
XXVI-5-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	OH
XXVI-5-8	Ph	*	Н	*	$\text{CH}_3$	Н	F	Н	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXV	√I-6.								
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>3</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVI-6-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН
XXVI-6-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	H	OH
XXVI-6-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	H	ОН
XXVI-6-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	OH
XXVI-6-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$\mathrm{CH}_3$	Н	F	Н	OH
XXVI-6-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	H	OH
XXVI-6-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	OH
XXVI-6-8	p-Me-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	Н	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table	XXV	7

<u>No</u>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVI-7-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН
XXVI-7-2	p-F-Ph	Н	H	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	OH
XXVI-7-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	OH
XXVI-7-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	OH
<b>XXVI-7-6</b>	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	Η	OH
<b>XXVI-7-7</b>	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	H	ОН
<b>XXVI-7-8</b>	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	OH
XXVI-7-20	p-F-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	Η	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$T_{\sim}1$	-1-	VV	۲ ۲	то
1 21	nie	XX	v	I-0.

No No		$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVI-8-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН
XXVI-8-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	ОН
XXVI-8-3	p-Cl-Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	ОН
XXVI-8-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	H	F	Н	OH
XXVI-8-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH₂Ph	$CH_3$	H	F	Н	ОН
XXVI-8-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	H	F	Н	OH
XXVI-8-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	H	F	H	OH
XXVI-8-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	Н	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Та	h	حا	XX	V	$Q_{-}$
1 2	111		$\Lambda$	v	<b>-7</b> .

Table AAVI									
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVI-9-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	OH
XXVI-9-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	H	F	Н	OH
XXVI-9-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Η	ОН
XXVI-9-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	H	F	Н	OH
XXVI-9-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	Н	ОН
XXVI-9-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	Н	ОН
XXVI-9-8	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	OH
XXVI-9-20	p-Br-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	Н	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXVI-10. 5

$N_{\odot}$ R <sup>1</sup> R <sup>2</sup> R <sup>3a</sup> R <sup>3b</sup> R <sup>4</sup> R <sup>5</sup> R <sup>6</sup> X Y									
$\mathcal{N}_{\underline{0}}$	$R^{I}$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>30</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>3</sup>	Rº	X	Y
XXVI-10-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН
XXVI-10-2	p-I-Ph	·H	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	ОН
XXVI-10-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$\mathrm{CH}_3$	H	F	Н	OH
XXVI-10-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	OH
XXVI-10-5	p-I-Ph	Н	H	CH₂Ph	$CH_3$	Н	F	H	OH
XXVI-10-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	Н	ОН
XXVI-10-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	ОН
XXVI-10-8	p-I-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

**XXVI-11-8** CH<sub>3</sub> \* H \*

Table XXV	Table XXVI-11.										
№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y		
XXVI-11-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	OH		
XXVI-11-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН		
XXVI-11-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	H	F	Η	OH		
XXVI-11-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	H	OH		
XXVI-11-5	$CH_3$	Н	Н	CH₂Ph	Et	Н	F	Н	OH		
XXVI-11-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	Н	OH		
XXVI-11-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	OH		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Et H F H OH

	Table XXVI-12.									
N₂	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	
XXVI-12-1	Et	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	ОН	
XXVI-12-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	OH	
XXVI-12-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Ή	F	Н	OH	
XXVI-12-4	Et	Н	H	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	F	Н	OH	
YYVI.12-5	Et	н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	Н	OH	

XXVI-12-5 Et H H CH<sub>2</sub>Ph XXVI-12-6 Et H H CH<sub>2</sub>-indol-3-yl Et H F H OH XXVI-12-7 Et H H CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub> Et H F H OH Et H F H OH **XXVI-12-8** Et \* Н

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5	Table	VVI	<b>/T</b> 1	12
`	Lable	XXV	/ I – '	١٦.

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVI-13-1	<sup>i</sup> Pr	H	Н	Н	Et	Н	F	Н	ОН
XXVI-13-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	OH
XXVI-13-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	OH
XXVI-13-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	ОН
XXVI-13-5	<sup>i</sup> Pr	Н	H	CH₂Ph	Et	Н	F	H	OH
XXVI-13-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	Н	OH
XXVI-13-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	OH
XXVI-13-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Et	H	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

7	റപ	L1	٦	V	X	(7)	ľ 1	1	
		91	-		A '	v	-	4	

1 aut 7 7 7 1 -	<u> </u>						_ 6		
№	R¹	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R³	$R^6$	X	Y
XXVI-14-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	OH
XXVI-14-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	OH
XXVI-14-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	H	F	Η	OH
XXVI-14-4	<sup>t</sup> Bu	H	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	H	F	Н	OH
XXVI-14-5	<sup>t</sup> Bu	Н	H	CH₂Ph	Et	H	F	Н	OH
XXVI-14-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	H	OH
XXVI-14-7	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	OH
XXVI-14-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Et	Н	F	Н	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

	_			
$T_{al}$	ole.	XX	VΙ-	15

Nº		R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVI-15-1	Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	ОН
XXVI-15-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	H	F	Н	ОН
XXVI-15-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Η	ОН
XXVI-15-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	OH
XXVI-15-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	Н	OH
XXVI-15-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	Н	OH
XXVI-15-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	OH
XXVI-15-8	Ph	*	Н	*	Et	Н	F	Н	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## Table XXVI-16.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVI-16-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	ОН
XXVI-16-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	H	F	Н	OH
XXVI-16-3	p-Me-Ph	H	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Η	F	Н	OH
XXVI-16-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	OH
XXVI-16-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	Н	OH
XXVI-16-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	Н	ОН
XXVI-16-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН
XXVI-16-8	p-Me-Ph	*	Н	*	Et	Η	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	XX	VI-1'	7.
N.C.		D	

No No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVI-17-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	OH
XXVI-17-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	OH
XXVI-17-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	OH
XXVI-17-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	OH
XXVI-17-5	p-F-Ph	Н	Н	CH₂Ph	Et	Н	F	Н	OH
XXVI-17-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	Н	OH
XXVI-17-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	OH
XXVI-17-8	p-F-Ph	*	Н	*	Et	Н	F	Н	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXVI-18.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ X Y										
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	
XXVI-18-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	ОН	
XXVI-18-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	OH	
XXVI-18-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	OH	
XXVI-18-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	OH	
XXVI-18-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH₂Ph	Et	Н	F	Н	OH	
XXVI-18-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	Н	OH	
XXVI-18-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	OH	
XXVI-18-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	Et	Н	F	Н	ОН	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXVI-19. 5

Table AAV	1-17.			31	-	- 5	6		
No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R⁴	R³	Rº	X	Y
XXVI-19-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	OH
XXVI-19-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН
XXVI-19-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	OH
XXVI-19-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	H	F	Н	OH
XXVI-19-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	Н	OH
XXVI-19-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	Н	OH
XXVI-19-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН
XXVI-19-8	p-Br-Ph	*	Н	*	Et	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

	1	1	37	777	71	1 1	$^{\circ}$
ŀ	ลท	le.	Х	х١	νı	[-2	IJ.

No		$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVI-20-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	OH
XXVI-20-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН
XXVI-20-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	OH
XXVI-20-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	ОН
XXVI-20-5	p-I-Ph	Н	Н	CH₂Ph	Et	Н	F	Н	ОН
XXVI-20-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	Н	ОН
XXVI-20-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН
XXVI-20-8	p-I-Ph	*	Н	*	Et	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

No		$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVI-21-1					,				OH
							-		
XXVI-21-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	Н	F	Н	OH
XXVI-21-3	$CH_3$	Η	H	$CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	F	Н	OH
XXVI-21-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	H	F	Н	OH
XXVI-21-5	$CH_3$	Н	Н	$CH_2Ph$	<sup>i</sup> Pr	H	F	Н	OH
XXVI-21-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	F	Н	ОН
XXVI-21-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Η	OH
XXVI-21-8	$CH_3$	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## 5 Table XXVI-22.

Table AAV.									
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVI-22-1	Et	Н	Н	H	'Pr	Н	F	Н	ОН
XXVI-22-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXVI-22-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Η	ОН
XXVI-22-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXVI-22-5	Et	Н	Н	CH₂Ph	'Pr	Н	F	Н	ОН
XXVI-22-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	F	Н	ОН
XXVI-22-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXVI-22-8	Et	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

WO 2008/121634 Docket No. 60137.0034WOU1

Table XXVI-23.

1 4010 2121 V									
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVI-23-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH
XXVI-23-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	H	F	Н	OH
XXVI-23-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	'Pr	H	F	Н	OH
XXVI-23-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	F	Н	ОН
XXVI-23-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	iPr	Н	F	Н	OH
XXVI-23-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXVI-23-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXVI-23-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

<b>TD</b> 1			377	7.	7 T	24
1 2	nı	e	Х.	XΝ	/ I	-24

No		R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVI-24-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	'Pr	Н	F	Н	ОН
XXVI-24-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXVI-24-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXVI-24-4	'Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXVI-24-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$^{i}$ Pr	Н	F	Н	ОН
XXVI-24-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH
XXVI-24-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXVI-24-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## 5 Table XXVI-25.

Nº	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVI-25-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXVI-25-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH
XXVI-25-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH
XXVI-25-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH
XXVI-25-5	Ph	Н	Н	CH₂Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXVI-25-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH
XXVI-25-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXVI-25-8	Ph	*	Н	*	'Pr	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

WO 2008/121634

Docket No. 60137.0034WOU1

/TO 1	1 1		X7X7X	71	~ ~
2	h	0	XXV	./ [	_ /h
1 4			$\Delta \Delta$	,	-ZV.

№		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVI-26-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH .
XXVI-26-2	p-Me-Ph	H	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Η	OH
XXVI-26-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH
XXVI-26-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH
XXVI-26-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH
XXVI-26-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH
XXVI-26-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXVI-26-8	p-Me-Ph	*	Н	*	'Pr	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXVI-27

Table AXVI-27.										
$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	$R^5$	$R^6$	X	Y		
p-F-Ph	Н	Н	Н	'Pr	Н	F	Н	OH		
p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН		
p-F-Ph	Η	Н	$CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	F	Н	ОН		
p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН		
p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	F	Н	ОН		
p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН		
p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН		
n E Dh	*	н	*	$^{i}\mathbf{Pr}$	Н	F	Н	OH		
	R <sup>1</sup> p-F-Ph p-F-Ph p-F-Ph p-F-Ph p-F-Ph p-F-Ph	R¹       R²         p-F-Ph       H         p-F-Ph       H         p-F-Ph       H         p-F-Ph       H         p-F-Ph       H         p-F-Ph       H         p-F-Ph       H	R¹       R²       R³a         p-F-Ph       H       H         p-F-Ph       H       H	R¹         R²         R³a         R³b           p-F-Ph         H         H         H           p-F-Ph         H         H         CH <sub>3</sub> p-F-Ph         H         H         CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> p-F-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> p-F-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> Ph           p-F-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl           p-F-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	R¹         R²         R³a         R³b         R⁴           p-F-Ph         H         H         H         'Pr           p-F-Ph         H         H         CH3         'Pr           p-F-Ph         H         H         CH(CH3)2         'Pr           p-F-Ph         H         H         CH2CH(CH3)2         'Pr           p-F-Ph         H         H         CH2Ph         'Pr           p-F-Ph         H         H         CH2-indol-3-yl         'Pr           p-F-Ph         H         H         CH2CH2SCH3         'Pr	R1       R2       R3a       R3b       R4       R5         p-F-Ph       H       H       H       H       Pr       H         p-F-Ph       H       H       CH3       Pr       H         p-F-Ph       H       H       CH(CH3)2       Pr       H         p-F-Ph       H       H       CH2CH(CH3)2       Pr       H         p-F-Ph       H       H       CH2Ph       Pr       H         p-F-Ph       H       H       CH2-indol-3-yl       Pr       H         p-F-Ph       H       H       CH2CH2SCH3       Pr       H	R1       R2       R3a       R3b       R4       R5       R6         p-F-Ph       H       H       H       H       F       H       F         p-F-Ph       H       H       CH3       Pr       H       F         p-F-Ph       H       H       CH(CH3)2       Pr       H       F         p-F-Ph       H       H       CH2CH(CH3)2       Pr       H       F         p-F-Ph       H       H       CH2Ph       Pr       H       F         p-F-Ph       H       H       CH2-indol-3-yl       Pr       H       F         p-F-Ph       H       H       CH2CH2SCH3       Pr       H       F	R1       R2       R3a       R3b       R4       R5       R6       X         p-F-Ph       H       H       H       H       FPr       H       F       H         p-F-Ph       H       H       CH3       Pr       H       F       H         p-F-Ph       H       H       CH(CH3)2       Pr       H       F       H         p-F-Ph       H       H       CH2CH(CH3)2       Pr       H       F       H         p-F-Ph       H       H       CH2Ph       Pr       H       F       H         p-F-Ph       H       H       CH2-indol-3-yl       Pr       H       F       H         p-F-Ph       H       H       CH2CH2SCH3       Pr       H       F       H		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## 5 Table XXVI-28.

1 4010 2121 1									
№	$R^1$	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	R³b	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVI-28-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	'Pr	Н	F	Н	OH
XXVI-28-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXVI-28-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXVI-28-4	p-Cl-Ph	Н	H	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Η	ОН
XXVI-28-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXVI-28-6	p-Cl-Ph	Н	H	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXVI-28-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXVI-28-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	VVIII	ാവ

Table AAV.									
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>3</sup>	R٥	X	Y
XXVI-29-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH
XXVI-29-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	Н	F	Н	OH
XXVI-29-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Η	OH
XXVI-29-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH
XXVI-29-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	H	F	Н	OH
XXVI-29-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	H	F	Н	OH
XXVI-29-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	F	Н	OH
XXVI-29-8	p-Br-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	H	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

	_	
Table	$\mathbf{X}\mathbf{X} = \mathbf{X}\mathbf{X}$	/I 2/\

Table AAV					.,				
№	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVI-30-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH
XXVI-30-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH
XXVI-30-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Η	OH
XXVI-30-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	H	OH
XXVI-30-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	F	Н	OH
XXVI-30-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH
XXVI-30-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH
XXVI-30-8	p-I-Ph	*	Н	*	'Pr	Н	F	Н	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table XXVI-31.

Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVI-31-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH
XXVI-31-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	OH
XXVI-31-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	Н	OH
XXVI-31-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	H	F	Н	OH
XXVI-31-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	F	Н	OH
XXVI-31-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH
XXVI-31-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXVI-31-8	$CH_3$	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

WO 2008/121634 Docket No. 60137.0034WOU1

Table XXVI-32.

10010111111000									
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVI-32-1	Et	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH
XXVI-32-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXVI-32-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН
XXVI-32-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXVI-32-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	F	Н	OH
XXVI-32-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН
XXVI-32-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН
XXVI-32-8	Et	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXVI-33

Table AAVI-33.											
№	R <sup>1</sup>	$\mathbb{R}^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R⁵	$R^6$	X	Y		
XXVI-33-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН		
XXVI-33-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	OH		
XXVI-33-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	Н	ОН		
XXVI-33-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	Н	OH		
XXVI-33-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH		
XXVI-33-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН		
XXVI-33-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH		
XXVI-33-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXVI-34. 5

Nº	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVI-34-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH
XXVI-34-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH
XXVI-34-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	Н	OH
XXVI-34-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	H	F	Н	ОН
XXVI-34-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXVI-34-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXVI-34-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН
XXVI-34-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

T	ah	حا	XXV	71	25
- 6	an.	ıc	$\Delta \Delta \lambda$	/ I	7.7.

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVI-35-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH
XXVI-35-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH
XXVI-35-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН
XXVI-35-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН
XXVI-35-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН
XXVI-35-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH
XXVI-35-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH
XXVI-35-8	Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table XXVI-36.

Table 7x7x V									
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXVI-36-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH
XXVI-36-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	OH
XXVI-36-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	Н	OH
XXVI-36-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH
XXVI-36-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH
XXVI-36-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXVI-36-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXVI-36-8	p-Me-Ph	*	Н	*	"Bu	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table XXVI-37.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVI-37-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH
XXVI-37-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	OH
XXVI-37-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	H	OH
XXVI-37-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН
XXVI-37-5	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2Ph$	"Bu	Н	F	Н	OH
XXVI-37-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	Н	OH
XXVI-37-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН
XXVI-37-8	p-F-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

OD 1	1 1	1	* 7	<b>47 T</b>	7 T	20	
Tal	nı	0	X	x١	./	_ 4 >	
14	.,,		/ <b>\</b> .	/ <b>\</b> '	v 1	,(	١.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVI-38-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH
XXVI-38-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	OH
XXVI-38-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	Н	OH
XXVI-38-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXVI-38-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXVI-38-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	Н	OH
XXVI-38-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	OH
XXVI-38-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	"Bu	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXVI-39.

14010 2121 1									
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVI-39-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH
XXVI-39-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXVI-39-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН
XXVI-39-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXVI-39-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	F	Н	OH
XXVI-39-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXVI-39-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXVI-39-8	p-Br-Ph	*	Н	*	"Bu	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## 5 Table XXVI-40.

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVI-40-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH
XXVI-40-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН
XXVI-40-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	H	F	Н	ОН
XXVI-40-4	p-I-Ph	H	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXVI-40-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	F	Н	OH
XXVI-40-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXVI-40-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН
XXVI-40-8	p-I-Ph	*	Н	*	"Bu	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tah	le	XXV	[_ <b>4</b> 1
1 (21)		$\Delta \Delta V$	I <del></del> I .

№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVI-41-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	OH
XXVI-41-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	H	F	Н	OH
XXVI-41-3	$CH_3$	H	H	$CH(CH_3)_2$	Bz	H	F	H	OH
XXVI-41-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	H	OH
XXVI-41-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	Н	ОН
XXVI-41-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	H	F	Н	OH
XXVI-41-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН
XXVI-41-8	$CH_3$	*	Н	*	Bz	Н	F	H	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table XXVI-42.

1 4010 2323 7									
№	R¹	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXVI-42-1	Et	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	ОН
XXVI-42-2	Et	Η.	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН
XXVI-42-3	Et	H	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	H	F	Н	OH
XXVI-42-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	OH
XXVI-42-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	Н	OH
XXVI-42-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	H	F	Н	OH
XXVI-42-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	H	OH
XXVI-42-8	Et	*	Н	*	Bz	H	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table XXVI-43.

10	nl	<b>D</b> 2	rs 3a	73b	n4	<b>m</b> 5	<b>D</b> 6	37	Y
№	K,	K <sup>2</sup>	K°"	K <sup>2</sup>	K.	K <sup>s</sup>	K°	X	Y
XXVI-43-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	OH
XXVI-43-2	<sup>i</sup> Pr	Н	H	CH <sub>3</sub>	Bz	H	F	Η	OH
XXVI-43-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	OH
XXVI-43-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	H	F	Н	OH
XXVI-43-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	Н	OH
XXVI-43-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	H	F	Н	ОН
XXVI-43-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ФФІ
XXVI-43-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Bz	Н	F	Н	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tah	ما	XXV	/T_/	14
I an		$\Delta \Delta$	, ,	++.

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVI-44-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	ОН
XXVI-44-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Η	ОН
XXVI-44-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН
XXVI-44-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	OH
XXVI-44-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	Н	OH
XXVI-44-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	Н	OH
XXVI-44-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	OH
XXVI-44-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Bz	Н	F	Н	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table XXVI-45.

R <sup>30</sup>	R <sup>4</sup>	R³	R°	X	Y
Н	Bz	Н	F	Н	OH
CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	OH
$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	OH
$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	H	F	Н	OH
CH₂Ph	Bz	Н	F	Н	OH
CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	Н	OH
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	OH
	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	H Bz CH <sub>3</sub> Bz CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> Bz CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> Bz CH <sub>2</sub> Ph Bz CH <sub>2</sub> -indol-3-yl Bz	H Bz H  CH <sub>3</sub> Bz H  CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> Bz H  CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> Bz H  CH <sub>2</sub> Ph Bz H  CH <sub>2</sub> -indol-3-yl Bz H	H Bz H F $CH_3$ Bz H F $CH(CH_3)_2$ Bz H F $CH_2CH(CH_3)_2$ Bz H F $CH_2Ph$ Bz H F $CH_2-indol-3-yl$ Bz H F	H Bz H F H $CH_3$ Bz H F H $CH(CH_3)_2$ Bz H F H $CH_2CH(CH_3)_2$ Bz H F H $CH_2Ph$ Bz H F H $CH_2-indol-3-yl$ Bz H F H

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>36</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table XXVI-46.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVI-46-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	ОН
XXVI-46-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН
XXVI-46-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН
XXVI-46-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН
XXVI-46-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH₂Ph	Bz	Н	F	Н	ОН
XXVI-46-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	Н	OH
XXVI-46-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	OH
XXVI-46-8	p-Me-Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	Н	ΟĤ

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

		~
コムト	$^{\sim}$ V V	VI-47.
1 4171	$r \wedge r$	V I-4/.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVI-47-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	OH
XXVI-47-2	p-F-Ph	Н	H	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	OH
XXVI-47-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН
XXVI-47-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН
XXVI-47-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	Н	ОН
XXVI-47-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	Н	OH
XXVI-47-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	OH
XXVI-47-8	p-F-Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup> $R^2$  and  $R^{3b}$  joined together by  $(CH_2)_3$  to form five-membered ring.

### Table XXVI-48.

Table AA v									
N₂	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVI-48-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	ОН
XXVI-48-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН
XXVI-48-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН
XXVI-48-4	p-Cl-Ph	Н	H	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	OH
XXVI-48-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	Н	ОН
XXVI-48-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	Н	OH
XXVI-48-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН
XXVI-48-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## 5 Table XXVI-49.

14010 1111 1									
No	Ri	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVI-49-1	p-Br-Ph	H	Н	Н	Bz	Н	F	Н	OH
XXVI-49-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	OH
XXVI-49-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	OH
XXVI-49-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН
XXVI-49-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH₂Ph	Bz	Н	F	Н	ОН
XXVI-49-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	Н	ОН
XXVI-49-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН
XXVI-49-8	p-Br-Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	Н	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	XXV	I-50.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVI-50-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	OH
XXVI-50-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	OH
XXVI-50-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	OH
XXVI-50-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	OH
XXVI-50-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	Н	ОН
XXVI-50-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	Н	OH
XXVI-50-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН
XXVI-50-8	p-I-Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

XXVII

Table	$YYVII_1$	

5

Table AAV									
No	R¹	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVII-1-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН
XXVII-1-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXVII-1-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXVII-1-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXVII-1-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXVII-1-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXVII-1-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXVII-1-8	$CH_3$	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

**WO 2008/121634** Docket No. 60137.0034WOU1

7	۲.	h	حا	V	V	ZΤ	[-2.
	เล	n	ıe.	х	×Υ	v ı	- /.

Nº	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVII-2-1	Et	Н	Н	Н Н		Н	F	F	ОН
XXVII-2-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXVII-2-3	Et	Н	H	$H   CH(CH_3)_2$		Н	F	F	OH
XXVII-2-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXVII-2-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXVII-2-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXVII-2-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXVII-2-8	Et	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table XXVII-3.

Table AA v									
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVII-3-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	OH
XXVII-3-2	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	H	F	F	OH
XXVII-3-3	$^{i}$ Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXVII-3-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	H	F	F	OH
XXVII-3-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH₂Ph	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXVII-3-6	<sup>i</sup> Pr	Н	H	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXVII-3-7	<sup>i</sup> Pr	H	Н	CH₂CH₂SCH₃	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXVII-3-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## Table XXVII-4.

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVII-4-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН
XXVII-4-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Ή	F	F	ОН
XXVII-4-3	<sup>t</sup> Bu	Н	H	$CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	H	F	F	OH
XXVII-4-4	'Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXVII-4-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2Ph$	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXVII-4-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXVII-4-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXVII-4-8	'Bu	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXVII-
--------------

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVII-5-1	Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН
XXVII-5-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	H	F	F	OH
XXVII-5-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXVII-5-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXVII-5-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXVII-5-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXVII-5-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXVII-5-8	Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

No No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVII-6-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН
XXVII-6-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXVII-6-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXVII-6-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXVII-6-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXVII-6-6	p-Me-Ph	H	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXVII-6-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXVII-6-8	p-Me-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## 5 Table XXVII-7.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVII-7-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	OH
XXVII-7-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXVII-7-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXVII-7-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXVII-7-6	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2Ph$	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXVII-7-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXVII-7-8	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXVII-7-20	p-F-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	XXV	'II-8.

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVII-8-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	OH
XXVII-8-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXVII-8-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXVII-8-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXVII-8-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXVII-8-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXVII-8-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXVII-8-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVII-9-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	OH
XXVII-9-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXVII-9-3	p-Br-Ph	Н	Ή	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXVII-9-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXVII-9-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXVII-9-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	H.	F	F	OH
XXVII-9-8	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$\text{CH}_3$	Н	F	F	OH
XXVII-9-20	p-Br-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXVII-10. 5

No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVII-10-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН
XXVII-10-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXVII-10-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXVII-10-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXVII-10-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXVII-10-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXVII-10-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXVII-10-8	p-I-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

OD 11	X7X7X7	TT 11
Table	XXV	-

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVII-11-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	OH
XXVII-11-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	OH
XXVII-11-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	OH
XXVII-11-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	ОН
XXVII-11-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	F	OH
XXVII-11-6	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	F	ОН
XXVII-11-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН
XXVII-11-8	$CH_3$	*	Н	*	Et	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table AA VII				21.					
N₀	R¹	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>30</sup>	R⁴	R <sup>3</sup>	R°	X	Y
XXVII-12-1	Et	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	OH
XXVII-12-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН
XXVII-12-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	OH
XXVII-12-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	OH
XXVII-12-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	F	OH
XXVII-12-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	F	OH
XXVII-12-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН
XXVII-12-8	Et	*	Н	*	Et	Н	F	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# 5 Table XXVII-13.

No	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVII-13-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	OH
XXVII-13-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	OH
XXVII-13-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	ОН
XXVII-13-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	OH
XXVII-13-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	F	ОН
XXVII-13-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	F	ОН
XXVII-13-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН
XXVII-13-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Et	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	YYV	$\Pi_{-}14$
I ainc	$\Delta \Delta V$	11-14.

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVII-14-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	ОН
XXVII-14-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	OH
XXVII-14-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	OH
XXVII-14-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	H	F	F	ОН
XXVII-14-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	F	ОН
XXVII-14-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	F	ОН
XXVII-14-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН
XXVII-14-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Et	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table VVVII 15

Table XXVI									
Nº	R¹	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVII-15-1	Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	OH
XXVII-15-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	H	F	F	OH
XXVII-15-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	OH
XXVII-15-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	OH
XXVII-15-5	Ph	Н	Н	CH₂Ph	Et	Н	F	F	OH
XXVII-15-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	F	OH
XXVII-15-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	H	F	F	ОН
XXVII-15-8	Ph	*	Н	*	Et	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXVII-16. 5

No	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVII-16-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	ОН
<b>XXVII-16-2</b>	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	OH
XXVII-16-3	p-Me-Ph	Н	Ή	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	ОН
XXVII-16-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	OH
XXVII-16-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	F	ОН
XXVII-16-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	F	ОН
<b>XXVII-16-7</b>	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН
XXVII-16-8	p-Me-Ph	*	Н	*	Et	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$\mathbf{T}$	ah'	۵	XX	W.	TT_	17
	ลก	10	~ ^	٠v	I I -	17.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVII-17-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	ОН
XXVII-17-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	H	F	F	OH
XXVII-17-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	H	F	F	OH
XXVII-17-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	OH
XXVII-17-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	F	OH
XXVII-17-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	F	OH
XXVII-17-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН
XXVII-17-8	p-F-Ph	*	Н	*	Et	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table XXVII-18.

Nº	R <sup>1</sup>	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVII-18-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	OH
XXVII-18-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	OH
XXVII-18-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	OH
XXVII-18-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	OH
XXVII-18-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	F	OH
XXVII-18-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	F	OH
XXVII-18-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	OH
XXVII-18-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	Et	Н	F	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table XXVII-19.

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVII-19-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	OH
XXVII-19-2	p-Br-Ph	Н	H	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	OH
XXVII-19-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	H	F	F	ОН
XXVII-19-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	OH
XXVII-19-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	F	OH
XXVII-19-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	F	OH
XXVII-19-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	OH
XXVII-19-8	p-Br-Ph	*	Н	*	Et	Н	F	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	XXV	/II-20.

No	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVII-20-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	ОН
XXVII-20-2	p-I-Ph	Н	H	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	OH
XXVII-20-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	OH
XXVII-20-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	H	F	F	OH
XXVII-20-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	H	F	F	OH
XXVII-20-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	F	ОН
XXVII-20-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	OH
XXVII-20-8	p-I-Ph	*	Н	*	Et	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table XXVII-21.

Table AAVI									
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R⁴	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXVII-21-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXVII-21-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXVII-21-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXVII-21-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXVII-21-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXVII-21-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXVII-21-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	F	F	OH
XXVII-21-8	$CH_3$	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# 5 Table XXVII-22.

No	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVII-22-1	Et	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXVII-22-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$^{i}$ Pr	Н	F	F	OH
XXVII-22-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	F	F	ОН
XXVII-22-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXVII-22-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXVII-22-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXVII-22-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	F	F	OH
XXVII-22-8	Et	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tabl	ρY	$\mathbf{v}$ V	TT_	23
Lan	- A	$\sim v$	11-	/ n

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVII-23-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXVII-23-2	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXVII-23-3	$^{i}$ Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXVII-23-4	<sup>i</sup> Pr	H	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	H	F	F	ОН
XXVII-23-5	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXVII-23-6	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	F	F	OH
XXVII-23-7	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXVII-23-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table AAVII-24.										
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	
XXVII-24-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	'Pr	Н	F	F	OH	
XXVII-24-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	Н	F	F	OH	
XXVII-24-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH	
XXVII-24-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH	
XXVII-24-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH	
XXVII-24-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	
XXVII-24-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	F	F	OH	
XXVII-24-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXVII-25. 5

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVII-25-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXVII-25-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	H	F	F	OH
XXVII-25-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXVII-25-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	F	F	OH
XXVII-25-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXVII-25-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXVII-25-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	F	F	OH
XXVII-25-8	Ph	*	Н	*	'Pr	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	XX	VII-26.

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVII-26-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXVII-26-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXVII-26-3	p-Me-Ph	Н	H	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXVII-26-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXVII-26-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXVII-26-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXVII-26-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXVII-26-8	p-Me-Ph	*	Н	*	'Pr	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXVI									
N₂	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVII-27-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXVII-27-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXVII-27-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXVII-27-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	H	F	F	ОН
XXVII-27-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXVII-27-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXVII-27-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXVII-27-8	p-F-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXVII-28. 5

14010 1111 11		_ 2	- 30	- 2h	-4	-5	56	77	7.7
№	R'	R²	R³a	R <sup>30</sup>					Y
XXVII-28-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	'Pr	H	F	F	OH
XXVII-28-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXVII-28-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXVII-28-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXVII-28-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	H	F	F	OH
XXVII-28-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXVII-28-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	F	F	ОН
XXVII-28-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$T_{\sim}1$	_1	١.	VI	71	711	[-29.
1 21	O.	е	$\Lambda$	<b>''</b>	/ I I	-Z7.

№		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVII-29-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXVII-29-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXVII-29-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXVII-29-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXVII-29-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXVII-29-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$^{i}$ Pr	Н	F	F	ОН
XXVII-29-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXVII-29-8	p-Br-Ph	*	Н	*	'Pr	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$T_{\alpha}1$	-1-	XXV	711	20
1 ai	ж	$\Delta \Delta \lambda$	. 11.	-ov.

Nº		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVII-30-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXVII-30-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXVII-30-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXVII-30-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXVII-30-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXVII-30-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	F	F	OH
XXVII-30-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	F	F	ОН
XXVII-30-8	p-I-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

No		R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXVII-31-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН
XXVII-31-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH
XXVII-31-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH
XXVII-31-4	$\text{CH}_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	Н	F	F	OH
XXVII-31-5	$CH_3$	Н	Н	$CH_2Ph$	"Bu	Н	F	F	ОН
XXVII-31-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	F	OH
XXVII-31-7	$CH_3$	Н	Н	CH₂CH₂SCH₃	"Bu	Н	F	F	ОН
XXVII-31-8	$CH_3$	*	Н	*	"Bu	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

OD 11	X 7 X 7 X 7 X	T 00
Lable	XXVI	1-32.

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXVII-32-1	Et	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH
XXVII-32-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	ОН
XXVII-32-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	ОН
XXVII-32-4	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН
XXVII-32-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH
XXVII-32-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	F	OH
XXVII-32-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH
XXVII-32-8	Et	*	Н	*	"Bu	Н	F	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table AAVI									
№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVII-33-1	<sup>i</sup> Pr	Н	H	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH
XXVII-33-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	OH
XXVII-33-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH
XXVII-33-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	ОН
XXVII-33-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	F	F	OH
XXVII-33-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	F	ОН
XXVII-33-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	OH
XXVII-33-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	"Bu	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXVII-34. 5

<b>№</b>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVII-34-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH
XXVII-34-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	H	F	F	OH
XXVII-34-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	ОН
XXVII-34-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	ОН
XXVII-34-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	F	F	ОН
XXVII-34-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	F	OH
XXVII-34-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	OH
XXVII-34-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

7	โลไ	h	le	Y	v	V	IT.	2	5	
	- 74	n	и.		А	v		- 7	•	

Nº	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVII-35-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН
XXVII-35-2	Ph	H	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Η	F	F	OH
XXVII-35-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	ОН
XXVII-35-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	ОН
XXVII-35-5	Ph	Н	H	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Η	F	F	OH
XXVII-35-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	H	F	F	ОН
XXVII-35-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	ОН
XXVII-35-8	Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## Table XXVII-36.

№         R¹         R²         R³a         R³b         R⁴         R⁵         R⁶         X         Y           XXVII-36-1         p-Me-Ph         H         H         H         H         F         F         OH           XXVII-36-2         p-Me-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> "Bu         H         F         F         OH           XXVII-36-4         p-Me-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> "Bu         H         F         F         OH           XXVII-36-5         p-Me-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         "Bu         H         F         F         OH           XXVII-36-6         p-Me-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         "Bu         H         F         F         OH           XXVII-36-8         p-Me-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> "Bu         H         F         F         OH	14010 7112 1 1		2	20	3h	-4	~ 5	756	7.7	
XXVII-36-2         p-Me-Ph         H         H         CH <sub>3</sub> "Bu         H         F         F         OH           XXVII-36-3         p-Me-Ph         H         H         CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> "Bu         H         F         F         OH           XXVII-36-4         p-Me-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> "Bu         H         F         F         OH           XXVII-36-5         p-Me-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> cH <sub>2</sub> ondol-3-yl         "Bu         H         F         F         OH           XXVII-36-7         p-Me-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> cH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> "Bu         H         F         F         OH	№	R'	R²	R3a	R	R⁺	R	R°	X	Y
XXVII-36-3         p-Me-Ph         H         H         CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> "Bu         H         F         F         OH           XXVII-36-4         p-Me-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> "Bu         H         F         F         OH           XXVII-36-5         p-Me-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> Ph         "Bu         H         F         F         OH           XXVII-36-6         p-Me-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         "Bu         H         F         F         OH           XXVII-36-7         p-Me-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> "Bu         H         F         F         OH	XXVII-36-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	"Bu	Н	F	F	OH
XXVII-36-4         p-Me-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> <sup>n</sup> Bu         H         F         F         OH           XXVII-36-5         p-Me-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> Ph <sup>n</sup> Bu         H         F         F         OH           XXVII-36-6         p-Me-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl <sup>n</sup> Bu         H         F         F         OH           XXVII-36-7         p-Me-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> <sup>n</sup> Bu         H         F         F         OH	XXVII-36-2	p-Me-Ph	Н	Η	CH <sub>3</sub>	"Bu	H	F	F	ОН
XXVII-36-5         p-Me-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> Ph         "Bu         H         F         F         OH           XXVII-36-6         p-Me-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         "Bu         H         F         F         OH           XXVII-36-7         p-Me-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> "Bu         H         F         F         OH	XXVII-36-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	OH
XXVII-36-6         p-Me-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl <sup>n</sup> Bu         H         F         F         OH           XXVII-36-7         p-Me-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> <sup>n</sup> Bu         H         F         F         OH	XXVII-36-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	H	F	F	OH
XXVII-36-7 p-Me-Ph H H CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> <sup>n</sup> Bu H F F OH	XXVII-36-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	$\mathbf{F}$	F	ОН
-	XXVII-36-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	F	OH
XXVII-36-8 p-Me-Ph * H * "Bu H F F OH	XXVII-36-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	OH
	XXVII-36-8	p-Me-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXVII-37. 5

№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVII-37-1	p-F-Ph	Н	Н	H	"Bu	Н	F	F	ОН
XXVII-37-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	OH
XXVII-37-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	OH
XXVII-37-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	ОН
<b>XXVII-37-5</b>	p-F-Ph	Н	Н	CH₂Ph	"Bu	Н	F	F	ОН
XXVII-37-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	F	OH
XXVII-37-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	ОН
XXVII-37-8	p-F-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

П	٦ <u>.</u> 1	1.	VV	VI	Т 2	8.
	าลก	ıe	$\mathbf{A} \mathbf{A}$	VΙ	- 1	Λ.

No	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVII-38-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН
XXVII-38-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	OH
XXVII-38-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	OH
XXVII-38-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	OH
XXVII-38-5	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2Ph$	"Bu	Н	F	F	OH
XXVII-38-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	F	OH
XXVII-38-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH
XXVII-38-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	"Bu	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXVII-39.

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVII-39-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH
XXVII-39-2	_				<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН
XXVII-39-3	p-Br-Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН
XXVII-39-4	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	Н	F	F	ОН
XXVII-39-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH
XXVII-39-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	F	OH
XXVII-39-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH
XXVII-39-8	p-Br-Ph	*	Н	*	"Bu	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table XXVII-40.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVII-40-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH
XXVII-40-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	OH
XXVII-40-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	ОН
XXVII-40-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	OH
XXVII-40-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН
XXVII-40-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	F	OH
XXVII-40-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН
XXVII-40-8	p-I-Ph	*	Н	*	"Bu	Н	F	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXVII-41.
-----------------

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXVII-41-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	ОН
XXVII-41-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	H	F	F	OH
XXVII-41-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	OH
XXVII-41-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	OH
XXVII-41-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	F	OH
XXVII-41-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	H	F	F	OH
<b>XXVII-41-7</b>	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	OH
XXVII-41-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	Bz	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

No	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVII-42-1	Et	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	OH
XXVII-42-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	OH
XXVII-42-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН
XXVII-42-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	OH
XXVII-42-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	F	OH
XXVII-42-6	Et	H	H	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	F	OH
<b>XXVII-42-7</b>	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	OH
XXVII-42-8	Et	*	Н	*	Bz	Н	F	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXVII-43 5

Nº		R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVII-43-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	OH
XXVII-43-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	H	F	F	OH
XXVII-43-3	$^{i}$ Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	OH
XXVII-43-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН
XXVII-43-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	F	OH
XXVII-43-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	F	ОН
XXVII-43-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ФИ
XXVII-43-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Bz	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	XXV	[ <b>I-44</b> .

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVII-44-1	'Bu	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	OH
XXVII-44-2	'Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	OH
XXVII-44-3	'Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН
XXVII-44-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН
XXVII-44-5	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	H	F	F	ОН
XXVII-44-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	F	ÓН
XXVII-44-7	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН
XXVII-44-8	'Bu	*	Н	*	Bz	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table AAVI									
Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVII-45-1	Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	OH
XXVII-45-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	OH
XXVII-45-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	OH
XXVII-45-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	OH
XXVII-45-5	Ph	H	Н	CH₂Ph	Bz	Н	F	F	OH
XXVII-45-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	F	ОН
XXVII-45-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН
XXVII-45-8	Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXVII-46. 5

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVII-46-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	ОН
XXVII-46-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН
XXVII-46-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН
XXVII-46-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН
XXVII-46-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	F	ОН
XXVII-46-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	F	ОН
XXVII-46-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	OH
XXVII-46-8	p-Me-Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

٦	โลโ	h	حا	X	V	W	ſΥ	-47	,
	- 21	n	-	А	А	v		-4 /	

Table AA VI.				31		. 4			
Nº	R¹	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>30</sup>	R <sup>4</sup>	R3	R°	X	Y
XXVII-47-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	OH
XXVII-47-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	OH
<b>XXVII-47-3</b>	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	OH
XXVII-47-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН
XXVII-47-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	F	OH
<b>XXVII-47-6</b>	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	F	OH
XXVII-47-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	OH
XXVII-47-8	p-F-Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXVI									
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXVII-48-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	ОН
XXVII-48-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН
XXVII-48-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН
XXVII-48-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	OH
XXVII-48-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	F	OH
XXVII-48-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	F	ОН
XXVII-48-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН
XXVII-48-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table XXVII-49.

1 4010 7171 11.									
No	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVII-49-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	ОН
XXVII-49-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН
XXVII-49-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	OH
XXVII-49-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	OH
XXVII-49-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	F	OH
XXVII-49-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	F	OH
XXVII-49-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН
XXVII-49-8	p-Br-Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

F OH

F OH

Bz H

XXVII-50-8 p-I-Ph \*

Table XXVI	I-50.								
No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVII-50-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	OH
XXVII-50-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	OH
XXVII-50-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	OH
XXVII-50-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	OH
XXVII-50-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	H	F	F	OH
XXVII-50-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

XXVII-50-7 p-I-Ph H H CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub> Bz H F

ХХVШ

Table XXVIII-1.												
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y			
XXVIII-1-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН			
XXVIII-1-2	$CH_3$	Н	H	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	ОН			
XXVIII-1-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	ОН			
XXVIII-1-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	ОН			
XXVIII-1-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	Н	F	ОН			
XXVIII-1-6	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	Н	F	ОН			
XXVIII-1-7	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН			
XXVIII-1-8	CH₃	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН			

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

5

Tabl	ما	XXV	711	T_2
1 2111		$\Lambda \Lambda 1$	, , ,	I = /

№	R¹	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVIII-2-1	Et	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	OH
XXVIII-2-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Η	F	OH
XXVIII-2-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXVIII-2-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$\mathrm{CH}_3$	Η	Н	F	OH
XXVIII-2-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXVIII-2-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXVIII-2-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXVIII-2-8	Et	*	Н	*	$CH_3$	Н	Н	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

No		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXVIII-3-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	OH
XXVIII-3-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXVIII-3-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXVIII-3-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXVIII-3-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXVIII-3-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXVIII-3-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXVIII-3-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	$CH_3$	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXVIII-4. 5

14010 1111 11		. 1	- 20	2h		-5	-6	<del></del>	
No	R¹	R <sup>2</sup>	R3a	R <sup>30</sup>	R⁺	K,	К°	X	Y
XXVIII-4-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	OH
XXVIII-4-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXVIII-4-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXVIII-4-4	'Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXVIII-4-5	'Bu	Н	Н	CH₂Ph	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXVIII-4-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXVIII-4-7	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXVIII-4-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	$CH_3$	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tabl	ما	XXV	/TT	[_5
1 211)	15	$\Lambda \Lambda 1$	/ I I	<b>-</b> .).

No		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVIII-5-1	Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН
XXVIII-5-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXVIII-5-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXVIII-5-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXVIII-5-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXVIII-5-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXVIII-5-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXVIII-5-8	Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXVI	Table XXVIII-6.									
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	
XXVIII-6-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН	
XXVIII-6-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	OH	
XXVIII-6-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	
XXVIII-6-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	OH	
XXVIII-6-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH₂Ph	$CH_3$	Н	Н	F	OH	
XXVIII-6-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	Н	F	OH	
XXVIII-6-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	
XXVIII-6-8	p-Me-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## 5 Table XXVIII-7.

№         R¹         R²         R³a         R³b         R⁴         R⁵         R⁶         X         Y           XXVIII-7-1         p-F-Ph         H         H         H         H         H         F         OH           XXVIII-7-2         p-F-Ph         H         H         CH₃         H         H         F         OH           XXVIII-7-3         p-F-Ph         H         H         CH(CH₃)₂         CH₃         H         H         F         OH           XXVIII-7-4         p-F-Ph         H         H         CH₂CH(CH₃)₂         CH₃         H         H         F         OH           XXVIII-7-6         p-F-Ph         H         H         CH₂-indol-3-yl         CH₃         H         H         F         OH           XXVIII-7-8         p-F-Ph         H         H         CH₂CH₂SCH₃         CH₃         H         H         F         OH           XXVIII-7-20         p-F-Ph         *         H         *         CH₃         H         H         F         OH	Table AAVIII	Table AAVIII-7.									
XXVIII-7-2         p-F-Ph         H         H         CH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> H         H         F         OH           XXVIII-7-3         p-F-Ph         H         H         CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> H         H         F         OH           XXVIII-7-4         p-F-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> H         H         F         OH           XXVIII-7-6         p-F-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> Ph         CH <sub>3</sub> H         H         F         OH           XXVIII-7-7         p-F-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         CH <sub>3</sub> H         H         F         OH           XXVIII-7-8         p-F-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         CH <sub>3</sub> H         H         F         OH	No	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	R <sup>δ</sup>	X	Y	
XXVIII-7-3         p-F-Ph         H         H         CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> H         H         F         OH           XXVIII-7-4         p-F-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> H         H         F         OH           XXVIII-7-6         p-F-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> Ph         CH <sub>3</sub> H         H         F         OH           XXVIII-7-7         p-F-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         CH <sub>3</sub> H         H         F         OH           XXVIII-7-8         p-F-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> H         H         F         OH	XXVIII-7-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	OH	
XXVIII-7-4         p-F-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> H         H         F         OH           XXVIII-7-6         p-F-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> Ph         CH <sub>3</sub> H         H         F         OH           XXVIII-7-7         p-F-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         CH <sub>3</sub> H         H         F         OH           XXVIII-7-8         p-F-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> H         H         F         OH	XXVIII-7-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	
XXVIII-7-6         p-F-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> Ph         CH <sub>3</sub> H         H         F         OH           XXVIII-7-7         p-F-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> -indol-3-yl         CH <sub>3</sub> H         H         F         OH           XXVIII-7-8         p-F-Ph         H         H         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> H         H         F         OH	XXVIII-7-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	H	F	OH	
XXVIII-7-7 p-F-Ph H H CH <sub>2</sub> -indol-3-yl CH <sub>3</sub> H H F OH XXVIII-7-8 p-F-Ph H H CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> H H F OH	XXVIII-7-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	OH	
XXVIII-7-8 p-F-Ph H H CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> H H F OH	XXVIII-7-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	
-	XXVIII-7-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	Н	F	OH	
<b>XXVIII-7-20</b> p-F-Ph * H * CH <sub>3</sub> H H F OH	XXVIII-7-8	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	ОН	
	XXVIII-7-20	p-F-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	Н	F	OH	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Т	ah	le	XX	VI	H-8.

№	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVIII-8-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	OH
XXVIII-8-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	H	Н	F	OH
XXVIII-8-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXVIII-8-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXVIII-8-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXVIII-8-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXVIII-8-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXVIII-8-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Nº	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXVIII-9-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	OH
XXVIII-9-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXVIII-9-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXVIII-9-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXVIII-9-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXVIII-9-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXVIII-9-8	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXVIII-9-20	p-Br-Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXVIII-10. 5

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVIII-10-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН
XXVIII-10-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Η	F	OH
XXVIII-10-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXVIII-10-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXVIII-10-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXVIII-10-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXVIII-10-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXVIII-10-8	p-I-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	YYVIII	_1	1
Table	$\Delta \Delta V III$	- 1	Ι.

Nº	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVIII-11-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	ОН
XXVIII-11-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	OH
XXVIII-11-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	ОН
XXVIII-11-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	ОН
XXVIII-11-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	Н	F	OH
XXVIII-11-6	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	Н	F	OH
XXVIII-11-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	OH
XXVIII-11-8	$CH_3$	*	Н	*	Et	H	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

№	R¹	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVIII-12-1	Et	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	OH
XXVIII-12-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	OH
XXVIII-12-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	H	F	OH
XXVIII-12-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	ОН
XXVIII-12-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	Н	F	OH
XXVIII-12-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	Н	F	OH
XXVIII-12-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН
XXVIII-12-8	Et	*	Н	*	Et	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# 5 Table XXVIII-13.

No	R¹	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVIII-13-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	ОН
XXVIII-13-2	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	OH
XXVIII-13-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	OH
XXVIII-13-4	$^{i}$ Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	ОН
XXVIII-13-5	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	Н	F	ОН
XXVIII-13-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	Н	F	ОН
XXVIII-13-7	<sup>i</sup> Pr	H	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН
XXVIII-13-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Et	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	XXV	III-14.

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVIII-14-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	OH
XXVIII-14-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	OH
XXVIII-14-3	<sup>t</sup> Bu	H	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	H	F	OH
XXVIII-14-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	Н	F	OH
XXVIII-14-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH₂Ph	Et	Н	Н	F	OH
XXVIII-14-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	H	F	OH
XXVIII-14-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH₂CH₂SCH₃	Et	Н	Н	F	OH
XXVIII-14-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Et	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table AA VIII									
№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVIII-15-1	Ph	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	OH
XXVIII-15-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	OH
XXVIII-15-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	OH
XXVIII-15-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	OH
XXVIII-15-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	H	Н	F	OH
XXVIII-15-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	Н	F	OH
XXVIII-15-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	H	F	OH
XXVIII-15-8	Ph	*	Н	*	Et	Н	Н	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table XXVIII-16.

No	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVIII-16-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	OH
XXVIII-16-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН
XXVIII-16-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	OH
XXVIII-16-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	OH
XXVIII-16-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	Н	F	ОН
XXVIII-16-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	Н	F	OH
XXVIII-16-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН
XXVIII-16-8	p-Me-Ph	*	Н	*	Et	Н	Н	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	XXV	711	$I_{-}1$	7
Table	$\Delta \Delta$		1 – I	

Nº	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVIII-17-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	OH
XXVIII-17-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН
XXVIII-17-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	OH
XXVIII-17-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	H	F	OH
XXVIII-17-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	Н	F	OH
XXVIII-17-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	Н	F	OH
XXVIII-17-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН
XXVIII-17-8	p-F-Ph	*	Н	*	Et	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## Table XXVIII-18.

Nº	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVIII-18-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	OH
XXVIII-18-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	OH
XXVIII-18-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Η	Н	F	OH
XXVIII-18-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	ОН
XXVIII-18-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	Н	F	OH
XXVIII-18-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	Н	F	OH
XXVIII-18-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	OH
XXVIII-18-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	Et	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# 5 Table XXVIII-19.

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVIII-19-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	ОН
XXVIII-19-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	OH
XXVIII-19-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	OH
XXVIII-19-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	OH
XXVIII-19-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	Н	F	ОН
XXVIII-19-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	Н	F	ОН
XXVIII-19-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН
XXVIII-19-8	p-Br-Ph	*	Н	*	Et	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

	* * * * * * * * * * * * * * * * * * *	TT 00
Table		11 761
rame	XXVI	H-ZV.

Nº	$R^{I}$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVIII-20-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	OH
XXVIII-20-2	p-I-Ph	H	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	H	F	OH
XXVIII-20-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	H	F	OH
XXVIII-20-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	H	F	OH
XXVIII-20-5	p-I-Ph	Н	H	CH <sub>2</sub> Ph	Et	H	Н	F	OH
XXVIII-20-6	p-I-Ph	H	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	H	H	F	OH
XXVIII-20-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	H	Н	F	OH
XXVIII-20-8	p-I-Ph	*	Н	*	Et	Н	Н	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

No	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVIII-21-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXVIII-21-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	H	Н	F	OH
XXVIII-21-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$^{i}$ Pr	Н	Н	F	OH
XXVIII-21-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	H	F	OH
XXVIII-21-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$^{i}$ Pr	H	Н	F	OH
XXVIII-21-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXVIII-21-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXVIII-21-8	$CH_3$	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# 5 Table XXVIII-22.

No	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVIII-22-1	Et	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXVIII-22-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	H	Н	F	ОН
XXVIII-22-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	H	F	OH
XXVIII-22-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$^{i}$ Pr	Н	Н	F	OH
XXVIII-22-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXVIII-22-6	Et	H	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXVIII-22-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXVIII-22-8	Et	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>36</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	XXVI	11-23
101111	/\ /\ V II	11-22.

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXVIII-23-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	'Pr	Н	Н	F	ОН
XXVIII-23-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	Н	Η	F	ОН
XXVIII-23-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXVIII-23-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXVIII-23-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXVIII-23-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXVIII-23-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXVIII-23-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## Table XXVIII-24.

No		R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVIII-24-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXVIII-24-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXVIII-24-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	Н	F	ОН
XXVIII-24-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$^{i}$ Pr	Н	Н	F	ОН
XXVIII-24-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXVIII-24-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXVIII-24-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXVIII-24-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# 5 Table XXVIII-25.

No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVIII-25-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXVIII-25-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	Н	Н	F	ОН
XXVIII-25-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXVIII-25-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXVIII-25-5	Ph	Н	Н	CH₂Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXVIII-25-6	Ph	· H	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXVIII-25-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXVIII-25-8	Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	YYV	JIII	-26
1 addic	$\Delta \Delta$	v 111	-ZU.

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVIII-26-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	'Pr	Н	Н	F	OH
XXVIII-26-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXVIII-26-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXVIII-26-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXVIII-26-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXVIII-26-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXVIII-26-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXVIII-26-8	p-Me-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

No No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVIII-27-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXVIII-27-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXVIII-27-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	H	Н	F	ОН
XXVIII-27-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXVIII-27-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	Н	F	ОН
XXVIII-27-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	Н	F	ОН
XXVIII-27-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	Н	F	ОН
XXVIII-27-8	p-F-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXVIII-28. 5

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVIII-28-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	'Pr	Н	Н	F	ОН
XXVIII-28-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXVIII-28-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXVIII-28-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXVIII-28-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	Н	F	OH
XXVIII-28-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXVIII-28-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	Н	F	OH
XXVIII-28-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXVIII									
№	$R^1$	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVIII-29-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXVIII-29-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXVIII-29-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	H	Н	F	ОН
XXVIII-29-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	Н	F	ОН
XXVIII-29-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH₂Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXVIII-29-6	p-Br-Ph	Н	H	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXVIII-29-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXVIII-29-8	p-Br-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	XXVII	T 20
Lanie	XXVII	1-5U.

No No	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVIII-30-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXVIII-30-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	Н	Н	F	OH
XXVIII-30-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXVIII-30-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	H	Н	F	ОН
XXVIII-30-5	p-I-Ph	Н	Н	CH₂Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXVIII-30-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXVIII-30-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXVIII-30-8	p-I-Ph	*	Н	*	'Pr	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table XXVIII-31.

N₂	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVIII-31-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH
XXVIII-31-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	H	Н	F	OH
XXVIII-31-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH
XXVIII-31-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	OH
XXVIII-31-5	$CH_3$	Н	Н	$CH_2Ph$	"Bu	Н	Н	F	OH
XXVIII-31-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	Н	F	ОН
XXVIII-31-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	Н	F	ОН
XXVIII-31-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	VVI	7TTT	-32
Lable	$\Lambda \Lambda 1$	/ 111	72.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVIII-32-1	Et	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН
XXVIII-32-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH
XXVIII-32-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	ОН
XXVIII-32-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	OH
XXVIII-32-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	Н	F	OH
XXVIII-32-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	Н	F	OH
XXVIII-32-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	Н	F	OH
XXVIII-32-8	Et	*	Н	*	"Bu	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

No		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVIII-33-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН
XXVIII-33-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	Н	F	ОН
XXVIII-33-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН
XXVIII-33-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН
XXVIII-33-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	Н	F	ОН
XXVIII-33-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	Н	F	OH
XXVIII-33-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН
XXVIII-33-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table XXVIII-34.

№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVIII-34-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH
XXVIII-34-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	Н	F	OH
XXVIII-34-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	OH
XXVIII-34-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH
XXVIII-34-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	Н	F	OH
XXVIII-34-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	Н	F	ОН
XXVIII-34-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	Н	F	OH
XXVIII-34-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	"Bu	Н	Н	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	XXVIII-35.	
I auto	$\Lambda\Lambda$	

№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVIII-35-1	Ph	Н	Н	Н	"Bu	Н	Н	F	OH
XXVIII-35-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	H	Н	F	OH
XXVIII-35-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	H	Н	F	OH
XXVIII-35-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	H	Н	F	OH
XXVIII-35-5	Ph	$\mathbf{H}_{s}$	Н	CH₂Ph	"Bu	Н	Н	F	OH
XXVIII-35-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	Н	F	ОН
XXVIII-35-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	Н	F	OH
XXVIII-35-8	Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## Table XXVIII-36.

No Table XX VIII	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVIII-36-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH
XXVIII-36-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	Н	F	OH
XXVIII-36-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	ОН
XXVIII-36-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	OH
XXVIII-36-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH₂Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН
XXVIII-36-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	Н	F	OH
XXVIII-36-7	p-Me-Ph	H	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH
XXVIII-36-8	p-Me-Ph	*	Н	*	"Bu	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXVIII-37. 5

Nº	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVIII-37-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН
XXVIII-37-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	Н	F	OH
XXVIII-37-3	p-F-Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	Н	Н	F	OH
XXVIII-37-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	OH
XXVIII-37-5	p-F-Ph	Н	Н	CH₂Ph	"Bu	Н	Н	F	OH
XXVIII-37-6	p-F-Ph	H	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	Н	F	OH
XXVIII-37-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	Н	F	OH
XXVIII-37-8	p-F-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	X7X7X	7TTY	20
Table	X X 1	/ I I I.	_ 4 X
I auto	$\Delta \Delta $	, TTT.	-50.

<u>№</u>	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVIII-38-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	"Bu	Н	Н	F	OH
XXVIII-38-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	Н	F	ОН
XXVIII-38-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	ОН
XXVIII-38-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	ОН
XXVIII-38-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	Н	F	OH
XXVIII-38-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	Н	F	ОН
XXVIII-38-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	Н	F	OH
XXVIII-38-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## Table XXVIII-39.

<u>No</u>		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVIII-39-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	"Bu	Н	Н	F	OH
XXVIII-39-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	Н	F	ОН
XXVIII-39-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH
XXVIII-39-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН
XXVIII-39-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	Н	F	ОН
XXVIII-39-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН
XXVIII-39-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	Н	F	ОН
XXVIII-39-8	p-Br-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## 5 Table XXVIII-40.

Table AA VII.									
No	$R^{I}$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R°	R٥	X	Y
XXVIII-40-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН
XXVIII-40-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	Н	F	OH
XXVIII-40-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	ОН
XXVIII-40-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	ОН
XXVIII-40-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	Н	F	ОН
XXVIII-40-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН
XXVIII-40-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH
XXVIII-40-8	p-I-Ph	*	Н	*	"Bu	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	<b>XXVII</b>	I-41
1 auto	VVV ATT	1-41.

№	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVIII-41-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	ОН
XXVIII-41-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH
XXVIII-41-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	OH
XXVIII-41-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	OH
XXVIII-41-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	Н	F	OH
XXVIII-41-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	Н	F	OH
XXVIII-41-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH
XXVIII-41-8	$CH_3$	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Nº		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVIII-42-1	Et	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	ОН
XXVIII-42-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH
XXVIII-42-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	H	F	ОН
XXVIII-42-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	OH
XXVIII-42-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	Н	F	ОН
XXVIII-42-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	Н	F	OH
XXVIII-42-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	ОН
XXVIII-42-8	Et	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXVIII-43. 5

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVIII-43-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	OH
XXVIII-43-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH
XXVIII-43-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	OH
XXVIII-43-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	OH
XXVIII-43-5	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	Η	F	OH
XXVIII-43-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	Н	F	ОН
XXVIII-43-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	ФФ
XXVIII-43-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

70° 1 1	37373	7TTT	-44
Table	XXV	/ 111	-44.

№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVIII-44-1	'Bu	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	OH
XXVIII-44-2	'Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	ОН
XXVIII-44-3	'Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	ОН
XXVIII-44-4	'Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	ОН
XXVIII-44-5	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	Н	F	OH
XXVIII-44-6	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	Н	F	OH
XXVIII-44-7	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH
XXVIII-44-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## Table XXVIII-45.

No		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVIII-45-1	Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	OH
XXVIII-45-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH
XXVIII-45-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	ОН
XXVIII-45-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	OH
XXVIII-45-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	Н	F	ОН
XXVIII-45-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	Н	F	ОН
XXVIII-45-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH
XXVIII-45-8	Ph	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table XXVIII-46.

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVIII-46-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	OH
XXVIII-46-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	H	Н	F	OH
XXVIII-46-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	OH
XXVIII-46-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	OH
XXVIII-46-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	Н	F	OH
XXVIII-46-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	Н	F	OH
XXVIII-46-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	ОН
XXVIII-46-8	p-Me-Ph	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	37373	7TTT	47
Lable	X X \	/         .	_4 /
1 auto	ZXZX ¥	TIT.	-7/.

No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVIII-47-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	OH
XXVIII-47-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH
XXVIII-47-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	OH
XXVIII-47-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	OH
XXVIII-47-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	Н	F	OH
XXVIII-47-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	Н	F	OH
XXVIII-47-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH
XXVIII-47-8	p-F-Ph	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## Table XXVIII-48.

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVIII-48-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	ОН
XXVIII-48-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH
XXVIII-48-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	ОН
XXVIII-48-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	OH
XXVIII-48-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	Н	F	OH
XXVIII-48-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	Н	F	ОН
XXVIII-48-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	ОН
XXVIII-48-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXVIII-49. 5

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVIII-49-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	OH
XXVIII-49-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH
XXVIII-49-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	OH
XXVIII-49-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	ОН
XXVIII-49-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	Н	F	ОН
XXVIII-49-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	Н	F	ОН
XXVIII-49-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	ОН
XXVIII-49-8	p-Br-Ph	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXVII									
No	$R^1$	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXVIII-50-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	OH
XXVIII-50-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH
XXVIII-50-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	OH
XXVIII-50-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	H	F	OH
XXVIII-50-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	Н	F	OH
XXVIII-50-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	Н	F	OH
XXVIII-50-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH
XXVIII-50-8	p-I-Ph	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

XXIX

5	Table XXIX-1.
J	1 abic 222122-1.

Table AAI									
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXIX-1-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXIX-1-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	H	$CH_3$	F	OH
XXIX-1-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-1-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-1-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-1-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-1-7	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-1-8	$CH_3$	*	Н	*	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tabl	١.	VV	rv	
เลก	le.	XX	IX-7.	

Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIX-2-1	Et	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXIX-2-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$\mathrm{CH}_3$	F	OH
XXIX-2-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$\mathrm{CH}_3$	F	OH
XXIX-2-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-2-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-2-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-2-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-2-8	Et	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIX-3.

No No		R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIX-3-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXIX-3-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXIX-3-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-3-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-3-5	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	CH <sub>3</sub>	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-3-6	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$\mathrm{CH}_3$	F	OH
XXIX-3-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	$\mathrm{CH}_3$	F	ОН
XXIX-3-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	$\text{CH}_3$	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXIX-4. 5

Nº	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIX-4-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXIX-4-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-4-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-4-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-4-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-4-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-4-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-4-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

7	็ลไ	h	e	XX	X-5	`
- 1	4			/\ /\	/	٠.

No No		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIX-5-1	Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXIX-5-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-5-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-5-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-5-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-5-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-5-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-5-8	Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIX-6.

I aute AAI	Λ-0.								
№	$R^1$	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIX-6-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXIX-6-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-6-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-6-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-6-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH₂Ph	$\text{CH}_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-6-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-6-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$\text{CH}_3$	F	ОН
XXIX-6-8	p-Me-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table XXIX-7.

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIX-7-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXIX-7-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-7-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-7-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$\mathrm{CH}_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-7-6	p-F-Ph	Н	Н	CH₂Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-7-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-7-8	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-7-20	p-F-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

	Table XXIX-8.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$										
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y		
XXIX-8-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН		
XXIX-8-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH		
XXIX-8-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH		
XXIX-8-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH		
XXIX-8-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH		
XXIX-8-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH		
XXIX-8-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH		
XXIX-8-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	$CH_3$	F	OH		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tabl	ما	XX	ſ٧.	9
1210	15	$\Delta \Delta$		゚゚゚゚゚゚゚゚゚゚゙゙゙゙゙゙゙゙゚゚゚゙゙゙゙゙゙゙゙゙゚゚゙゙ヹ゚゚゙゙゙゙゙゙

Table AAIA									
No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R³	R <sup>6</sup>	X	Υ
XXIX-9-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXIX-9-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-9-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-9-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-9-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-9-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	H	$CH_3$	F	OH
XXIX-9-8	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-9-20	p-Br-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## 5 Table XXIX-10.

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIX-10-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXIX-10-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-10-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-10-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-10-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-10-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-10-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-10-8	p-I-Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	$CH_3$	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Ta	ել	$\sim$	v	VΙ	v	1	1
12	111	_	^	ΛІ	^-		н.

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIX-11-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXIX-11-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-11-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-11-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-11-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-11-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-11-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-11-8	$CH_3$	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table XXIX-12

Nº			R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIX-12-1	Et	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXIX-12-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-12-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-12-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-12-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-12-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-12-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXIX-12-8	Et	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# 5 Table XXIX-13.

No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIX-13-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXIX-13-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-13-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-13-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-13-5	<sup>i</sup> Pr	Н	H	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-13-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-13-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-13-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIX-	14.								
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIX-14-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXIX-14-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	H	$CH_3$	F	ОН
XXIX-14-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	H	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXIX-14-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )	Et	Н	$CH_3$	F	OH
				2					
XXIX-14-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH₂Ph	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-14-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
				yl					
XXIX-14-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
				3					

Et

Η

 $CH_3$ 

OH

Η

Tr. 1.1	1 - 32	VIV	1 5	
l ahi	le X	XIX	- 17	١

XXIX-14-8

<sup>t</sup>Bu

No No		R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIX-15-1	Ph	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXIX-15-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-15-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-15-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-15-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	$\text{CH}_3$	F	ОН
XXIX-15-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-15-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-15-8	Ph	*	Н	*	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## 5 Table XXIX-16.

Table AAI	1-10.								
№	$R^1$	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIX-16-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXIX-16-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-16-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-16-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-16-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-16-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-16-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-16-8	p-Me-Ph	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

2983472-1

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIX-17.									
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	$R^5$	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIX-17-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXIX-17-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-17-3	p-F <b>-</b> Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-17-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-17-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-17-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-17-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-17-8	p-F-Ph	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	XXIX-18.
No	$R^1$

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIX-18-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXIX-18-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-18-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-18-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-18-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-18-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-18-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-18-8	p-Cl-Ph	*	H	*	Et	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXIX-19. 5

Nº	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIX-19-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXIX-19-2	p-Br-Ph	Η	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-19-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-19-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-19-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-19-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-19-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-19-8	p-Br-Ph	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIX-20.  No $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$									
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIX-20-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXIX-20-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-20-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-20-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-20-5	p-I-Ph	Н	Н	CH₂Ph	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-20-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-20-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-20-8	p-I-Ph	*	Н	*	Et	Н	$CH_3$	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIX-21
---------------

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIX-21-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXIX-21-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-21-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXIX-21-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-21-5	$CH_3$	Н	Н	CH₂Ph	'Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-21-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-21-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-21-8	$CH_3$	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# 5 Table XXIX-22.

No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIX-22-1	Et	Н	Н	Н	'Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXIX-22-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-22-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-22-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-22-5	Et	Н	Н	CH₂Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	$\mathrm{CH}_3$	F	OH
XXIX-22-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-22-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-22-8	Et	*	Н	*	'Pr	Н	$CH_3$	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	XXIX-23	
I abic	7X7X17X-4J	

Nº	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIX-23-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	'Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXIX-23-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-23-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-23-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-23-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-23-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-23-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-23-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## Table XXIX-24.

No		R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIX-24-1					<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
							CH <sub>3</sub>		
XXIX-24-2							_		
XXIX-24-3							CH <sub>3</sub>		
XXIX-24-4	'Bu	H	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXIX-24-5	'Bu	Н	Н	CH₂Ph	'Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXIX-24-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-24-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-24-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXIX-25. 5

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIX-25-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXIX-25-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-25-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-25-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-25-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-25-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-25-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-25-8	Ph	*	Н	*	'Pr	Н	$CH_3$	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	XXIX-	-26.

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIX-26-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXIX-26-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-26-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-26-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Η	$CH_3$	F	OH
XXIX-26-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-26-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-26-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-26-8	p-Me-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIX-27

Table XXIX									
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIX-27-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXIX-27-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Η	$CH_3$	F	OH
XXIX-27-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-27-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-27-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-27-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-27-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	H	$CH_3$	F	ОН
XXIX-27-8	p-F-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## 5 Table XXIX-28.

Table AAIA									
No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIX-28-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXIX-28-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH,
XXIX-28-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-28-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXIX-28-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-28-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-28-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-28-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	$\text{CH}_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>36</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIX-29.											
№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y		
XXIX-29-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH		
XXIX-29-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	Н	$CH_3$	F	OH		
XXIX-29-3	p-Br-Ph	Н	H	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH		
XXIX-29-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	$CH_3$	F	OH		
XXIX-29-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH		
XXIX-29-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH		
XXIX-29-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН		
XXIX-29-8	p-Br-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIX-30. $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$												
Nº	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y			
XXIX-30-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН			
XXIX-30-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	H	$CH_3$	F	OH			
XXIX-30-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH			
XXIX-30-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	OH			
XXIX-30-5	p-I-Ph	Н	Н	CH₂Ph	'Pr	Н	$CH_3$	F	ОН			
XXIX-30-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	$CH_3$	F	ОН			
XXIX-30-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	H	$CH_3$	F	ОН			
XXIX-30-8	p-I-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	H	$CH_3$	F	OH			

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXIX-31. 5

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIX-31-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXIX-31-2	$CH_3$	H	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-31-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-31-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-31-5	$CH_3$	Н	Н	CH₂Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	·F	OH
XXIX-31-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-31-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-31-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIX-32. $R^1$ $R^2$ $R^{3a}$ $R^{3b}$ $R^4$ $R^5$ $R^6$ $X$ $Y$												
No	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y			
XXIX-32-1	Et	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH			
XXIX-32-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	OH			
XXIX-32-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	$\mathrm{CH}_3$	F	OH			
XXIX-32-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH			
XXIX-32-5	Et	Н	Н	CH₂Ph	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH			
XXIX-32-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH			
XXIX-32-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<i>"</i> Bu	Н	$CH_3$	F	OH			
XXIX-32-8	Et	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	OH			

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

No No		R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIX-33-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXIX-33-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-33-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-33-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	H	$CH_3$	F	OH
XXIX-33-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-33-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXIX-33-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-33-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXIX-34. 5

Nº	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIX-34-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXIX-34-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-34-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-34-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-34-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-34-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-34-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-34-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tabl	۱.	7777	T 📆 7	25
1 ani	le.	XX	ıx.	- 17

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIX-35-1	Ph	Н	Н	Н	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXIX-35-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-35-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-35-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-35-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXIX-35-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXIX-35-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXIX-35-8	Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## Table XXIX-36.

	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIX-36-1							CH <sub>3</sub>		
XXIX-36-2	-						CH <sub>3</sub>		
	•			CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>					
XXIX-36-4	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXIX-36-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXIX-36-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXIX-36-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-36-8	p-Me-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## Table XXIX-37.

3.0	51	<b>5</b> 2	73.30	3h	-4	-5	-6		<del></del>
No	K.	K²	K <sup>3</sup>	R	R"	R <sup>3</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIX-37-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXIX-37-2	p-F-Ph	H	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-37-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-37-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXIX-37-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-37-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-37-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-37-8	p-F-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tabl	1 .	3737	T 3 7	20
เฉก	9	x x	1 X -	- 4 X
I au		ZXZX.	128	

No॒	$\mathbb{R}^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIX-38-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXIX-38-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-38-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-38-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-38-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-38-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-38-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-38-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# Table XXIX-39.

No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIX-39-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXIX-39-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-39-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	$\text{CH}_3$	F	ОН
XXIX-39-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-39-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-39-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-39-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-39-8	p-Br-Ph	*	Н	*	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# 5 Table XXIX-40.

№	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIX-40-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXIX-40-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-40-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-40-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-40-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXIX-40-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-40-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-40-8	p-I-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXIX-41
---------------

№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIX-41-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXIX-41-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-41-3	$CH_3$	H	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-41-4	$CH_3$	H	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	H	$CH_3$	F	OH
XXIX-41-5	$CH_3$	H	H	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-41-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-41-7	$CH_3$	H	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-41-8	$CH_3$	*	Н	*	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## Table XXIX-42.

No	$\mathbb{R}^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIX-42-1	Et	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXIX-42-2	Et	Н	H	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXIX-42-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-42-4	Et	Н	H	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-42-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-42-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-42-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-42-8	Et	*	Н	*	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# 5 Table XXIX-43.

No No	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIX-43-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXIX-43-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-43-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-43-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-43-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-43-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-43-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ФФІ
XXIX-43-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	XXIX-44	
Iaulo	$\Delta \Delta I \Delta$	

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIX-44-1	'Bu	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXIX-44-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$\text{CH}_3$	F	ОН
XXIX-44-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	H	$CH_3$	F	ОН
XXIX-44-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-44-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-44-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	H	$CH_3$	F	ОН
XXIX-44-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-44-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## Table XXIX-45.

		V	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R*	R³	$R^6$	X	Y
XXIX-45-1	Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXIX-45-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-45-3	Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	H	$CH_3$	F	ОН
XXIX-45-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-45-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-45-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-45-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXIX-45-8	Ph	*	Н	*	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# 5 Table XXIX-46.

No	R <sup>1</sup>	$\mathbb{R}^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIX-46-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXIX-46-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-46-3	p-Me-Ph	H	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-46-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	H	$CH_3$	F	OH
XXIX-46-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-46-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-46-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-46-8	p-Me-Ph	*	Н	*	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	XX	LX-47	7.
-------	----	-------	----

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIX-47-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	ОН
XXIX-47-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-47-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-47-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-47-5	p-F-Ph	Η	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-47-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-47-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-47-8	p-F-Ph	*	Н	*	Bz	Н	$CH_3$	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## Table XXIX-48.

1 4010 212112									
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIX-48-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXIX-48-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-48-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-48-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-48-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-48-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-48-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-48-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	Bz	Н	$\mathrm{CH}_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXIX-49. 5

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIX-49-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXIX-49-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-49-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-49-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-49-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-49-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-49-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-49-8	p-Br-Ph	*	Н	*	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tak	ما	VV	$\mathbf{v}$	-50	١
1211		$\Delta \Delta$	_ ^ -		١.

14010 717117									
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R۶	R <sup>6</sup>	X	Y
XXIX-50-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	CH <sub>3</sub>	F	OH
XXIX-50-2	p-I-Ph	Η	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	H	$CH_3$	F	ОН
XXIX-50-3	p-I-Ph	H	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	H	$CH_3$	F	OH
XXIX-50-4	p-I-Ph	H	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-50-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-50-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН
XXIX-50-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	$CH_3$	F	OH
XXIX-50-8	p-I-Ph	*	Н	*	Bz	Н	$CH_3$	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

XXX

5

Table AA									
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXX-1-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	OH
XXX-1-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	H	OH
XXX-1-3	$\mathrm{CH}_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	ОН
XXX-1-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	ОН
XXX-1-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	Н	OH
XXX-1-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	Н	OH
XXX-1-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	ОН
XXX-1-8	$CH_3$	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	Н	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

2983472-1

Tabl	le.	XXX-2
1 (11)		/\/\\\~~.

No	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXX-2-1	Et	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН
XXX-2-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	ОН
XXX-2-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	ОН
XXX-2-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	ОН
XXX-2-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН
XXX-2-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН
XXX-2-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН
XXX-2-8	Et	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	Н	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## Table XXX-3.

Table AA									
№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXX-3-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	OH
XXX-3-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Η	OH
XXX-3-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	OH
XXX-3-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	OH
XXX-3-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	Н	OH
XXX-3-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	Н	OH
XXX-3-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	OH
XXX-3-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	Н	ОH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# 5 Table XXX-4.

No	R¹	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXX-4-1	'Bu	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	OH
XXX-4-2	'Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	ОН
XXX-4-3	'Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН
XXX-4-4	'Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	OH
XXX-4-5	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	OH
XXX-4-6	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	CH <sub>3</sub>	Η	F	Н	OH
XXX-4-7	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	OH
XXX-4-8	'Bu	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	Н	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tak	le	YYY 5
1 41	"	$\Delta \Delta \Delta = 0$ .

WO 2008/121634 No. 60137.0034WOU1

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXX-5-1	Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН
XXX-5-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН
XXX-5-3	Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	OH
XXX-5-4	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	ОН
XXX-5-5	Ph	Н	Н	CH₂Ph	$CH_3$	Н	F	Н	OH
XXX-5-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	Н	ОН
XXX-5-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	ОН
XXX-5-8	Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## Table XXX-6.

No No	R <sup>1</sup>	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXX-6-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН
XXX-6-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН
XXX-6-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	ОН
XXX-6-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	ОН
XXX-6-5	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2Ph$	$CH_3$	Н	F	Н	ОН
XXX-6-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	Н	ОН
XXX-6-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	ОН
XXX-6-8	p-Me-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# 5 Table XXX-7.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXX-7-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН
XXX-7-2	p-F-Ph	H	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	H	OH
XXX-7-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	OH
XXX-7-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	ОН
XXX-7-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	H	F	Н	OH
XXX-7-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН
XXX-7-8	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	ОН
XXX-7-20	p-F-Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$T_{\alpha}$	L 1	_	$\mathbf{v}$	v	v	0
Ta	UJ	ı	$\Delta$	Λ	Λ.	-0.

№		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXX-8-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН
XXX-8-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН
XXX-8-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	ОН
XXX-8-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН
XXX-8-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	Н	OH
XXX-8-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	Н	ОН
XXX-8-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	ОН
XXX-8-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table AAA									
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXX-9-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	OH
XXX-9-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	OH
XXX-9-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Η	F	Н	OH
XXX-9-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	ОН
XXX-9-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	Н	OH
XXX-9-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	Н	ОН
XXX-9-8	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН
XXX-9-20	p-Br-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXX-10. 5

14010 72747	71	<b>D</b> 2	T 3a	To 3h	D4	70.5	ъ6	37	* 7
No	K'	K*	K <sup>3</sup>	R	R <sup>4</sup>	K°	K°	X	Y
XXX-10-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН
XXX-10-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	ОН
XXX-10-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	Н	ОН
XXX-10-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	Н	F	Н	ОН
XXX-10-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	Н	ОН
XXX-10-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	CH <sub>3</sub>	Н	F	H	ОН
XXX-10-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	Н	OH
XXX-10-8	p-I-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tal	h	ےا	V	V٦	₹_	1	1	
1 a	ועו	C	$\Lambda$	$\Delta Z$	7-	1	1	

1 4010 11111									
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXX-11-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	OH
XXX-11-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН
XXX-11-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	OH
XXX-11-4	CH <sub>3</sub>	Н	H	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	ОН
XXX-11-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	Н	ОН
XXX-11-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	H	ОН
XXX-11-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН
XXX-11-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	Et	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table MAY									
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXX-12-1	Et	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	OH
XXX-12-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН
XXX-12-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	H	ОН
XXX-12-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	ОН
XXX-12-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	Н	ОН
XXX-12-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	Н	OH
XXX-12-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	OH
XXX-12-8	Et	*	Н	*	Et	Н	F	Н	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXX-13. 5

14010 71212									
Nº	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXX-13-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	OH
XXX-13-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	OH
XXX-13-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	OH
XXX-13-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	OH
XXX-13-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	Н	OH
XXX-13-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	Н	ОН
XXX-13-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	H	ОН
XXX-13-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Et	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

7	Гa	h	۵	Y	$\mathbf{v}$	X-	.1	4
- 1	ıa	IJ.	ıc	$\Lambda$	Λ	Λ.	- 1	4.

14010 717171 1	. 1.								
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXX-14-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	OH
XXX-14-2	<sup>t</sup> Bu	H	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН
XXX-14-3	'Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	ОН
XXX-14-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	ОН
XXX-14-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH₂Ph	Et	Н	F	Н	ОН
XXX-14-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	Н	ОН
XXX-14-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН
XXX-14-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Et	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## Table XXX-15.

14010 71717									
No	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R⁴	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXX-15-1	Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	OH
XXX-15-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН
XXX-15-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	OH
XXX-15-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	ОН
XXX-15-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	Н	ОН
XXX-15-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	Н	ОН
XXX-15-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН
XXX-15-8	Ph	*	Н	*	Et	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXX-16. 5

1 4010 71717									
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXX-16-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	OH
XXX-16-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН
XXX-16-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	ОН
XXX-16-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	ОН
XXX-16-5	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2Ph$	Et	Н	F	Н	ОН
XXX-16-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	Н	ОН
XXX-16-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН
XXX-16-8	p-Me-Ph	*	Н	*	Et	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

7T 1 1	373737	17
Lable	XXX-	17.

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXX-17-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	ОН
XXX-17-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН
XXX-17-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	ОН
XXX-17-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	ОН
XXX-17-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	Н	ОН
XXX-17-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	Н	ОН
XXX-17-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	OH
XXX-17-8	p-F-Ph	*	Н	*	Et	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table XXX-18.

1 4010 74747									
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXX-18-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	ОН
XXX-18-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН
XXX-18-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	ОН
XXX-18-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	OH
XXX-18-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	Н	OH
XXX-18-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	Н	OH
XXX-18-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	OH
XXX-18-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	Et	Н	F	Н	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXX-19. 5

No	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXX-19-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	ОН
XXX-19-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	H	F	Н	ОН
XXX-19-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	OH
XXX-19-4	p-Br-Ph	Н	H	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	ОН
XXX-19-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH₂Ph	Et	Н	F	Н	ОН
XXX-19-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	Н	OH
XXX-19-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	H	F	H	ОН
XXX-19-8	p-Br-Ph	*	Н	*	Et	Н	F	Н	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXX-20.											
№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y		
XXX-20-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	Н	OH		
XXX-20-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	Н	ОН		
XXX-20-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	Н	ОН		
XXX-20-4	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	F	Н	ОН		
XXX-20-5	p-I-Ph	Н	Н	CH₂Ph	Et	Н	F	Н	OH		

Et H F H OH

XXX-20-6 p-I-Ph H H CH<sub>2</sub>-indol-3-yl Et H F H OH

XXX-20-7 p-I-Ph H H CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub> Et H F H \*

Tabl	حا	XXX-21	
1 an		ΛΛΛ <del>-</del> ΖΙ	

XXX-20-8 p-I-Ph \*

No No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXX-21-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH
XXX-21-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	H	F	Н	OH
XXX-21-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXX-21-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$^{i}$ Pr	Н	F	Н	ОН
XXX-21-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXX-21-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH
XXX-21-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXX-21-8	$CH_3$	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXX-22. 5

14010 11111		, 							
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXX-22-1	Et	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXX-22-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXX-22-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXX-22-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXX-22-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXX-22-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH
XXX-22-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$^{i}$ Pr	Н	F	Н	ОН
XXX-22-8	Et	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tab	le	XXX-23.

№	$R^1$	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXX-23-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH
XXX-23-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXX-23-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXX-23-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXX-23-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH₂Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXX-23-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	F	Н	ОН
XXX-23-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXX-23-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## Table XXX-24.

No No		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXX-24-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXX-24-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH
XXX-24-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH
XXX-24-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	F	Н	ОН
XXX-24-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXX-24-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$^{i}$ Pr	Н	F	Н	ОН
XXX-24-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	F	Н	OH
XXX-24-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## 5 Table XXX-25.

14010 71777									
No	$R^1$	$\mathbb{R}^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXX-25-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH
XXX-25-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	H	F	Η	ОН
XXX-25-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH
XXX-25-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$^{i}$ Pr	Н	F	Н	ОН
XXX-25-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH
XXX-25-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH
XXX-25-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	F	Н	OH
XXX-25-8	Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tal	bl	e	$X^{x}$	$\langle \rangle$	ζ-	20	5	

No	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXX-26-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXX-26-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	H	F	Н	OH
XXX-26-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH
XXX-26-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$^{i}$ Pr	Н	F	Н	OH
XXX-26-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH₂Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH
XXX-26-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH
XXX-26-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH
XXX-26-8	p-Me-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	H	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table XXX-27.

Nº	$\frac{R^1}{R^1}$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXX-27-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXX-27-2	p-F-Ph	Н	H	CH <sub>3</sub>	$^{i}$ Pr	Н	F	H	ОН
XXX-27-3	p-F-Ph	Н	H	$CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	F	H	OH
XXX-27-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	F	Н	OH
XXX-27-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	F	Н	OH
XXX-27-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	H	OH
XXX-27-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXX-27-8	p-F-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	H	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXX-28. 5

14516 11111 201									
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXX-28-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH
XXX-28-2	p-Cl-Ph	Н	H	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	H	OH
XXX-28-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH
XXX-28-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXX-28-5	p-Cl-Ph	H	H	CH₂Ph	'Pr	Н	F	Н	OH
XXX-28-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH
XXX-28-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH
XXX-28-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$T_{\alpha}$	۱.	XXX-29.
Tau.	ιc	$\Lambda\Lambda\Lambda^{-29}$ .

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXX-29-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	'Pr	Н	F	Н	OH
XXX-29-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	Н	F	Н	ОН
XXX-29-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXX-29-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXX-29-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН
XXX-29-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	H	F	Н	ОН
XXX-29-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	H	F	Н	ОН
XXX-29-8	p-Br-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table XXX-30.

№	R <sup>1</sup>	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXX-30-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH
XXX-30-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH
XXX-30-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$^{i}$ Pr	Н	F	Н	ОН
XXX-30-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	Н	OH
XXX-30-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$^{i}$ Pr	Н	F	Н	OH
XXX-30-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	F	Н	OH
XXX-30-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	F	Н	OH
XXX-30-8	p-I-Ph	*	Н	*	'Pr	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXX-31. 5

14010 1 1 1 1 1 1									
$\mathcal{N}_{\overline{0}}$	$R^1$	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXX-31-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН
XXX-31-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	OH
XXX-31-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН
XXX-31-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXX-31-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	H	F	Н	OH
XXX-31-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXX-31-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН
XXX-31-8	$CH_3$	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

T-1.	1 .	XX	7.7	22
ıяr	ne.	$\mathbf{x}$	Α.	- 7 /

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXX-32-1	Et	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН
XXX-32-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXX-32-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH
XXX-32-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXX-32-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXX-32-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXX-32-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXX-32-8	Et	*	Н	*	"Bu	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table XXX-33.

No	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXX-33-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXX-33-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXX-33-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH
XXX-33-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	Н	OH
XXX-33-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	F	Н	OH
XXX-33-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	Н	OH
XXX-33-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	OH
XXX-33-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	"Bu	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXX-34. 5

Nº	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXX-34-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН
XXX-34-2	'Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	OH
XXX-34-3	'Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	Н	OH
XXX-34-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXX-34-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	F	Н	OH
XXX-34-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	Н	OH
XXX-34-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXX-34-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	"Bu	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

П	г~	L	۱.	V	v	v	^ ^	4	•
	14	n	ю.	$\Delta$	А	А	- 7	-	١.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXX-35-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH
XXX-35-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	OH
XXX-35-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	H	F	Н	OH
XXX-35-4	Ph	Η	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН
XXX-35-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	H	F	Н	ОН
XXX-35-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	H	F	Н	OH
XXX-35-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	OH
XXX-35-8	Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## Table XXX-36.

14010 71717 50.									
№	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXX-36-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH
XXX-36-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	OH
XXX-36-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	Н	OH
XXX-36-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH
XXX-36-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН
XXX-36-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXX-36-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXX-36-8	p-Me-Ph	*	Н	*	"Bu	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table XXX-37.

No	$\mathbb{R}^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXX-37-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH
XXX-37-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	OH
XXX-37-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXX-37-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	H	F	Н	ОН
XXX-37-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXX-37-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXX-37-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН
XXX-37-8	p-F-Ph	*	Н	*	"Bu	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$T_{\alpha}$	۱,	VVV	-38
Tabl	ı	XXX	-ാര.

№	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXX-38-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH
XXX-38-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXX-38-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXX-38-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	OH
XXX-38-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН
XXX-38-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	F	H	ОН
XXX-38-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXX-38-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	"Bu	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table XXX-39.

Table AAA-57.									
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXX-39-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН
XXX-39-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXX-39-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXX-39-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Η	F	Н	ОН
XXX-39-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXX-39-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXX-39-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXX-39-8	p-Br-Ph	*	Н	*	"Bu	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## 5 Table XXX-40.

No	R¹	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXX-40-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	Н	ОН
XXX-40-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXX-40-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXX-40-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXX-40-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXX-40-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXX-40-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	Н	ОН
XXX-40-8	p-I-Ph	*	Н	*	"Bu	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	VVV	1	
1 able	XXX-4	1	

14010 1 1111	*								
No	$R^1$	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R³	Rº	X	Y
XXX-41-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	ОН
XXX-41-2	$CH_3$	H	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН
XXX-41-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН
XXX-41-4	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН
XXX-41-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	Н	ОН
XXX-41-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	Н	ОН
XXX-41-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН
XXX-41-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	Bz	Н	F	Н	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

1 dole XXX-42.										
№	$\mathbb{R}^1$	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	
XXX-42-1	Et	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	OH	
XXX-42-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	OH	
XXX-42-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	OH	
XXX-42-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	OH	
XXX-42-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	Н	OH	
XXX-42-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	Н	OH	
XXX-42-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН	
XXX-42-8	Et	*	Н	*	Bz	Н	F	Н	OH	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table XXX-43.

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXX-43-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	ОН
XXX-43-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	OH
XXX-43-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	H	F	Н	OH
XXX-43-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	OH
XXX-43-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	Н	OH
XXX-43-6	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	Н	ОН
XXX-43-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ФР
XXX-43-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Bz	H	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tabl	ما	XXX-44.
1 (41)		AAA*++.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXX-44-1	'Bu	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	OH
XXX-44-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН
XXX-44-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Η	ОН
XXX-44-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН
XXX-44-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	Н	ОН
XXX-44-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	Н	ОН
XXX-44-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН
XXX-44-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Bz	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## Table XXX-45.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXX-45-1	Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	OH
XXX-45-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН
XXX-45-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН
XXX-45-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН
XXX-45-5	Ph	Н	Н	$CH_2Ph$	Bz	Н	F	Н	OH
XXX-45-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	Н	ОН
XXX-45-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН
XXX-45-8	Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	Н	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXX-46 5

Table AAA									
Nº	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXX-46-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	ОН
XXX-46-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН
XXX-46-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН
XXX-46-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН
XXX-46-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	Н	ОН
XXX-46-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	Н	ОН
XXX-46-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН
XXX-46-8	p-Me-Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tal. 1.	VVV 1	7
rabie	XXX-47	١.

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXX-47-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	ОН
XXX-47-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН
XXX-47-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН
XXX-47-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН
XXX-47-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	Н	ОН
XXX-47-6	p-F-Ph	H	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	Н	ОН
XXX-47-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН
XXX-47-8	p-F-Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	Н	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table XXX-48.

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXX-48-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	ОН
XXX-48-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН
XXX-48-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	OH
XXX-48-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН
XXX-48-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	Н	ОН
XXX-48-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	Н	OH
XXX-48-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН
XXX-48-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## 5 Table XXX-49.

№	$R^1$	$\mathbb{R}^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXX-49-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	OH
XXX-49-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН
XXX-49-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Η	OH
XXX-49-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	OH
XXX-49-5	p-Br-Ph	H	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	Н	OH
XXX-49-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	Н	OH
XXX-49-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH₂CH₂SCH₃	Bz	Н	F	Н	OH
XXX-49-8	p-Br-Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

7	$\Gamma_{\alpha} h$	le.	Y	VV	_5	n
	11111		$\Delta$	へへ	- )	ι.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXX-50-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	Н	OH
XXX-50-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН
XXX-50-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН
XXX-50-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	Н	ОН
XXX-50-5	p-I-Ph	Н	Н	CH₂Ph	Bz	Н	F	Н	OH
XXX-50-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	Н	ОН
XXX-50-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	Н	ОН
XXX-50-8	p-I-Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	Н	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$$R^{3a} \xrightarrow{R^2} O \\ OR^1 \qquad R^{5WW} \\ N \xrightarrow{R^6} NH_2$$

5

XXXI

٦	Γ <sub>~</sub>	L	٦	XXXI-1.	
-	ıа	D	ı	$\Delta \Delta \Delta I^{-1}$ .	

Table XXX									
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXI-1-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	OH
XXXI-1-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXXI-1-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXXI-1-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXXI-1-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXXI-1-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXXI-1-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXXI-1-8	$CH_3$	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXXI	-/

№	R¹	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXI-2-1	Et	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	OH
XXXI-2-2	Et	Н	H	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXXI-2-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXXI-2-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXXI-2-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXXI-2-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXXI-2-7	Et	Н	Н	CH₂CH₂SCH₃	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXXI-2-8	Et	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

14010 71717									
№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXI-3-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	OH
XXXI-3-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXXI-3-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXXI-3-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXXI-3-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXXI-3-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXXI-3-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXXI-3-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXXI-4. 5

N₂	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXI-4-1	'Bu	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	OH
XXXI-4-2	'Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXXI-4-3	'Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXXI-4-4	'Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXXI-4-5	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXXI-4-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXXI-4-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXXI-4-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tabla	VVVI	-
Table	XXXI-	٠),

No	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXI-5-1	Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН
XXXI-5-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXXI-5-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXXI-5-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Η	F	F	ОН
XXXI-5-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Η	F	F	ОН
<b>XXXI-5-6</b>	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXXI-5-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXXI-5-8	Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

<u>No</u>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXI-6-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН
XXXI-6-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXXI-6-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXXI-6-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН
XXXI-6-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXXI-6-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXXI-6-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН
XXXI-6-8	p-Me-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table XXXI-7

Taule AAA									
№	R¹	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXI-7-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН
XXXI-7-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXXI-7-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXXI-7-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXXI-7-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXXI-7-7	p-F-Ph	Н	H	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXXI-7-8	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXXI-7-20	p-F-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

OD 1 1		XXX	
าวก	0	$\mathbf{x} \mathbf{x} \mathbf{x}$	$_{-x}$
10.17		/ / / / /	т.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXI-8-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	OH
XXXI-8-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXXI-8-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXXI-8-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXXI-8-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXXI-8-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXXI-8-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXXI-8-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

No No	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXI-9-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	OH
XXXI-9-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXXI-9-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXXI-9-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXXI-9-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXXI-9-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXXI-9-8	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXXI-9-20	p-Br-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXXI-10. 5

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXI-10-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	OH
XXXI-10-2	p-I-Ph	Н	H	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXXI-10-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	OH
XXXI-10-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXXI-10-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXXI-10-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXXI-10-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	F	F	ОН
XXXI-10-8	p-I-Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	XXX	1-1	ı
1 41111	$\Delta \Delta \Delta \Delta$		

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXI-11-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	ОН
XXXI-11-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Η	F	F	OH
XXXI-11-3	$CH_3$	Η	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	F	F	ОН
XXXI-11-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	F	F	ОН
XXXI-11-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	F	OH
XXXI-11-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	F	OH
XXXI-11-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	OH
XXXI-11-8	$CH_3$	*	Н	*	Et	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table XXXI-12.

I auto XXX									
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXI-12-1	Et	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	OH
XXXI-12-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	OH
XXXI-12-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	OH
XXXI-12-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	OH
XXXI-12-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	F	ОН
XXXI-12-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	F	ОН
XXXI-12-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН
XXXI-12-8	Et	*	Н	*	Et	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# 5 Table XXXI-13.

№	R¹	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXI-13-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	ОН
XXXI-13-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН
XXXI-13-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	OH
XXXI-13-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	OH
XXXI-13-5	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	F	OH
XXXI-13-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	F	OH
XXXI-13-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН
XXXI-13-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Et	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tah	le	XXXI-	14
Tau	ľ	$\Delta M = 1$	ıт.

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXI-14-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	OH
XXXI-14-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	OH
XXXI-14-3	<sup>t</sup> Bu	Н	H	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	OH
XXXI-14-4	<sup>t</sup> Bu	H	H	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	OH
XXXI-14-5	<sup>t</sup> Bu	H	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	F	OH
XXXI-14-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	F	OH
XXXI-14-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	OH
XXXI-14-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Et	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tabl	ما	YYYI	_1	5
1 4 1 7 1		$\Delta \Delta \Delta \Delta \Delta I$		.,

Table AAA									
No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXI-15-1	Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	OH
XXXI-15-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	OH
XXXI-15-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	ОН
XXXI-15-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	ОН
XXXI-15-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	F	ОН
XXXI-15-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	F	OH
XXXI-15-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	OH
XXXI-15-8	Ph	*	Н	*	Et	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## 5 Table XXXI-16.

№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXI-16-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	ОН
XXXI-16-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН
XXXI-16-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	ОН
XXXI-16-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	ОН
XXXI-16-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	F	ОН
XXXI-16-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	F	ОН
XXXI-16-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН
XXXI-16-8	p-Me-Ph	*	Н	*	Et	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

1	Га1	hl	6	X	X	Χl	_1	7	•
	1			$^{\Lambda}$	$^{\prime}$	$\Delta$	-	•	

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXI-17-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	OH
XXXI-17-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	OH
XXXI-17-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	OH
XXXI-17-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	OH
XXXI-17-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	F	OH
XXXI-17-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	$\mathbf{F}^{-1}$	F	OH
XXXI-17-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН
XXXI-17-8	p-F-Ph	*	Н	*	Et	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table XXXI-18.

Table AAA									
No	$R^1$	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXI-18-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	ОН
XXXI-18-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	OH
XXXI-18-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	ОН
XXXI-18-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	ОН
XXXI-18-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	F	ОН
XXXI-18-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	F	ОН
XXXI-18-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН
XXXI-18-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	Et	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## 5 Table XXXI-19.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXXI-19-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	OH
XXXI-19-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	ОН
XXXI-19-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	ОН
XXXI-19-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	ОН
XXXI-19-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	F	ОН
XXXI-19-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	F	ОН
XXXI-19-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	OH
XXXI-19-8	p-Br-Ph	*	Н	*	Et	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

T-1	_ 1	_	$\mathbf{v}$	$\sigma$	ZΥ	ำ	Λ	
Tal	D	le	$\Delta \lambda$	\./	M	-2	U	١.

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$ .	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXI-20-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	F	F	OH
XXXI-20-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	OH
XXXI-20-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	OH
XXXI-20-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	F	F	OH
XXXI-20-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	F	F	OH
XXXI-20-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	F	F	ОН
XXXI-20-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	F	F	OH
XXXI-20-8	p-I-Ph	*	Н	*	Et	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table XXXI-21.

14010 717171									
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXI-21-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXXI-21-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXXI-21-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXXI-21-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXXI-21-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	F	F	ОН
XXXI-21-6	$CH_3$	Н	$\mathbf{H}$	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXXI-21-7	$CH_3$	Н	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXXI-21-8	$CH_3$	*	Н	*	'Pr	Н	F	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXXI-22. 5

№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXXI-22-1	Et	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXXI-22-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXXI-22-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXXI-22-4	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$^{i}$ Pr	Н	F	F	ОН
XXXI-22-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXXI-22-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXXI-22-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXXI-22-8	Et	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Т	`^`	h	۱۸	V	ZVI	[-23	
- 1	и	וו		$\Lambda$	$\sim$	-2.3	١.

No	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXI-23-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXXI-23-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXXI-23-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	F	F	ОН
XXXI-23-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXXI-23-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXXI-23-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXXI-23-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	F	F	ОН
XXXI-23-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## Table XXXI-24.

No	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXI-24-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXXI-24-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXXI-24-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXXI-24-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXXI-24-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	F	F	ОН
XXXI-24-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXXI-24-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$^{i}$ Pr	Н	F	F	OH
XXXI-24-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## 5 Table XXXI-25.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXI-25-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXXI-25-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXXI-25-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXXI-25-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXXI-25-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXXI-25-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXXI-25-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	F	F	OH
XXXI-25-8	Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table X	XXI	-26.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXI-26-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	'Pr	Н	F	F	OH
XXXI-26-2	p-Me-Ph	Н	Η	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXXI-26-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXXI-26-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXXI-26-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXXI-26-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH
XXXI-26-7	p-Me-Ph	Н	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXXI-26-8	p-Me-Ph	*	Н	*	'Pr	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## Table XXXI-27.

No No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXXI-27-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXXI-27-2	p-F-Ph	Н	H	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXXI-27-3	p-F-Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	'Pr	Н	F	F	OH
XXXI-27-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	F	F	ОН
XXXI-27-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	F	F	ОН
XXXI-27-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	F	F	OH
XXXI-27-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXXI-27-8	p-F-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table XXXI-28.

Table XXXI-28.											
Nº	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y		
XXXI-28-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH		
XXXI-28-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH		
XXXI-28-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH		
XXXI-28-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$^{i}$ Pr	Η	F	F	ОН		
XXXI-28-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH		
XXXI-28-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH		
XXXI-28-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	F	F	OH		
XXXI-28-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	'Pr	Н	F	F	OH		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

`	· ^	ZZZI	777	1 _	٠. 1	т
4	- /.'	ΧI	- X 2	ıe	an	- 1
	-2	$\Delta \Delta I$	$\Delta I$		aυ	- 1

14010 111111									
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXI-29-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	'Pr	Н	F	F	OH
XXXI-29-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXXI-29-3	p-Br-Ph	H	Н	$CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	F	F	ОН
XXXI-29-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXXI-29-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXXI-29-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXXI-29-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH₂CH₂SCH₃	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН
XXXI-29-8	p-Br-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXXI-50.											
№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y		
XXXI-30-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН		
XXXI-30-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH		
XXXI-30-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	OH		
XXXI-30-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН		
XXXI-30-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН		
XXXI-30-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН		
XXXI-30-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	F	F	OH		
XXXI-30-8	p-I-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	F	F	ОН		

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table XXXI-31.

№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXI-31-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	"Bu	Н	F	F	OH
XXXI-31-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	OH
XXXI-31-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	ОН
XXXI-31-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH
XXXI-31-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН
XXXI-31-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH
XXXI-31-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	ОН
XXXI-31-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

T .	11	XXX	
I 2	nie	x	1_4/
ıα	$\omega_{1}$	ZXZXZ	し フム・

14010 1 11 11 11									
№	$\mathbb{R}^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXI-32-1	Et	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН
XXXI-32-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН
XXXI-32-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	ОН
XXXI-32-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН
XXXI-32-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН
XXXI-32-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	F	ОН
XXXI-32-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН
XXXI-32-8	Et	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## Table XXXI-33.

<u>No</u>		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXI-33-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН
XXXI-33-2	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН
XXXI-33-3	$^{i}$ Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН
XXXI-33-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН
XXXI-33-5	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН
XXXI-33-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН
XXXI-33-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	ОН
XXXI-33-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	"Bu	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table XXXI-34.

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXI-34-1	'Bu	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH
XXXI-34-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	ОН
XXXI-34-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	OH
XXXI-34-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	H	F	F	OH
XXXI-34-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH
XXXI-34-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	F	OH
XXXI-34-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH
XXXI-34-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	"Bu	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tal	<b>ل</b> ا	_	VI	r	<i>7</i> T	2	5	
I a	נט	C	$\Lambda I$	\∠	M	-၁	J	٠

No	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXI-35-1	Ph	Н	Н	Н	"Bu	Н	F	F	OH
XXXI-35-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	OH
XXXI-35-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH
XXXI-35-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH
XXXI-35-5	Ph	Н	H	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH
XXXI-35-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	F	OH
XXXI-35-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH
XXXI-35-8	Ph	*	Н	*	"Bu	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table AAAI-30.										
Nº	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	
XXXI-36-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	"Bu	Н	F	F	ОН	
XXXI-36-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	OH	
XXXI-36-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН	
XXXI-36-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH	
XXXI-36-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	F	F	OH	
XXXI-36-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	F	OH	
XXXI-36-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH	
XXXI-36-8	p-Me-Ph	*	Н	*	"Bu	Н	F	F	ОН	

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table XXXI-37.

Table AAA									
Nº	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXXI-37-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	"Bu	Н	F	F	OH
XXXI-37-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	OH
XXXI-37-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	ОН
XXXI-37-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	OH
XXXI-37-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН
XXXI-37-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	F	OH
XXXI-37-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН
XXXI-37-8	p-F-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	H	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

TD - 1. 1	١	3737371	20
Lan	le.	XXXI	I – 1X.

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXXI-38-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH
XXXI-38-2	p-Cl-Ph	H	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	H	F	F	OH
XXXI-38-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	ОН
XXXI-38-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	ОН
XXXI-38-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	F	F	OH
XXXI-38-6	p-Cl-Ph	H	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	F	F	OH
XXXI-38-7	p-Cl-Ph	Н	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	OH
XXXI-38-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	"Bu	H	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## Table XXXI-39.

	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXI-39-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН
XXXI-39-2	p-Br-Ph	Ĥ	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	ОН
XXXI-39-3	p-Br-Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	"Bu	Н	F	F	ОН
XXXI-39-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	ОН
XXXI-39-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	F	F	ОН
XXXI-39-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH
XXXI-39-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	OH
XXXI-39-8	p-Br-Ph	*	Н	*	"Bu	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXXI-40 5

Table AAAI-40.												
Nº	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y			
XXXI-40-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH			
XXXI-40-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	F	F	OH			
XXXI-40-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	ОН			
XXXI-40-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	F	F	ОН			
XXXI-40-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	F	F	ОН			
XXXI-40-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	ОН			
XXXI-40-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	F	F	OH			
XXXI-40-8	p-I-Ph	*	Н	*	"Bu	Н	F	F	OH			

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tala	۱.	VVVI	11
i an	ıe	$\Lambda\Lambda\Lambda$	-41.

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXI-41-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	ОН
XXXI-41-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН
XXXI-41-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	OH
XXXI-41-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	OH
XXXI-41-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	F	ОН
XXXI-41-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	F	ОН
XXXI-41-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН
XXXI-41-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	Bz	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

No.			D3a	R <sup>3b</sup>	D4	D.5	D6	v	Y
No	K	K-	K	K	K	K	K	Λ	ĭ
XXXI-42-1	Et	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	ОН
XXXI-42-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	OH
XXXI-42-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН
XXXI-42-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН
XXXI-42-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	H	F	F	ОН
XXXI-42-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	F	ОН
XXXI-42-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	OH
XXXI-42-8	Et	*	Н	*	Bz	Н	F	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXXI-43. 5

No	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXI-43-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	ОН
XXXI-43-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН
XXXI-43-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН
XXXI-43-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН
XXXI-43-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	F	ОН
XXXI-43-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	F	ОН
XXXI-43-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ФФІ
XXXI-43-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	Bz	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

nn .	1 1	3.7	77	T 77	
1 2	nı	_ X	x	ΧІ	-44.

Nº	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXI-44-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	ОН
XXXI-44-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН
XXXI-44-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН
XXXI-44-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	OH
XXXI-44-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	F	ОН
XXXI-44-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	F	ОН
XXXI-44-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	OH
XXXI-44-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Bz	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Nº		R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXI-45-1	Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	ОН
XXXI-45-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН
XXXI-45-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН
XXXI-45-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН
XXXI-45-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	F	ОН
XXXI-45-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	F	OH
XXXI-45-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	OH
XXXI-45-8	Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## Table XXXI-46.

№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXI-46-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	OH
XXXI-46-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	OH
XXXI-46-3	p-Me-Ph	H	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	OH
XXXI-46-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	OH
XXXI-46-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	F	OH
XXXI-46-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	F	OH
XXXI-46-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	OH
XXXI-46-8	p-Me-Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tabl	~ V	v	VΪ	17
таю	<b>E</b> 1	$\Lambda$	Λŀ	-4/.

No	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXXI-47-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	OH
XXXI-47-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	OH
XXXI-47-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	OH
XXXI-47-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН
XXXI-47-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	F	ОН
XXXI-47-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	F	OH
XXXI-47-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	OH
XXXI-47-8	p-F-Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXI-48-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	ОН
XXXI-48-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН
XXXI-48-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН
XXXI-48-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН
XXXI-48-5	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2Ph$	Bz	Н	F	F	ОН
XXXI-48-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	F	ОН
XXXI-48-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН
XXXI-48-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## 5 Table XXXI-49.

Nõ	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXXI-49-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	OH
XXXI-49-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	OH
XXXI-49-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН
XXXI-49-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН
XXXI-49-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	F	OH
XXXI-49-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	F	ОН
XXXI-49-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН
XXXI-49-8	p-Br-Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

nn 1	1	377	1777	T -	Λ
Tab	10	Y	ХΧ	T_5	0.
i au		_/\_/	$\Delta$	1-2	v.

Nº		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXI-50-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	F	F	OH
XXXI-50-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН
XXXI-50-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	ОН
XXXI-50-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	F	F	OH
XXXI-50-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	F	F	OH
XXXI-50-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	F	F	OH
XXXI-50-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	F	F	ОН
XXXI-50-8	p-I-Ph	*	Н	*	Bz	Н	F	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$$R^{3a} \xrightarrow{R^2} O \\ OR^1 \qquad R^{5} \\ NH_2$$

XXXII

5	Toble	XXXII	1
•	rame	A A A B	

Table AAA									
Nº	R¹	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXXII-1-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН
XXXII-1-2	$CH_3$	Н	H	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXXII-1-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXXII-1-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXXII-1-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXXII-1-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXXII-1-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXXII-1-8	$CH_3$	*	Н	*	$CH_3$	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXXII-2.

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXII-2-1	Et	Н	Н	Н	 CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	OH

№	R <sup>1</sup>	$\mathbb{R}^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXII-2-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	OH
XXXII-2-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXXII-2-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН
XXXII-2-5	Eŧ	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	CH <sub>3</sub>	H	Н	F	OH
XXXII-2-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	CH <sub>3</sub>	H	Н	F	OH
XXXII-2-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН
XXXII-2-8	Et	*	Н	*	$CH_3$	Н	Н	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

_				
Tъ	h	9	XXXI	1_3

№	$R^1$	$\mathbb{R}^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXII-3-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	OH
XXXII-3-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXXII-3-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXXII-3-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXXII-3-5	<sup>i</sup> Pr	H	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXXII-3-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXXII-3-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXXII-3-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	$CH_3$	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# Table XXXII-4.

14010 12121									
No	$R^1$	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXII-4-1	'Bu	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	OH
XXXII-4-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXXII-4-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXXII-4-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXXII-4-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXXII-4-6	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXXII-4-7	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXXII-4-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	$CH_3$	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## Table XXXII-5.

No	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXII-5-1	Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	OH
XXXII-5-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXII-5-3	Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	OH
XXXII-5-4	Ph	Н	H	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	H	F	OH
XXXII-5-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXXII-5-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXXII-5-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	H	F	ОН
XXXII-5-8	Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## Table XXXII-6.

№	R¹	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXII-6-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	OH
XXXII-6-2	p-Me-Ph	H	H	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	H	F	ОН
XXXII-6-3	p-Me-Ph	Н	H	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Η	Н	F	OH
XXXII-6-4	p-Me-Ph	Н	H	$CH_2CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>	H	Н	F	OH
XXXII-6-5	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2Ph$	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	OH
XXXII-6-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXXII-6-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	OH
XXXII-6-8	p-Me-Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# Table XXXII-7.

№	7.1	<b>D</b> 2	ъ 3а	D 3b	D4	<b>D</b> 5	D6	3.7	
Nō	K.	K <sup>2</sup>	K	K**	K'	K <sup>s</sup>	K°	X	Y
XXXII-7-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	OH
XXXII-7-2	p-F-Ph	H	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	H	Н	F	ОН
XXXII-7-3	p-F-Ph	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$CH_3$	H	Н	F	OH
XXXII-7-4	p-F-Ph	H	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXXII-7-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	H	Н	F	OH
XXXII-7-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXXII-7-8	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXXII-7-20	p-F-Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	H	H	F	ОН

<sup>5</sup>  $R^2$  and  $R^{3b}$  joined together by  $(CH_2)_3$  to form five-membered ring.

## Table XXXII-8.

Table AAA	11-0.								
№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXII-8-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	OH
XXXII-8-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	H	Н	F	OH
XXXII-8-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	OH

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXII-8-4	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	OH
XXXII-8-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXXII-8-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	H	F	ОН
XXXII-8-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXXII-8-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## Table XXXII-9.

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXII-9-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН
XXXII-9-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	H	F	ОН
XXXII-9-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	H	Н	F	OH
XXXII-9-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	H	Н	F	ОН
XXXII-9-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXXII-9-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	$CH_3$	Н	H	F	ОН
XXXII-9-8	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXXII-9-20	p-Br-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

# Table XXXII-10.

14010 1111111	1 10.								
№	$\mathbb{R}^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXXII-10-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	ОН
XXXII-10-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXXII-10-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	OH
XXXII-10-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXXII-10-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXXII-10-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	CH <sub>3</sub>	Н	Н	F	OH
XXXII-10-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$CH_3$	Н	Н	F	ОН
XXXII-10-8	p-I-Ph	*	Н	*	$CH_3$	Н	Н	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXXII-11

Table AAAI									
№	$R^1$	$\mathbb{R}^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXXII-11-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	OH
XXXII-11-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	OH
XXXII-11-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	OH
XXXII-11-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	OH

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXXII-11-5	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	Н	F	ОН
XXXII-11-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	Н	F	ОН
XXXII-11-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН
XXXII-11-8	$CH_3$	*	Н	*	Et	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	VVVI	T_1	2
I ame	~ ~ ~ 1		/

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXII-12-1	Et	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	OH
XXXII-12-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН
XXXII-12-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	ОН
XXXII-12-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	ОН
XXXII-12-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	Н	F	ОН
XXXII-12-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	Н	F	ОН
XXXII-12-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН
XXXII-12-8	Et	*	Н	*	Et	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## Table XXXII-13.

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXII-13-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	OH
XXXII-13-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	OH
XXXII-13-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	OH
XXXII-13-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	ОН
XXXII-13-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	Н	F	OH
XXXII-13-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	Н	F	OH
XXXII-13-7	$^{i}$ Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН
XXXII-13-8	$^{i}$ Pr	*	Н	*	Et	Н	Н	F	OH

<sup>5 \*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## Table XXXII-14.

No	R <sup>1</sup>	$\mathbb{R}^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	Y	Y
312		10	10	IC	10	10			<u> </u>
XXXII-14-1	'Bu	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	OH
XXXII-14-2	'Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	OH
XXXII-14-3	'Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	ОН
XXXII-14-4	'Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	ОН
XXXII-14-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	H	F	ОН

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXII-14-6	'Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	Н	F	OH
XXXII-14-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН
XXXII-14-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Et	Н	Н	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

-			-	_
'T'o	ble	XXXI	1 1	4
10	1115	XXXI	-	

Nº	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXII-15-1	Ph	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	OH
XXXII-15-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН
XXXII-15-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	ОН
XXXII-15-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	ОН
XXXII-15-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	Н	F	ОН
<b>XXXII-15-6</b>	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	Н	F	OH
XXXII-15-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН
XXXII-15-8	Ph	*	Н	*	Et	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXXII-16.

No	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXII-16-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	ОН
<b>XXXII-16-2</b>	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	OH
XXXII-16-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	OH
XXXII-16-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	OH
XXXII-16-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	Н	F	ОН
XXXII-16-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	H	Н	F	ОН
XXXII-16-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Ή	F	ОН
<b>XXXII-16-8</b>	p-Me-Ph	*	Н	*	Et	Н	Н	F	ОН

 $<sup>^{*}</sup>$ R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXXII-17.

Table XXXII-17.										
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y	
XXXII-17-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	ОН	
XXXII-17-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН	
XXXII-17-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	ОН	
XXXII-17-4	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Et	Н	Н	F	ОН	
XXXII-17-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	Н	F	ОН	
XXXII-17-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	Н	F	OH	

No	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXII-17-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН
XXXII-17-8	p-F-Ph	*	Н	*	Et	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table	XXXI	1-18
1 41710	$-\Delta \Delta \Delta \Delta L$	1-10-

No	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXII-18-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	OH
XXXII-18-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	OH
XXXII-18-3	p-Cl-Ph	H	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	OH
XXXII-18-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	OH
XXXII-18-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	H	Н	F	OH
XXXII-18-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	Н	F	ОН
XXXII-18-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН
XXXII-18-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	Et	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXXII-19.

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXII-19-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	OH
XXXII-19-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	OH
XXXII-19-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	OH
XXXII-19-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	ОН
XXXII-19-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н	Н	F	ОН
<b>XXXII-19-6</b>	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	Н	F	ОН
XXXII-19-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН
XXXII-19-8	p-Br-Ph	*	Н	*	Et	Н	Н	F	ОН

<sup>5</sup>  $R^2$  and  $R^{3b}$  joined together by  $(CH_2)_3$  to form five-membered ring.

Table XXXII-20.

	Table AAM-20.										
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y		
XXXII-20-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Et	Н	Н	F	OH		
XXXII-20-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Et	Н	Н	F	ОН		
XXXII-20-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	ОН		
XXXII-20-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Et	Н	Н	F	ОН		
XXXII-20-5	p-I-Ph	Н	H	CH₂Ph	Et	Н	Н	F	ОН		
XXXII-20-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Et	Н	Н	F	ОН		
XXXII-20-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Et	Н	H	F	ОН		

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXII-20-8	p-I-Ph	*	Н	*	Et	Н	Н	F	OH

\*R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXXII-21.

№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXII-21-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXXII-21-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXXII-21-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXXII-21-4	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$^{i}$ Pr	Н	Н	F	OH
XXXII-21-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXXII-21-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXXII-21-7	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXXII-21-8	$CH_3$	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXXII-22.

№	R¹	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXII-22-1	Et	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXXII-22-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	H	Н	F	OH
XXXII-22-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXXII-22-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	H	Н	F	OH
XXXII-22-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
<b>XXXII-22-6</b>	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
<b>XXXII-22-7</b>	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXXII-22-8	Et	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH

<sup>5</sup>  $R^2$  and  $R^{36}$  joined together by  $(CH_2)_3$  to form five-membered ring.

Table XXXII-23

Table AAAI									
№	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXXII-23-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	'Pr	Н	Н	F	ОН
XXXII-23-2	<sup>i</sup> Pr	Н	H	CH <sub>3</sub>	'Pr	Н	Н	F	OH
XXXII-23-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXXII-23-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXXII-23-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH₂Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
<b>XXXII-23-6</b>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXXII-23-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXXII-23-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	$^{i}\mathbf{Pr}$	Н	Н	F	ОН

\*R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$\mathbf{T}$	- 1 1	1.	37	777	711	10	4
- 1:2	an.	e	Т.	$\mathbf{A}$	KΠ	- / 4	+

<u>No</u>		R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXII-24-1	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXXII-24-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXXII-24-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$^{i}$ Pr	Н	Н	F	ОН
XXXII-24-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	Н	F	ОН
XXXII-24-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXXII-24-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	'Pr	Н	Н	F	ОН
XXXII-24-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	Н	F	ОН
XXXII-24-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXXII-25.

14010 7171711									
$\mathcal{N}_{\underline{0}}$	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXII-25-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXXII-25-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	H	F	ОН
XXXII-25-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXXII-25-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXXII-25-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXXII-25-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXXII-25-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXXII-25-8	Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH

<sup>5 \*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXXII-26.

No	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXII-26-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	'Pr	Н	Н	F	ОН
XXXII-26-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	Н	Н	F	OH
XXXII-26-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	H	Н	F	OH
XXXII-26-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	'Pr	Н	Н	F	OH
XXXII-26-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	'Pr	Н	Н	F	OH
XXXII-26-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXXII-26-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXXII-26-8	p-Me-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

OC 1 1	1	******	~ ~~
T o b	-	~ ~ ~ 1	1.3.7
1 41)	ıc	XXXI	-2/.

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXII-27-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXXII-27-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXXII-27-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXXII-27-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXXII-27-5	p-F-Ph	Н	Н	CH₂Ph	Pr	Н	Н	F	ОН
XXXII-27-6	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXXII-27-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	Н	F	OH
XXXII-27-8	p-F-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table XXXII-28.

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXII-28-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXXII-28-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXXII-28-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXXII-28-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXXII-28-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXXII-28-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXXII-28-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	$^{i}$ Pr	Н	Н	F	OH
XXXII-28-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table XXXII-29.

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXII-29-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXXII-29-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXXII-29-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	H	Н	F	OH
XXXII-29-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXXII-29-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXXII-29-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	OH
XXXII-29-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	'Pr	Н	Н	F	OH
XXXII-29-8	p-Br-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tabla	VVVII 20	١.
Table	XXXII-30	١.

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXII-30-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXXII-30-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	'Pr	Н	Н	F	ОН
XXXII-30-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXXII-30-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXXII-30-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXXII-30-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXXII-30-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН
XXXII-30-8	p-I-Ph	*	Н	*	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table XXXII-31.

No No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXII-31-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH
XXXII-31-2	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН
XXXII-31-3	$CH_3$	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН
XXXII-31-4	$CH_3$	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН
XXXII-31-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН
<b>XXXII-31-6</b>	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН
<b>XXXII-31-7</b>	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH
XXXII-31-8	$CH_3$	*	Н	*	"Bu	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXXII-32 5

1 4010 7474741.				A1					
№	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXII-32-1	Et	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН
XXXII-32-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	Н	F	ОН
XXXII-32-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	ОН
XXXII-32-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH
XXXII-32-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	Н	F	ОН
XXXII-32-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	Н	F	ОН
<b>XXXII-32-7</b>	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	Н	F	ОН
XXXII-32-8	Et	*	Н	*	"Bu	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXXII-33.

	1 4010 2 12 12 11.										
•	№	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y	

N₂	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXII-33-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН
XXXII-33-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	Н	F	ОН
XXXII-33-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН
XXXII-33-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	ОН
XXXII-33-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН
XXXII-33-6	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН
<b>XXXII-33-7</b>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН
XXXII-33-8	<sup>i</sup> Pr	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

~		-4			 ~ 4
1	'n	ı۱۸	XY	/ V	 2/1
	<b>a</b> .i.	סונ	$\Lambda$	$\sim$	 .)4.

14010 1111111									
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXII-34-1	'Bu	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН
XXXII-34-2	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН
XXXII-34-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH
XXXII-34-4	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	ОН
XXXII-34-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	Н	F	ОН
XXXII-34-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	Н	F	ОН
XXXII-34-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	Н	F	ОН
XXXII-34-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	"Bu	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table XXXII-35.

No	$R^1$	$R^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXII-35-1	Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН
XXXII-35-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	Н	F	ОН
XXXII-35-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	ОН
XXXII-35-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	ОН
XXXII-35-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	Н	F	ОН
XXXII-35-6	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	Н	F	ОН
XXXII-35-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	Н	F	ОН
XXXII-35-8	Ph	*	Н	*	"Bu	Н	Н	F	ОН

<sup>5 \*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tabl	ا ما	$\mathbf{v}\mathbf{v}$	YI	T_2	6
1 (11)		$\Lambda \Lambda$	$\Delta$	17	U.

No	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXII-36-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH
XXXII-36-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH
XXXII-36-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH
XXXII-36-4	p-Me-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	H	F	OH
XXXII-36-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	Н	F	OH
XXXII-36-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	Н	F	OH
XXXII-36-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	Н	Н	F	OH
XXXII-36-8	p-Me-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXXII-37.

N₂	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXXII-37-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН
XXXII-37-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	Н	Н	F	OH
XXXII-37-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН
XXXII-37-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН
XXXII-37-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	Н	F	ОН
<b>XXXII-37-6</b>	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН
<b>XXXII-37-7</b>	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН
XXXII-37-8	p-F-Ph	*	Н	*	"Bu	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

## 5 Table XXXII-38.

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXII-38-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH
XXXII-38-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	H	Н	F	OH
XXXII-38-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН
XXXII-38-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	OH
XXXII-38-5	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН
XXXII-38-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH
XXXII-38-7	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH
XXXII-38-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

1 1		
'T`~ L.	e XXXI	11 20
- i am		11-34

№	R <sup>I</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXII-39-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH
XXXII-39-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН
XXXII-39-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH
XXXII-39-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН
XXXII-39-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	"Bu	Н	Н	F	OH
XXXII-39-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	Н	F	OH
XXXII-39-7	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	"Bu	H	Н	F	OH
XXXII-39-8	p-Br-Ph	*	Н	*	"Bu	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

### Table XXXII-40.

1 4010 7171711									
№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXXII-40-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH
XXXII-40-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	"Bu	H	Н	F	ОН
XXXII-40-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	OH
XXXII-40-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	"Bu	Н	Н	F	ОН
XXXII-40-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	OH
XXXII-40-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	"Bu	Н	Н	F	ОН
XXXII-40-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	<sup>n</sup> Bu	Н	Н	F	ОН
XXXII-40-8	p-I-Ph	*	Н	*	"Bu	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### 5 Table XXXII-41.

№	$R^1$	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXII-41-1	CH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	ОН
XXXII-41-2	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	ОН
XXXII-41-3	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	ОН
XXXII-41-4	CH <sub>3</sub>	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	ОН
XXXII-41-5	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	Н	F	ОН
XXXII-41-6	$CH_3$	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	Н	F	ОН
XXXII-41-7	CH <sub>3</sub>	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH
XXXII-41-8	CH <sub>3</sub>	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

$T_{\alpha}1$	L1~	VVVI	T 42
ı a	nie		1-47

Nº	$R^1$	$\mathbb{R}^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXXII-42-1	Et	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	OH
XXXII-42-2	Et	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH
XXXII-42-3	Et	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	H	Н	F	OH
XXXII-42-4	Et	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	ОН
XXXII-42-5	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	Н	F	ОН
XXXII-42-6	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	Н	F	ОН
XXXII-42-7	Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH
XXXII-42-8	Et	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tabl	~ ~	vv	711	12
rani	$c_{\prime}$	$\Lambda \Lambda I$	NΠ	-42

Taule AAAI									
№	R¹	$\mathbb{R}^2$	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>					Y
XXXII-43-1	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	Н					OH
XXXII-43-2	<sup>i</sup> Pr	Н	Η	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH
XXXII-43-3	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	OH
XXXII-43-4	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	ОН
XXXII-43-5	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	Н	F	OH
<b>XXXII-43-6</b>	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	Н	F	OH
XXXII-43-7	<sup>i</sup> Pr	Н	Н	CH₂CH₂SCH₃	Bz	Н	Н	F	OH
XXXII-43-8	$^{i}$ Pr	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	ОН

10 \*R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXXII-44.

Table AAAI									
Nº	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXII-44-1	'Bu	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	ОН
<b>XXXII-44-2</b>	'Bu	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH
XXXII-44-3	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	ОН
XXXII-44-4	<sup>t</sup> Bu	H	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	OH -
XXXII-44-5	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	H	Н	F	OH
XXXII-44-6	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	Н	F	ОН
XXXII-44-7	<sup>t</sup> Bu	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	ОН
XXXII-44-8	<sup>t</sup> Bu	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXXII-45.

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXII-45-1	Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	OH
XXXII-45-2	Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH
XXXII-45-3	Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	ОН
XXXII-45-4	Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	OH
XXXII-45-5	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	Н	F	ОН
<b>XXXII-45-6</b>	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	Н	F	OH
XXXII-45-7	Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH
XXXII-45-8	Ph	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXXII-46.

14010 7171711	1 10.								
No	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXII-46-1	p-Me-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	OH
XXXII-46-2	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH
XXXII-46-3	p-Me-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	OH
XXXII-46-4	p-Me-Ph	Н	Η	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	H	Н	F	OH
XXXII-46-5	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	Н	F	ОН
XXXII-46-6	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	Н	F	ОН
XXXII-46-7	p-Me-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	ОН
XXXII-46-8	p-Me-Ph	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Table XXXII-47.

No	R¹	R <sup>2</sup>	$R^{3a}$	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXXII-47-1	p-F-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	ОН
XXXII-47-2	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	H	F	OH
XXXII-47-3	p-F-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	OH
XXXII-47-4	p-F-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	OH
XXXII-47-5	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	Н	F	OH
<b>XXXII-47-6</b>	p-F-Ph	Η	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	H	F	OH
XXXII-47-7	p-F-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH
XXXII-47-8	p-F-Ph	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	ОН

<sup>5</sup>  $R^2$  and  $R^{3b}$  joined together by  $(CH_2)_3$  to form five-membered ring.

Table XXXII-48.

No	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXXII-48-1	p-Cl-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	ОН

№	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3a</sup>	$R^{3b}$	$R^4$	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	Y
XXXII-48-2	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	ОН
XXXII-48-3	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	ОН
XXXII-48-4	p-Cl-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	ОН
<b>XXXII-48-5</b>	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	Η	F	ОН
XXXII-48-6	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	Н	F	OH
<b>XXXII-48-7</b>	p-Cl-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	ОН
XXXII-48-8	p-Cl-Ph	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	ОН

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

Tak	l۸	VI	$\mathbf{v}$	ſΤ	49.
Tan	œ	XΣ	N A I		47

№	$\mathbf{p}^1$	$\mathbf{p}^2$	P <sup>3a</sup>	$\mathbf{P}^{3b}$	R <sup>4</sup>	$\mathbf{R}^{5}$	$\mathbf{R}^6$	x	Y
7.45	IX.	1	1/		11		11	<i>7</i> <b>x</b>	
XXXII-49-1	p-Br-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	OH
XXXII-49-2	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	Η	F	OH
XXXII-49-3	p-Br-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	OH
XXXII-49-4	p-Br-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	OH
XXXII-49-5	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	Н	F	ОН
XXXII-49-6	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	Н	F	OH
<b>XXXII-49-7</b>	p-Br-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	H	F	OH
<b>XXXII-49-8</b>	p-Br-Ph	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	OH

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

#### Table XXXII-50.

Table AAAII-30.									
Nº	$R^1$	$R^2$	$R^{3a}$	$R^{3b}$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	$R^6$	X	Y
XXXII-50-1	p-I-Ph	Н	Н	Н	Bz	Н	Н	F	OH
XXXII-50-2	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	OH
XXXII-50-3	p-I-Ph	Н	Н	$CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	OH
XXXII-50-4	p-I-Ph	Н	Н	$CH_2CH(CH_3)_2$	Bz	Н	Н	F	ОН
XXXII-50-5	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Bz	Н	Н	F	OH
XXXII-50-6	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> -indol-3-yl	Bz	Н	Н	F	ОН
XXXII-50-7	p-I-Ph	Н	Н	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Bz	Н	Н	F	ОН
XXXII-50-8	p-I-Ph	*	Н	*	Bz	Н	Н	F	OH

 $<sup>^{*}</sup>$ R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> joined together by (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub> to form five-membered ring.

10

15

20

25

30

#### DOSAGE, ADMINISTRATION, AND USE

A sixth embodiment of the present invention is directed to a composition for the treatment of any of the viral agents disclosed herein said composition comprising a pharmaceutically acceptable medium selected from among an excipient, carrier, diluent, and equivalent medium and a compound, that is intended to include its salts (acid or basic addition salts), hydrates, solvates, and crystalline forms can be obtained, represented by formula I.

It is contemplated that the formulation of the sixth embodiment can contain any of the compounds contemplated in any of the aspects of the first, second, third, fourth, and fifth embodiments or those specifically recited in the tables above or exemplified herein, either alone or in combination with another compound of the present invention.

The compounds of the present invention may be formulated in a wide variety of oral administration dosage forms and carriers. Oral administration can be in the form of tablets, coated tablets, hard and soft gelatin capsules, solutions, emulsions, syrups, or suspensions. Compounds of the present invention are efficacious when administered by suppository administration, among other routes of administration. The most convenient manner of administration is generally oral using a convenient daily dosing regimen which can be adjusted according to the severity of the disease and the patient's response to the antiviral medication.

A compound or compounds of the present invention, as well as their pharmaceutically acceptable salts, together with one or more conventional excipients, carriers, or diluents, may be placed into the form of pharmaceutical compositions and unit dosages. The pharmaceutical compositions and unit dosage forms may be comprised of conventional ingredients in conventional proportions, with or without additional active compounds and the unit dosage forms may contain any suitable effective amount of the active ingredient commensurate with the intended daily dosage range to be employed. The pharmaceutical compositions may be employed as solids, such as tablets or filled capsules, semisolids, powders, sustained release formulations, or liquids such as

WO 2008/121634 Docket No. 60137.0034WOU1

5

10

15

20

25

30

suspensions, emulsions, or filled capsules for oral use; or in the form of suppositories for rectal or vaginal administration. A typical preparation will contain from about 5% to about 95% active compound or compounds (w/w). The term "preparation" or "dosage form" is intended to include both solid and liquid formulations of the active compound and one skilled in the art will appreciate that an active ingredient can exist in different preparations depending on the desired dose and pharmacokinetic parameters.

The term "excipient" as used herein refers to a compound that is used to prepare a pharmaceutical composition, and is generally safe, non-toxic and neither biologically nor otherwise undesirable, and includes excipients that are acceptable for veterinary use as well as human pharmaceutical use. The compounds of this invention can be administered alone but will generally be administered in admixture with one or more suitable pharmaceutical excipients, diluents or carriers selected with regard to the intended route of administration and standard pharmaceutical practice.

A "pharmaceutically acceptable salt" form of an active ingredient may also initially confer a desirable pharmacokinetic property on the active ingredient which were absent in the non-salt form, and may even positively affect the pharmacodynamics of the active ingredient with respect to its therapeutic activity in the body. The phrase "pharmaceutically acceptable salt" of a compound as used herein means a salt that is pharmaceutically acceptable and that possesses the desired pharmacological activity of the parent compound. Such salts include: (1) acid addition salts, formed with inorganic acids such as hydrochloric acid, hydrobromic acid, sulfuric acid, nitric acid, phosphoric acid, and the like; or formed with organic acids such as glycolic acid, pyruvic acid, lactic acid, malonic acid, malic acid, maleic acid, fumaric acid, tartaric acid, citric acid, 3-(4-hydroxybenzoyl)benzoic acid, cinnamic acid, mandelic acid, methanesulfonic acid, ethanesulfonic acid, 1,2-ethane-disulfonic acid, 2hydroxyethanesulfonic acid, benzenesulfonic acid, 4-chlorobenzenesulfonic acid, 2-naphthalenesulfonic acid, 4-toluenesulfonic acid, camphorsulfonic acid, lauryl sulfuric acid, gluconic acid, glutamic acid, salicylic acid, muconic acid, and the like or (2) basic addition salts formed with the conjugate bases of any of

10

15

20

25

30

the inorganic acids listed above, wherein the conjugate bases comprise a cationic component selected from among Na<sup>+</sup>, K<sup>+</sup>, Mg<sup>2+</sup>, Ca<sup>2+</sup>, and NH<sub>g</sub>R<sup>m</sup><sub>4-g</sub><sup>+</sup>, in which R<sup>m</sup> is a C<sub>1-3</sub> alkyl and g is a number selected from among 0, 1, 2, 3, or 4. It should be understood that all references to pharmaceutically acceptable salts include solvent addition forms (solvates) or crystal forms (polymorphs) as defined herein, of the same acid addition salt.

Solid form preparations include powders, tablets, pills, capsules, suppositories, and dispersible granules. A solid carrier may be one or more substances which may also act as diluents, flavoring agents, solubilizers, lubricants, suspending agents, binders, preservatives, tablet disintegrating agents, or an encapsulating material. In powders, the carrier generally is a finely divided solid which is a mixture with the finely divided active component. In tablets, the active component generally is mixed with the carrier having the necessary binding capacity in suitable proportions and compacted in the shape and size desired. Suitable carriers include but are not limited to magnesium carbonate, magnesium stearate, talc, sugar, lactose, pectin, dextrin, starch, gelatin, tragacanth, methylcellulose, sodium carboxymethylcellulose, a low melting wax, cocoa butter, and the like. Solid form preparations may contain, in addition to the active component, colorants, flavors, stabilizers, buffers, artificial and natural sweeteners, dispersants, thickeners, solubilizing agents, and the like.

Liquid formulations also are suitable for oral administration include liquid formulation including emulsions, syrups, elixirs and aqueous suspensions. These include solid form preparations which are intended to be converted to liquid form preparations shortly before use. Emulsions may be prepared in solutions, for example, in aqueous propylene glycol solutions or may contain emulsifying agents such as lecithin, sorbitan monooleate, or acacia. Aqueous suspensions can be prepared by dispersing the finely divided active component in water with viscous material, such as natural or synthetic gums, resins, methylcellulose, sodium carboxymethylcellulose, and other well known suspending agents.

The compounds of the present invention may be formulated for administration as suppositories. A low melting wax, such as a mixture of fatty

10

15

20

25

30

acid glycerides or cocoa butter is first melted and the active component is dispersed homogeneously, for example, by stirring. The molten homogeneous mixture is then poured into convenient sized molds, allowed to cool, and to solidify.

The compounds of the present invention may be formulated for vaginal administration. Pessaries, tampons, creams, gels, pastes, foams or sprays containing in addition to the active ingredient such carriers as are known in the art to be appropriate.

Suitable formulations along with pharmaceutical carriers, diluents and expcipients are described in *Remington: The Science and Practice of Pharmacy* **1995**, edited by E. W. Martin, Mack Publishing Company, 19th edition, Easton, Pennsylvania, which is hereby incorporated by reference. The compounds of the present invention can also be encapsulated in liposomes, such as those disclosed in U.S. Patent Nos. 6,180,134, 5,192,549, 5,376,380, 6,060,080, 6,132,763, each of which is incorporated by reference. A skilled formulation scientist may modify the formulations within the teachings of the specification to provide numerous formulations for a particular route of administration without rendering the compositions of the present invention unstable or compromising their therapeutic activity.

The modification of the present compounds to render them more soluble in water or other vehicle, for example, may be easily accomplished by minor modifications (e.g., salt formulation), which are well within the ordinary skill in the art. It is also well within the ordinary skill of the art to modify the route of administration and dosage regimen of a particular compound in order to manage the pharmacokinetics of the present compounds for maximum beneficial effect in patients.

A seventh embodiment of the present invention is directed to a use of the compound represented by formula I in the manufacture of a medicament for the treatment of any condition the result of an infection by any one of the following viral agents: hepatitis C virus, West Nile virus, yellow fever virus, dengue virus,

I-MAK 1005

5

10

15

25

rhinovirus, polio virus, hepatitis A virus, bovine viral diarrhea virus and Japanese encephalitis virus.

The term "medicament" means a substance used in a method of treatment and/or prophylaxis of a subject in need thereof, wherein the substance includes, but is not limited to, a composition, a formulation, a dosage form, and the like, comprising the compound of formula I. It is contemplated that the compound of the use of the compound represented by formula I in the manufacture of a medicament for the treatment of any of the antiviral conditions disclosed herein of the seventh embodiment can be any of the compounds contemplated in any of the aspects of the first, second, third, fourth, fifth embodiments or those specifically recited in the tables above or exemplified herein, either alone or in combination with another compound of the present invention. A medicament includes, but is not limited to, any one of the compositions contemplated by the sixth embodiment of the present invention.

A eighth embodiment of the present invention is directed to a method of treatment and/or prophylaxis in a subject in need thereof said method comprises administering a therapeutically effective amount of the compound represented by formula I to the subject.

A first aspect of the eighth embodiment is directed to a method of
treatment and/or prophylaxis in a subject in need thereof said method comprises
administering a therapeutically effective of at least two or more different
compounds falling within the scope of the compound represented by formula I to
the subject.

A second aspect of the eighth embodiment is directed to a method of treatment and/or prophylaxis in a subject in need thereof said method comprises alternatively or concurrently administering a therapeutically effective of at least two compounds falling within the scope of the compound represented by formula I to the subject.

It is intended that a subject in need thereof is one that has any condition the result of an infection by any of the viral agents disclosed herein, which includes, but is not limited to, hepatitis C virus, West Nile virus, yellow fever

10

15

20

25

30

virus, dengue virus, rhinovirus, polio virus, hepatitis A virus, bovine viral diarrhea virus or Japanese encephalitis virus, flaviviridae viruses or pestiviruses or hepaciviruses or a viral agent causing symptoms equivalent or comparable to any of the above-listed viruses.

The term "subject" means a mammal, which includes, but is not limited to, cattle, pigs, sheep, chicken, turkey, buffalo, llama, ostrich, dogs, cats, and humans, preferably the subject is a human. It is contemplated that in the method of treating a subject thereof of the sixth embodiment can be any of the compounds contemplated in any of the aspects of the first, second, and third embodiments or those specifically recited in the tables above, either alone or in combination with another compound of the present invention.

The term "therapeutically effective amount" as used herein means an amount required to reduce symptoms of the disease in an individual. The dose will be adjusted to the individual requirements in each particular case. That dosage can vary within wide limits depending upon numerous factors such as the severity of the disease to be treated, the age and general health condition of the patient, other medicaments with which the patient is being treated, the route and form of administration and the preferences and experience of the medical practitioner involved. For oral administration, a daily dosage of between about 0.1 and about 10 g, including all values in between, such as 0.25, 0.5, 0.75, 1, 1.5, 2, 2.5, 3, 3.5, 4, 4.5, 5, 5.5, 6, 6.5, 7, 7.5, 8, 8.5, 9, and 9.5, per day should be appropriate in monotherapy and/or in combination therapy. A preferred daily dosage is between about 0.5 and about 7.5 g per day, more preferred 1.5 and about 6.0 g per day. Generally, treatment is initiated with a large initial "loading dose" to rapidly reduce or eliminate the virus following by a decreasing the dose to a level sufficient to prevent resurgence of the infection. One of ordinary skill in treating diseases described herein will be able, without undue experimentation and in reliance on personal knowledge, experience and the disclosures of this application, to ascertain a therapeutically effective amount of the compounds of the present invention for a given disease and patient.

Therapeutic efficacy can be ascertained from tests of liver function including, but not limited to protein levels such as serum proteins (e.g., albumin,

clotting factors, alkaline phosphatase, aminotransferases (e.g., alanine transaminase, aspartate transaminase), 5'-nucleosidase, γ-glutaminyltranspeptidase, etc.), synthesis of bilirubin, synthesis of cholesterol, and synthesis of bile acids; a liver metabolic function, including, but not limited to, carbohydrate metabolism, amino acid and ammonia metabolism. Alternatively the therapeutic effectiveness may be monitored by measuring HCV-RNA. The results of these tests will allow the dose to be optimized.

A third aspect of the eighth embodiment, is directed to a method of treatment and/or prophylaxis in a subject in need thereof said method comprises 10 administering to the subject a therapeutically effective of a compound represented by formula I and a therapeutically effective amount of another antiviral agent; wherein the administration is concurrent or alternative. It is understood that the time between alternative administration can range between 1-24 hours, which includes any sub-range in between including, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 15 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, and 23 hours. Examples of "another antiviral agents" include, but are not limited to: HCV NS3 protease inhibitors (see WO 2008010921, WO 2008010921, EP 1881001, WO 2007015824, WO 2007014925, WO 2007014926, WO 2007014921, WO 2007014920, WO 2007014922, US 2005267018, WO 2005095403, WO 20 2005037214, WO 2004094452, US 2003187018, WO 200364456, WO 2005028502, and WO 2003006490); HCV NS5B Inhibitors (see US 2007275947, US20072759300, WO2007095269, WO 2007092000, WO 2007076034, WO 200702602, US 2005-98125, WO 2006093801, US 2006166964, WO 2006065590, WO 2006065335, US 2006040927, US 25 2006040890, WO 2006020082, WO 2006012078, WO 2005123087, US 2005154056, US 2004229840, WO 2004065367, WO 2004003138, WO 2004002977, WO 2004002944, WO 2004002940, WO 2004000858, WO 2003105770, WO 2003010141, WO 2002057425, WO 2002057287, WO 2005021568, WO 2004041201, US 20060293306, US 20060194749, US 20060241064, US 6784166, WO 2007088148, WO 2007039142, WO 30 2005103045, WO 2007039145, WO 2004096210, and WO 2003037895); HCV NS4 Inhibitors (see WO 2007070556 and WO 2005067900); HCV NS5a Inhibitors (see US 2006276511, WO 2006120252, WO 2006120251, WO

2006100310, WO 2006035061); Toll-like receptor agonists (see WO 2007093901); and other inhibitors (see WO 2004035571, WO 2004014852, WO 2004014313, WO 2004009020, WO 2003101993, WO 2000006529).

A fourth aspect of the eighth embodiment, is directed to a method of treatment in a subject in need thereof said method comprises alternatively or concurrently administering a therapeutically effective of a compound represented by formula I and another antiviral agent to the subject. It is understood that the time between alternative administration can range between 1-24 hours, which includes any sub-range in between including, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, and 23 hours.

A fifth aspect of the eighth embodiment, is directed to a method of treatment and/or prophylaxis in a subject in need thereof said method comprises administering to the subject a therapeutically effective of at least one compound represented by formula I and a therapeutically effective amount of another antiviral agent; wherein the administration is concurrent or alternative. It is understood that the time between alternative administration can range between 1-24 hours, which includes any sub-range in between including, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, and 23 hours.

A sixth aspect of the eighth embodiment, is directed to a method of treatment in a subject in need thereof said method comprises alternatively or concurrently administering a therapeutically effective of at least one compound represented by formula I and another antiviral agent to the subject. It is understood that the time between alternative administration can range between 1-24 hours, which includes any sub-range in between including, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, and 23 hours.

It is contemplated that the another antiviral agent includes, but is not limited to interferon  $-\alpha$ , interferon- $\beta$ , pegylated interferon- $\alpha$ , ribavirin, levovirin, viramidine, another nucleoside HCV polymerase inhibitor, a HCV non-nucleoside polymerase inhibitor, a HCV protease inhibitor, a HCV helicase inhibitor or a HCV fusion inhibitor. When the active compound or its derivative or salt are administered in combination with another antiviral agent the activity

2983472-1

30

5

10

15

15

may be increased over the parent compound. When the treatment is combination therapy, such administration may be concurrent or sequential with respect to that of the nucleoside derivatives. "Concurrent administration" as used herein thus includes administration of the agents at the same time or at different times.

Administration of two or more agents at the same time can be achieved by a single formulation containing two or more active ingredients or by substantially simultaneous administration of two or more dosage forms with a single active agent.

It will be understood that references herein to treatment extend to prophylaxis as well as to the treatment of existing conditions. Furthermore, the term "treatment" of a HCV infection, as used herein, also includes treatment or prophylaxis of a disease or a condition associated with or mediated by HCV infection, or the clinical symptoms thereof.

### PROCESS FOR PREPARATION

An ninth embodiment of the present invention is directed to a process for preparing the compound of formula I, which comprises reacting a suitably substituted phosphochloridate compound 4 with a nucleoside analog 5

wherein the substituents R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3a</sup>, R<sup>3b</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, X, Y, R<sup>6</sup>, and base have
their meanings as disclosed in the Detailed Description of the Invention and X' is
a leaving group, such as Cl, Br, I, tosylate, mesylate, trifluoroacetate,
trifluorosulfonate, pentafluorophenoxide, p-NO<sub>2</sub>-phenoxide, or other commonly
used leaving groups as disclosed in *Advanced Organic Chemistry* by March,
Fourth Edition. Leaving groups and methods that can be used to effect the
formation of a phosphoramidate nucleoside conjugate are found in US
20060142238 and WO 2007095269. Preferably, the leaving group is Cl.

This reaction is performed in an anhydrous aprotic solvent such tetrahydrofuran, dioxane, or both tetrahydrofuran and dioxane, or any functional

2983472-1

- 668 -

equivalent thereof, with tetrahydrofuran being the preferred solvent. The reaction is typically initiated at a temperature range from -78°C to 40°C with the preferred reaction temperature being between 0°C and room temperature. The nucleoside is first stirred with a base (5 to 12 equivalents) such as N
methylimidazole, collidine, pyridine, 2,6-lutidine, 2, 6-¹Bu-pyridine, etc. a tertiary amine base, such as triethylamine, diisopropylethylamine, etc., or an alkyl Grignard reagent, such as tBuMgCl, tBuMgBr, MeMgCl, MeMgBr, etc.

The phosphorochloridate (3-10 equivalents) is dissolved in the reaction solvent and added to the mixture of the nucleoside and base. The reaction is then allowed to stir over a period of time at a temperature between room temperature being room temperature and time being 24 hr. The solvent is removed from the reaction mixture and the product is purified by chromatography on silica gel.

A tenth embodiment of the present invention is directed to a product

obtained by a process which comprises reacting a suitably substituted

phosphochloridate compound 4 with a nucleoside analog 5

wherein the substituents R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3a</sup>, R<sup>3b</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, X, Y, R<sup>6</sup>, X', and base have their meanings as disclosed in the Detailed Description of the Invention.

This reaction can be performed in an anhydrous aprotic solvent or other suitable solvent, such as tetrahydrofuran, dioxane, or a mixture of tetrahydrofuran and dioxane, with tetrahydrofuran being the preferred solvent.

The reaction is typically initiated at a temperature range from -78°C to 40°C with the preferred reaction temperature being between 0°C and room temperature.

The nucleoside is first stirred with a base (5 to 12 equivalents) such as N-methylimidazole, a tertiary amine base or tButyl Magnesium Chloride. A phosphorochloridate (3-10 equivalents (or suitable "phosphoro-(leaving group)-date")) is dissolved in the reaction solvent and added to the mixture of the nucleoside and base. The reaction is then allowed to stir over a period of time at

10

15

20

a temperature between room temperature and 40°C for a period of 30 min to 24 hr. with the preferred reaction temperature being room temperature and time being 24 hr. The solvent is removed from the reaction mixture and the product is purified by chromatography on silica gel.

### **Compounds and Preparation**

Phosphoramidate compounds of the present invention can be prepared by condensation of a nucleoside analog 5 with a suitably substituted phosphochloridate compound 4 (Scheme 1). The nucleoside analog is made by conventional procedures disclosed in any one of U.S. Published Application Nos. 2005/0009737, 2006/0199783, 2006/0122146, and 2007/0197463, each of which is incorporated by reference in its entirety.

Disclosed 1H-NMR values were recorded on a Varian AS-400 instrument. Mass spectral data were obtain using either a Micromass-Quattromicro API or a Waters Acquity.

Thus, by way of example only, a suitably substituted phenol can be reacted with phosphorus oxychloride (1) to afford an aryloxy phosphorodichloridate 2 (see Example 1) which is subsequently treated with a acid addition salt of an α-amino acid ester in the presence of TEA to afford an aryloxy phosphorochloridate 4. This arylalkoxy-amino acid phosphoramidate is reacted with the nucleoside analog to provide the product I (for procedure see, e.g., C. McGuigan et al. Antiviral Res. 1992 17:311-321; D. Curley et al. Antiviral Res. 1990 14:345-356; McGuigan et al. Antiviral Chem. Chemother 1990 1(2):107-113).

#### Scheme 1

The preparation of nucleoside phosphoramidates requires reacting an appropriately substituted phosphochloridate with a nucleoside containing a free 5'-hydroxyl moiety. In cases where only one hydroxyl group is present, preparation of the phosphoramidate usually proceeds smoothly when the phosphochloridate is reacted with the desired nucleoside. In cases where the nucleoside contains more than one free hydroxyl group, preparation of the appropriately protected nucleoside might be required. Silyl, acetonide or other alcohol protecting groups known in the art might be warranted for protection of the sugar moiety. For protection of the nucleoside base, protecting a free amino group may require amidine protection strategy.

Condensation of the phosphochloridate can be carried out on the

unprotected nucleoside. Since the 5'-OH group of a nucleoside is much less
hindered than the 3'-OH group, selective phosphoramidation is possible under
carefully controlled conditions. After condensation to form a protected
phosphoramidate nucleoside, deprotection to obtain the free phosphoramidate
nucleoside can be carried out using standard protocols for nucleic acid

chemistry. In many cases, the desired product is readily separated from the
starting material using column chromatography on silica gel. The synthetic
scheme is summarized in Scheme 1.

2983472-1

5

10

A further understanding of the disclosed embodiments will be appreciated by consideration of the following examples, which are only meant to be illustrative, and not limit the disclosed invention.

#### **EXAMPLE 1**

5 General Procedure for Preparation of phosphorodichloridates

A solution of the appropriate phenol R¹-OH (1eq) and triethylamine (1 eq.) in anhydrous ether was added dropwise to a stirred solution of phosphoryl trichloride 1 (1eq) at 0 °C over a period of 3 hours under nitrogen. Then the temperature was warmed to room temperature, and the reaction was stirred overnight. The triethylamine salt was quickly removed with suction filtration and the filtrate concentrated *in vacuo* to dryness to afford 2 as an oil which was used without further purification.

### **EXAMPLE 2**

General Procedure for Preparation of phosphorochloridates

$$R^{3a}$$
 $R^{3b}$ 
 $R$ 

A solution of triethylamine (2eq) in anhydrous dichloromethane was added dropwise to a solution of aryloxy-phosphodichloridate 2 (1 eq) and the

2983472-1

15

appropriate amino ester 3 (1 eq) in anhydrous dichloromethane with vigorous stirring at -78 °C over a period of 30 to 120 minutes. Then the reaction temperature was allowed to warm to room temperature and stirred over night. Solvent was removed. The residue was washed with ethyl ether and filtered, the filtrate was dried over reduced pressure to give 4.

#### **EXAMPLE 3**

### General Procedures for nucleoside phosphoramidate derivatives

$$R^{3a}$$
  $R^{3b}$   $R$ 

A solution of the appropriate phosphorochloridate 4 (6.5 equivalents) in anhydrous tetrahydrofuran (THF) was added to a mixture of nucleoside 5 (1 equivalent) and N-methylimidazole (8 equivalents) in anhydrous THF with vigorous stirring at room temperature and the reaction mixture was stirred overnight. The solvent was removed *in vacuo* and the crude was purified by column chromatography and/or preparative thin layer chromatography to give I.

#### **EXAMPLE 4**

#### Preparation of 2'-deoxy-2'-fluoro-2'-C-methyluridine

2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-C-methylcytidine (1.0g, 1 eq ) (Clark, J., et al., J. Med. Chem., 2005, 48, 5504-5508) was dissolved in 10 ml of anhydrous pyridine and concentrated to dryness in vacuo. The resulting syrup was dissolved in 20 ml of anhydrous pyridine under nitrogen and cooled to 0°C with stirring. The brown solution was treated with benzoyl chloride (1.63g, 3eq) dropwise over 10 min. The ice bath was removed and stirring continued for 1.5h whereby thin-layer chromatography (TLC) showed no remaining starting material. The mixture was quenched by addition of water (0.5 ml) and concentrated to dryness. The residue was dissolved in 50 mL of dichloromethane (DCM) and washed with saturated NaHCO<sub>3</sub> aqueous solution and H<sub>2</sub>O. The organic phase was dried over NaSO<sub>4</sub> and filtered, concentrated to dryness to give N<sup>4</sup>,3',5'-tribenzoyl-2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-C-methylcytidine (2.0 g, Yield: 91%).

N<sup>4</sup>,3',5'-tribenzoyl-2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-C-methylcytidine (2.0g, 1 eq ) was refluxed in 80% aqueous AcOH overnight. After cooling and standing at room temperature (15 °C), most of the product precipitated and then was filtered

2983472-1

5

10

15

10

15

20

through a sintered funnel. White precipitate was washed with water and co-evaporated with toluene to give a white solid. The filtrate was concentrated and co-evaporated with toluene to give additional product which was washed with water to give a white solid. Combining the two batches of white solid gave 1.50g of 3',5'-dibenzoyl-2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-C-methyluridine (Yield: 91%).

To a solution of 3',5'-dibenzoyl-2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-C-methyluridine (1.5 g, 1eq) in MeOH (10 mL) was added a solution of saturated ammonia in MeOH (20mL). The reaction mixture was stirred at 0 °C for 30 min, and then warmed to room temperature slowly. After the reaction mixture was stirred for another 18 hours, the reaction mixture was evaporated under reduced pressure to give the residue, which was purified by column chromatography to afford pure compound 2'-deoxy-2'-fluoro-2'-C-methyluridine (500 mg, Yield: 60 %).

#### **EXAMPLE 5**

# Preparation of 2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-C-methyluridine 5'-(phenyl methoxy-alanyl phosphate)

Phenyl methoxyalaninyl phosphorochloridate (1 g, 6.5 eq ) dissolved in 3 mL of THF was added to a mixture of 2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-C-methyluridine (0.15 g,1 eq) and N-methylimidazole (0.3 g, 8 eq) in 3 mL THF with vigorous stirring at room temperature, then the reaction was stirred overnight. Solvent was removed by reduced pressure. The resulting crude product was dissolved in methanol purified by prep-HPLC on a YMC 25x30X2 mm column using a water / acetonitrile gradient elution mobile phase. The acetonitrile and water were

**WO 2008/121634** Docket No. 60137.0034WOU1

> removed under reduced pressure to give the desired product (50.1 mg, 15.6%). <sup>1</sup>H NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  1.20-1.27 (m, 6H), 3.58 (d, J = 16.0 Hz, 3H), 3.75-3.92 (m, 2H), 4.015-4.379 (m, 2H), 5.54 (t, J = 10.2 Hz, 1H), 5.83-5.91 (m, 1H), 6.00-6.16 (m, 1H), 7.18 (d, J = 8.0 Hz, 2H), 7.22 (s, 1H), 7.35 (t, J = 4.4 Hz, 2H), 7.55 (s, 1H), 11.52 (s, 1H); MS, m/e 502 (M+1)<sup>+</sup>.

#### **EXAMPLE 6**

## Preparation of 2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-C-methyluridine 5'-(phenyl methoxy-valyl phosphate)

10

5

Phenyl methoxy-valyl phosphorochloridate (0.6 g, 3.6 eq ) dissolved in 3 mL of THF was added to a mixture of 2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-*C*-methyluridine (0.15 g,1 eq) and N-methylimidazole (0.44 g, 9 eq) in 3 mL THF with vigorous stirring at room temperature, then the reaction was stirred overnight. Solvent was removed by reduced pressure. The resulting crude product was dissolved in methanol purified by prep-HPLC on a YMC 25x30X2 mm column using a water / acetonitrile gradient elution mobile phase. The acetonitrile and water were removed under reduced pressure to give the desired product (60 mg, 20%). <sup>1</sup>H NMR (DMSO-*d*<sub>6</sub>)  $\delta$  0.74-0.847 (m, 6H), 1.20-1.28 (m, 3H), 1.89-1.92 (m, 1H), 3.50-3.54 (m, 1H), 3.58 (d, *J* = 10.4Hz, 3H), 3.72-3.95 (m, 1H), 4.03-4.05 (m, 1H), 4.23-4.43 (m, 2H), 5.56 (t, *J* = 16.0 Hz, 1H), 5.85-5.92 (m, 1H), 6.01-6.07 (m, 1H), 7.16-7.21 (m, 3H), 7.37 (t, *J* = 8 Hz, 2H), 7.55-7.60 (m, 1H), 11.52 (s, 1H); MS, *m/e* 530 (M+1)<sup>+</sup>.

#### **EXAMPLE 7**

# Preparation of 2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-C-methyluridine 5'-(4-bromophenyl methoxy-valyl phosphate)

5

4-Bromophenyl methoxy-valyl phosphorochloridate (1 g, 3.4 eq ) dissolved in 3 mL of THF was added to a mixture of 2'-deoxy-2'-fluoro-2'-C-methyluridine (0.2 g,1 eq) and N-methylimidazole (0.35 g, 6 eq) in 3 mL THF with vigorous stirring at room temperature, then the reaction was stirred overnight. Solvent was removed by reduced pressure. The resulting crude product was dissolved in methanol purified by prep-HPLC on a YMC 25x30X2 mm column using a water / acetonitrile gradient elution mobile phase. The acetonitrile and water were removed reduced pressure to give the desired product (120 mg, 26%). <sup>1</sup>H NMR (DMSO-d<sub>6</sub>) δ 0.72-0.82 (m, 6H), 1.19-1.26 (m, 3H), 1.86-1.92 (m, 1H), 3.48-3.50 (m, 1H), 3.56 (d, *J* = 12.0 Hz, 3H), 3.72-3.89 (m, 1H), 3.96-4.03 (m, 1H), 4.22-4.37 (m, 2H), 5.54-5.60 (m, 1H), 5.85-5.91 (m, 1H), 5.98-6.13 (m, 1H), 7.15 (d, *J* = 8.0 Hz, 2H), 7.49-7.56 (m, 3H), 11.53 (s, 1H); MS, *m/e* 608 (M+1)<sup>+</sup>.

#### **EXAMPLE 8**

# Preparation of 2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-C-methyluridine 5'-(4-bromophenyl methoxy-alanyl phosphate)

5

10

15

20

4-Bromophenyl methoxy-alanyl phosphorochloridate (0.6 g, 5 eq ) dissolved in 3 mL of THF was added to a mixture of 2'-deoxy-2'-fluoro-2'-C-methyluridine (0.15 g,1 eq)and N-methylimidazole (0.3 g, 7.8 eq) in 3 mL THF with vigorous stirring at room temperature, then the reaction was stirred overnight. Solvent was removed by reduced pressure. The resulting crude product was dissolved in methanol purified by prep-HPLC on a YMC 25x30X2 mm column using a water / acetonitrile gradient elution mobile phase. The acetonitrile and water were removed under reduced pressure to give the desired product (40 mg, 12 %);  $^{1}$ H NMR (DMSO- $d_{6}$ )  $\delta$  1.20-1.26 (m, 6H), 3.57 (d, J= 2.8 Hz, 3H), 3.84 (s, 1H), 3.97-4.03 (m, 1H), 4.21-4.25 (m, 1H), 4.33-4.37 (m, 2H), 5.54-5.60 (m, 1H), 5.83-5.89 (m, 1H), 5.98-6.19 (m, 1H), 7.16 (t, J= 10.2 Hz, 2H), 7.52-7.57 (m, 3H), 11.52 (s, 1 H); MS, m/e 580(M+1) $^{+}$ .

#### **EXAMPLE 9**

# Preparation of $\mathbb{N}^4$ -(N,N-dimethylformamidinyl)-2'-deoxy-2'-fluoro-2'-C-methylcytidine

2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-C-methylcytidine (500 mg, 1.9 mmol) was stirred with dimethylformamide dimethyl acetal in DMF (10 mL). The resulting mixture was stirred at room temperature overnight. After solvent removal the

2983472-1

- 678 -

crude product was used for next step without further purification.

#### **EXAMPLE 10**

# Preparation of 2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-C-methylcytidine 5'-(phenyl methoxy-alanyl phosphate)

Phenyl methoxyalaninyl phosphorochloridate (0.6 g, 6 eq ) dissolved in 3 mL of THF was added to a mixture of N<sup>4</sup>-(*N*,*N*-dimethylformamidinyl)-2'-deoxy-2'-fluoro-2'-*C*-methylcytidine (0.15 g,1 eq) and N-methylimidazole (0.3 g, 7.8 eq) in 3 mL THF with vigorous stirring at room temperature, then the reaction was stirred overnight. Solvent was removed by reduced pressure. The resulting crude product was dissolved in methanol purified by prep-HPLC on a YMC 25x30X2 mm column using a water / acetonitrile gradient elution mobile phase. The acetonitrile and water were removed under reduced pressure to give the desired product (62 mg, 20.6%). <sup>1</sup>H NMR (DMSO-*d*<sub>6</sub>) δ 1.16 (d, *J* = 23.2 Hz, 3H), 1.22 (d, *J* = 7.2 Hz, 3H), 3.56 (S, 3H), 3.69-3.75 (d, *J* = 25.6 Hz, 1H), 3.82-3.86 (m, 1H), 3.96-3.98 (m, 1H), 4.21-4.34 (m, 2H), 5.68 (d, *J* = 7.2 Hz, 1H), 5.75-5.77 (m, 1H), 6.07-6.16 (m, 1H), 7.15-7.19 (m, 3H), 7.2 (d, *J* = 9.2 Hz, 2H), 7.39 (t, *J* = 7.8 Hz, 2H), 7.48 (d, *J* = 9.2 Hz, 1H); MS, *m/e* 501(M+1)<sup>+</sup>.

#### **EXAMPLE 11**

# Preparation of 2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-C-methylcytidine 5'-(4-bromophenyl methoxy-valyl phosphate)

4-Bromophenyl methoxy-valyl phosphorochloridate (1.0 g, 3.4 eq.) dissolved in 3 mL of THF was added to a mixture of N<sup>4</sup>-(N,Ndimethylformamidinyl)-2'-deoxy-2'-fluoro-2'-C-methylcytidine (0.2 g,1 eq.) and N-methylimidazole (0.35 g, 6 eq.) in 3 mL THF with vigorous stirring at room 10 temperature, then the reaction was stirred overnight. Solvent was removed by reduced pressure. The resulting crude product was dissolved in methanol purified by prep-HPLC on a YMC 25x30X2 mm column using a water / acetonitrile gradient elution mobile phase. The acetonitrile and water were removed under reduced pressure to give the desired product as a white solid (59 15 mg, 13%);  ${}^{1}$ H NMR (DMSO- $d_{6}$ )  $\delta$  0.74-0.83 (m, 6H), 1.12-1.20 (m, 3H), 1.89-1.92 (m, 1H), 3.49-3.51 (m, 1H), 3.55 (s, 3H), 3.59-3.68 (m, 1H), 3.72-.383 (m, 1H), 4.21-4.39 (m, 2H), 5.70-5.72 (m, 1H), 5.76-5.83 (m, 1H), 6.04-6.16 (m, 1H), 7.15 (d, J = 13.0 Hz, 2H), 7.26 (s, 1H), 7.33 (s, 1H), 7.46-7.55 (m, 1H), 7.56 (d, J = 4.4 Hz, 2H); MS, m/e 607 (M+1)<sup>+</sup>. 20

#### **EXAMPLE 12**

## Preparation of 2'-deoxy-2'-fluoro-2'-C-methylcytidine 5'-(phenyl methoxy-valyl phosphate)

Phenyl methoxy-valyl phosphorochloridate (0.6 g, 6 eq ) dissolved in 3 mL of THF was added to a mixture of N<sup>4</sup>-(N,N-dimethylformamidinyl)-2'deoxy-2'-fluoro-2'-C-methylcytidine (0.15 g,1 eq) and N-methylimidazole (0.3 g, 10 7.8 eq) in 3 mL THF with vigorous stirring at room temperature, then the reaction was stirred overnight. Solvent was removed by reduced pressure The resulting crude product was dissolved in methanol purified by prep-HPLC on a YMC 25x30X2 mm column using a water / acetonitrile gradient elution mobile phase. The acetonitrile and water were removed under reduced pressure to give the desired product as a white solid (86 mg, 42.9 %).  $^{1}$ H NMR (DMSO- $d_{6}$ )  $\delta$ 15 0.72-0.80 (m, 6H), 1.09-1.18 (m, 3H), 1.87-1.92 (m, 1H), 3.47-3.51 (m, 1H), 3.58 (s, 3H), 3.71-3.75 (m, 1H), 3.97 (t, J = 11.2 Hz, 1H), 4.22-4.37 (m, 2H),  $5.70 \text{ (d, } J = 8.0 \text{ Hz, } 1\text{H}), 5.76-5.84 \text{ (m, } 1\text{H}), 6.01-6.15 \text{ (m, } 1\text{H}), 7.13-7.18 \text{ (m, } 1\text{H})}$ 3H), 7.27 (s, 2H), 7.34 (d, J = 4.0 Hz, 2H), 7.46-7.50 (m, 1H); MS, m/e 529 20  $(M+1)^{+}$ .

### **EXAMPLES**

Example numbers 13-54 and 56-66 are prepared using similar procedures described for examples 5-8. The example number, compound identification, and NMR/MS details are shown below:

5

Ex.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	NMR/MS
13	Ph 1-Napth	Н	Н	Me Me	Et Bn	1H NMR (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 1.12-1.16 (m, 3H), 1.20-1.28(m,6H), 3.70-3.90 (m, 2H), 4.00-4.08 (m, 3H), 4.18-4.45 (m, 2H), 5.52-5.58 (m, 1H), 5.85-5.98 (m, 1H), 6.00-6.20 (m, 2H), 7.16-7.23 (m, 3H), 7.37-7.40 (m, 2H), 7.54-7.60 (m, 1H), 11.54 (s.1H); MS, m/e 516.1 (M+1)+ 1H NMR (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 1.18-1.30 (m, 6H), 3.78-4.10 (m, 3H), 4.38-4.49 (m, 2H), 4.99-5.11 (m, 2H), 5.28-5.40 (m, 1H), 5.85-6.10 (m, 2H), 6.30-6.41 (m, 1H), 7.28-7.32 (m, 5H), 7.41-7.60 (m, 5H), 7.73-
15	Ph	Н	Н	Н	Me	7.76(m, 1H), 7.94-8.11(m, 1H), 8.13-8.15(m, 1H), 11.50 (s.1H);  MS, m/e 628.4 (M+1)+  1H NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) & 1.22 (d, J=22.4 Hz, 3H), 3.59(s, 3H), 3.63-3.69 (m, 2H), 3.74-3.8(m, 1H), 4.02(d, J=11.2 Hz, 1H), 4.23-4.28(m, 1H), 4.40-4.43 (m, 1H), 5.57-5.60 (m, 1H), 5.89(d, J=6.8 Hz, 1H), 6.00-6.06(m, 2H), 7.15-7.23 (m, 3H), 7.35-7.39 (m, 2H), 7.52(d, J=8 Hz, 1Hz)
16	2,4-Cl- Ph	Н	Н	Me	Me	1H), 11.52(s, 1H); MS, m/e 487.97 (M+1)+ 1H NMR (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 1.22-1.28 (m, 6H), 3.57-3.60 (m, 3H), 3.84- 3.92 (m, 2H), 4.00-4.04 (m, 1H), 4.31-4.44 (m, 2H), 5.54-5.61 (m, 1H), 5.85-6.10 (m, 2H), 6.32-6.43 (m, 1H), 7.44-7.54 (m, 3H), 7.72- 7.75 (m, 1H), 11.54 (s.1H); MS, m/e 570.2 (M+1)+
17	1-Napth	Н	Н	Me	Me	1H NMR (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 1.15-1.27 (m, 6H), 3.51-3.55 (d, 3H), 3.85-3.96 (m, 2H), 4.00-4.10(m, 1H), 4.30-4.46 (m, 2H), 5.31-5.39 (m, 1H), 5.89-6.05 (m, 2H), 6.22-6.34 (m, 1H), 7.44-7.60 (m, 5H), 7.73-7.77 (m, 1H), 7.93-7.96 (m, 1H), 8.12-8.14 (m, 1H),11.50(s.1H); MS, m/e 552.1 (M+1)+
18	Ph	*	Н	*	Me	1H NMR (DMSO- $d_6$ ) $\delta$ 1.19 (d, J=22.8 Hz, 3H), 1.69-1.84 (m, 3H), 1.99-2.04 (m, 1H), 3.16-3.21 (m, 2H), 3.58 (s, 3H), 3.68-3.8 (m, 1H), 4.00 (m, 1H), 4.01-4.13 (m, 1H), 4.22-4.25 (m, 1 H), 4.5 (d, J = 11.2 Hz, 1H), 5.54 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.86 (s, 1H), 5.6 (d, J = 19.6 Hz, 1H), 7.15-7.2 (m, 3H), 7.34 (t, J = 8.0 Hz, 2H), 7.51 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 11.38 (s, 1H); MS, m/e 527.93(M+1)+
19	Ph	Н	Н	Me	n-Bu	1H NMR (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) 8 0.80-0.90 (m, 3H), 1.20-1.35 (m, 8H), 1.48-1.55 (m, 2H), 3.78-3.88 (m, 2H), 3.95-4.08 (m, 3H), 4.22-4.45 (m, 2H), 5.55-5.57(t, 1H), 5.85-6.18 (m, 3H), 7.14-7.23 (m, 3H), 7.35-7.40 (m, 2H), 7.51-7.60 (d, 1H), 11.50 (s.1H); MS, m/e 544.2 (M+1)+
20	Ph	Н	Н	Me	Bn	1H NMR (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 1.20-1.30 (m, 6H), 3.72-4.05 (m, 3H), 4.23-4.27 (m, 1H), 4.32-4.45 (m, 1H), 5.07-5.10(t, 2H), 5.52-5.56(t, 1H),

T.	$\mathbf{p}^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	NIMIDAMC
Ex.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	K"	R	R.	NMR/MS 5.86-6.10 (m, 2H), 6.13-6.21(m,1H), 7.15-7.21 (m, 3H), 7.29-7.40 (m,
						7H), 7.51-7.56 (d, 1H), 11.50 (s.1H); MS, m/e 578.2 (M+1)+
21	4-F-Ph	Н	Н	Me	Me	1H NMR (DMSO- $d_6$ ) $\delta$ 1.28-1.34 (m, 6H), 3.65(d, J= 4 Hz, 3H), 3.85-
21	7-1-11	11	11	1710	IVIC	3.96 (m, 2H), 4.06-4.12 (m, 1H), 4.30-4.34 (m,1H), 4.40-4.47 (m, 1H),
						5.62-5.67 (m, 1H), 5.94-6.01(m, 1H), 6.09 (d, J=18.8 Hz, 1H), 6.17-
						6.26 (m, 1H), 7.27-7.33(m, 4H), 7.62 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 11.61 (s, 1H)
						; MS, m/e 519.94(M+1)+
22	4-Cl-Ph	Н	Н	Me	Me	1H NMR (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 1.22-1.28 (m, 6H), 3.58 (d, 2H), 3.70-
						3.95(m,2H), 3.95-4.08 (m,1H), 4.23-4.45 (m, 2H), 5.55-5.61(t, 1H),
						5.85-6.10 (m, 2H), 6.15-6.23(m,1H), 7.20-7.26 (m, 2H), 7.43-7.46 (m,
						2H), 7.54-7.57 (d, 1H), 11.50 (s.1H); MS, m/e 536.1 (M+1)+
23	3,4-Cl- Ph	Н	Н	Me	Me	1H NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) 8 1.13 (m, 6H), 3.49 (s, 3H), 3.61-3.85 (m, 2H),
	LH					3.90-3.93 (m, 1H), 4.16-4.22 (m, 1H), 4.27-4.31 (m, 1H), 5.47-5.52
						(m, 1H), $5.82$ (d, $J = 11.6$ Hz, 1H), $5.93$ (d, $J = 19.2$ Hz, 1H), $6.15-6.25$ (m, 1H), $7.13$ (t, $J = 9.6$ Hz, 1H), $7.43$ (d, $J = 12$ Hz, 2H), $7.57$ (d, $J = 12$ Hz, 2Hz, 2Hz), $7.57$ (d, $J = 12$ Hz, 2Hz), $7.57$ (d, $J = 12$ Hz), $7.57$ (d, $J = 12$ Hz
						6.0 Hz, 1H), 11.43(s, 1H); MS, m/e 569.85 (M+1)+
24	DL	11	TT	Ma	2 D.,	1H NMR (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) \$ 0.83 (d, J = 6.8 Hz, 6H), 1.20-1.26 (m, 6H),
24	Ph	Н	Н	Me	2-Bu	1.79-1.86 (m, 1H), 3.73-3.90 (m, 4H), 4.01 (t, J = 11.2 Hz, 1H), 4.21-
						4.28 (m, 1H), 4.33-4.42 (m, 1H), 5.54 (t, J = 7.6 Hz, 1H), 5.85-5.92
						(m, 1H), 5.99-6.13 (m, 2H), 7.19 (t, J = 8 Hz, 3H), 7.36 (t, J = 7.6 Hz,
						2H), 7.53 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 11.52 (s, 1H); MS, m/e 544.00 (M+1)+
25	Ph	Н	Н	Me	i-Pr	1H NMR (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 1.13-1.28 (m, 12H), 3.74-3.81 (m, 2H), 3.95-
25	* **	**	**	1410		4.08 (m,1H), 4.20-4.45 (m, 2H), 4.83-4.87 (m, 1H), 5.52-5.58 (m, 1H),
						5.84-6.15 (m, 3H), 7.17-7.23 (m, 3H), 7.35-7.39 (m, 2H), 7.54-7.57
						(m, 1H), 11.50 (s.1H); MS, m/e 530.2 (M+1)+
26	4-MeO-	Н	Н	Me	n-Bu	1HNMR (400MHz, DMSO- $d_6$ ): $\delta$ =0.78-0.82 (m, 3H), 1.29-1.47 (m,
	Ph					8H), 1.49-1.54 (m, 2H), 3.66-3.87 (m, 5H), 3.96-4.02 (m, 3H), 4.21-
						4.39 (m, 2H), 5.57 (t, J= 12.0Hz, 1H), 5.84-6.05 (m, 3H), 6.90 (dd, J1
						=8.0Hz, J2=4.0Hz, 2H), 7.09-7.14 (dd, J1=16.0Hz, J2=4.0Hz, 2H),
						7.55 (d, J=8.0Hz, 1H), 11.48-11.62 (s, 1H)
27	4-F-Ph	Н	H	Me	Et	1H NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δ 1.12-1.28 (m, 9H), 3.72-3.94(m,2H) ,3.98-4.10
						(m,3H), 4.21-4.42(m,2H), 5.55-5.61 (t, 1H), 5.85-6.20 (m, 3H), 7.18-
						7.25 (m,4H), 7.55-7.58 (d, 1H), 11.50 (s.1H); MS, m/e 533.90 (M+1)+
28	4-F-Ph	Η	Н	Me	i-Pr	1H NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δ 1.13-1.30 (m, 12H), 3.74-3.85(m,2H) ,3.98-
						4.06 (m,1H), 4.23-4.41(m,2H), 4.83-4.87 (m, 1H), 5.55-5.61 (t, 1H),
						5.85-6.12 (m, 3H), 7.18-7.24 (m,4H), 7.55-7.58 (d, 1H), 11.50 (s.1H);
						MS, m/e 547.91 (M+1)+
29	4-F-Ph	Н	Н	Me	Bn	1H NMR (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) 8 1.10-1.23 (m, 6H), 3.65-3.89(m,3H) ,4.10-4.30
						(m,2H), 4.96-5.00(m,2H), 5.46-5.50 (t, 1H), 5.75-5.96 (m, 2H), 6.04-
						6.12(m,1H), 7.05-7.11 (m,4H), 7.20-7.24 (d, 5H), 7.42-7.45(d,1H),
•	4340	**	**			11.50 (s.1H); MS, m/e 595.94 (M+1)+
30	4-MeO- Ph	Н	Н	Me	i-Pr	1HNMR (400MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ): 8=1.15-1.27 (m, 12H), 3.71-3.89 (m, 5H), 3.98 4.02 (m, 1H), 4.22 4.25 (m, 1H), 4.23 4.20 (m, 1H), 4.84
	1 11					5H), 3.98-4.02 (m, 1H), 4.22-4.25 (m, 1H), 4.33-4.39 (m, 1H), 4.84-
						4.87 (m, 1H), 5.57 (t, J= 12.0Hz, 1H), 5.91-6.03 (m, 3H), 6.90 (d, J=
24	2 CL DI	TT	ŢŦ	<b>N</b> 4-	D.:	8.0Hz, 2H), 7.09-7.14 (m, 2H), 7.55 (d, J= 8.0Hz, 1H), 11.51 (s, 1H)  1H NMR (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 1.23 (m, 6 H), 3.93-4.00 (m, 3 H), 4.27-4.40
31	2-Cl-Ph	Н	Н	Me	Bn	(m, 2H), 5.0(t, J= 7.2 Hz, 2 H), 5.53 (m, 1 H), 5.80-6.0(m, 2 H),
						6.30(m, 1H), 7.15 (d, J= 2.4 Hz, 1 H), 7.27 (m, 6 H), 7.51 (m, 3 H),
						11.5 (s, 1 H); MS, m/e 579.87(M+1)+ / 596.78 (M+18)+
						11.5 (0, 111), 1110, 1110 517.01(111.1), 1570.10 (111.10),

Ex.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	NMR/MS
32	2,4-Cl-	Н	Н	Me	n-Bu	1H NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δ=0.82 (m, 3 H),1.23 (m, 8 H), 1.47 (m, 2 H),
	Ph					3.86 (m, 2 H), 3.84 (m, 3 H),4.27-4.43 (m, 2H), 5.5 (m, 1 H), 6.02 (m
						,2 H), 6.35(m, 1H), 7.44 (m, 3 H), 7.77 (m, 1 H), 11.5 (s, 1 H); MS,
						m/e 611.87(M+1)+
33	4-Me-	Н	Н	Me	i-Pr	1H NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δ 1.14-1.27 (m, 12H), 2.17-2.26 (m, 3H), 3.73-
- 7	Ph					3.82 (m, 1H), 3.99-4.02 (m, 1H), 4.23-4.26 (m, 1H), 4.37-4.40 (m,
						1H), 4.82-4.88 (m, 1H), 5.52-5.58 (m, 1H), 5.85-6.07 (m, 3H), 7.01-
						7.20 (m, 4H), 7.55 (d, J = 16Hz, 1H), 11.51 (s, 1H); MS, m/e 543.98
						(M+1)+; 1108.86 (2M+23)+
34	4-F-Ph	Н	Н	Me	n-Bu	1H NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δ 0.82-0.89 (m,3H), 1.20-1.31 (m, 8H), 1.48-
J <b>T</b>	7-1 -11	**	**	1410	пъч	1.53 (m,2H), 3.77-3.90 (m,2H), 3.95-4.10 (m,3H), 4.21-4.45(m,2H),
						5.56-5.61 (t, 1H), 5.83-6.20 (m, 3H), 7.18-7.25 (m,4H), 7.55-7.58 (d,
						1H), 11.50 (s.1H); MS, m/e 584.1 (M+23)+
25	2.4	Н	Н	Me	Et	1H NMR (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ1.12-1.31 (m, 9H), 3.77-3.92 (m,2H), 3.95-4.08
35	3,4- diCl-Ph	п	п	Me	Et	(m,3H), 4.21-4.45(m,2H), 5.56-5.62 (t, 1H), 5.80-6.11 (m, 2H), 6.18-
	dici-i ii					6.33(m,1H), 7.18-7.25 (m,1H), 7.49-7.56 (d, 2H), 7.62-7.67(m,1H),
						11.50 (s.1H); MS, m/e 606.1 (M+23)+
	2 (1 7)		**		· n	
36	2-Cl-Ph	H	Н	Me	i-Pr	1HNMR (400MHz, DMSO- $d_6$ ): $\delta$ =1.12-1.16 (m, 6H), 1.21-1.27 (m,
						6H), 3.79-3.85 (m, 2H), 4.00-4.07 (m, 1H), 4.28-4.32 (m, 1H), 4.38-
						4.43 (m, 1H), 4.83-4.87 (m, 1H), 5.56 (dd, J1=16.0Hz, J2=8.0Hz, 1H),
						5.85-6.12 (m, 2H), 6.20-6.33 (m, 1H), 7.19-7.22 (m, 1H), 7.33 (t, J=
						16.0Hz, 1H), 7.48-7.55 (m, 3H), 11.55 (s, 1H)
37	4-MeO-	H	Н	Me	Bn	1HNMR(400MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ): δ=1.19-1.26 (m, 6H), 3.69-3.70 (s,
	Ph					3H), 3.87 (m, 2H), 3.99 (m, 1H), 4.20-4.21 (m, 1H), 4.35 (m, 1H),
						5.07-5.09 (m, 2H), 5.54 (t, J = 16.0Hz, 1H), 5.85-5.92 (m, 1H), 6.04-
						6.10 (m, 2H), 6.86 (d, J= 8.0Hz, 2H), 7.09 (dd, J1=16.0Hz, J2=4.0Hz,
						2H), 7.30-7.34 (m, 5H), 7.53 (s, 1H), 11.52 (s, 1H)
38	Ph	H	Н	Me	n-Pen	1H NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δ 0.79-0.81 (m, 3H), 1.17-1.23 (m, 10H), 3.74-
						3.81 (m, 2H), 3.94-3.96 (m, 3H), 4.19-4.36 (m, 2H), 5.49-5.54 (m,
						1H), 5.87-6.08 (m,3H), 7.14-7.33 (m, 3H), 7.31-7.35 (m, 2H), 7.51 (d,
						J = 8Hz, 1H), 11.51 (s, 1H); MS, m/e 557.9 (M+1)+; 1136.88
						(2M+23)+
39	4-Cl-Ph	H	Н	Me	i-Pr	1H NMR (DMSO- $d_6$ ) $\delta$ 1.04-1.19 (m, 12H), 3.76-3.80 (m, 2H), 3.98-
						4.08 (m, 1H), 4.42-4.42 (m, 2H), 4.82-4.85 (m, 1H), 5.55-5.60 (m,
						1H), 5.80-6.20 (m,3H),7.20-7.2 5(m, 2H), 7.43 (d, J = 8.8Hz, 1H), 7.54
						(d, J = 8Hz, 1H), 11.51 (s, 1H); MS, m/e 563.88 (M+1)+; 1148.73
						(2M+23)+
40	4-Cl-Ph	Н	Н	Me	n-Bu	1H NMR (DMSO- $d_6$ ) $\delta$ 0.85 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.22-1.33 (m,
						8H), 1.45-1.53 (m, 2H), 3.80-3.87 (m, 2H), 3.96-4.04 (m, 3H), 4.24-
						4.27 (m, 1H), 4.35-4.39 (m, 1H), 5.56-5.61 (m, 1H), 5.82-6.11 (m,
						2H), 6.15-6.18 (m, 1H), 7.20-7.56 (m, 4H), 7.51-7.57 (m.1H), 11.54
						(s, 1H); MS, m/e577.95(M+1)+
41	4-Cl-Ph	Н	Н	Me	Et	1H NMR (DMSO- $d_6$ ) $\delta$ 1.14 (t, J = 7.0Hz, 3H), 1.20-1.28 (m,
	. 3					6H),3.77-3.88 (m, 2H), 3.99-4.07 (m, 3H), 4.24-4.28 (m, 1H), 4.34-
						4.43 (m, 1H), 5.56-5.61 (m, 1H), 5.86-6.13 (m, 2H), 6.15-6.24 (m,
						1H), 7.20-7.26 (m, 2H), 7.44 (d, J = 7.6Hz, 2H), 7.55 (d, J = 7.6Hz,
						1H), 11.55 (s, 1H); MS, m/e549.11(M+1)+
42	4 Ma	Н	Ц	Ma	n-Bu	1H NMR (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 0.79-0.83 (m, 3H), 1.17-1.28 (m, 8H), 1.45-
42	4-Me- Ph	п	Н	Me	n-Du	1.47 (m, 2H), 2.22 (d, J = 2.8Hz, 1H), 3.70-3.90 (m, 2H), 3.95-3.98
	1 11					1.77 (III, 211), 2.22 (U, 3 – 2.0112, 111), 3.70-3.90 (III, 211), 3.73-3.90

- IF	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	NMR/MS
Ex.	K	K⁻	K	К	К	(m, 3H), 4.10-4.40 (m, 2H), 5.51 (t, 1H), 5.80-5.90 (m, 1H), 5.95-6.05
						(m, 2H), 7.02-7.06 (m, 2H), 7.51 (t, J = 4.2Hz, 4H), 7.51 (d, 1H),
						11.51 (s, 1H); MS, m/e 557.99(M+1)+; 1136.84(2M+23)+
43	4-Me-	Н	Н	Me	Bn	1H NMR (DMSO- $d_6$ ) $\delta$ 1.16-1.24 (m, 6H), 2.22 (s, 3H), 3.65-4.03
7.5	Phe	**	**	1710	Dii	(m,3H), 4.11-4.38 (m, 2H), 5.04-5.05 (m, 2H), 5.48-5.50 (m, 1H),
						5.77-5.87 (m,1H),5.90-6.11 (m, 2H), 6.98-7.10 (m, 4H), 7.28-7.32 (m,
						5H), 7.50 (t, 1H), 11.48 (s, 1H); MS, m/e 592.00 (M+1)+.
44	Ph	Н	Н	Et	Me	1H NMR (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 0.70-0.80 (m, 3H), 1.11-1.26 (m, 3H), 1.42-
77		••	***		1,10	1.61 (m, 2H), 3.50-3.54 (m, 3H), 3.58-3.80 (m, 2H), 3.91-4.02 (m,
						1H), 4.12-4.38 (m, 2H), 5.47-5.52 (m,1H),5.90-6.03 (m, 2H), 7.08-
						7.16 (m, 3H), 7.26-7.35 (m, 2H),7.48 (t,1H),11.45 (s, 1H); MS, m/e
						515.95 (M+1)+; 1052.82 (2M+23)+
45	Ph	Н	Н	Me	4-F-Bn	<sup>1</sup> HNMR (400MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ): δ 1.20-1.26 (m, 6H), 3.80-3.93 (m,
43	1 11	11	11	1710	TI DII	2H), 3.98 (s, 1H), 4.25-4.26 (m, 1H), 4.36-4.37 (m, 1H), 5.07 (s, 2H),
						5.52-5.55 (m, 1H), 5.86-5.87(m, 1H), 5.98-6.04 (m, 1H), 6.14-6.17 (m,
						1H), 7.15-7.20 (m, 5H), 7.36 (dd, <i>J</i> = 20.0, 8.0 Hz, 4H), 7.54 (s, 1H),
						11.55 (s, 1H)
46	4-Cl-Ph	Н	Н	Me	n-Bu	<sup>1</sup> HNMR (400MHz, DMSO- <i>d<sub>6</sub></i> ): δ 1.21-1.28 (m, 6H), 3.71-3.88 (m,
70	4-CI-1 II		11	IVIC	n Du	1H), 3.91-3.98 (m, 1H), 4.00-4.01 (m, 1H), 4.23-4.27 (m, 1H), 4.35-
						4.38 (m, 1H), 5.08 (d, $J = 4.0$ Hz, 2H), 5.57 (dd, $J = 12.0$ , 8.0 Hz, 1H),
						5.91 (d, $J = 8.0$ Hz, 1H), 6.01 (d, $J = 8.0$ Hz, 1H), 6.22-6.24 (m, 1H),
						7.17-7.23 (m, 2H), 7.31-7.40 (m, 7H), 7.53 (s, 1H), 11.50 (s, 1H)
47	Ph	Н	Н	Me	3-Me-1-	<sup>1</sup> H NMR (DMSO- $d_6$ ) $\delta$ 0.80-0.82 (m, 6H), 1.18-1.40 (m, 8H), 1.50-
7/	1 11	11	**	1710	Bu	1.58 (m, 1H), 3.71-3.82 (m, 3H), 3.97-3.4.01 (m, 3H), 4.21-4.40 (m,
						2H), 5.30(t, $J = 8.6$ Hz, 1H), 5.81-6.10 (m, 3H), 7.15-7.20 (m, 3H),
						7.32-7.36 (m, 2H), 7.48 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 11.38 (s, 1H); MS, $m/e$
						557.98 (M+1) <sup>+</sup> ; 1136.88 (2M+23) <sup>+</sup>
48	3,4-	Н	Н	Me	Bn	<sup>1</sup> H NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δ 1.05-1.37 (m, 6H), 3.71-3.82 (m, 1H), 3.87-
40	diCl-Ph	**	**	1,10	D.I.	4.02 (m, 2H), 4.28-4.29 (m, 1H),4.36-4.38 (m, 1H),5.04 (d, <i>J</i> = 5.2Hz,
						2H), 5.55-5.64 (m, 1H), 5.85-5.94 (m, 1H), 6.00-6.05 (m, 1H), 6.29-
						6.40 (m, 1H),7.17-7.24 (m, 1H), 7.30-7.41 (m, 5H), 7.45-7.58 (m, 2H),
						7.61 (d, $J = 4.0$ Hz, 1H), 11.53 (s, 1H); MS, $m/e545.80$ (M+1) <sup>+</sup> ;
49	Ph	Н	Н	Me	c-Hex	<sup>1</sup> H NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δ 1.18-1.41 (m, 12H), 1.59-1.67 (m, 4H), 3.74-
••						13.80 (m, 1H), 3.96-4.02 (m, 1H), 4.19-4.26 (m, 1H), 4.31-4.39 (m,
						1H), 4.60 (s, 1H), 5.52 (t, $J = 7.8$ Hz, 1H), 5.80-6.09 (m, 3H), 7.15-
						7.20 (m, 3H), 7.32-7.36 (m, 2H), 7.52 (d, $J = 8$ Hz, 1H), 11.50 (s, 1H);
						MS, m/e 569.98 (M+1) <sup>+</sup> ; 592.14 (M+23) <sup>+</sup>
50	Ph	Н	Me	Н	n-Bu	1H NMR (DMSO- $d_6$ ) $\delta$ 0.76 (t, J = 7.2Hz, 3H), 1.10-1.22 (m, 8H),
						1.38-1.43 (m, 2H), 3.72-3.75 (m, 2H), 3.87-3.93 (m, 3H), 4.14-4.21
						(m, 1H), 4.23-4.33 (m, 1H), 5.46-5.54 (m, 1H), 5.84-6.11 (m, 3H),
						7.09-7.14 (m, 2H), 7.27-7.32 (m, 2H), 7.34-7.51 (m, 1H), 11.47 (s,
						1H); MS, m/e543.98(M+1)+
51	Ph	Н	Me	Н	i-Pr	1H NMR (DMSO- $d_6$ ) $\delta$ 1.39 (d, J = 7.2Hz, 6H), 1.19-1.29 (m, 6H),
~-	=					3.65-3.75 (m, 2H), 3.95-4.05 (m, 1H), 4.20-4.22 (m, 1H), 4.31-4.33
						(m, 1H), 4.79-4.82 (m, 1H), 5.48-5.57 (m, 1H), 5.84-5.91 (m, 1H),
						5.96-6.07 (m, 2H), 7.12-7.35 (m, 5H), 7.44-7.54 (m.1H), 11.49(s, 1H);
						MS, m/e529.96 (M+1)+
52	Ph	Н	Me	Н	Bn	<sup>1</sup> H NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δ 1.18-1.28 (m, 6H), 3.70-3.83 (m, 1H), 3.87-
					<del></del>	3.94 (m, 1H), 3.99-4.01 (m, 1H), 4.23-4.26 (m, 1H), 4.33-4.37 (m,

Ex.	$\mathbb{R}^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	NMR/MS
						1H), 5.03-5.12 (m, 2H), 5.51-5.59 (m, 1H), 5.87-5.90 (m, 1H), 5.95-
						6.07 (m, 1H), 6.10-6.27 (m, 1H), 7.15-7.23 (m, 3H), 7.31-7.38 (m,
						7H), 7.47-7.56 (m, 1H), 11.50 (s, 1H); MS, m/e577.99 (M+1)+
53	2-Cl-Ph	H	Н	Me	n-Bu	<sup>1</sup> HNMR (400MHz, DMSO- $d_6$ ): $\delta$ 0.81-0.86 (m, 3H), 1.21-1.31 (m,
						8H), 1.46-1.52 (m, 2H), 3.84-3.90 (m, 2H), 3.97-4.04 (m, 3H), 4.27-
						4.41 (m, 2H), 5.53-5.58 (m, 1H), 5.82-5.95 (m, 1H), 5.96-6.10 (m,
						1H), 6.27-6.31 (m, 1H), 7.19-7.22 (m, 1H), 7.34 (dd, $J = 8.0$ , 4.0 Hz,
						1H), 7.47-7.55 (m, 3H), 11.55 (s, 1H)
54	4-Br-Ph	Н	Н	Me	i-Pr	<sup>1</sup> HNMR (400MHz, DMSO- $d_6$ ): $\delta$ 1.10-1.14 (m, 6H), 1.20-1.27 (m,
						6H), 3.74-3.81 (m, 2H), 3.99-4.01 (m, 1H), 4.21-4.25 (m, 1H), 4.37-
						4.38 (m, 1H), 4.81-4.85 (m, 1H), 5.58 (dd, $J = 8.0$ , 4.0 Hz, 1H), 5.82-
						5.95 (m, 1H), $5.96-6.09$ (m, 1H), $6.10-6.13$ (m, 1H), $7.18$ (dd, $J =$
						12.0, 8.0 Hz, 2H), 7.53-7.57 (m, 3H), 11.52 (s, 1H)
55	4-F-Ph	Н	Н	Me	c-Hex	<sup>1</sup> H NMR (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 1.20-1.44 (m, 12H), 1.60-1.71 (m, 4H), 3.75-
						4.02 (m, 2H), 3.94-4.02 (m, 1H), 4.19-4.26 (m, 2H), 4.59-4.61 (m,
						1H), 5.57 (t, J = 8.4 Hz, 1H), 5.85-6.06 (m, 3H), 7.17-7.23 (m, 4H),
						7.54 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 11.50 (s, 1H); MS, $m/e$ 587.92 (M+1) <sup>+</sup>
56	4-Br-Ph	Н	Н	Me	c-Hex	<sup>1</sup> HNMR (400MHz, DMSO- $d_6$ ): $\delta$ =1.18-1.46 (m, 12H), 1.61-1.69 (m,
30	4-D1-1 II	11	11	IVIC	C-11CX	4H), 3.75-3.82 (m, 2H), 3.95-4.08 (m, 1H), 4.25-4.28 (m, 1H), 4.38 (s,
						1H), 4.60-4.62 (m, 1H), 5.56-5.60 (m, 1H), 5.82-5.95 (m, 1H), 6.02-
						6.20 (m, 2H), 7.09-7.20 (m, 2H), 7.53-7.57 (m, 3H), 11.52 (s, 1H)
						MS, m/e 650.0 (M+3) <sup>+</sup>
57	Ph	Н	Н	Et	i-Pr	<sup>1</sup> HNMR (400MHz, DMSO- $d_6$ ): $\delta$ =0.75-0.82 (m, 3H), 1.12-1.26 (m,
31	111	11	11	Li	1-11	9H), 1.52-1.59 (m, 2H), 3.55-3.68 (m, 1H), 3.72-3.85 (m, 1H), 3.95-
						4.08 (m, 1H), 4.18-4.28 (m, 1H), 4.32-4.41 (m, 1H), 4.83-4.86 (m,
						1H), 5.55 (m, <i>J</i> = 7.6Hz, 1H), 5.99-6.04 (m, 2H), 6.05-6.10 (m, 1H),
						7.14-7.21 (m, 3H), 7.33-7.37 (m, 2H), 7.52-7.54 (m, 1H), 11.53 (s,
						1H); MS, m/e566.07(M+23) <sup>+</sup>
	D.	**		п.		HINIMD (400MHz, DMCO J.), \$ 0.75 0.00 (m. 2H), 1.24 1.44 (m.
58	Ph	Н	H	Et	c-Hex	<sup>1</sup> HNMR (400MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ): 8 0.75-0.88 (m, 3H), 1.26-1.46 (m,
						9H), 1.52-1.69 (m, 6H), 3.60-3.63 (m, 1H), 3.72-3.90 (m, 1H), 4.02-
						4.03 (m, 1H), 4.24-4.27 (m, 1H), 4.37-4.38 (m, 1H), 4.63-4.65 (m,
						1H), 5.55 (dd, <i>J</i> =8.0Hz, 4.4Hz, 1H), 5.80-5.95 (m, 1H), 6.00-6.07 (m,
						2H), 7.15-7.22 (m, 3H), 7.34-7.38 (m, 2H), 7.54 (d, <i>J</i> =8.0Hz, 1H),
						11.55 (s, 1H); MS, m/e 584.01 (M+1) <sup>+</sup> , 606.17 (M+23) <sup>+</sup>
59	4-F-Ph	Н	Н	Et	c-Hex	<sup>1</sup> H NMR (DMSO- $d_6$ ) $\delta$ 0.75-0.84 (m, 3H), 1.24 (d, $J = 22.8$ Hz, 3H),
						1.29-1.47 (m, 6H), 1.51-1.70 (m, 6H), 3.59-3.66 (m, 1H), 3.77-3.84
						(m, 1H), 3.98-4.04 (m, 1H), 4.21-4.27 (m, 1H), 4.34-4.41 (m, 1H),
						4.60-4.65 (m, 1H), 5.56-5.60 (m, 1H), 5.84-5.90 (m, 1H), 6.00-6.08
						(m, 2H), 7.20-7.24 (m, 4H), 7.56(d, J = 8.0Hz, 1H), 11.49 (s, 1H); MS,
						$m/e 602.00(M+1)^+$
<b>40</b>	Dh	п	п	Ma	E"Cn	<sup>1</sup> H NMR (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 1.18-1.25(m, 6H), 3.71-3.89 (m, 2H), 3.92-3.99
60	Ph	Н	Н	Me	F-CH <sub>2</sub> - CH <sub>2</sub> -	(m, 1H), 4.19-4.27 (m, 4H), 4.48-4.61 (m, 2H), 3.94-3.98 (m, 2H),
					2112	4.11-4.23 (m, 4H), 5.47-5.52 (m, 1H), 6.01-6.11 (m, 1H), 5.90-6.14
						(m, 2H), 7.15-7.21 (m, 3H), 7.32-7.36 (m, 2H), 7.46-7.57 (m, 1H),
						(III, 2H), 7.13-7.21 (III, 3H), 7.32-7.30 (III, 2H), 7.40-7.37 (III, 1H), 11.49 (s,1H); MS, m/e 533.86 (M+1) <sup>+</sup>
						עד. דו (פונד), נונד), איז איז (פונד) איז (פונד), נונד, איז (פונד) איז (פונד) איז (פונד) איז (פונד) איז (פונד)

Ex.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3a</sup>	R <sup>3b</sup>	R <sup>4</sup>	NMR/MS
61	Ph	Н	Н	Me	F <sub>2</sub> CH-	<sup>1</sup> H NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δ 1.17-1.24 (m, 6H), 3.67-3.81 (m, 1H), 3.89-
					CH <sub>2</sub> -	3.98 (m, 2H),4.21-4.36 (m, 4H), 5.48-5.53 (m, 1H), 5.82-6.05 (m,
						2H), 6.18-6.22 (m, 2H), 7.15-7.20 (m, 3H), 7.32-7.36 (m, 2H), 7.51 (s,
						1H),11.50 (s, 1H); MS, m/e 551.92 (M+1) <sup>+</sup> ;
62	Ph	Н	Н	Me	(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	¹H NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δ 1.13-1.29 (m, 6H), 3.67-3.81 (m, 1H), 3.94-
					CH-	4.32 (m, 4H), 5.47 (t, J = 8 Hz 1H), 5.82-6.01 (m, 2H), 6.33-6.36 (m,
						1H), 6.70-6.78 (m, 1H), 7.09-7.15 (m, 3H), 7.28-7.32 (m, 2H), 7.43-
						7.46 (m, 1H),11.44 (s, 1H); MS, m/e 637.90 (M+1) <sup>+</sup>
63	Ph	Н	Н	Me	$(CH_2F)_2$	<sup>1</sup> H NMR (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 1.20-1.29 (m, 6H), 3.70-3.90 (m, 1H), 3.91-
*					-CH-	4.12 (m, 2H), 4.20-4.33 (m, 1H), 4.35-4.48 (m, 1H), 4.52-4.55 (m,
						2H) , 4.63-4.67 (m, 2H), 5.20-5.35 (m, 1H), 5.56 (t, $J = 8.4$ Hz, 1H),
						5.80-5.95 (m, 1H), 5.95-6.10 (m, 1H), 6.18-6.21 (m, 1H), 7.18-7.23
						(m, 3H), 7.35-7.39 (m, 2H), 7.54 (s, 1H),11.55 (s, 1H); MS, m/e
						565.98 (M+1) <sup>+</sup>
64	Ph	Н	Н	Me	c-Pr-	<sup>1</sup> H NMR (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 0.20-0.24(m, 2H), 0.47-0.48(m, 2H), 0.76-
٠.					CH <sub>2</sub> -	0.84(m, 3H), 1.03-1.05(m, 1H), 1.23(dd, J= 22.4 6.8 Hz 3H), 1.55-
						1.60(m, 2H), 3. 61-3.68(m, 1H), 3. 81-3.89 (m, 3H), 3.98-4.03(m, 1H),
						4.23-4.29(m, 1H), 4.35-4.41(m, 1H), 5.56-6.00(m, 1H), 5.88-5.91(m,
						1H), 6.04-6.10(m, 2H), 7.20-7.24(m, 4H), 7.55 (d, <i>J</i> = 7.6 Hz
						1H),11.53 (s, 1H); MS, <i>m/e</i> 573.17 (M+1) <sup>+</sup>
65	Ph	Н	Н	Et	c-Pen	<sup>1</sup> H NMR (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 0.75-0.83 (m, 3H), 1.20-1.28 (m, 3H), 1.49-
						1.63 (m, 8H), 1.76-1.80 (m, 2H), 3.58-3.60 (m, 1H), 3.70-3.82 (m,
						1H), 3.98-4.05 (m, 1H), 4.24-4.26 (m, 1H) , 4.37-4.42 (m, 1H), 5.03
						(s, 1H), 5.54-5.57 (m, 1H), 5.90-6.00 (m,1H), 6.02-6.07 (m, 2H), 7.15-
						7.22 (m, 3H), 7.35-7.39 (m, 2H) 7.55 (d, $J = 8.0$ Hz, 1H), 11.55 (s,
						1H); MS, m/e 570.03 (M+1) <sup>+</sup>

<sup>\*</sup>R<sup>2</sup> and R<sup>3b</sup> together are –(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>– as derived from L-proline

# The purification procedure by Prep-HPLC:

Crude products were dissolved in methanol. Injection volumes of these solutions were 5 mL.

The preparative HPLC system including 2 sets of Gilson 306 pumps, a Gilson 156 UV/Vis detector, a Gilson 215 injector & fraction collector, with Unipoint control software. A Ymc 25×30×2 mm column was used. The mobile phase was HPLC grade water (A), and HPLC grade acetonitrile (B). Fractions were collected into 100\*15mm glass tubes.

HPLC gradient is shown in Table 1. Once the gradient was selected, acetonitrile solution was injected into HPLC system, and then fractions collected

2983472-1

according to UV peaks. After the separation, each glass tubes were run MS test to collect the desired compounds. The fractions with target MS were combined in a well-weighted flask. Most of acetonitrile was removed under reduce pressure and the remaining solution was freeze-dried to give desired compound.

5

Table 1:

Preparative HPLC gradient						
Time (min)	Flow rate	% A	% B			
	(mL/min)					
0	15	90	10			
30	15	60	40			

# **Preparation of Example 66**

# 10 Scheme

# Preparation of compound (b)

2983472-1

- 688 -

10

15

20

To a solution of compound **a** (1 g, 2.69 mmol) in anhydrous THF (30 mL) was added dropwise 1 M solution of LiAl(OBu-t)<sub>3</sub>H in THF (2.69 mL, 2.69 mmol) at -20 °C. The reaction mixture was stirred for 2-3 h at the same temperature. EtOAc (100 mL) was added followed by saturated NH<sub>4</sub>Cl solution (10 mL) and reaction mixture was slowly brought to room temperature. Reaction mixture was extracted with EtOAc and washed with 1N HCl and water. Combined organic phase was evaporated to give 0.8 g of crude compound **b** as transparent oil, which was used directly for next reaction.

## Preparation of compound (d)

To a solution of compound **b** (0.8 g, 2.1mmol), compound **c** (0.45 g, 2.5 mmol) and Ph<sub>3</sub>P (0.56 g, 2.1 mmol) in anhydrous THF (20 mL) under nitrogen atmosphere was added DEAD (1.8 mL). The reaction mixture was stirred at room temperature overnight. The reaction solution was concentrated under reduce pressure. The residue was separated by preparative layer chromatography (hexanes:EtOAc = 3:1) to give crude compound **d** (0.8 g). The crude compound **d** was used to the next step without further purification.

### Preparation of compound (e)

Compound d (0.8 g, 1.57 mmol) was dissolved in THF (2 mL) and THF saturated with ammonia (5 mL) was then added to this solution. The reaction mixture was heated to 90 °C overnight. After 18 hours, the solution was cooled to room temperature by ice water, then the solvent was removed under reduced pressure and the residue was purified by column to give compound e (0.75 g) for the next step.

### Preparation of compound (f)

25 Compound e (0.5 g, 1.01 mmol) was dissolved in methanol (2 mL) and methanol was saturated with ammonia (5 mL) was then added to this solution. The reaction mixture was stirred at room temperature overnight. After 18 hours, the solvent was removed under reduced pressure and the residue was purified by column to give crude compound f (0.15 g) for the next step.

## 30 Preparation of compound (i)

A solution of triethylamine (1.07 g, 10.6 mmol) in anhydrous dichloromethane (15 mL) was added dropwise to a solution of compound g (1.16

g, 5.3 mmol) and compound **h** (1.31 g, 5.3 mmol) in dichloromethane (10 mL) with vigorous stirring at -78 °C over a period of 2 hours. After completion of addition, the reaction temperature was allowed to warm to room temperature gradually and stirred over night. Then the solvent was removed under vacuum and anhydrous ether 20 mL was added and the precipitated salt was filtered and the precipitate was washed with ether. The combined organic phase was concentrated to give the colorless oil of compound **i** (1.0 g).

# **Preparation of Compound 66**

To a solution of compound **j** (0.1 g, 0.35 mmol) dissolved in 10 mL of anhydrous THF, stirred and added 0.4g NMI till the solution became clear, added compound **i** (0.8 g, 2.89 mmol) in 10 mL THF dropwise, stirred at r.t. overnight. Compound purity and identification was confirmed by LCMS. The solvent was evaporated and purified by Prep-HPLC to afford 66. (25 mg, Yield: 13.6%). <sup>1</sup>H NMR (DMSO-*d*<sub>6</sub>) δ 1.08 (d, *J* = 22.8 Hz, 3H), 1.17-1.24 (m, 3H), 3.50-3.52 (m, 3H), 3.78-3.83 (m, 1H), 4.10-4.13 (m, 1H), 4.24-4.44 (m, 2H), 5.85-5.92 (m, 1H), 6.01-6.11 (m,1H), 6.2.-6.27 (m, 1H), 7.08-7.19 (m, 4H), 7.31-7.38 (m, 3H), 8.15 (s, 1H), 8.26 (s, 1H); MS, *m/e* 525 (M+1)<sup>+</sup>.

20 Example numbers 67-74, identified below, were prepared using similar procedures disclosed for Example 66, above.

Example	R <sup>11</sup>	R <sup>10</sup>	NMR/MS	
67	ОН	NH <sub>2</sub>	<sup>1</sup> H NMR (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 1.06-1.13 (m, 3H), 1.20-1.24	
			(m, 3H), 3.27-3.33(m, 3H), 3.56 (s, 1H), 3.82-3.88	
			(m, 1H), 4.07-4.13 (m, 1H), 4.25-4.40 (m, 2H),	
			5.85-5.87 (m, 1H), 5.98-6.09 (m, 2H), 6.59 (s, 32H),	
			7.14-7.37 (m, 3H), 7.35-7.37 (m, 2H), 7.79 (d, <i>J</i> =7.2	
			Hz, 1H), 10.69 (s, 1H); MS, $m/e$ 541 (M+1) <sup>+</sup> ;	
68	NH <sub>2</sub>	NH <sub>2</sub>	<sup>1</sup> H NMR (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 1.07 (d, <i>J</i> =22.8 Hz, 3H),	
			1.19 (d, <i>J</i> =7.2 Hz, 3H), 3.51 (s, 3H), 3.62 (s, 1H),	

Example	R <sup>II</sup>	R <sup>10</sup>	NMR/MS
			3.75-3.81 (m, 1H), 4.05-4.11 (m, 1H), 4.27-4.42 (m,
			2H), 5.79-5.83 (m, 1H), 5.92 (s, 2H), 6.00-6.09 (m,
			2H), 6.75 (s, 2H), 7.08-7.17 (m, 3H), 7.31-7.35 (m,
			2H), 7.78 (s, 1H); MS, <i>m/e</i> 540 (M+1) <sup>+</sup> ;
69	NH <sub>2</sub>	c-Pentyl-NH-	<sup>1</sup> H NMR (DMSO- $d_6$ ) $\delta$ 1.05 (d, $J$ =22.8 Hz, 3H),
			1.09-1.19 (m, 3H), 1.48 (s, 4H), 1.66 (s, 1H), 1.86
			(s, 1H), 3.54 (d, <i>J</i> =14 Hz, 3H), 3.65 (s, 1H), 4.25-
			4.43 (m, 4H), 5.71-5.82 (m, 1H), 5.94-6.04 (m, 4H),
			7.11-7.24 (m, 3H), 7.26-7.34 (m, 2H), 7.77(d, <i>J</i> =3.6
			Hz, 1H); MS, <i>m/e</i> 608(M+1) <sup>+</sup>
70	NH <sub>2</sub>		<sup>1</sup> H NMR (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 1.07 (d, <i>J</i> =22.4 Hz, 3H),
		$ -N\rangle$	2.35-2.38 (m, 2H), 3.54 (d, <i>J</i> =9.2 Hz, 3H), 3.59-3.62
			(m, 2H), 3.65 (s, 1H), 3.75-3.82 (m, 1H), 4.01-4.13
			(m, 2H), 4.22-4.40 (m, 6H), 5.75-5.85 (m, 1H),
			6.00-6.07 (m, 4H), 7.15-7.21 (m, 3H), 7.32-7.35 (m,
			2H), 7.79 (d, <i>J</i> =4.0 Hz, 1H); MS, <i>m/e</i> 580 (M+1) <sup>+</sup>
71	NH <sub>2</sub>	Et <sub>2</sub> N-	<sup>1</sup> H NMR (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 1.06-1.28 (m, 12H), 3.55 (d,
			<i>J</i> =4.8 Hz, 3H), 3.79-3.87 (m, 4H), 4.07-4.12 (m,
			2H), 4.29-4.42 (m, 3H), 5.75-5.82 (m, 1H), 5.94 (s,
			2H), 6.04-6.10 (m, 2H), 7.14-7.22 (m, 3H), 7.31-
			7.37 (m, 2H), 7.82 (d, <i>J</i> =4.4 Hz, 1H); MS, <i>m/e</i> 596
			(M+1) <sup>+</sup>
72	NH <sub>2</sub>	n-Propyl-NH-	<sup>1</sup> H NMR (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 0.84 (t, <i>J</i> =7.2 Hz, 3H), 1.01-
			1.01 (m, 3H), 1.09-1.12 (m, 3H), 1.51-1.56 (m, 2H),
			3.48 (d, <i>J</i> =15.2 Hz, 3H), 3.79-3.82 (m, 1H), 4.04-
			4.05 (m, 1H), 4.27-4.38 (m, 3H), 5.72-5.79 (m, 1H),
			5.98-6.04 (m, 4H), 7.13-7.20 (m, 3H), 7.26-7.32 (m,
			2H), 7.76 (d, <i>J</i> =5.2 Hz, 1H); MS, <i>m/e</i> 582 (M+1) <sup>+</sup>
73	NH <sub>2</sub>	c-Butyl-NH-	<sup>1</sup> H NMR (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 1.02-1.08 (m, 3H), 1.18 (d,
			<i>J</i> =4.8 Hz, 3H), 1.44-1.61 (m, 2H) , 2.02-2.17 (m,
			4H), 3.51 (d, <i>J</i> =10.8 Hz, 3H), 3.78-3.83 (m, 1H),
			4.03-4.06 (m, 1H), 4.27-4.38 (m, 2H), 4.53-4.62 (m,
			1H), 5.68-5.79 (m, 1H), 5.95-6.04 (m, 4H), 7.11-
			7.18 (m, 3H), 7.29-7.35 (m, 2H), 7.51-7.58 (m, 1H),
			7.78 (d, $J$ =5.2 Hz, 1H); MS, $m/e$ 594 (M+1) <sup>+</sup>

Example	R <sup>11</sup>	R <sup>10</sup>	NMR/MS
74	NH <sub>2</sub>	Me-N N-	<sup>1</sup> H NMR (DMSO- $d_6$ ) $\delta$ 0.97-1.20 (m, 6H), 2.18 (s,
			3H), 2.19 (s, 4H), 3.43-3.47(m, 3H), 3.75 (s, 1H),
			4.01-4.06 (m, 4 H), 4.22-4.35 (m, 3H), 5.69-5.75 (m,
			1H), 5.98-6.05 (m, 3H), 7.09-7.15 (m, 3H), 7.25-
			7.29 (m, 2H), 7.77 (d, <i>J</i> =3.6 Hz, 1H); MS, <i>m/e</i> 623
			(M+1) <sup>+</sup>

Example numbers 75-80 are prepared using similar procedures disclosed for Example **66**, above.

5

		•
Example	R <sup>11</sup>	R <sup>10</sup>
75	Н	n-propyl-NH-
76	Н	c-Butyl-NH-
<b>7</b> 7	Н	c-Pentyl-NH-
78	Н	$-$ N $\bigcirc$
79	Н	_N
80	Н	-N

**EXAMPLE 81** 

Certain exemplified compounds were obtained as mixture of diastereomers because of the chirality at phosphorous. The diastereomers were

2983472-1

- 692 -

separated on a Chiralpak-AS-H (2 X 25 cm) column under Supercritical Fluid Chromatography (SFC) conditions using 20% methanol in carbon dioxide as solvent. The absolute stereochemistry of the P-chiral center of the diastereromers were not determined. However, chromatographic resolution of these two diastereomers provides for isomers that are characterized as fast eluting and slow eluting isomers. Some examples are shown below.

Compound	EC90 (uM)
Example 15 (Diastereomeric mixture)	0.86
Fast Moving isomer of Example 15	1.35
Slow Moving isomer of Example 15	0.26
Example 39 (Diastereomeric mixture)	0.47
Fast Moving isomer of Example 39	0.78
Slow Moving isomer of Example 39	0.02
Example 49 (Diastereomeric mixture)	0.126
Fast Moving isomer of Example 49	0.03
Slow Moving isomer of Example 49	5.78

#### **EXAMPLE 82**

HCV replicon assay. HCV replicon RNA-containing Huh7 cells

(clone A cells; Apath, LLC, St. Louis, Mo.) were kept at exponential growth in Dulbecco's modified Eagle's medium (high glucose) containing 10% fetal bovine serum, 4 mM L-glutamine and 1 mM sodium pyruvate, 1× nonessential amino acids, and G418 (1,000 μg/ml). Antiviral assays were performed in the same medium without G418. Cells were seeded in a 96-well plate at 1,500 cells per well, and test compounds were added immediately after seeding. Incubation time 4 days. At the end of the incubation step, total cellular RNA was isolated (RNeasy 96 kit; Qiagen). Replicon RNA and an internal control (TaqMan rRNA control reagents; Applied Biosystems) were amplified in a single-step multiplex

RT-PCR protocol as recommended by the manufacturer. The HCV primers and probe were designed with Primer Express software (Applied Biosystems) and covered highly conserved 5'-untranslated region (UTR) sequences (sense, 5'-AGCCATGGCGTTAGTA(T)GAGTGT-3', and antisense, 5'-

5 TTCCGCAGACCACTATGG-3'; probe, 5'-FAM-CCTCCAGGACCCCCCCTCCC-TAMRA-3').

To express the antiviral effectiveness of a compound, the threshold RT-PCR cycle of the test compound was subtracted from the average threshold RT-PCR cycle of the no-drug control ( $\Delta Ct_{HCV}$ ). A  $\Delta Ct$  of 3.3 equals a 1-log 10 reduction (equal to the 90% effective concentration [EC<sub>90</sub>]) in replicon RNA levels. The cytotoxicity of the test compound could also be expressed by calculating the  $\Delta Ct_{rRNA}$  values. The  $\Delta \Delta Ct$  specificity parameter could then be introduced ( $\Delta Ct_{HCV} - \Delta Ct_{rRNA}$ ), in which the levels of HCV RNA are normalized for the rRNA levels and calibrated against the no-drug control.

Ex #	Compound	Log10 Reduction at 50µM	EC90 (μM)
5	MeO <sub>2</sub> C N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	-1.21	3.0
6	MeO-22 H	-0.45	ND
7	MeO <sub>2</sub> C H	0.31	ND
8	Me O,C	-1.48	2.11

Ex #	Compound	Log10 Reduction at 50µM	EC90 (μM)
10	MeQC H	-1.25	19.15
11	MeQC H	-0.55	ND
12	Meo.c. NH2	0.31	ND
15	MeO Ph O N O N O N O N O N O N O N O N O N O	ND	0.86
25	N HO F	-2.22	0.39
27	ZH NO HO	-2.25	0.66
28	NH NH NH NH NH NH NH NH NH NH NH NH NH N	-2.16	0.75

Ex #	Compound	Log10 Reduction at 50µM	EC90 (μM)
36	CI NH NH NH O HO F	-1.64	21.9
39	CI NH O NH	-1.78	0.47
49	NH NH NH NH NH NH NH NH NH NH NH NH NH N	-2.69	0.126
53	O NH N N HO F	-1.33	<0.3
54	Br NH	-1.55	0.57
55	O NH O NH O NH O NH O NH O NH O NH	-2.38	<0.3
69	NH NH NH NH NH NH	-2.25	< 0.3

Ex #	Compound	Log10 Reduction at 50µM	EC90 (μM)
70	NH <sub>2</sub>	-2.25	<0.3

<sup>1</sup>(4-BrPh): 4-bromo-phenyl.

The entire contents of 60/909,315, filed March 30, 2007; 60/982,309, filed October 24, 2007; and 12/053,015, filed March 21, 2008 are hereby

- incorporated by reference in the present application so far as needed to supplement the present disclosure and/or rectify any errors. Moreover, the patent and non-patent references disclosed herein are incorporated by reference. In the event that the incorporated patent and non-patent reference contains a term that conflicts with a term disclosed in either one of the two Provisional
- Applications or the present application text, the meaning of the term contained in the present application text and the two Provisional Applications controls provided that the overall meaning of the incorporated subject matter is not lost.

### We claim:

1. A compound, its stereoisomer, salt, hydrate, solvate, or crystalline form thereof, represented by formula I:

$$R^{3a}$$
 $N$ 
 $P^*$ 
 $O$ 
 $R^{5}$ 
 $R^{6}$ 
 $R^{6}$ 

I

5

#### wherein

- (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, n-alkyl; branched alkyl; cycloalkyl; or aryl, which includes, but is not limited to, phenyl or naphthyl, where phenyl or naphthyl are optionally substituted with at least one of C<sub>1-6</sub> alkyl, C<sub>2-6</sub> alkenyl, C<sub>2-6</sub> alkynyl,

  C<sub>1-6</sub> alkoxy, F, Cl, Br, I, nitro, cyano, C<sub>1-6</sub> haloalkyl, -N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, C<sub>1-6</sub> acylamino, -NHSO<sub>2</sub>C<sub>1-6</sub> alkyl, -SO<sub>2</sub>N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, COR<sup>1</sup>, and -SO<sub>2</sub>C<sub>1-6</sub> alkyl; (R<sup>1</sup> is independently hydrogen or alkyl, which includes, but is not limited to, C<sub>1-20</sub> alkyl, C<sub>1-10</sub> alkyl, or C<sub>1-6</sub> alkyl, R<sup>1</sup> is -OR' or -N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>);
- (b) R<sup>2</sup> is hydrogen, C <sub>1-10</sub> alkyl, R<sup>3a</sup> or R<sup>3b</sup> and R<sup>2</sup> together are (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>
  so as to form a cyclic ring that includes the adjoining N and C atoms,
  C(O)CR<sup>3a</sup>R<sup>3b</sup>NHR<sup>1</sup>, where n is 2 to 4 and R<sup>1</sup>, R<sup>3a</sup>, and R<sup>3b</sup>;
- (c) R<sup>3a</sup> and R<sup>3b</sup> are (i) independently selected from hydrogen, C<sub>1-10</sub> alkyl, cycloalkyl, -(CH<sub>2</sub>)<sub>c</sub>(NR<sup>3'</sup>)<sub>2</sub>, C<sub>1-6</sub> hydroxyalkyl, -CH<sub>2</sub>SH, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>S(O)<sub>d</sub>Me, (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>NHC(=NH)NH<sub>2</sub>, (1H-indol-3-yl)methyl, (1H-imidazol-4-yl)methyl, (CH<sub>2</sub>)<sub>e</sub>COR<sup>3"</sup>, aryl and aryl C<sub>1-3</sub> alkyl, said aryl groups optionally substituted with a group selected from hydroxyl, C<sub>1-10</sub> alkyl, C<sub>1-6</sub> alkoxy, halogen, nitro and cyano; (ii) R<sup>3a</sup> and R<sup>3b</sup> both are C<sub>1-6</sub> alkyl; (iii) R<sup>3a</sup> and R<sup>3b</sup> together are (CH<sub>2</sub>)<sub>f</sub> so as to form a spiro ring; (iv) R<sup>3a</sup> is hydrogen and R<sup>3b</sup> and R<sup>2</sup> together are (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> so as to form a cyclic ring that includes the adjoining N and C atoms (v) R<sup>3b</sup> is hydrogen and R<sup>3a</sup> and R<sup>2</sup> together are (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> so as to form a cyclic ring that

includes the adjoining N and C atoms, where c is 1 to 6, d is 0 to 2, e is 0 to 3, f is 2 to 5, n is 2 to 4, and where R<sup>3'</sup> is independently hydrogen or C<sub>1-6</sub> alkyl and  $R^{3''}$  is -OR' or -N( $R^{3'}$ )<sub>2</sub>); (vi)  $R^{3a}$  is H and  $R^{3b}$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH<sub>2</sub>-indol-3-yl, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H, CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, 5 CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>-imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl; or (viii) R<sup>3a</sup> is CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH2-indol-3-vl, -CH2CH2SCH3, CH2CO2H, CH2C(O)NH2, CH2CH2COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>-10 imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl and R<sup>3b</sup> is H. where R<sup>3'</sup> is independently hydrogen or alkyl, which includes, but is not limited to,  $C_{1-20}$  alkyl,  $C_{1-10}$  alkyl, or  $C_{1-6}$  alkyl,  $R^{3"}$  is -OR' or  $-N(R^{3})_{2}$ ;

- 15 (d) R<sup>4</sup> is hydrogen, C<sub>1-10</sub> alkyl, C<sub>1-10</sub> alkyl optionally substituted with a lower alkyl, alkoxy, di(lower alkyl)-amino, or halogen, C<sub>1-10</sub> haloalkyl, C<sub>3-10</sub> cycloalkyl, cycloalkyl alkyl, cycloheteroalkyl, aminoacyl, aryl, such as phenyl, heteroaryl, such as, pyridinyl,substituted aryl, or substituted heteroaryl;
- (e) R<sup>5</sup> is H, a lower alkyl, CN, vinyl, O-(lower alkyl), hydroxyl lower 20 alkyl, i.e., -(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>OH, where p is 1 -6, including hydroxyl methyl (CH<sub>2</sub>OH), CH<sub>2</sub>F, N<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CN, CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>NHCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, alkyne (optionally substituted), or halogen, including F, Cl, Br, or I, with the provisos that when X is OH, base is cytosine and R<sup>6</sup> is H, R<sup>5</sup> cannot be N<sub>3</sub> and when X is OH, R<sup>6</sup> is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F and B is a purine base, R<sup>5</sup> cannot be H;
  - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, F, or CN;
    - (g) X is H, OH, F, OMe, halogen, NH<sub>2</sub>, or N<sub>3</sub>;
    - (h) Y is OH, H,  $C_{1-4}$  alkyl,  $C_{2-4}$  alkenyl,  $C_{2-4}$  alkynyl, vinyl,  $N_3$ , CN, Cl, Br, F, I,  $NO_2$ ,  $OC(O)O(C_{1-4}$  alkyl),  $OC(O)O(C_{1-4}$  alkyl),  $OC(O)O(C_{2-4}$  alkynyl),  $OC(O)O(C_{2-4}$  alkenyl),  $OC_{1-10}$  haloalkyl, O(aminoacyl),  $O(C_{1-10}$  acyl),  $O(C_{1-4}$  alkyl),  $O(C_{2-4}$  alkenyl),  $O(C_{1-4}$  acyl),  $O(C_{1-4}$  alkyl),  $O(C_{2-4}$  alkenyl),  $O(C_{1-4}$  acyl),  $O(C_{2-4}$  alkyl),  $O(C_{2-4}$  alkenyl),  $O(C_{2-4}$  alkyl),  $O(C_{2-4}$  alkenyl),  $O(C_{2-4}$  alkyl),  $O(C_{2-4}$  alkenyl),  $O(C_{2-4}$  alkyl),  $O(C_{2-4}$  alkyl), O(

2983472-1

25

SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> acyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>2-4</sub> alkynyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>2-4</sub> alkenyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> acyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>2-4</sub> alkenyl), NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1-4</sub> alkyl), NH(C<sub>2-4</sub> alkenyl), NH(C<sub>2-4</sub> alkynyl), NH(C<sub>1-4</sub> acyl), N(C<sub>1-4</sub> alkyl)<sub>2</sub>, N(C<sub>1-18</sub> acyl)<sub>2</sub>, wherein alkyl, alkynyl, alkenyl and vinyl are optionally substituted by N<sub>3</sub>, CN, one to three halogen (Cl, Br, F, I), NO<sub>2</sub>, C(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), C(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), C(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), C(O)O(C<sub>2-4</sub> alkynyl), C(O)O(C<sub>2-4</sub> alkenyl), O(C<sub>1-4</sub> acyl), O(C<sub>1-4</sub> alkyl), O(C<sub>2-4</sub> alkenyl), SO(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), NO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), NO<sub>3</sub>(O)<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), NO<sub>4</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), NH(C<sub>1-4</sub> alkyl), NH(C<sub>1-4</sub> acyl)<sub>2</sub>;

the base is a naturally occurring or modified purine or pyrimidine base represented by the following structures:

wherein

Z is N or  $CR^{12}$ ;

 $R^7$ ,  $R^8$ ,  $R^9$ ,  $R^{10}$ , and  $R^{11}$  are independently H, F, Cl, Br, I, OH, OR', SH, SR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkenyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkenyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkynyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> such as C=CH, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkynyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkoxy of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkoxy of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>H, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R',

2983472-1

- 700 -

15

wherein R' is an optionally substituted alkyl, which includes, but is not limited to, an optionally substituted C<sub>1-20</sub> alkyl, an optionally substituted C<sub>1-10</sub> alkyl, an optionally substituted lower alkyl; an optionally substituted cycloalkyl; an optionally substituted alkynyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, an optionally substituted lower alkenyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, or optionally substituted acyl, which includes but is not limited to C(O) alkyl, C(O)(C<sub>1-20</sub> alkyl), C(O)(C<sub>1-10</sub> alkyl), or C(O)(lower alkyl) or alternatively, in the instance of NR'<sub>2</sub>, each R' comprise at least one C atom that are joined to form a heterocycle comprising at least two carbon atoms; and

R<sup>12</sup> is an H, halogen (including F, Cl, Br, I), OH, OR', SH, SR', NH<sub>2</sub>,

NHR', NR'<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub> lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkyl of

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkenyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkenyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkynyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkynyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkoxy of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkoxy of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>H, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R'; with the proviso that when base is represented by the structure c with R<sup>11</sup> being hydrogen, R<sup>12</sup> is not a: (i) −C≡C−H, (ii) −C=CH<sub>2</sub>, or (iii) −NO<sub>2</sub>.

- 2. A compound its stereoisomer, salt, hydrate, solvate, or crystalline form thereof selected from among
- 5 2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-*C*-methyluridine 5'-(phenyl methoxy-alanyl phosphate ((S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester);
  - 6 2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-*C*-methyluridine 5'-(phenyl methoxy-valyl phosphate ((S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-3-methyl-butyric acid methyl ester;
  - 7 2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-*C*-methyluridine 5'-(4-bromophenyl methoxy-valyl phosphate ((S)-2-{(4-bromo-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-3-methyl-butyric acid methyl ester);
  - **8** 2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-*C*-methyluridine 5'-(4-bromophenyl methoxyalanyl phosphate (((S)-2-{(4-bromo-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester);
  - 9 N<sup>4</sup>-(*N*,*N*-dimethylformamidinyl)-2'-deoxy-2'-fluoro-2'-*C*-methylcytidine;
  - 10 2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-C-methylcytidine 5'-(phenyl methoxy-alanyl phosphate (((S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-oxo-3-amino-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-

2983472-1

20

25

30

10

15

20

25

30

35

40

45

50

- 3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenyoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester);
- 11 2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-*C*-methylcytidine 5'-(4-bromophenyl methoxy-valyl phosphate (2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-*C*-methyluridine 5'-(4-bromophenyl methoxy-valyl phosphate ((S)-2-{(4-bromo-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-oxo-3-amino-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxyl-phosphorylamino}-3-methyl-butyric acid methyl ester);
- 12 2'-deoxy-2'-fluoro-2'-*C*-methylcytidine 5'-(phenyl methoxy-valyl phosphate ((S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-oxo-3-amino-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-3-methyl-butyric acid methyl ester;
- 13 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid ethyl ester;
- 14 (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(naphthalen-1-yloxy)-phosphorylamino]-propionic acid benzyl ester;
- **15** {[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-acetic acid methyl ester;
- 16 (S)-2-{(2,4-Dichloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
- 17 (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(naphthalen-1-yloxy)-phosphorylamino]-propionic acid methyl ester;
  - **18** (S)-1-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphoryl}-pyrrolidine-2-carboxylic acid methyl ester;
  - 19 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid butyl ester;
  - **20** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid benzyl ester;
  - **21** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-fluoro-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid methyl ester;
  - **22** (S)-2-{(4-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxyl-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
  - **23** (S)-2-{(3,4-Dichloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
- **24** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid sec-butyl ester;
- 25 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid isopropyl ester;

10

15

20

25

30

35

40

45

- **26** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-methoxy-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid butyl ester;
- **27** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-fluoro-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid ethyl ester;
- **28** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-fluoro-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid isopropyl ester;
- **29** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-fluoro-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid benzyl ester;
- **30** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-methoxy-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid isopropyl ester;
- 31 (S)-2-{(2-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid benzyl ester;
- **32** (S)-2-{(2,4-Dichloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid butyl ester;
- **33** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-p-tolyloxy-phosphorylamino}-propionic acid isopropyl ester;
- **34** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-fluoro-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid butyl ester;
- **35** (S)-2-{(3,4-Dichloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid ethyl ester;
- **36** (S)-2-{(2-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid isopropyl ester;
- 37 (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-methoxy-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid benzyl ester;
- **38** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid pentyl ester;
- **39** (S)-2-{(4-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid isopropyl ester;
- **40** (S)-2-{(4-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid butyl ester;
- **41** (S)-2-{(4-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid ethyl ester;

15

20

25

30

35

40

45

- **42** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-p-tolyloxy-phosphorylamino}-propionic acid butyl ester;
- **43** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo- 3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-p-tolyloxy-phosphorylamino}-propionic acid benzyl ester;
- 44 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-butyric acid methyl ester;
- **45** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid 4-fluoro-benzyl ester;
- **46** (S)-2-{(2-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid butyl ester;
- **47** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid 3-methyl-butyl ester;
- **48** (S)-2-{(2,4-Dichloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid ethyl ester;
- **49** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid cyclohexyl ester;
- **50** (R)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid butyl ester;
- **51** (R)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid isopropyl ester;
- **52** (R)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid benzyl ester;
- **53** (S)-2-{(2-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid butyl ester;
- **54** (S)-2-{(4-Bromo-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid isopropyl ester;
- 55 (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-fluoro-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid cyclohexyl ester;
- **56** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-bromo-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid cyclohexyl ester;
- 57 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-butyric acid isopropyl ester;

2983472-1

- 704 -

10

15

20

25

30

35

40

45

- **58** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-butyric acid cyclohexyl ester;
- **59** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-fluoro-phenoxy)-phosphorylamino]-butyric acid cyclohexyl ester;
- **60** (S)-2-{(4-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4 R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-butyric acid isopropyl ester;
- **61** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid 2,2-difluoro-ethyl ester;
- **62** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid 2,2,2-trifluoro-1-trifluoromethyl-ethyl ester;
- **63** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid 2-fluoro-1-fluoromethyl-ethyl ester;
- **64** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid cyclopropyl methyl ester;
  - **65** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-butyric acid cyclopentyl ester;
  - **66** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(6-Amino-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
  - **67** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-Amino-6-hydroxy-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
  - **68** (S)-2-{(R)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,6-Diamino-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
  - **69** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-Amino-6-cyclopentylamino-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
  - **70** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-Amino-6-azetidin-1-yl-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
- 71 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-Amino-6-diethylamino-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
  - **72** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-Amino-6-propylamino-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
  - 73 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-Amino-6-cyclobutylamino-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;

10

74 (S)-2-({(2R,3R,4R,5R)-5-[2-Amino-6-(4-methyl-piperazin-1-yl)-purin-9-yl]-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy}-phenoxy-p hosphorylamino)-propionic acid methyl ester;

75 (2S)-methyl 2-((((2R,3R,4R,5R)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-5-(6-(propylamino)-9H-purin-9-yl)tetrahydrofuran-2-yl)methoxy)(phenoxy)phosphorylamino)propanoate;

**76** (2S)-methyl 2-((((2R,3R,4R,5R)-5-(6-(cyclobutylamino)-9H-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyltetrahydrofuran-2-yl)methoxy)(phenoxy)phosphorylamino)propanoate;

77 (2S)-methyl 2-((((2R,3R,4R,5R)-5-(6-(cyclopentylamino)-9H-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyltetrahydrofuran-2-yl)methoxy)(phenoxy)phosphorylamino)propanoate;

78 (2S)-methyl 2-((((2R,3R,4R,5R)-5-(6-(aziridin-1-yl)-9H-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyltetrahydrofuran-2-

15 yl)methoxy)(phenoxy)phosphorylamino)propanoate;

79 (2S)-methyl 2-((((2R,3R,4R,5R)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-5-(6-(piperidin-1-yl)-9H-purin-9-yl)tetrahydrofuran-2-yl)methoxy)(phenoxy)phosphorylamino)propanoate; and

80 (2S)-methyl 2-((((2R,3R,4R,5R)-5-(6-(azetidin-1-yl)-9H-purin-9-yl)-20 4-fluoro-3-hydroxy-4-methyltetrahydrofuran-2yl)methoxy)(phenoxy)phosphorylamino)propanoate.

A composition for the treatment and/or prophylaxis of any of the viral agents disclosed herein said composition comprising a pharmaceutically acceptable medium selected from among an excipient, carrier, diluent, and equivalent medium and a compound, its stereoisomer, salt, hydrate, solvate, or crystalline form thereof, represented by formula I:

$$R^{3a}$$
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{3a}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{3a}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{3a}$ 
 $R^{3a}$ 
 $R^{3a}$ 
 $R^{3a}$ 
 $R^{3a}$ 
 $R^{3a}$ 
 $R^{3a}$ 
 $R^{3a}$ 
 $R^{3a}$ 
 $R^{3a}$ 

I

30 wherein

(a)  $R^1$  is hydrogen, n-alkyl; branched alkyl; cycloalkyl; or aryl, which includes, but is not limited to, phenyl or naphthyl, where phenyl or naphthyl are optionally substituted with at least one of  $C_{1-6}$  alkyl,  $C_{2-6}$  alkenyl,  $C_{2-6}$  alkynyl,

2983472-1

- 706 **-**

 $C_{1-6}$  alkoxy, F, Cl, Br, I, nitro, cyano,  $C_{1-6}$  haloalkyl,  $-N(R^{1'})_2$ ,  $C_{1-6}$  acylamino,  $-NHSO_2C_{1-6}$  alkyl,  $-SO_2N(R^{1'})_2$ ,  $COR^{1"}$ , and  $-SO_2C_{1-6}$  alkyl; ( $R^{1'}$  is independently hydrogen or alkyl, which includes, but is not limited to,  $C_{1-20}$  alkyl,  $C_{1-10}$  alkyl, or  $C_{1-6}$  alkyl,  $R^{1"}$  is -OR' or  $-N(R^{1'})_2$ );

- 5 (b) R<sup>2</sup> is hydrogen, C <sub>1-10</sub> alkyl, R<sup>3a</sup> or R<sup>3b</sup> and R<sup>2</sup> together are (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> so as to form a cyclic ring that includes the adjoining N and C atoms, C(O)CR<sup>3a</sup>R<sup>3b</sup>NHR<sup>1</sup>, where n is 2 to 4 and R<sup>1</sup>, R<sup>3a</sup>, and R<sup>3b</sup>;
- R<sup>3a</sup> and R<sup>3b</sup> are (i) independently selected from hydrogen, C<sub>1-10</sub> alkyl, cycloalkyl, - $(CH_2)_c(NR^3)_2$ ,  $C_{1-6}$  hydroxyalkyl, - $CH_2SH$ , - $(CH_2)_2S(O)_dMe$ , -10 (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>NHC(=NH)NH<sub>2</sub>, (1H-indol-3-yl)methyl, (1H-imidazol-4-yl)methyl, -(CH<sub>2</sub>)<sub>e</sub>COR<sup>3"</sup>, aryl and aryl C<sub>1-3</sub> alkyl, said aryl groups optionally substituted with a group selected from hydroxyl,  $C_{1-10}$  alkyl,  $C_{1-6}$  alkoxy, halogen, nitro and cvano; (ii) R<sup>3a</sup> and R<sup>3b</sup> both are C<sub>1-6</sub> alkyl; (iii) R<sup>3a</sup> and R<sup>3b</sup> together are(CH<sub>2</sub>)<sub>f</sub> so as to form a spiro ring; (iv) R<sup>3a</sup> is hydrogen and R<sup>3b</sup> and R<sup>2</sup> together are (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> so as to form a cyclic ring that includes the adjoining N and C atoms (v) R<sup>3b</sup> is 15 hydrogen and R<sup>3a</sup> and R<sup>2</sup> together are (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> so as to form a cyclic ring that includes the adjoining N and C atoms, where c is 1 to 6, d is 0 to 2, e is 0 to 3, f is 2 to 5, n is 2 to 4, and where R<sup>3</sup> is independently hydrogen or C<sub>1-6</sub> alkyl and  $R^{3"}$  is -OR' or -N( $R^{3'}$ )<sub>2</sub>); (vi)  $R^{3a}$  is H and  $R^{3b}$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH<sub>2</sub>-indol-3-yl, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>, 20 CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H, CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>-imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl; or (viii) R<sup>3a</sup> is CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH2-indol-3-vl, -CH2CH2SCH3, CH2CO2H, CH2C(O)NH2, CH2CH2COOH, 25 CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl and R<sup>3b</sup> is H, where R<sup>3'</sup> is independently hydrogen or alkyl, which includes, but is not limited to,  $C_{1\text{--}20}$  alkyl,  $C_{1\text{--}10}$  alkyl, or  $C_{1\text{--}6}$  alkyl,  $R^{3"}$  is -OR' or  $-N(R^{3'})_2);$ 30
  - (d)  $R^4$  is hydrogen,  $C_{1-10}$  alkyl,  $C_{1-10}$  alkyl optionally substituted with a lower alkyl, alkoxy, di(lower alkyl)-amino, or halogen,  $C_{1-10}$  haloalkyl,  $C_{3-10}$

cycloalkyl, cycloalkyl alkyl, cycloheteroalkyl, aminoacyl, aryl, such as phenyl, heteroaryl, such as, pyridinyl, substituted aryl, or substituted heteroaryl;

- (e) R<sup>5</sup> is H, a lower alkyl, CN, vinyl, O-(lower alkyl), hydroxyl lower alkyl, i.e., -(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>OH, where p is 1 -6, including hydroxyl methyl (CH<sub>2</sub>OH), CH<sub>2</sub>F, N<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CN, CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>NHCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, alkyne (optionally substituted), or halogen, including F, Cl, Br, or I, with the provisos that when X is OH, base is cytosine and R<sup>6</sup> is H, R<sup>5</sup> cannot be N<sub>3</sub> and when X is OH, R<sup>6</sup> is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F and B is a purine base, R<sup>5</sup> cannot be H;
  - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, F, or CN;
- 10 (g) X is H, OH, F, OMe, halogen, NH<sub>2</sub>, or N<sub>3</sub>;
- Y is OH, H, C<sub>1-4</sub> alkyl, C<sub>2-4</sub> alkenyl, C<sub>2-4</sub> alkynyl, vinyl, N<sub>3</sub>, CN, (h) Cl, Br, F, I, NO<sub>2</sub>, OC(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), OC(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), OC(O)O(C<sub>2-4</sub> alkynyl), OC(O)O(C<sub>2-4</sub> alkenyl), OC<sub>1-10</sub> haloalkyl, O(aminoacyl), O(C<sub>1-10</sub> acyl),  $O(C_{1-4} \text{ alkyl}), O(C_{2-4} \text{ alkenyl}), S(C_{1-4} \text{ acyl}), S(C_{1-4} \text{ alkyl}), S(C_{2-4} \text{ alkynyl}), S(C_{2-4} \text$ alkenyl),  $SO(C_{1-4} \text{ acyl})$ ,  $SO(C_{1-4} \text{ alkyl})$ ,  $SO(C_{2-4} \text{ alkynyl})$ ,  $SO(C_{2-4} \text{ alkenyl})$ , 15  $SO_2(C_{1-4} \text{ acyl})$ ,  $SO_2(C_{1-4} \text{ alkyl})$ ,  $SO_2(C_{2-4} \text{ alkynyl})$ ,  $SO_2(C_{2-4} \text{ alkenyl})$ ,  $OS(O)_2(C_{1-4} \text{ alkyl})$ 4 acyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>2-4</sub> alkenyl), NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1-4</sub> alkyl), NH(C<sub>2-4</sub> alkenyl),  $NH(C_{2-4}$  alkynyl),  $NH(C_{1-4}$  acyl),  $N(C_{1-4}$  alkyl)<sub>2</sub>,  $N(C_{1-18}$  acyl)<sub>2</sub>, wherein alkyl, alkynyl, alkenyl and vinyl are optionally substituted by N<sub>3</sub>, CN, one to three halogen (Cl, Br, F, I), NO<sub>2</sub>, C(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), C(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), 20  $C(O)O(C_{2-4} \text{ alkynyl}), C(O)O(C_{2-4} \text{ alkenyl}), O(C_{1-4} \text{ acyl}), O(C_{1-4} \text{ alkyl}), O(C_{2-4} \text{ alkynyl})$ alkenyl), S(C<sub>1-4</sub> acyl), S(C<sub>1-4</sub> alkyl), S(C<sub>2-4</sub> alkynyl), S(C<sub>2-4</sub> alkenyl), SO(C<sub>1-4</sub> acyl),  $SO(C_{1-4} \text{ alkyl})$ ,  $SO(C_{2-4} \text{ alkynyl})$ ,  $SO(C_{2-4} \text{ alkenyl})$ ,  $SO_2(C_{1-4} \text{ acyl})$ ,  $SO_2(C_{1-4} \text{ alkyl})$ ,  $SO_2(C_{2-4} \text{ alkynyl})$ ,  $SO_2(C_{2-4} \text{ alkenyl})$ ,  $OS(O)_2(C_{1-4} \text{ acyl})$ , OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>2-4</sub> alkenyl), NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1-4</sub> alkyl), NH(C<sub>2-4</sub> 25 alkenyl),  $NH(C_{2-4}$  alkynyl),  $NH(C_{1-4}$  acyl),  $N(C_{1-4}$  alkyl)<sub>2</sub>,  $N(C_{1-4}$  acyl)<sub>2</sub>;

the base is a naturally occurring or modified purine or pyrimidine base represented by the following structures:

wherein

Z is N or  $CR^{12}$ ;

R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup>,R<sup>9</sup>, R<sup>10</sup>, and R<sup>11</sup> are independently H, F, Cl, Br, I, OH, OR', SH, SR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkenyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkenyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkynyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> such as C≡CH, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkynyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkoxy of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkoxy of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>H, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R',

wherein R' is an optionally substituted alkyl, which includes, but is not limited to, an optionally substituted  $C_{1-20}$  alkyl, an optionally substituted  $C_{1-10}$  alkyl, an optionally substituted lower alkyl; an optionally substituted cycloalkyl; an optionally substituted alkynyl of  $C_2$ - $C_6$ , an optionally substituted lower alkenyl of  $C_2$ - $C_6$ , or optionally substituted acyl, which includes but is not limited to C(O) alkyl,  $C(O)(C_{1-20}$  alkyl),  $C(O)(C_{1-10}$  alkyl), or C(O)(lower alkyl) or alternatively, in the instance of  $NR'_2$ , each R' comprise at least one C atom that are joined to form a heterocycle comprising at least two carbon atoms; and

R<sup>12</sup> is an H, halogen (including F, Cl, Br, I), OH, OR', SH, SR', NH<sub>2</sub>,

NHR', NR'<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub> lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkyl of

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkenyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkenyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkynyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkynyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkoxy of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkoxy of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>H, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R'; with the proviso that when base is represented by the structure c with R<sup>11</sup> being hydrogen, R<sup>12</sup> is not a: (i) -C≡C-H, (ii) -C=CH<sub>2</sub>, or (iii) -NO<sub>2</sub>.

2983472-1

- 709 -

15

20

25

30

35

40

- A composition for the treatment and/or prophylaxis of any of the viral agents disclosed herein said composition comprising a pharmaceutically acceptable medium selected from among an excipient, carrier, diluent, and
   equivalent medium and a compound, its stereoisomer, salt, hydrate, solvate, or crystalline form thereof, selected from among
  - 5 2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-*C*-methyluridine 5'-(phenyl methoxy-alanyl phosphate ((S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester);
  - **6** 2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-*C*-methyluridine 5'-(phenyl methoxy-valyl phosphate ((S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-3-methyl-butyric acid methyl ester;
  - 7 2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-*C*-methyluridine 5'-(4-bromophenyl methoxy-valyl phosphate ((S)-2-{(4-bromo-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-3-methyl-butyric acid methyl ester);
  - **8** 2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-*C*-methyluridine 5'-(4-bromophenyl methoxyalanyl phosphate (((S)-2-{(4-bromo-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester);
  - 9 N<sup>4</sup>-(*N*,*N*-dimethylformamidinyl)-2'-deoxy-2'-fluoro-2'-*C*-methylcytidine;
  - 10 2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-C-methylcytidine 5'-(phenyl methoxy-alanyl phosphate (((S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-oxo-3-amino-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenyoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester);
  - 11 2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-*C*-methylcytidine 5'-(4-bromophenyl methoxy-valyl phosphate (2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-*C*-methyluridine 5'-(4-bromophenyl methoxy-valyl phosphate ((S)-2-{(4-bromo-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-oxo-3-amino-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxyl-phosphorylamino}-3-methyl-butyric acid methyl ester);
  - 12 2'-deoxy-2'-fluoro-2'-*C*-methylcytidine 5'-(phenyl methoxy-valyl phosphate ((S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-oxo-3-amino-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-3-methyl-butyric acid methyl ester;
  - 13 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid ethyl ester;
  - 14 (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(naphthalen-1-yloxy)-phosphorylamino]-propionic acid benzyl ester;
- 15 {[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxyphosphorylamino}-acetic acid methyl ester;

10

15

20

25

30

35

40

45

- **16** (S)-2-{(2,4-Dichloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
- 17 (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(naphthalen-1-yloxy)-phosphorylamino]-propionic acid methyl ester;
- **18** (S)-1-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphoryl}-pyrrolidine-2-carboxylic acid methyl ester;
- 19 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid butyl ester;
- **20** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid benzyl ester;
- **21** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-fluoro-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid methyl ester;
- **22** (S)-2-{(4-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
- **23** (S)-2-{(3,4-Dichloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
- **24** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid sec-butyl ester;
- **25** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid isopropyl ester;
- **26** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-methoxy-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid butyl ester;
- 27 (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-fluoro-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid ethyl ester;
- **28** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-fluoro-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid isopropyl ester;
- **29** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-fluoro-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid benzyl ester;
- **30** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-methoxy-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid isopropyl ester;
- **31** (S)-2-{(2-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid benzyl ester;

15

20

25

30

35

40

45

- **32** (S)-2-{(2,4-Dichloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid butyl ester;
- **33** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-p-tolyloxy-phosphorylamino}-propionic acid isopropyl ester;
- **34** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-fluoro-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid butyl ester;
- **35** (S)-2-{(3,4-Dichloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid ethyl ester;
- **36** (S)-2-{(2-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid isopropyl ester;
- 37 (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-methoxy-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid benzyl ester;
- **38** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid pentyl ester;
- **39** (S)-2-{(4-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid isopropyl ester;
- **40** (S)-2-{(4-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid butyl ester;
- **41** (S)-2-{(4-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid ethyl ester;
- **42** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-p-tolyloxy-phosphorylamino}-propionic acid butyl ester;
- 43 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo- 3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-p-tolyloxy-phosphorylamino}-propionic acid benzyl ester;
- 44 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-butyric acid methyl ester;
- **45** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid 4-fluoro-benzyl ester;
- **46** (S)-2-{(2-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid butyl ester;
- 47 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid 3-methyl-butyl ester;

15

20

25

30

35

40

45

- **48** (S)-2-{(2,4-Dichloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid ethyl ester;
- **49** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid cyclohexyl ester;
- **50** (R)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid butyl ester;
- **51** (R)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid isopropyl ester;
- **52** (R)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid benzyl ester;
- **53** (S)-2-{(2-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid butyl ester;
- **54** (S)-2-{(4-Bromo-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid isopropyl ester;
- **55** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-fluoro-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid cyclohexyl ester;
- **56** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-bromo-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid cyclohexyl ester;
- 57 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-butyric acid isopropyl ester;
- **58** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-butyric acid cyclohexyl ester;
- **59** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-fluoro-phenoxy)-phosphorylamino]-butyric acid cyclohexyl ester;
- **60** (S)-2-{(4-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4 R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-butyric acid isopropyl ester;
- **61** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid 2,2-difluoro-ethyl ester;
- **62** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid 2,2,2-trifluoro-1-trifluoromethyl-ethyl ester;
- 63 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid 2-fluoro-1-fluoromethyl-ethyl ester;

15

30

- **64** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo- 3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid cyclopropyl methyl ester;
- **65** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-butyric acid cyclopentyl ester;
- **66** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(6-Amino-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
- 10 **67** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-Amino-6-hydroxy-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
  - **68** (S)-2-{(R)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,6-Diamino-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
  - **69** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-Amino-6-cyclopentylamino-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
- 70 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-Amino-6-azetidin-1-yl-purin-9-yl)-4-20 fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxyphosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
  - 71 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-Amino-6-diethylamino-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
- 72 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-Amino-6-propylamino-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
  - 73 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-Amino-6-cyclobutylamino-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
  - 74 (S)-2-({(2R,3R,4R,5R)-5-[2-Amino-6-(4-methyl-piperazin-1-yl)-purin-9-y l]-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy}-phenoxy-p hosphorylamino)-propionic acid methyl ester;
- 75 (2S)-methyl 2-((((2R,3R,4R,5R)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-5-(6-(propylamino)-9H-purin-9-yl)tetrahydrofuran-2yl)methoxy)(phenoxy)phosphorylamino)propanoate;
  - 76 (2S)-methyl 2-((((2R,3R,4R,5R)-5-(6-(cyclobutylamino)-9H-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyltetrahydrofuran-2-yl)methoxy)(phenoxy)phosphorylamino)propanoate;
- 40 77 (2S)-methyl 2-((((2R,3R,4R,5R)-5-(6-(cyclopentylamino)-9H-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyltetrahydrofuran-2-yl)methoxy)(phenoxy)phosphorylamino)propanoate;
  - 78 (2S)-methyl 2-((((2R,3R,4R,5R)-5-(6-(aziridin-1-yl)-9H-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyltetrahydrofuran-2-
- yl)methoxy)(phenoxy)phosphorylamino)propanoate;
  79 (2S)-methyl 2-((((2R,3R,4R,5R)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-5-(6-(piperidin-1-yl)-9H-purin-9-yl)tetrahydrofuran-2
  - yl)methoxy)(phenoxy)phosphorylamino)propanoate; and

**80** (2S)-methyl 2-((((2R,3R,4R,5R)-5-(6-(azetidin-1-yl)-9H-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyltetrahydrofuran-2-yl)methoxy)(phenoxy)phosphorylamino)propanoate.

- 5. A use of the compound represented by formula I in the manufacture of a medicament for the treatment of any condition the result of an infection by hepatitis C virus, West Nile virus, yellow fever virus, dengue virus, rhinovirus, polio virus, hepatitis A virus, bovine viral diarrhea virus or Japanese encephalitis virus.
- wherein the compound, its stereoisomer, salt, hydrate, solvate, or crystalline form thereof, are represented by formula I:

$$R^{3a}$$
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{3b}$ 
 $R^{3b}$ 

### wherein

- 15 (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, n-alkyl; branched alkyl; cycloalkyl; or aryl, which includes, but is not limited to, phenyl or naphthyl, where phenyl or naphthyl are optionally substituted with at least one of C<sub>1-6</sub> alkyl, C<sub>2-6</sub> alkenyl, C<sub>2-6</sub> alkynyl, C<sub>1-6</sub> alkoxy, F, Cl, Br, I, nitro, cyano, C<sub>1-6</sub> haloalkyl, -N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, C<sub>1-6</sub> acylamino, -NHSO<sub>2</sub>C<sub>1-6</sub> alkyl, -SO<sub>2</sub>N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, COR<sup>1</sup>, and -SO<sub>2</sub>C<sub>1-6</sub> alkyl; (R<sup>1</sup> is independently hydrogen or alkyl, which includes, but is not limited to, C<sub>1-20</sub> alkyl, C<sub>1-10</sub> alkyl, or C<sub>1-6</sub> alkyl, R<sup>1</sup> is -OR' or -N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>);
  - (b)  $R^2$  is hydrogen,  $C_{1-10}$  alkyl,  $R^{3a}$  or  $R^{3b}$  and  $R^2$  together are  $(CH_2)_n$  so as to form a cyclic ring that includes the adjoining N and C atoms,  $C(O)CR^{3a}R^{3b}NHR^1$ , where n is 2 to 4 and  $R^1$ ,  $R^{3a}$ , and  $R^{3b}$ ;
- 25 (c)  $R^{3a}$  and  $R^{3b}$  are (i) independently selected from hydrogen,  $C_{1-10}$  alkyl, cycloalkyl, -(CH<sub>2</sub>)<sub>c</sub>(NR<sup>3'</sup>)<sub>2</sub>,  $C_{1-6}$  hydroxyalkyl, -CH<sub>2</sub>SH, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>S(O)<sub>d</sub>Me, -

(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>NHC(=NH)NH<sub>2</sub>, (1H-indol-3-yl)methyl, (1H-imidazol-4-yl)methyl, -(CH<sub>2</sub>)<sub>e</sub>COR<sup>3"</sup>, aryl and aryl C<sub>1-3</sub> alkyl, said aryl groups optionally substituted with a group selected from hydroxyl, C<sub>1-10</sub> alkyl, C<sub>1-6</sub> alkoxy, halogen, nitro and cyano; (ii) R<sup>3a</sup> and R<sup>3b</sup> both are C<sub>1-6</sub> alkyl; (iii) R<sup>3a</sup> and R<sup>3b</sup> together are(CH<sub>2</sub>)<sub>f</sub> so as to form a spiro ring; (iv) R<sup>3a</sup> is hydrogen and R<sup>3b</sup> and R<sup>2</sup> together are (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> 5 so as to form a cyclic ring that includes the adjoining N and C atoms (v) R<sup>3b</sup> is hydrogen and R<sup>3a</sup> and R<sup>2</sup> together are (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> so as to form a cyclic ring that includes the adjoining N and C atoms, where c is 1 to 6, d is 0 to 2, e is 0 to 3, f is 2 to 5, n is 2 to 4, and where R<sup>3'</sup> is independently hydrogen or C<sub>1-6</sub> alkyl and  $R^{3''}$  is -OR' or -N( $R^{3'}$ )<sub>2</sub>); (vi)  $R^{3a}$  is H and  $R^{3b}$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, 10 CH2CH(CH3)2, CH(CH3)CH2CH3, CH2Ph, CH2-indol-3-yl, -CH2CH2SCH3, CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H, CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH2CH2CH2CH2NH2, -CH2CH2CH2NHC(NH)NH2, CH2-imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl; or (viii) 15 R<sup>3a</sup> is CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH2-indol-3-yl, -CH2CH2SCH3, CH2CO2H, CH2C(O)NH2, CH2CH2COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl and R<sup>3b</sup> is H, where R<sup>3'</sup> is independently hydrogen or alkyl, which includes, but is not limited to, C<sub>1-20</sub> alkyl, C<sub>1-10</sub> alkyl, or C<sub>1-6</sub> alkyl, R<sup>3"</sup> is -OR' or 20  $-N(R^{3'})_2);$ 

- (d)  $R^4$  is hydrogen,  $C_{1-10}$  alkyl,  $C_{1-10}$  alkyl optionally substituted with a lower alkyl, alkoxy, di(lower alkyl)-amino, or halogen,  $C_{1-10}$  haloalkyl,  $C_{3-10}$  cycloalkyl, cycloalkyl alkyl, cycloheteroalkyl, aminoacyl, aryl, such as phenyl, heteroaryl, such as, pyridinyl, substituted aryl, or substituted heteroaryl;
- (e) R<sup>5</sup> is H, a lower alkyl, CN, vinyl, O-(lower alkyl), hydroxyl lower alkyl, i.e., -(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>OH, where p is 1 -6, including hydroxyl methyl (CH<sub>2</sub>OH), CH<sub>2</sub>F, N<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CN, CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>NHCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, alkyne (optionally substituted), or halogen, including F, Cl, Br, or I, with the provisos that when X is OH, base is cytosine and R<sup>6</sup> is H, R<sup>5</sup> cannot be N<sub>3</sub> and when X is OH, R<sup>6</sup> is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F and B is a purine base, R<sup>5</sup> cannot be H;
  - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, F, or CN;

2983472-1

- 716 -

25

- (g) X is H, OH, F, OMe, halogen, NH<sub>2</sub>, or N<sub>3</sub>;
- Y is OH, H, C<sub>1-4</sub> alkyl, C<sub>2-4</sub> alkenyl, C<sub>2-4</sub> alkynyl, vinyl, N<sub>3</sub>, CN, (h) Cl, Br, F, I,  $NO_2$ ,  $OC(O)O(C_{1.4} \text{ alkyl})$ ,  $OC(O)O(C_{1.4} \text{ alkyl})$ ,  $OC(O)O(C_{2.4} \text{ alkyl})$ alkynyl),  $OC(O)O(C_{2-4}$  alkenyl),  $OC_{1-10}$  haloalkyl, O(aminoacyl),  $O(C_{1-10}$  acyl), 5  $O(C_{1-4} \text{ alkyl})$ ,  $O(C_{2-4} \text{ alkenyl})$ ,  $S(C_{1-4} \text{ acyl})$ ,  $S(C_{1-4} \text{ alkyl})$ ,  $S(C_{2-4} \text{ alkynyl})$ ,  $S(C_{2-4} \text{ alkynyl})$ ,  $S(C_{2-4} \text{ alkynyl})$ alkenyl), SO(C<sub>1-4</sub> acyl), SO(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO(C<sub>2-4</sub> alkynyl), SO(C<sub>2-4</sub> alkenyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> acyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>2-4</sub> alkynyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>2-4</sub> alkenyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> 4 acyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>2-4</sub> alkenyl), NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1-4</sub> alkyl), NH(C<sub>2-4</sub> alkenyl), NH(C<sub>2-4</sub> alkynyl), NH(C<sub>1-4</sub> acyl), N(C<sub>1-4</sub> alkyl)<sub>2</sub>, N(C<sub>1-18</sub> acyl)<sub>2</sub>, wherein alkyl, alkynyl, alkenyl and vinyl are optionally substituted by N<sub>3</sub>, CN, 10 one to three halogen (Cl, Br, F, I), NO<sub>2</sub>, C(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), C(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl),  $C(O)O(C_{2-4} \text{ alkynyl}), C(O)O(C_{2-4} \text{ alkenyl}), O(C_{1-4} \text{ acyl}), O(C_{1-4} \text{ alkyl}), O(C_{2-4} \text{ alkyl})$ alkenyl), S(C<sub>1-4</sub> acyl), S(C<sub>1-4</sub> alkyl), S(C<sub>2-4</sub> alkynyl), S(C<sub>2-4</sub> alkenyl), SO(C<sub>1-4</sub> acyl), SO(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO(C<sub>2-4</sub> alkynyl), SO(C<sub>2-4</sub> alkenyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> acyl),  $SO_2(C_{1-4} \text{ alkyl})$ ,  $SO_2(C_{2-4} \text{ alkynyl})$ ,  $SO_2(C_{2-4} \text{ alkenyl})$ ,  $OS(O)_2(C_{1-4} \text{ acyl})$ , 15 OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>2-4</sub> alkenyl), NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1-4</sub> alkyl), NH(C<sub>2-4</sub> alkenyl), NH( $C_{2-4}$  alkynyl), NH( $C_{1-4}$  acyl), N( $C_{1-4}$  alkyl)<sub>2</sub>, N( $C_{1-4}$  acyl)<sub>2</sub>;

the base is a naturally occurring or modified purine or pyrimidine base represented by the following structures:

20

wherein

Z is N or  $CR^{12}$ ;

2983472-1

- 717 -

15

20

30

 $R^7$ ,  $R^8$ ,  $R^9$ ,  $R^{10}$ , and  $R^{11}$  are independently H, F, Cl, Br, I, OH, OR', SH, SR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkenyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkynyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkynyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> such as C $\equiv$ CH, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkynyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkoxy of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkoxy of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>H, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH $\equiv$ CHCO<sub>2</sub>H, or CH $\equiv$ CHCO<sub>2</sub>R',

wherein R' is an optionally substituted alkyl , which includes, but is not limited to, an optionally substituted  $C_{1\text{-}20}$  alkyl, an optionally substituted  $C_{1\text{-}10}$  alkyl, an optionally substituted lower alkyl; an optionally substituted cycloalkyl; an optionally substituted alkynyl of  $C_2\text{-}C_6$ , an optionally substituted lower alkenyl of  $C_2\text{-}C_6$ , or optionally substituted acyl, which includes but is not limited to C(O) alkyl,  $C(O)(C_{1\text{-}20}$  alkyl),  $C(O)(C_{1\text{-}10}$  alkyl), or C(O) (lower alkyl) or alternatively, in the instance of  $NR'_2$ , each R' comprise at least one C atom that are joined to form a heterocycle comprising at least two carbon atoms; and

 $R^{12}$  is an H, halogen (including F, Cl, Br, I), OH, OR', SH, SR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub> lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkenyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkenyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkynyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkynyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkoxy of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkoxy of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>H, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R'; with the proviso that when base is represented by the structure c with  $R^{11}$  being hydrogen,  $R^{12}$  is not a: (i) -C=C-H, (ii)  $-C=CH_2$ , or (iii)  $-NO_2$ .

### 25 6. A use of

a compound, its stereoisomer, salt, hydrate, solvate, or crystalline form thereof, selected from among

- 5 2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-*C*-methyluridine 5'-(phenyl methoxy-alanyl phosphate ((S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester);
- 6 2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-*C*-methyluridine 5'-(phenyl methoxy-valyl phosphate ((S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-

15

20

25

35

40

- yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-3-methyl-butyric acid methyl ester;
- 7 2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-*C*-methyluridine 5'-(4-bromophenyl methoxy-valyl phosphate ((S)-2-{(4-bromo-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-3-methyl-butyric acid methyl ester);
- **8** 2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-*C*-methyluridine 5'-(4-bromophenyl methoxy-alanyl phosphate (((S)-2-{(4-bromo-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-vlmethoxyl-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester);
- 9  $N^4$ -(N,N-dimethylformamidinyl)-2'-deoxy-2'-fluoro-2'-C-methylcytidine;
- 10 2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-C-methylcytidine 5'-(phenyl methoxy-alanyl phosphate (((S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-oxo-3-amino-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenyoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester);
- 11 2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-*C*-methylcytidine 5'-(4-bromophenyl methoxy-valyl phosphate (2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-*C*-methyluridine 5'-(4-bromophenyl methoxy-valyl phosphate ((S)-2-{(4-bromo-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-oxo-3-amino-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-3-methyl-butyric acid methyl ester);
- 12 2'-deoxy-2'-fluoro-2'-C-methylcytidine 5'-(phenyl methoxy-valyl phosphate ((S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-oxo-3-amino-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-3-methyl-butyric acid methyl ester;
- 13 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid ethyl ester;
- 14 (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-30 yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(naphthalen-1-yloxy)-phosphorylamino]-propionic acid benzyl ester;
  - **15** {[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-acetic acid methyl ester;
  - **16** (S)-2-{(2,4-Dichloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
  - 17 (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(naphthalen-1-yloxy)-phosphorylamino]-propionic acid methyl ester;
  - 18 (S)-1-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphoryl}-pyrrolidine-2-carboxylic acid methyl ester;
- 19 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid butyl ester;
  - **20** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid benzyl ester;

10

15

20

25

30

35

40

45

- 21 (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-fluoro-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid methyl ester;
- **22** (S)-2-{(4-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
- 23 (S)-2-{(3,4-Dichloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxyl-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
- **24** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid sec-butyl ester;
- **25** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid isopropyl ester;
- **26** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-methoxy-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid butyl ester;
- **27** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-fluoro-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid ethyl ester;
- **28** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-fluoro-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid isopropyl ester;
- **29** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-fluoro-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid benzyl ester;
- **30** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-methoxy-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid isopropyl ester;
- 31 (S)-2-{(2-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxyl-phosphorylamino}-propionic acid benzyl ester;
- **32** (S)-2-{(2,4-Dichloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxyl-phosphorylamino}-propionic acid butyl ester;
- **33** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-p-tolyloxy-phosphorylamino}-propionic acid isopropyl ester;
- **34** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-fluoro-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid butyl ester;
- **35** (S)-2-{(3,4-Dichloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid ethyl ester;
- **36** (S)-2-{(2-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid isopropyl ester;

10

15

20

25

30

35

40

45

- 37 (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-methoxy-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid benzyl ester;
- **38** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid pentyl ester;
- **39** (S)-2-{(4-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid isopropyl ester;
- **40** (S)-2-{(4-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid butyl ester;
- **41** (S)-2-{(4-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid ethyl ester;
- **42** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-p-tolyloxy-phosphorylamino}-propionic acid butyl ester;
- **43** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo- 3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-p-tolyloxy-phosphorylamino}-propionic acid benzyl ester;
- **44** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-butyric acid methyl ester;
- **45** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid 4-fluoro-benzyl ester;
- **46** (S)-2-{(2-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxyl-phosphorylamino}-propionic acid butyl ester;
- 47 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid 3-methyl-butyl ester;
- 48 (S)-2-{(2,4-Dichloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid ethyl ester;
- **49** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid cyclohexyl ester;
- **50** (R)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid butyl ester;
- **51** (R)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid isopropyl ester;
- **52** (R)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid benzyl ester;

10

15

20

25

30

35

40

45

- **53** (S)-2-{(2-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid butyl ester;
- **54** (S)-2-{(4-Bromo-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid isopropyl ester;
- 55 (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-fluoro-phenoxy)-phosphorylaminol-propionic acid cyclohexyl ester;
- **56** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-bromo-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid cyclohexyl ester;
- **57** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-butyric acid isopropyl ester;
- **58** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-butyric acid cyclohexyl ester;
- **59** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-fluoro-phenoxy)-phosphorylamino]-butyric acid cyclohexyl ester;
- **60** (S)-2-{(4-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4 R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-butyric acid isopropyl ester;
- **61** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid 2,2-difluoro-ethyl ester;
- **62** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo- 3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid 2,2,2-trifluoro-1-trifluoromethyl-ethyl ester;
- **63** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid 2-fluoro-1-fluoromethyl-ethyl ester;
- **64** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo- 3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid cyclopropyl methyl ester;
- **65** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-butyric acid cyclopentyl ester;
- **66** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(6-Amino-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
  - **67** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-Amino-6-hydroxy-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
- **68** (S)-2-{(R)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,6-Diamino-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;

2983472-1

- 722 -

15

20

25

35

40

**69** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-Amino-6-cyclopentylamino-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;

70 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-Amino-6-azetidin-1-yl-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;

71 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-Amino-6-diethylamino-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;

**72** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-Amino-6-propylamino-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;

73 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-Amino-6-cyclobutylamino-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;

74 (S)-2-({(2R,3R,4R,5R)-5-[2-Amino-6-(4-methyl-piperazin-1-yl)-purin-9-y l]-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy}-phenoxy-p hosphorylamino)-propionic acid methyl ester;

75 (2S)-methyl 2-((((2R,3R,4R,5R)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-5-(6-(propylamino)-9H-purin-9-yl)tetrahydrofuran-2-yl)methoxy)(phenoxy)phosphorylamino)propanoate;

**76** (2S)-methyl 2-((((2R,3R,4R,5R)-5-(6-(cyclobutylamino)-9H-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyltetrahydrofuran-2-yl)methoxy)(phenoxy)phosphorylamino)propanoate;

77 (2S)-methyl 2-((((2R,3R,4R,5R)-5-(6-(cyclopentylamino)-9H-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyltetrahydrofuran-2-yl)methoxy)(phenoxy)phosphorylamino)propanoate;

78 (2S)-methyl 2-((((2R,3R,4R,5R)-5-(6-(aziridin-1-yl)-9H-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyltetrahydrofuran-2-

30 yl)methoxy)(phenoxy)phosphorylamino)propanoate;

79 (2S)-methyl 2-((((2R,3R,4R,5R)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-5-(6-(piperidin-1-yl)-9H-purin-9-yl)tetrahydrofuran-2-yl)methoxy)(phenoxy)phosphorylamino)propanoate; and

**80** (2S)-methyl 2-((((2R,3R,4R,5R)-5-(6-(azetidin-1-yl)-9H-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyltetrahydrofuran-2-yl)methoxy)(phenoxy)phosphorylamino)propanoate

in the manufacture of a medicament for the treatment of any condition the result of an infection by hepatitis C virus, West Nile virus, yellow fever virus, dengue virus, rhinovirus, polio virus, hepatitis A virus, bovine viral diarrhea virus or Japanese encephalitis virus.

7. A method of treatment in a subject in need thereof, which comprises:

administering a therapeutically effective amount of the compound represented by formula I to the subject;

wherein the compound or its stereoisomer, salt, hydrate, solvate, or crystalline form thereof represented by formula I:

$$R^{3a}$$
 $N$ 
 $P$ 
 $O$ 
 $R^{5}$ 
 $N$ 
 $R^{6}$ 
 $R^{6}$ 

I

wherein

- (a) R<sup>1</sup> is hydrogen, n-alkyl; branched alkyl; cycloalkyl; or aryl, which includes, but is not limited to, phenyl or naphthyl, where phenyl or naphthyl are optionally substituted with at least one of C<sub>1-6</sub> alkyl, C<sub>2-6</sub> alkenyl, C<sub>2-6</sub> alkynyl, C<sub>1-6</sub> alkoxy, F, Cl, Br, I, nitro, cyano, C<sub>1-6</sub> haloalkyl, -N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, C<sub>1-6</sub> acylamino, -NHSO<sub>2</sub>C<sub>1-6</sub> alkyl, -SO<sub>2</sub>N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>, COR<sup>1</sup>, and -SO<sub>2</sub>C<sub>1-6</sub> alkyl; (R<sup>1</sup> is independently hydrogen or alkyl, which includes, but is not limited to, C<sub>1-20</sub> alkyl, C<sub>1-10</sub> alkyl, or C<sub>1-6</sub> alkyl, R<sup>1</sup> is -OR' or -N(R<sup>1</sup>)<sub>2</sub>);
- 15 (b) R<sup>2</sup> is hydrogen, C <sub>1-10</sub> alkyl, R<sup>3a</sup> or R<sup>3b</sup> and R<sup>2</sup> together are (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> so as to form a cyclic ring that includes the adjoining N and C atoms, C(O)CR<sup>3a</sup>R<sup>3b</sup>NHR<sup>1</sup>, where n is 2 to 4 and R<sup>1</sup>, R<sup>3a</sup>, and R<sup>3b</sup>;
- (c) R<sup>3a</sup> and R<sup>3b</sup> are (i) independently selected from hydrogen, C<sub>1-10</sub> alkyl, cycloalkyl, -(CH<sub>2</sub>)<sub>c</sub>(NR<sup>3'</sup>)<sub>2</sub>, C<sub>1-6</sub> hydroxyalkyl, -CH<sub>2</sub>SH, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>S(O)<sub>d</sub>Me, -20 (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>NHC(=NH)NH<sub>2</sub>, (1H-indol-3-yl)methyl, (1H-imidazol-4-yl)methyl, (CH<sub>2</sub>)<sub>e</sub>COR<sup>3"</sup>, aryl and aryl C<sub>1-3</sub> alkyl, said aryl groups optionally substituted with a group selected from hydroxyl, C<sub>1-10</sub> alkyl, C<sub>1-6</sub> alkoxy, halogen, nitro and cyano; (ii) R<sup>3a</sup> and R<sup>3b</sup> both are C<sub>1-6</sub> alkyl; (iii) R<sup>3a</sup> and R<sup>3b</sup> together are(CH<sub>2</sub>)<sub>f</sub> so as to form a spiro ring; (iv) R<sup>3a</sup> is hydrogen and R<sup>3b</sup> and R<sup>2</sup> together are (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> so as to form a cyclic ring that includes the adjoining N and C atoms (v) R<sup>3b</sup> is

2983472-1

- 724 -

hydrogen and R<sup>3a</sup> and R<sup>2</sup> together are (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> so as to form a cyclic ring that includes the adjoining N and C atoms, where c is 1 to 6, d is 0 to 2, e is 0 to 3, f is 2 to 5, n is 2 to 4, and where R<sup>3'</sup> is independently hydrogen or C<sub>1-6</sub> alkyl and  $R^{3}$  is -OR' or -N( $R^{3}$ )<sub>2</sub>); (vi)  $R^{3a}$  is H and  $R^{3b}$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH<sub>2</sub>-indol-3-yl, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>, 5 CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H, CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH2CH2CH2CH2NH2, -CH2CH2CH2NHC(NH)NH2, CH2-imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl; or (viii) R<sup>3a</sup> is CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH2-indol-3-yl, -CH2CH2SCH3, CH2CO2H, CH2C(O)NH2, CH2CH2COOH, 10 CH2CH2C(O)NH2, CH2CH2CH2CH2NH2, -CH2CH2CH2NHC(NH)NH2, CH2imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl and R<sup>3b</sup> is H, where R<sup>3'</sup> is independently hydrogen or alkyl, which includes, but is not limited to,  $C_{1-20}$  alkyl,  $C_{1-10}$  alkyl, or  $C_{1-6}$  alkyl,  $R^{3"}$  is -OR' or  $-N(R^{3'})_2);$ 15

- (d)  $R^4$  is hydrogen,  $C_{1-10}$  alkyl,  $C_{1-10}$  alkyl optionally substituted with a lower alkyl, alkoxy, di(lower alkyl)-amino, or halogen,  $C_{1-10}$  haloalkyl,  $C_{3-10}$  cycloalkyl, cycloalkyl alkyl, cycloheteroalkyl, aminoacyl, aryl, such as phenyl, heteroaryl, such as, pyridinyl, substituted aryl, or substituted heteroaryl;
- 20 (e) R<sup>5</sup> is H, a lower alkyl, CN, vinyl, O-(lower alkyl), hydroxyl lower alkyl, i.e., -(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>OH, where p is 1 -6, including hydroxyl methyl (CH<sub>2</sub>OH), CH<sub>2</sub>F, N<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CN, CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>NHCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, alkyne (optionally substituted), or halogen, including F, Cl, Br, or I, with the provisos that when X is OH, base is cytosine and R<sup>6</sup> is H, R<sup>5</sup> cannot be N<sub>3</sub> and when X is OH, R<sup>6</sup> is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F and B is a purine base, R<sup>5</sup> cannot be H;
  - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, F, or CN;
  - (g) X is H, OH, F, OMe, halogen, NH<sub>2</sub>, or N<sub>3</sub>;
- (h) Y is OH, H, C<sub>1-4</sub> alkyl, C<sub>2-4</sub> alkenyl, C<sub>2-4</sub> alkynyl, vinyl, N<sub>3</sub>, CN,
   Cl, Br, F, I, NO<sub>2</sub>, OC(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), OC(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), OC(O)O(C<sub>2-4</sub>
   30 alkynyl), OC(O)O(C<sub>2-4</sub> alkenyl), OC<sub>1-10</sub> haloalkyl, O(aminoacyl), O(C<sub>1-10</sub> acyl),
   O(C<sub>1-4</sub> alkyl), O(C<sub>2-4</sub> alkenyl), S(C<sub>1-4</sub> acyl), S(C<sub>1-4</sub> alkyl), S(C<sub>2-4</sub> alkynyl), S(C<sub>2-4</sub>

alkenyl), SO(C<sub>1-4</sub> acyl), SO(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO(C<sub>2-4</sub> alkynyl), SO(C<sub>2-4</sub> alkenyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> acyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>2-4</sub> alkynyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>2-4</sub> alkenyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> acyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>2-4</sub> alkenyl), NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1-4</sub> alkyl), NH(C<sub>2-4</sub> alkenyl), NH(C<sub>2-4</sub> alkynyl), NH(C<sub>1-4</sub> acyl), N(C<sub>1-4</sub> alkyl)<sub>2</sub>, N(C<sub>1-18</sub> acyl)<sub>2</sub>,

5 wherein alkyl, alkynyl, alkenyl and vinyl are optionally substituted by N<sub>3</sub>, CN, one to three halogen (Cl, Br, F, I), NO<sub>2</sub>, C(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), C(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), C(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), C(O)O(C<sub>2-4</sub> alkynyl), C(O)O(C<sub>2-4</sub> alkenyl), O(C<sub>1-4</sub> acyl), O(C<sub>1-4</sub> alkyl), O(C<sub>2-4</sub> alkenyl), SO(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkynyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkenyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> acyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>2-4</sub> alkenyl), NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1-4</sub> alkyl), NH(C<sub>2-4</sub> alkenyl), NH(C<sub>2-4</sub> alkynyl), NH(C<sub>1-4</sub> acyl), N(C<sub>1-4</sub> alkyl)<sub>2</sub>, N(C<sub>1-4</sub> acyl)<sub>2</sub>;

the base is a naturally occurring or modified purine or pyrimidine base represented by the following structures:

15

wherein

Z is N or  $CR^{12}$ ;

20  $R^7$ ,  $R^8$ ,  $R^9$ ,  $R^{10}$ , and  $R^{11}$  are independently H, F, Cl, Br, I, OH, OR', SH, SR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkenyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkenyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkynyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> such as C=CH, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkynyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkoxy of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkoxy

2983472-1

- 726 -

10

15

25

30

35

of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>H, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R',

wherein R' is an optionally substituted alkyl , which includes, but is not limited to, an optionally substituted  $C_{1\text{-}20}$  alkyl, an optionally substituted  $C_{1\text{-}10}$  alkyl, an optionally substituted lower alkyl; an optionally substituted cycloalkyl; an optionally substituted alkynyl of  $C_2\text{-}C_6$ , an optionally substituted lower alkenyl of  $C_2\text{-}C_6$ , or optionally substituted acyl, which includes but is not limited to C(O) alkyl,  $C(O)(C_{1\text{-}20}$  alkyl),  $C(O)(C_{1\text{-}10}$  alkyl), or C(O)(lower alkyl) or alternatively, in the instance of  $NR'_2$ , each R' comprise at least one C atom that are joined to form a heterocycle comprising at least two carbon atoms; and

 $R^{12}$  is an H, halogen (including F, Cl, Br, I), OH, OR', SH, SR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub> lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkenyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkenyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkynyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkynyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkoxy of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkoxy of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>H, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R'; with the proviso that when base is represented by the structure c with  $R^{11}$  being hydrogen,  $R^{12}$  is not a: (i) -C=C-H, (ii) -C=CH<sub>2</sub>, or (iii)  $-NO_2$ .

20 8. A method of treatment in a subject in need thereof, which comprises:

administering a therapeutically effective amount of a compound, its stereoisomer, salt, hydrate, solvate, or crystalline form thereof, selected from among

- 5 2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-*C*-methyluridine 5'-(phenyl methoxy-alanyl phosphate ((S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester);
- 6 2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-C-methyluridine 5'-(phenyl methoxy-valyl phosphate ((S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-3-methyl-butyric acid methyl ester;
- 7 2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-*C*-methyluridine 5'-(4-bromophenyl methoxy-valyl phosphate ((S)-2-{(4-bromo-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-3-methyl-butyric acid methyl ester);

10

15

20

25

30

35

40

- **8** 2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-*C*-methyluridine 5'-(4-bromophenyl methoxyalanyl phosphate (((S)-2-{(4-bromo-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxyl-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester);
- 9  $N^4$ -(N,N-dimethylformamidinyl)-2'-deoxy-2'-fluoro-2'-C-methylcytidine;
- 10 2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-C-methylcytidine 5'-(phenyl methoxy-alanyl phosphate (((S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-oxo-3-amino-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenyoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester);
- 11 2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-*C*-methylcytidine 5'-(4-bromophenyl methoxy-valyl phosphate (2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-*C*-methyluridine 5'-(4-bromophenyl methoxy-valyl phosphate ((S)-2-{(4-bromo-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-oxo-3-amino-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-3-methyl-butyric acid methyl ester);
- 12 2'-deoxy-2'-fluoro-2'-C-methylcytidine 5'-(phenyl methoxy-valyl phosphate ((S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-oxo-3-amino-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-3-methyl-butyric acid methyl ester;
- 13 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid ethyl ester;
  - **14** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(naphthalen-1-yloxy)-phosphorylamino]-propionic acid benzyl ester;
  - 15 {[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-acetic acid methyl ester;
- **16** (S)-2-{(2,4-Dichloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
  - 17 (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(naphthalen-1-yloxy)-phosphorylamino]-propionic acid methyl ester;
  - **18** (S)-1-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphoryl}-pyrrolidine-2-carboxylic acid methyl ester;
  - 19 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid butyl ester;
  - **20** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid benzyl ester;
- 21 (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-fluoro-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid methyl ester;
  - **22** (S)-2-{(4-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxyl-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;

15

20

25

30

35

40

45

- **23** (S)-2-{(3,4-Dichloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
- **24** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid sec-butyl ester;
- **25** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid isopropyl ester;
- **26** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-methoxy-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid butyl ester;
- **27** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-fluoro-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid ethyl ester;
- **28** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-fluoro-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid isopropyl ester;
- **29** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-fluoro-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid benzyl ester;
- **30** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-methoxy-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid isopropyl ester;
- **31** (S)-2-{(2-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid benzyl ester;
- **32** (S)-2-{(2,4-Dichloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid butyl ester;
- **33** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-p-tolyloxy-phosphorylamino}-propionic acid isopropyl ester;
- **34** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-fluoro-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid butyl ester;
- **35** (S)-2-{(3,4-Dichloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid ethyl ester;
- **36** (S)-2-{(2-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid isopropyl ester;
- **37** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-methoxy-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid benzyl ester;
- **38** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid pentyl ester;

15

20

25

30

35

40

45

- 39 (S)-2-{(4-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid isopropyl ester;
- 40 (S)-2-{(4-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid butyl ester;
- 41 (S)-2-{(4-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid ethyl ester;
- 42 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-p-tolyloxyphosphorylamino}-propionic acid butyl ester:
- 43 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1vl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-p-tolyloxyphosphorylamino}-propionic acid benzyl ester:
- 44 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxyphosphorylamino}-butyric acid methyl ester;
- 45 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1vl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxyl-phenoxyphosphorylamino}-propionic acid 4-fluoro-benzyl ester;
- 46 (S)-2-{(2-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2vlmethoxyl-phosphorylamino}-propionic acid butyl ester;
- 47 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxyphosphorylamino}-propionic acid 3-methyl-butyl ester;
- 48 (S)-2-{(2,4-Dichloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2ylmethoxyl-phosphorylamino}-propionic acid ethyl ester;
- 49 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxyphosphorylamino}-propionic acid cyclohexyl ester;
- **50** (R)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxyphosphorylamino}-propionic acid butyl ester;
- 51 (R)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxyphosphorylamino}-propionic acid isopropyl ester;
- 52 (R)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxyphosphorylamino}-propionic acid benzyl ester;
- 53 (S)-2-{(2-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid butyl ester;
- 54 (S)-2-{(4-Bromo-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2ylmethoxyl-phosphorylamino}-propionic acid isopropyl ester;

10

15

20

25

30

35

40

45

- 55 (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-fluorophenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid cyclohexyl ester;
- 56 (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxyl-(4-bromophenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid cyclohexyl ester;
- 57 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxyphosphorylamino}-butyric acid isopropyl ester;
- 58 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxyphosphorylamino}-butyric acid cyclohexyl ester;
- **59** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-fluorophenoxy)-phosphorylamino]-butyric acid cyclohexyl ester;
- 60 (S)-2-{(4-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2ylmethoxy]-phosphorylamino}-butyric acid isopropyl ester;
- 61 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1vI)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxyphosphorylamino}-propionic acid 2,2-difluoro-ethyl ester;
- 62 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxyphosphorylamino}-propionic acid 2,2,2-trifluoro-1-trifluoromethyl-ethyl ester;
- 63 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1vI)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxyphosphorylamino}-propionic acid 2-fluoro-1-fluoromethyl-ethyl ester;
- 64 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxyphosphorylamino}-propionic acid cyclopropyl methyl ester;
- 65 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxyphosphorylamino}-butyric acid cyclopentyl ester;
- 66 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(6-Amino-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
  - 67 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-Amino-6-hydroxy-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxyphosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
- 68 (S)-2-{(R)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,6-Diamino-purin-9-yl)-4-fluoro-3hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}propionic acid methyl ester;
  - 69 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-Amino-6-cyclopentylamino-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxyphosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
  - 70 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-Amino-6-azetidin-1-yl-purin-9-yl)-4fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxyphosphorylamino}-propionic acid methyl ester;

20

25

30

35

71 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-Amino-6-diethylamino-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;

72 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-Amino-6-propylamino-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;

73 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-Amino-6-cyclobutylamino-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;

 $74 (S)-2-(\{(2R,3R,4R,5R)-5-[2-Amino-6-(4-methyl-piperazin-1-yl)-purin-9-y l]-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy\}-phenoxy-p hosphorylamino)-propionic acid methyl ester;$ 

75 (2S)-methyl 2-((((2R,3R,4R,5R)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-5-(6-(propylamino)-9H-purin-9-yl)tetrahydrofuran-2-

15 yl)methoxy)(phenoxy)phosphorylamino)propanoate;

76 (2S)-methyl 2-((((2R,3R,4R,5R)-5-(6-(cyclobutylamino)-9H-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyltetrahydrofuran-2-yl)methoxy)(phenoxy)phosphorylamino)propanoate;

77 (2S)-methyl 2-((((2R,3R,4R,5R)-5-(6-(cyclopentylamino)-9H-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyltetrahydrofuran-2-yl)methoxy)(phenoxy)phosphorylamino)propanoate;

78 (2S)-methyl 2-((((2R,3R,4R,5R)-5-(6-(aziridin-1-yl)-9H-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyltetrahydrofuran-2-yl)methoxy)(phenoxy)phosphorylamino)propanoate;

79 (2S)-methyl 2-((((2R,3R,4R,5R)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-5-(6-(piperidin-1-yl)-9H-purin-9-yl)tetrahydrofuran-2-yl)methoxy)(phenoxy)phosphorylamino)propanoate; and

80 (2S)-methyl 2-((((2R,3R,4R,5R)-5-(6-(azetidin-1-yl)-9H-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyltetrahydrofuran-2-

yl)methoxy)(phenoxy)phosphorylamino)propanoate.

9. A process for preparing a compound, its stereoisomer, salt, hydrate, solvate, or crystalline form thereof, represented by formula I:

Ι

wherein

2983472-1

- 732 -

- (a)  $R^1$  is hydrogen, n-alkyl; branched alkyl; cycloalkyl; or aryl, which includes, but is not limited to, phenyl or naphthyl, where phenyl or naphthyl are optionally substituted with at least one of  $C_{1-6}$  alkyl,  $C_{2-6}$  alkenyl,  $C_{2-6}$  alkynyl,  $C_{1-6}$  alkoxy, F, Cl, Br, I, nitro, cyano,  $C_{1-6}$  haloalkyl,  $-N(R^{1'})_2$ ,  $C_{1-6}$  acylamino,  $-NHSO_2C_{1-6}$  alkyl,  $-SO_2N(R^{1'})_2$ ,  $COR^{1"}$ , and  $-SO_2C_{1-6}$  alkyl;  $(R^{1'})_3$  is independently hydrogen or alkyl, which includes, but is not limited to,  $C_{1-20}$  alkyl,  $C_{1-10}$  alkyl, or  $C_{1-6}$  alkyl,  $R^{1"}$  is -OR' or  $-N(R^{1'})_2$ );
- (b) R<sup>2</sup> is hydrogen, C <sub>1-10</sub> alkyl, R<sup>3a</sup> or R<sup>3b</sup> and R<sup>2</sup> together are (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> so as to form a cyclic ring that includes the adjoining N and C atoms,
   C(O)CR<sup>3a</sup>R<sup>3b</sup>NHR<sup>1</sup>, where n is 2 to 4 and R<sup>1</sup>, R<sup>3a</sup>, and R<sup>3b</sup>;
- R<sup>3a</sup> and R<sup>3b</sup> are (i) independently selected from hydrogen, C<sub>1-10</sub> alkyl, cycloalkyl, -(CH<sub>2</sub>)<sub>c</sub>(NR<sup>3</sup>)<sub>2</sub>, C<sub>1-6</sub> hydroxyalkyl, -CH<sub>2</sub>SH, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>S(O)<sub>d</sub>Me, -(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>NHC(=NH)NH<sub>2</sub>, (1H-indol-3-yl)methyl, (1H-imidazol-4-yl)methyl, -(CH<sub>2</sub>)<sub>e</sub>COR<sup>3"</sup>, aryl and aryl C<sub>1-3</sub> alkyl, said aryl groups optionally substituted with a group selected from hydroxyl, C<sub>1-10</sub> alkyl, C<sub>1-6</sub> alkoxy, halogen, nitro and 15 cvano: (ii) R<sup>3a</sup> and R<sup>3b</sup> both are C<sub>1-6</sub> alkyl; (iii) R<sup>3a</sup> and R<sup>3b</sup> together are (CH<sub>2</sub>)<sub>f</sub> so as to form a spiro ring; (iv) R<sup>3a</sup> is hydrogen and R<sup>3b</sup> and R<sup>2</sup> together are (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> so as to form a cyclic ring that includes the adjoining N and C atoms (v) R<sup>3b</sup> is hydrogen and R<sup>3a</sup> and R<sup>2</sup> together are (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> so as to form a cyclic ring that includes the adjoining N and C atoms, where c is 1 to 6, d is 0 to 2, e is 0 to 3, f 20 is 2 to 5, n is 2 to 4, and where R<sup>3'</sup> is independently hydrogen or C<sub>1-6</sub> alkyl and  $R^{3''}$  is -OR' or -N( $R^{3'}$ )<sub>2</sub>); (vi)  $R^{3a}$  is H and  $R^{3b}$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH<sub>2</sub>-indol-3-yl, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>, CH2CO2H, CH2C(O)NH2, CH2CH2COOH, CH2CH2C(O)NH2, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>-imidazol-4-yl,
- CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>-imidazol-4-yl,
  CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl; or (viii)
  R<sup>3a</sup> is CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph,
  CH<sub>2</sub>-indol-3-yl, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H, CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH,
  CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower

or imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl and R<sup>3b</sup> is H, where R<sup>3'</sup> is independently hydrogen or alkyl, which

10

includes, but is not limited to,  $C_{1-20}$  alkyl,  $C_{1-10}$  alkyl, or  $C_{1-6}$  alkyl,  $R^{3"}$  is -OR' or  $-N(R^{3'})_2$ );

- (d)  $R^4$  is hydrogen,  $C_{1-10}$  alkyl,  $C_{1-10}$  alkyl optionally substituted with a lower alkyl, alkoxy, di(lower alkyl)-amino, or halogen,  $C_{1-10}$  haloalkyl,  $C_{3-10}$  cycloalkyl, cycloalkyl alkyl, cycloheteroalkyl, aminoacyl, aryl, such as phenyl, heteroaryl, such as, pyridinyl, substituted aryl, or substituted heteroaryl;
- (e) R<sup>5</sup> is H, a lower alkyl, CN, vinyl, O-(lower alkyl), hydroxyl lower alkyl, i.e., -(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>OH, where p is 1 -6, including hydroxyl methyl (CH<sub>2</sub>OH), CH<sub>2</sub>F, N<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CN, CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>NHCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, alkyne (optionally substituted), or halogen, including F, Cl, Br, or I, with the provisos that when X is OH, base is cytosine and R<sup>6</sup> is H, R<sup>5</sup> cannot be N<sub>3</sub> and when X is OH, R<sup>6</sup> is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F and B is a purine base, R<sup>5</sup> cannot be H;
  - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, F, or CN;
  - (g) X is H, OH, F, OMe, halogen, NH<sub>2</sub>, or N<sub>3</sub>;
- 15 Y is OH, H, C<sub>1-4</sub> alkyl, C<sub>2-4</sub> alkenyl, C<sub>2-4</sub> alkynyl, vinyl, N<sub>3</sub>, CN, (h) Cl, Br, F, I, NO<sub>2</sub>, OC(O)O( $C_{1-4}$  alkyl), OC(O)O( $C_{1-4}$  alkyl), OC(O)O( $C_{2-4}$ alkynyl), OC(O)O(C<sub>2-4</sub> alkenyl), OC<sub>1-10</sub> haloalkyl, O(aminoacyl), O(C<sub>1-10</sub> acyl),  $O(C_{1-4} \text{ alkyl})$ ,  $O(C_{2-4} \text{ alkenyl})$ ,  $S(C_{1-4} \text{ acyl})$ ,  $S(C_{1-4} \text{ alkyl})$ ,  $S(C_{2-4} \text{ alkynyl})$ ,  $S(C_{2-4} \text{ alkynyl})$ ,  $S(C_{2-4} \text{ alkynyl})$ alkenyl),  $SO(C_{1-4} \text{ acyl})$ ,  $SO(C_{1-4} \text{ alkyl})$ ,  $SO(C_{2-4} \text{ alkynyl})$ ,  $SO(C_{2-4} \text{ alkenyl})$ , 20  $SO_2(C_{1-4} \text{ acyl})$ ,  $SO_2(C_{1-4} \text{ alkyl})$ ,  $SO_2(C_{2-4} \text{ alkynyl})$ ,  $SO_2(C_{2-4} \text{ alkenyl})$ ,  $OS(O)_2(C_{1-4} \text{ alkyl})$ 4 acyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>2-4</sub> alkenyl), NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1-4</sub> alkyl), NH(C<sub>2-4</sub> alkenyl),  $NH(C_{2-4}$  alkynyl),  $NH(C_{1-4}$  acyl),  $N(C_{1-4}$  alkyl)<sub>2</sub>,  $N(C_{1-18}$  acyl)<sub>2</sub>, wherein alkyl, alkynyl, alkenyl and vinyl are optionally substituted by N<sub>3</sub>, CN, one to three halogen (Cl, Br, F, I), NO<sub>2</sub>, C(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), C(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl),  $C(O)O(C_{2-4} \text{ alkynyl}), C(O)O(C_{2-4} \text{ alkenyl}), O(C_{1-4} \text{ acyl}), O(C_{1-4} \text{ alkyl}), O(C_{2-4} \text{ alkyl})$ 25 alkenyl), S(C<sub>1-4</sub> acyl), S(C<sub>1-4</sub> alkyl), S(C<sub>2-4</sub> alkynyl), S(C<sub>2-4</sub> alkenyl), SO(C<sub>1-4</sub> acyl),  $SO(C_{1-4} \text{ alkyl})$ ,  $SO(C_{2-4} \text{ alkynyl})$ ,  $SO(C_{2-4} \text{ alkenyl})$ ,  $SO_2(C_{1-4} \text{ acyl})$ ,  $SO_2(C_{1-4} \text{ alkyl})$ ,  $SO_2(C_{2-4} \text{ alkynyl})$ ,  $SO_2(C_{2-4} \text{ alkenyl})$ ,  $OS(O)_2(C_{1-4} \text{ acyl})$ ,  $OS(O)_2(C_{1-4} \text{ alkyl}), OS(O)_2(C_{2-4} \text{ alkenyl}), NH_2, NH(C_{1-4} \text{ alkyl}), NH(C_{2-4} \text{ alkyl})$ alkenyl), NH( $C_{2-4}$  alkynyl), NH( $C_{1-4}$  acyl), N( $C_{1-4}$  alkyl)<sub>2</sub>, N( $C_{1-4}$  acyl)<sub>2</sub>; 30

the base is a naturally occurring or modified purine or pyrimidine base represented by the following structures:

wherein

Z is N or CR<sup>12</sup>;

5

10

15

20

 $R^7$ ,  $R^8$ ,  $R^9$ ,  $R^{10}$ , and  $R^{11}$  are independently H, F, Cl, Br, I, OH, OR', SH, SR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkenyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkenyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkynyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> such as C $\equiv$ CH, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkynyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkoxy of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkoxy of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>H, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH $\equiv$ CHCO<sub>2</sub>H, or CH $\equiv$ CHCO<sub>2</sub>R',

wherein R' is an optionally substituted alkyl , which includes, but is not limited to, an optionally substituted  $C_{1\text{-}20}$  alkyl, an optionally substituted  $C_{1\text{-}10}$  alkyl, an optionally substituted lower alkyl; an optionally substituted cycloalkyl; an optionally substituted alkynyl of  $C_2\text{-}C_6$ , an optionally substituted lower alkenyl of  $C_2\text{-}C_6$ , or optionally substituted acyl, which includes but is not limited to C(O) alkyl,  $C(O)(C_{1\text{-}20}$  alkyl),  $C(O)(C_{1\text{-}10}$  alkyl), or C(O)(lower alkyl) or alternatively, in the instance of  $NR'_2$ , each R' comprise at least one C atom that are joined to form a heterocycle comprising at least two carbon atoms; and

 $R^{12}$  is an H, halogen (including F, Cl, Br, I), OH, OR', SH, SR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub> lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkenyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkenyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkynyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkynyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkoxy of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkoxy of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>H, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R'; with the proviso that when base is represented by the structure c with  $R^{11}$  being hydrogen,  $R^{12}$  is not a: (i) -C=C-H, (ii) -C=CH<sub>2</sub>, or (iii) -NO<sub>2</sub>;

said process comprising:

10

20

25

30

reacting a substituted phosphochloridate compound 4 with a nucleoside analog 5

- 10. A process for preparing a compound, its stereoisomer, salt, hydrate, solvate, or crystalline form thereof, selected from among
- 5 2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-C-methyluridine 5'-(phenyl methoxy-alanyl phosphate ((S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester);
  - 6 2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-*C*-methyluridine 5'-(phenyl methoxy-valyl phosphate ((S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-3-methyl-butyric acid methyl ester;
    - 7 2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-*C*-methyluridine 5'-(4-bromophenyl methoxy-valyl phosphate ((S)-2-{(4-bromo-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-3-methyl-butyric acid methyl ester);
    - **8** 2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-*C*-methyluridine 5'-(4-bromophenyl methoxy-alanyl phosphate (((S)-2-{(4-bromo-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester);
    - 9 N<sup>4</sup>-(*N*,*N*-dimethylformamidinyl)-2'-deoxy-2'-fluoro-2'-*C*-methylcytidine;
    - 10 2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-C-methylcytidine 5'-(phenyl methoxy-alanyl phosphate (((S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-oxo-3-amino-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-

2983472-1

- 736 -

10

15

20

25

30

35

40

45

50

3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenyoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester);

- 11 2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-*C*-methylcytidine 5'-(4-bromophenyl methoxy-valyl phosphate (2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-*C*-methyluridine 5'-(4-bromophenyl methoxy-valyl phosphate ((S)-2-{(4-bromo-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-oxo-3-amino-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-3-methyl-butyric acid methyl ester);
- 12 2'-deoxy-2'-fluoro-2'-*C*-methylcytidine 5'-(phenyl methoxy-valyl phosphate ((S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-oxo-3-amino-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-3-methyl-butyric acid methyl ester;
- 13 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid ethyl ester;
- 14 (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(naphthalen-1-yloxy)-phosphorylamino]-propionic acid benzyl ester;
  - 15 {[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-acetic acid methyl ester;
  - **16** (S)-2-{(2,4-Dichloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
- 17 (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(naphthalen-1-yloxy)-phosphorylamino]-propionic acid methyl ester;
- **18** (S)-1-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphoryl}-pyrrolidine-2-carboxylic acid methyl ester;
- **19** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid butyl ester;
- **20** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid benzyl ester;
- **21** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-fluoro-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid methyl ester;
- **22** (S)-2-{(4-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
- **23** (S)-2-{(3,4-Dichloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
- **24** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid sec-butyl ester;
- **25** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid isopropyl ester;

15

20

25

30

35

40

45

- **26** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-methoxy-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid butyl ester;
- 27 (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-fluoro-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid ethyl ester;
- **28** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-fluoro-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid isopropyl ester;
- **29** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-fluoro-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid benzyl ester;
- **30** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-methoxy-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid isopropyl ester;
- **31** (S)-2-{(2-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid benzyl ester;
- **32** (S)-2-{(2,4-Dichloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid butyl ester;
  - 33 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-p-tolyloxy-phosphorylamino}-propionic acid isopropyl ester;
- **34** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-fluoro-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid butyl ester;
- **35** (S)-2-{(3,4-Dichloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid ethyl ester;
- **36** (S)-2-{(2-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid isopropyl ester;
- 37 (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-methoxy-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid benzyl ester;
- **38** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid pentyl ester;
- **39** (S)-2-{(4-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid isopropyl ester;
- **40** (S)-2-{(4-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid butyl ester;
- 41 (S)-2-{(4-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid ethyl ester;

10

15

20

25

30

35

40

45

- **42** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-p-tolyloxy-phosphorylamino}-propionic acid butyl ester;
- 43 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo- 3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-p-tolyloxy-phosphorylamino}-propionic acid benzyl ester;
- 44 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-butyric acid methyl ester;
- **45** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid 4-fluoro-benzyl ester;
- **46** (S)-2-{(2-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid butyl ester;
- 47 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid 3-methyl-butyl ester;
- **48** (S)-2-{(2,4-Dichloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid ethyl ester;
- **49** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid cyclohexyl ester;
- **50** (R)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid butyl ester;
- **51** (R)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid isopropyl ester;
- **52** (R)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid benzyl ester;
- **53** (S)-2-{(2-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid butyl ester;
- **54** (S)-2-{(4-Bromo-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxyl-phosphorylamino}-propionic acid isopropyl ester;
- 55 (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-fluoro-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid cyclohexyl ester;
- 56 (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-bromo-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid cyclohexyl ester;
- 57 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-butyric acid isopropyl ester;

10

15

20

25

30

35

40

45

- **58** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-butyric acid cyclohexyl ester;
- **59** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-fluoro-phenoxy)-phosphorylamino]-butyric acid cyclohexyl ester;
- **60** (S)-2-{(4-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4 R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-butyric acid isopropyl ester;
- **61** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid 2,2-difluoro-ethyl ester;
- **62** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo- 3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid 2,2,2-trifluoro-1-trifluoromethyl-ethyl ester;
- **63** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid 2-fluoro-1-fluoromethyl-ethyl ester;
- **64** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo- 3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid cyclopropyl methyl ester;
- **65** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-butyric acid cyclopentyl ester;
- **66** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(6-Amino-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
  - **67** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-Amino-6-hydroxy-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
  - **68** (S)-2-{(R)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,6-Diamino-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
  - **69** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-Amino-6-cyclopentylamino-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
    - **70** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-Amino-6-azetidin-1-yl-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
- 71 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-Amino-6-diethylamino-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
  - 72 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-Amino-6-propylamino-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
  - 73 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-Amino-6-cyclobutylamino-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;

74 (S)-2-({(2R,3R,4R,5R)-5-[2-Amino-6-(4-methyl-piperazin-1-yl)purin-9-y 1]-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy}phenoxy-p hosphorylamino)-propionic acid methyl ester;

75 (2S)-methyl 2-((((2R,3R,4R,5R)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-5-(6-(propylamino)-9H-purin-9-yl)tetrahydrofuran-2-

yl)methoxy)(phenoxy)phosphorylamino)propanoate;

76 (2S)-methyl 2-((((2R,3R,4R,5R)-5-(6-(cyclobutylamino)-9H-purin-9yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyltetrahydrofuran-2yl)methoxy)(phenoxy)phosphorylamino)propanoate;

77 (2S)-methyl 2-((((2R,3R,4R,5R)-5-(6-(cyclopentylamino)-9H-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyltetrahydrofuran-2yl)methoxy)(phenoxy)phosphorylamino)propanoate;

78 (2S)-methyl 2-((((2R,3R,4R,5R)-5-(6-(aziridin-1-yl)-9H-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyltetrahydrofuran-2-

yl)methoxy)(phenoxy)phosphorylamino)propanoate; 15

79 (2S)-methyl 2-((((2R,3R,4R,5R)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-5-(6-(piperidin-1-yl)-9H-purin-9-yl)tetrahydrofuran-2yl)methoxy)(phenoxy)phosphorylamino)propanoate; and

80 (2S)-methyl 2-((((2R,3R,4R,5R)-5-(6-(azetidin-1-yl)-9H-purin-9-yl)-20 4-fluoro-3-hydroxy-4-methyltetrahydrofuran-2yl)methoxy)(phenoxy)phosphorylamino)propanoate

said process comprising:

reacting a substituted phosphochloridate compound 4 with a nucleoside

25 analog 5

5

10

- A product its stereoisomer, salt, hydrate, solvate or crystalline 11. form thereof, prepared a process comprising:
- 30 reacting a substituted phosphochloridate compound 4 with a nucleoside analog 5

wherein

- (a)  $R^1$  is hydrogen, n-alkyl; branched alkyl; cycloalkyl; or aryl, which includes, but is not limited to, phenyl or naphthyl, where phenyl or naphthyl are optionally substituted with at least one of  $C_{1-6}$  alkyl,  $C_{2-6}$  alkenyl,  $C_{2-6}$  alkynyl,  $C_{1-6}$  alkoxy, F, Cl, Br, I, nitro, cyano,  $C_{1-6}$  haloalkyl,  $-N(R^1)_2$ ,  $C_{1-6}$  acylamino,  $-NHSO_2C_{1-6}$  alkyl,  $-SO_2N(R^1)_2$ ,  $COR^1$ , and  $-SO_2C_{1-6}$  alkyl; ( $R^1$  is independently hydrogen or alkyl, which includes, but is not limited to,  $C_{1-20}$  alkyl,  $C_{1-10}$  alkyl, or  $C_{1-6}$  alkyl,  $R^1$  is -OR or  $-N(R^1)_2$ ;
- 10 (b) R<sup>2</sup> is hydrogen, C <sub>1-10</sub> alkyl, R<sup>3a</sup> or R<sup>3b</sup> and R<sup>2</sup> together are (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> so as to form a cyclic ring that includes the adjoining N and C atoms, C(O)CR<sup>3a</sup>R<sup>3b</sup>NHR<sup>1</sup>, where n is 2 to 4 and R<sup>1</sup>, R<sup>3a</sup>, and R<sup>3b</sup>;
- R<sup>3a</sup> and R<sup>3b</sup> are (i) independently selected from hydrogen, C<sub>1-10</sub> alkyl, cycloalkyl, -(CH<sub>2</sub>)<sub>c</sub>(NR $^3$ ')<sub>2</sub>, C<sub>1-6</sub> hydroxyalkyl, -CH<sub>2</sub>SH, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>S(O)<sub>d</sub>Me, -15 (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>NHC(=NH)NH<sub>2</sub>, (1H-indol-3-yl)methyl, (1H-imidazol-4-yl)methyl, -(CH<sub>2</sub>)<sub>e</sub>COR<sup>3"</sup>, aryl and aryl C<sub>1-3</sub> alkyl, said aryl groups optionally substituted with a group selected from hydroxyl, C<sub>1-10</sub> alkyl, C<sub>1-6</sub> alkoxy, halogen, nitro and cyano; (ii) R<sup>3a</sup> and R<sup>3b</sup> both are C<sub>1-6</sub> alkyl; (iii) R<sup>3a</sup> and R<sup>3b</sup> together are(CH<sub>2</sub>)<sub>f</sub> so as to form a spiro ring; (iv) R<sup>3a</sup> is hydrogen and R<sup>3b</sup> and R<sup>2</sup> together are (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> so as to form a cyclic ring that includes the adjoining N and C atoms (v) R<sup>3b</sup> is 20 hydrogen and R<sup>3a</sup> and R<sup>2</sup> together are (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> so as to form a cyclic ring that includes the adjoining N and C atoms, where c is 1 to 6, d is 0 to 2, e is 0 to 3, f is 2 to 5, n is 2 to 4, and where R<sup>3'</sup> is independently hydrogen or C<sub>1-6</sub> alkyl and  $R^{3''}$  is -OR' or -N( $R^{3'}$ )<sub>2</sub>); (vi)  $R^{3a}$  is H and  $R^{3b}$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH<sub>2</sub>-indol-3-yl, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>, 25 CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H, CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>-imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl; or (viii)

10

15

R<sup>3a</sup> is CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>Ph, CH<sub>2</sub>-indol-3-yl, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H, CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>-imidazol-4-yl, CH<sub>2</sub>OH, CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph), CH<sub>2</sub>SH, or lower cycloalkyl and R<sup>3b</sup> is H, where R<sup>3'</sup> is independently hydrogen or alkyl, which includes, but is not limited to, C<sub>1-20</sub> alkyl, C<sub>1-10</sub> alkyl, or C<sub>1-6</sub> alkyl, R<sup>3"</sup> is -OR' or -N(R<sup>3'</sup>)<sub>2</sub>);

- (d)  $R^4$  is hydrogen,  $C_{1-10}$  alkyl,  $C_{1-10}$  alkyl optionally substituted with a lower alkyl, alkoxy, di(lower alkyl)-amino, or halogen,  $C_{1-10}$  haloalkyl,  $C_{3-10}$  cycloalkyl, cycloalkyl alkyl, cycloheteroalkyl, aminoacyl, aryl, such as phenyl, heteroaryl, such as, pyridinyl, substituted aryl, or substituted heteroaryl;
- (e) R<sup>5</sup> is H, a lower alkyl, CN, vinyl, O-(lower alkyl), hydroxyl lower alkyl, i.e., -(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>OH, where p is 1 -6, including hydroxyl methyl (CH<sub>2</sub>OH), CH<sub>2</sub>F, N<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CN, CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>NHCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, alkyne (optionally substituted), or halogen, including F, Cl, Br, or I, with the provisos that when X is OH, base is cytosine and R<sup>6</sup> is H, R<sup>5</sup> cannot be N<sub>3</sub> and when X is OH, R<sup>6</sup> is CH<sub>3</sub> or CH<sub>2</sub>F and B is a purine base, R<sup>5</sup> cannot be H;
  - (f)  $R^6$  is H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, F, or CN;
  - (g) X is H, OH, F, OMe, halogen, NH<sub>2</sub>, or N<sub>3</sub>;
- (h) Y is OH, H, C<sub>1-4</sub> alkyl, C<sub>2-4</sub> alkenyl, C<sub>2-4</sub> alkynyl, vinyl, N<sub>3</sub>, CN, Cl, Br, F, I, NO<sub>2</sub>, OC(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), OC(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), OC(O)O(C<sub>2-4</sub> alkynyl), OC(O)O(C<sub>2-4</sub> alkenyl), OC<sub>1-10</sub> haloalkyl, O(aminoacyl), O(C<sub>1-10</sub> acyl), O(C<sub>1-4</sub> alkyl), O(C<sub>2-4</sub> alkenyl), S(C<sub>1-4</sub> acyl), S(C<sub>1-4</sub> alkyl), S(C<sub>2-4</sub> alkynyl), S(C<sub>2-4</sub> alkenyl), SO(C<sub>1-4</sub> acyl), SO(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO(C<sub>2-4</sub> alkynyl), SO(C<sub>2-4</sub> alkenyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> acyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>2-4</sub> alkynyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>2-4</sub> alkenyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> acyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkyl), OS(O)<sub>2</sub>(C<sub>2-4</sub> alkenyl), NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1-4</sub> alkyl), NH(C<sub>2-4</sub> alkenyl), NH(C<sub>2-4</sub> alkynyl), NH(C<sub>1-4</sub> acyl), N(C<sub>1-18</sub> acyl)<sub>2</sub>, wherein alkyl, alkynyl, alkenyl and vinyl are optionally substituted by N<sub>3</sub>, CN, one to three halogen (Cl, Br, F, I), NO<sub>2</sub>, C(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), C(O)O(C<sub>1-4</sub> alkyl), O(C<sub>2-4</sub> alkenyl), O(C<sub>1-4</sub> alkyl), O(C<sub>1-4</sub> alkyl), O(C<sub>2-4</sub> alkenyl), S(C<sub>1-4</sub> acyl), S(C<sub>1-4</sub> alkyl), S(C<sub>2-4</sub> alkenyl), S(C<sub>2-4</sub> alkenyl), S(C<sub>1-4</sub> alkyl), S(C<sub>1-4</sub> alkyl), S(C<sub>1-4</sub> alkynyl), S(C<sub>1-4</sub> alkenyl), S(C<sub>1-4</sub> alkynyl), S(C<sub>1-4</sub> alkenyl), S(C<sub>1-4</sub>

acyl), SO( $C_{1-4}$  alkyl), SO( $C_{2-4}$  alkynyl), SO( $C_{2-4}$  alkenyl), SO<sub>2</sub>( $C_{1-4}$  acyl), SO<sub>2</sub>( $C_{1-4}$  alkyl), SO<sub>2</sub>( $C_{2-4}$  alkynyl), SO<sub>2</sub>( $C_{2-4}$  alkenyl), OS(O)<sub>2</sub>( $C_{1-4}$  acyl), OS(O)<sub>2</sub>( $C_{1-4}$  alkyl), OS(O)<sub>2</sub>( $C_{2-4}$  alkenyl), NH<sub>2</sub>, NH( $C_{1-4}$  alkyl), NH( $C_{2-4}$  alkenyl), NH( $C_{2-4}$  alkynyl), NH( $C_{1-4}$  acyl), N( $C_{1-4}$  alkyl)<sub>2</sub>, N( $C_{1-4}$  acyl)<sub>2</sub>;

5 the base is a naturally occurring or modified purine or pyrimidine base represented by the following structures:

wherein

 $Z ext{ is N or } CR^{12};$ 

 $R^7$ ,  $R^8$ ,  $R^9$ ,  $R^{10}$ , and  $R^{11}$  are independently H, F, Cl, Br, I, OH, OR', SH, SR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkenyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkenyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkynyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> such as C=CH, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkynyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkoxy of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkoxy of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>H, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R',

wherein R' is an optionally substituted alkyl, which includes, but is not limited to, an optionally substituted  $C_{1-20}$  alkyl, an optionally substituted  $C_{1-10}$  alkyl, an optionally substituted lower alkyl; an optionally substituted cycloalkyl; an optionally substituted alkynyl of  $C_2$ - $C_6$ , an optionally substituted lower alkenyl of  $C_2$ - $C_6$ , or optionally substituted acyl, which includes but is not limited to C(O) alkyl,  $C(O)(C_{1-20}$  alkyl),  $C(O)(C_{1-10}$  alkyl), or C(O)(lower alkyl) or alternatively, in the instance of  $NR'_2$ , each R' comprise at least one C atom that are joined to form a heterocycle comprising at least two carbon atoms; and

2983472-1

15

20

25

 $R^{12}$  is an H, halogen (including F, Cl, Br, I), OH, OR', SH, SR', NH<sub>2</sub>, NHR', NR'<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub> lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkyl of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkenyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkenyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkynyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkynyl of C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, lower alkoxy of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenated (F, Cl, Br, I) lower alkoxy of C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CO<sub>2</sub>H, CO<sub>2</sub>R', CONH<sub>2</sub>, CONHR', CONR'<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>H, or CH=CHCO<sub>2</sub>R'; with the proviso that when base is represented by the structure c with  $R^{11}$  being hydrogen,  $R^{12}$  is not a: (i) -C=CH, (ii) -C=CH<sub>2</sub>, or (iii) -NO<sub>2</sub>

and

5

15

25

30

wherein X' is a leaving group, such as, Cl.

12. A product its stereoisomer, salt, hydrate, solvate or crystalline form thereof, prepared a process comprising:

reacting a substituted phosphochloridate compound 4 with a nucleoside analog 5

wherein the product comprises a compound, its stereoisomer, salt, hydrate, solvate, or crystalline form thereof, selected from among

- 5 2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-C-methyluridine 5'-(phenyl methoxy-alanyl phosphate ((S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester);
  - 6 2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-*C*-methyluridine 5'-(phenyl methoxy-valyl phosphate ((S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-3-methyl-butyric acid methyl ester;
    - 7 2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-*C*-methyluridine 5'-(4-bromophenyl methoxy-valyl phosphate ((S)-2-{(4-bromo-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-3-methyl-butyric acid methyl ester);

10

15

2.0

25

30

35

40

- **8** 2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-*C*-methyluridine 5'-(4-bromophenyl methoxy-alanyl phosphate (((S)-2-{(4-bromo-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester);
- 9 N<sup>4</sup>-(N,N-dimethylformamidinyl)-2'-deoxy-2'-fluoro-2'-C-methylcytidine;
- 10 2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-C-methylcytidine 5'-(phenyl methoxy-alanyl phosphate (((S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-oxo-3-amino-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenyoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester);
- 11 2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-*C*-methylcytidine 5'-(4-bromophenyl methoxy-valyl phosphate (2'-Deoxy-2'-fluoro-2'-*C*-methyluridine 5'-(4-bromophenyl methoxy-valyl phosphate ((S)-2-{(4-bromo-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-oxo-3-amino-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-3-methyl-butyric acid methyl ester);
- 12 2'-deoxy-2'-fluoro-2'-C-methylcytidine 5'-(phenyl methoxy-valyl phosphate ((S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-oxo-3-amino-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-3-methyl-butyric acid methyl ester;
- 13 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid ethyl ester;
- 14 (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(naphthalen-1-yloxy)-phosphorylamino]-propionic acid benzyl ester;
- **15** {[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-acetic acid methyl ester;
- **16** (S)-2-{(2,4-Dichloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
  - 17 (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(naphthalen-1-yloxy)-phosphorylamino]-propionic acid methyl ester;
  - **18** (S)-1-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphoryl}-pyrrolidine-2-carboxylic acid methyl ester;
  - **19** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid butyl ester;
  - **20** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid benzyl ester;
- 21 (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-fluoro-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid methyl ester;
  - **22** (S)-2-{(4-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;

15

20

25

30

35

40

45

- **23** (S)-2-{(3,4-Dichloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
- **24** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid sec-butyl ester;
- **25** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid isopropyl ester;
- **26** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-methoxy-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid butyl ester;
- **27** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-fluoro-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid ethyl ester;
- **28** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-fluoro-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid isopropyl ester;
- **29** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-fluoro-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid benzyl ester;
- **30** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-methoxy-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid isopropyl ester;
- **31** (S)-2-{(2-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid benzyl ester;
- **32** (S)-2-{(2,4-Dichloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid butyl ester;
- **33** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-p-tolyloxy-phosphorylamino}-propionic acid isopropyl ester;
- **34** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-fluoro-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid butyl ester;
- **35** (S)-2-{(3,4-Dichloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid ethyl ester;
- **36** (S)-2-{(2-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid isopropyl ester;
- **37** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-methoxy-phenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid benzyl ester;
- **38** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid pentyl ester;

15

20

25

30

35

40

45

- **39** (S)-2-{(4-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid isopropyl ester;
- **40** (S)-2-{(4-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxyl-phosphorylamino}-propionic acid butyl ester;
- 41 (S)-2-{(4-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid ethyl ester;
- **42** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-p-tolyloxy-phosphorylamino}-propionic acid butyl ester;
- **43** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-p-tolyloxy-phosphorylamino}-propionic acid benzyl ester;
- 44 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-butyric acid methyl ester;
- **45** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid 4-fluoro-benzyl ester;
- **46** (S)-2-{(2-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid butyl ester;
- 47 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid 3-methyl-butyl ester;
- **48** (S)-2-{(2,4-Dichloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid ethyl ester;
- **49** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid cyclohexyl ester;
- **50** (R)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid butyl ester;
- 51 (R)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid isopropyl ester;
- **52** (R)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid benzyl ester;
  - 53 (S)-2-{(2-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phosphorylamino}-propionic acid butyl ester;
  - 54 (S)-2-{(4-Bromo-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxyl-phosphorylamino}-propionic acid isopropyl ester;

10

15

20

25

30

35

40

45

- 55 (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-fluorophenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid cyclohexyl ester;
- **56** (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-(4-bromophenoxy)-phosphorylamino]-propionic acid cyclohexyl ester;
- 57 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxyphosphorylamino}-butyric acid isopropyl ester;
- 58 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1vI)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxyl-phenoxyphosphorylamino}-butyric acid cyclohexyl ester;
- 59 (S)-2-[[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hvdroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxyl-(4-fluorophenoxy)-phosphorylamino]-butyric acid cyclohexyl ester;
- 60 (S)-2-{(4-Chloro-phenoxy)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-dioxo-3,4dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2ylmethoxy]-phosphorylamino}-butyric acid isopropyl ester;
- 61 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxyl-phenoxyphosphorylamino}-propionic acid 2,2-difluoro-ethyl ester;
- 62 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxyl-phenoxyphosphorylamino}-propionic acid 2,2,2-trifluoro-1-trifluoromethyl-ethyl ester;
- 63 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxyphosphorylamino}-propionic acid 2-fluoro-1-fluoromethyl-ethyl ester;
- **64** (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1vl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxyphosphorylamino}-propionic acid cyclopropyl methyl ester;
- 65 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,4-Dioxo-3,4-dihydro-2H-pyrimidin-1yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxyphosphorylamino}-butyric acid cyclopentyl ester;
- 66 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(6-Amino-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxyl-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
  - 67 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-Amino-6-hydroxy-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxyphosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
  - 68 (S)-2-{(R)-[(2R,3R,4R,5R)-5-(2,6-Diamino-purin-9-yl)-4-fluoro-3hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}propionic acid methyl ester;
  - 69 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-Amino-6-cyclopentylamino-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxyphosphorylamino}-propionic acid methyl ester;
  - 70 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-Amino-6-azetidin-1-yl-purin-9-yl)-4fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxyphosphorylamino}-propionic acid methyl ester;

71 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-Amino-6-diethylamino-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;

72 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-Amino-6-propylamino-purin-9-yl)-4fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxyphosphorylamino}-propionic acid methyl ester;

73 (S)-2-{[(2R,3R,4R,5R)-5-(2-Amino-6-cyclobutylamino-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy]-phenoxy-phosphorylamino}-propionic acid methyl ester;

74 (S)-2-({(2R,3R,4R,5R)-5-[2-Amino-6-(4-methyl-piperazin-1-yl)-purin-9-yl]-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-tetrahydro-furan-2-ylmethoxy}-phenoxy-p hosphorylamino)-propionic acid methyl ester;

75 (2S)-methyl 2-((((2R,3R,4R,5R)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-5-(6-(propylamino)-9H-purin-9-yl)tetrahydrofuran-2-

15 yl)methoxy)(phenoxy)phosphorylamino)propanoate;

76 (2S)-methyl 2-((((2R,3R,4R,5R)-5-(6-(cyclobutylamino)-9H-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyltetrahydrofuran-2-yl)methoxy)(phenoxy)phosphorylamino)propanoate;

77 (2S)-methyl 2-((((2R,3R,4R,5R)-5-(6-(cyclopentylamino)-9H-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyltetrahydrofuran-2-yl)methoxy)(phenoxy)phosphorylamino)propanoate;

78 (2S)-methyl 2-((((2R,3R,4R,5R)-5-(6-(aziridin-1-yl)-9H-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyltetrahydrofuran-2-yl)methoxy)(phenoxy)phosphorylamino)propanoate;

79 (2S)-methyl 2-((((2R,3R,4R,5R)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyl-5-(6-(piperidin-1-yl)-9H-purin-9-yl)tetrahydrofuran-2-yl)methoxy)(phenoxy)phosphorylamino)propanoate; and

**80** (2S)-methyl 2-((((2R,3R,4R,5R)-5-(6-(azetidin-1-yl)-9H-purin-9-yl)-4-fluoro-3-hydroxy-4-methyltetrahydrofuran-2-

30 yl)methoxy)(phenoxy)phosphorylamino)propanoate

wherein Base' is as recited in each of compounds 5-74; and

wherein X' is a leaving group, such as, Cl.

35

10

20