

(19)



**Евразийское
патентное
ведомство**

(21) **202091046** (13) **A1**

(12) **ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОЙ ЗАЯВКЕ**

(43) Дата публикации заявки
2020.08.05

(51) Int. Cl. *A01N 43/40* (2006.01)
A01N 43/54 (2006.01)
A01P 13/00 (2006.01)

(22) Дата подачи заявки
2018.10.26

(54) **ГЕРБИЦИДЫ НА ОСНОВЕ ПИРИДИН- И ПИРИМИДИНКАРБОКСИЛАТА И СПОСОБЫ ИХ ПРИМЕНЕНИЯ**

(31) **62/577,972**

(32) **2017.10.27**

(33) **US**

(86) **PCT/US2018/057626**

(87) **WO 2019/084353 2019.05.02**

(71) Заявитель:

ДАУ АГРОСАЙЕНСИЗ ЭлЭлСи (US)

(72) Изобретатель:

Белл Джаред, Байсс Энн М., Дзубл Джон Ф., Эккельбарджер Джозеф Д., Эпп Джеффри Б., Ирвин Николас М., Кистер Джереми, Ло Вилльям К., Лосо Майкл Р., Лоу Кристиан Т., Роханна Джон К., Сачиви Норберт М., Сиддалл Томас Л., Стюард Кимберли М., Йеркс Карла Н. (US)

(74) Представитель:

Медведев В.Н. (RU)

(57) В данном документе предусмотрены пиридин- и пиримидинкарбоксилаты и их производные, а также композиции на их основе и способы их применения в качестве гербицидов.

A1

202091046

202091046

A1

ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ

2420-561996EA/060

ГЕРБИЦИДЫ НА ОСНОВЕ ПИРИДИН- И ПИРИМИДИНКАРБОКСИЛАТА И СПОСОБЫ ИХ ПРИМЕНЕНИЯ

ПЕРЕКРЕСТНАЯ ССЫЛКА НА РОДСТВЕННЫЕ ЗАЯВКИ

Данная заявка испрашивает преимущество и приоритет предварительной заявки на патент США № 62/577972, поданной 27 октября 2017 г., полное раскрытие которой явным образом включено посредством ссылки в данный документ во всей своей полноте.

ОБЛАСТЬ ТЕХНИКИ

В данном документе предусмотрены гербицидные соединения, композиции, содержащие их, и способы их применения для контроля нежелательной растительности.

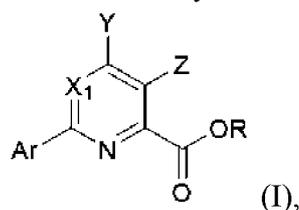
УРОВЕНЬ ТЕХНИКИ

Появление нежелательной растительности или сорняков является постоянной проблемой, с которой сталкиваются фермеры, в отношении сельскохозяйственных культур, пастбищ и других посадок. Сорняки конкурируют с сельскохозяйственными культурами и, следовательно, могут отрицательно влиять на урожайность сельскохозяйственных культур. Применение химических гербицидов является важным инструментом при контроле нежелательной растительности.

Остается потребность в новых химических гербицидах, которые обеспечивают более широкий спектр контроля сорняков, селективность, минимальное повреждение сельскохозяйственных культур, стабильность при хранении, легкость эксплуатации, более высокую активность в отношении сорняков, и/или в средствах для устранения устойчивости в отношении гербицидов, которая развилась в отношении гербицидов, применяемых в данный момент.

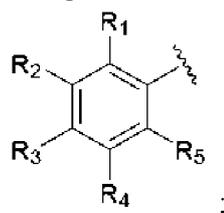
КРАТКОЕ ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ

В данном документе предусмотрены соединения формулы (I):



где

Ar представляет собой



X_1 представляет собой N или CR_6 ;

R представляет собой водород, замещенный либо незамещенный алкил, замещенный либо незамещенный фенил, замещенный либо незамещенный бензил, замещенный либо незамещенный пиридинилметил, замещенный либо незамещенный алкенил или замещенный либо незамещенный алкинил;

R_1, R_2, R_3, R_4 и R_5 независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, галогена, гидроксигруппы, замещенного либо незамещенного алкила, замещенного либо незамещенного галогеналкила, замещенного либо незамещенного алкенила, замещенного либо незамещенного галогеналкенила, замещенного либо незамещенного алкинила, замещенного либо незамещенного циклоалкила, замещенного либо незамещенного галогенциклоалкила, замещенного либо незамещенного арила, замещенного либо незамещенного арилокси, замещенного либо незамещенного алкокси, замещенного либо незамещенного галогеналкокси, замещенного либо незамещенного алкилсульфанила, замещенного либо незамещенного галогеналкилсульфанила, замещенного либо незамещенного алкилсульфинила, замещенного либо незамещенного галогеналкилсульфинила, замещенного либо незамещенного алкилсульфонила, замещенного либо незамещенного галогеналкилсульфонила, замещенного либо незамещенного алкилсульфонил(окси), замещенного либо незамещенного галогеналкилсульфонил(окси), амина, алкиламина, диалкиламина, амидо, формила, 2,2-диметилгидразоно, метоксиимино, гидроксимино, алкилкарбонила, алкоксикарбонила, нитро и циано, или R_1 и R_2, R_2 и R_3, R_3 и R_4 или R_4 и R_5 вместе могут образовывать замещенное либо незамещенное 5- или 6-членное алифатическое или ароматическое кольцо, содержащее 0-3 гетероатома, выбранных из группы, состоящей из O, N и S;

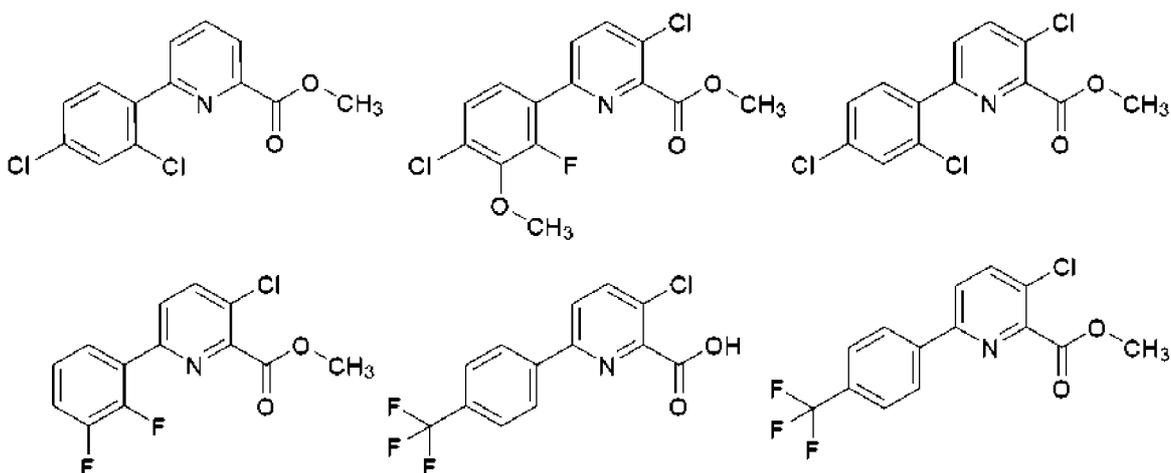
R_6 представляет собой водород, галоген, замещенный либо незамещенный алкил, замещенный либо незамещенный галогеналкил, замещенный либо незамещенный алкинил, замещенный либо незамещенный алкокси, замещенный либо незамещенный алкилсульфанил, гидроксигруппы, амина, циано или ациламино;

Y выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, замещенного либо незамещенного алкила, замещенного либо незамещенного галогеналкила, замещенного либо незамещенного алкенила, замещенного либо незамещенного галогеналкенила, замещенного либо незамещенного алкинила, замещенного либо незамещенного алкокси, замещенного либо незамещенного галогеналкокси, замещенного либо незамещенного алкилсульфанила, замещенного либо незамещенного алкилсульфинила, замещенного либо незамещенного алкилсульфонила, нитро и циано;

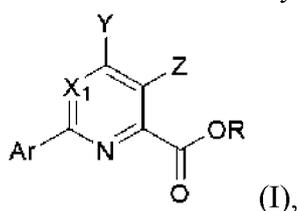
Z выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, алкила, галогеналкила, алкинила, алкокси, галогеналкокси, алкилсульфанила, амина, нитро и циано;

при условии, что если $X_1=N$, то Y не является алкокси;

при условии, что соединение формулы (I) является отличным от

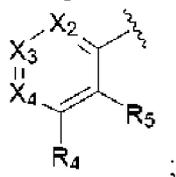


Также в данном документе предусмотрены соединения формулы (I):



где

Ar представляет собой



X_1 представляет собой N или CR_6 ; X_2 представляет собой N или CR_1 ; X_3 представляет собой N или CR_2 ; X_4 представляет собой N или CR_3 ;

R представляет собой водород, замещенный либо незамещенный алкил, фенил, замещенный либо незамещенный бензил, замещенный либо незамещенный пиридинилметил, замещенный либо незамещенный алкенил или замещенный либо незамещенный алкинил;

R_1 , R_2 , R_3 , R_4 и R_5 независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, галогена, гидроксильной, замещенной либо незамещенной алкильной, замещенной либо незамещенной галогеналкильной, замещенной либо незамещенной алкенильной, замещенной либо незамещенной галогеналкенильной, замещенной либо незамещенной алкинильной, замещенной либо незамещенной циклоалкильной, замещенной либо незамещенной галогенциклоалкильной, замещенной либо незамещенной арильной, замещенной либо незамещенной арилокси-, замещенной либо незамещенной алкокси-, замещенной либо незамещенной галогеналкокси-, замещенной либо незамещенной алкилсульфанильной, замещенной либо незамещенной галогеналкилсульфанильной, замещенной либо

незамещенного алкилсульфинила, замещенного либо незамещенного галогеналкилсульфинила, замещенного либо незамещенного алкилсульфонила, замещенного либо незамещенного галогеналкилсульфонила, замещенного либо незамещенного алкилсульфонил(окси), замещенного либо незамещенного галогеналкилсульфонил(окси), амина, алкиламина, диалкиламина, амидо, формила, 2,2-диметилгидразоно, метоксиимино, гидроксимино, алкилкарбонила, алкоксикарбонила, нитро и циано, или R_1 и R_2 , R_2 и R_3 , R_3 и R_4 или R_4 и R_5 вместе могут образовывать замещенное либо незамещенное 5- или 6-членное алифатическое или ароматическое кольцо, содержащее 0-3 гетероатома, выбранных из группы, состоящей из O, N и S;

R_6 представляет собой водород, галоген, замещенный либо незамещенный алкил, замещенный либо незамещенный галогеналкил, замещенный либо незамещенный алкинил, замещенный либо незамещенный алкокси, замещенный либо незамещенный алкилсульфанил, гидроксид, амина, циано или ациламино;

Y выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, замещенного либо незамещенного алкила, замещенного либо незамещенного галогеналкила, замещенного либо незамещенного алкенила, замещенного либо незамещенного галогеналкенила, замещенного либо незамещенного алкинила, замещенного либо незамещенного алкокси, замещенного либо незамещенного галогеналкокси, замещенного либо незамещенного алкилсульфанила, замещенного либо незамещенного алкилсульфинила, замещенного либо незамещенного алкилсульфонила, нитро и циано; и

Z выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, алкила, галогеналкила, алкинила, алкокси, галогеналкокси, алкилсульфанила, амина, нитро и циано;

при условии, что если X_1 представляет собой N, то Y не является алкокси.

В различных аспектах соединения могут включать соединения, где R выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_8 алкила, замещенного C_1 - C_8 алкила, C_2 - C_8 алкенила, C_2 - C_8 алкинила, бензила, замещенного бензила и пиридинилметила.

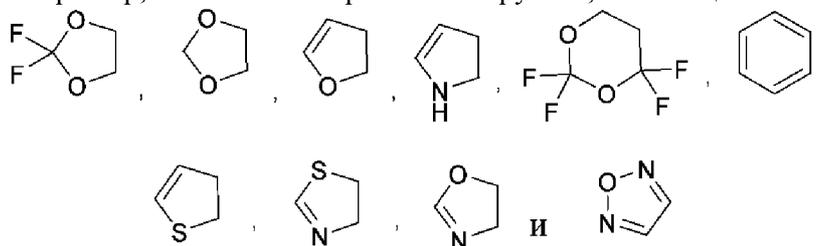
Некоторые соединения в соответствии с различными аспектами могут включать соединения, где R_1 или R_5 выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, циано, амина, амидо, нитро, C_1 - C_8 алкила, C_1 - C_8 галогеналкила, C_2 - C_8 алкенила, C_2 - C_8 алкинила, C_1 - C_8 алкокси, C_1 - C_8 алкилсульфанила, C_1 - C_8 алкилсульфинила, C_1 - C_8 алкилсульфонила, формила.

Также некоторые аспекты могут включать соединения, где R_2 или R_4 выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, нитро, C_1 - C_8 алкила, C_1 - C_8 галогеналкила, C_1 - C_8 алкокси, C_1 - C_8 алкилсульфанила и C_1 - C_8 алкилсульфинила.

В различных аспектах R_3 может быть выбран из группы, состоящей из галогена, замещенного либо незамещенного галогеналкила, замещенного либо незамещенного циклоалкила, замещенного либо незамещенного галогенциклоалкила, замещенного либо незамещенного галогеналкилсульфанила, замещенного либо незамещенного

алкилсульфонил(окси) и циано.

Некоторые соединения в соответствии с различными аспектами включают соединения, где R1 и R2, R2 и R3, R3 и R4 или R4 и R5 вместе могут образовывать замещенное либо незамещенное 5- или 6-членное алифатическое или ароматическое кольцо, содержащее 0-3 гетероатома, такие как выбранные из группы, состоящей из O, N или S. Например, такое как выбранное из группы, состоящей из



В некоторых аспектах R может быть выбран из группы, состоящей из водорода, C1-C8алкила, замещенного C1-C8алкила, C2-C8алкенила, C2-C8алкинила, бензила, замещенного бензила и пиридинилметила.

В различных аспектах R1, R2, R3, R4, и R5 может быть независимо выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, циано, amino, амидо, нитро, C1-C8алкила, C1-C8галогеналкила, C2-C8алкенила, C2-C8алкинила, C1-C8алкокси, C1-C8алкилсульфанила, C1-C8алкилсульфинила, C1-C8алкилсульфонила и формила.

В некоторых аспектах R2 или R4 может быть выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, нитро, C1-C8алкила, C1-C8галогеналкила, C1-C8алкокси, C1-C8алкилсульфанила и C1-C8алкилсульфинила.

Также в данном документе включены соединения в соответствии с различными аспектами, где R выбран из группы, состоящей из водорода, метила, цианометила, 2-метилаллила, пропаргила, бензила, замещенного бензила и пиридинилметила; R1 или R5 выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, циано, (C1-C4)алкила и (C1-C4)алкокси; R2 или R4 выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, (C2-C4)алкинила и (C1-C4)галогеналкила; R3 выбран из группы, состоящей из галогена, замещенного (C3-C6)циклоалкила, (C1-C4)галогеналкилсульфанила, (C1-C4)галогеналкила и (C1-C4)галогеналкокси, или R1 и R2, R2 и R3, R3 и R4 или R4 и R5 вместе могут образовывать замещенное либо незамещенное 5- или 6-членное алифатическое или ароматическое кольцо, содержащее 0-3 гетероатома, выбранных из группы, состоящей из O, N и S; R6 выбран из группы, состоящей из водорода, галогена и гидрокси; Y представляет собой H; и Z представляет собой галоген.

В некоторых аспектах R может быть выбран из группы, состоящей из водорода, метила, цианометила, 2-метилаллила, пропаргила, бензила, замещенного бензила и пиридинилметила; R₁, R₂, R₃, R₄ и R₅ независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, галогена, (C₁-C₄)галогеналкила и (C₁-C₄)алкокси; R₆ выбран из группы,

состоящей из водорода, галогена и гидрокси; Y представляет собой H; и Z представляет собой галоген.

В некоторых аспектах композиции могут содержать (включать) любое из вышеуказанных соединений и приемлемые с точки зрения сельского хозяйства вспомогательное вещество или носитель.

В некоторых аспектах композиции могут включать любое из вышеуказанных соединений и дополнительных гербицидных соединений.

В различных аспектах композиции могут включать любое из вышеуказанных соединений и антидот.

Также в данном документе в соответствии с различными аспектами включен способ контроля нежелательной растительности, который включает (a) приведение в контакт нежелательной растительности или области, прилегающей к нежелательной растительности, или (b) предвсходное приведение в контакт почвы или воды с любым из вышеуказанных соединений или композиций. Такие способы и аспекты могут включать способы, в которых композиции применяют до появления всходов, после появления всходов, или как до появления всходов, так и после появления всходов.

ПОДРОБНОЕ ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ

I. Определения

При использовании в данном документе контроль или осуществление контроля нежелательной растительности могут подразумевать включение уничтожения или предотвращения появления растительности, или обуславливания какого-либо другого неблагоприятного модифицирующего эффекта в отношении растительности, например, некроза, хлороза, остановки роста, отклонений от естественного роста или развития, регуляции, потери влаги, задержки развития и т. п.

При использовании в данном документе гербицид, гербицидная композиция и гербицидный активный ингредиент могут подразумевать включение соединения, которое осуществляет контроль нежелательной растительности при применении в подходящем количестве.

При использовании в данном документе гербицидно эффективное или достаточное для контроля растительности количество может подразумевать включение количества гербицидного активного ингредиента, применение которого обеспечивает осуществление контроля соответствующей нежелательной растительности.

При использовании в данном документе применение гербицида, гербицидной композиции или гербицидного активного ингредиента может подразумевать включение их доставки непосредственно к целевой растительности, или к месту ее произрастания, или к области, на которой является необходимым контроль нежелательной растительности. Способы применения включают без ограничения приведение в контакт нежелательной растительности или области, прилегающей к нежелательной растительности, до появления

всходов, после появления всходов, в отношении листьев, почвы и/или воды.

При использовании в данном документе растения и растительность включают без ограничения покоящиеся семена, проросшие семена, всходящие проростки, растения, развивающиеся из вегетативных черенков, незрелую растительность, зрелую растительность, репродуктивную растительность и сформированную растительность.

При использовании в данном документе незрелая растительность может подразумевать включение небольших вегетирующих растений до наступления репродуктивной стадии, и зрелая растительность может подразумевать включение вегетирующих растений во время и после завершения репродуктивной стадии.

При использовании в данном документе "антидот" может предусматривать включение молекул, применяемых в комбинации с гербицидами для уменьшения эффекта гербицида в отношении культурных растений и для улучшения селективности между культурными растениями и видами сорняков, подвергаемых воздействию гербицида.

При использовании в данном документе "вспомогательное вещество" может подразумевать включение вещества в гербицидном составе или добавляемого в резервуар опрыскивателя для улучшения гербицидной активности или характеристик, связанных с применением. Вспомогательные вещества для распыления могут быть сгруппированы в две широкие категории: активаторные вспомогательные вещества и специализированные целевые вспомогательные вещества.

При использовании в данном документе приемлемые с точки зрения сельского хозяйства соли и сложные эфиры могут подразумевать включение солей и сложных эфиров соединений формулы (I), которые демонстрируют гербицидную активность, или которые преобразуются или могут быть преобразованы в растениях, воде или почве в упоминаемый гербицид. Иллюстративные приемлемые с точки зрения сельского хозяйства сложные эфиры представляют собой те, которые подвергаются или могут быть подвергнуты гидролизу, окислению, метаболизированию, или преобразованы каким-либо иным способом, например, в растениях, воде или почве, в соответствующую пиридинкарбоновую кислоту, которая в зависимости от pH может быть в диссоциированной или недиссоциированной форме.

Подходящие приемлемые с точки зрения сельского хозяйства соли включают таковые, полученные из щелочных или щелочноземельных металлов, и таковые, полученные из аммиака и аминов. Предпочтительные катионы включают катионы натрия, калия, магния и аммония в соответствии с формулой:



где каждый из R^{10} , R^{11} , R^{12} и R^{13} независимо представляет собой водород или C_1 - C_{12} алкил, C_3 - C_{12} алкенил или C_3 - C_{12} алкинил, каждый из которых необязательно замещен одним или несколькими заместителями, такими как гидрокси, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_4 алкилтио или фенильные группы, при условии, что R^{10} , R^{11} , R^{12} и R^{13} являются стерически

совместимыми. Кроме того, любые два из R^{10} , R^{11} , R^{12} и R^{13} вместе могут представлять собой алифатический дифункциональный фрагмент, содержащий от одного до двенадцати атомов углерода и не более двух атомов кислорода или серы. Соли соединений формулы (I) можно получать путем обработки соединений формулы (I) гидроксидом металла, таким как гидроксид натрия, амином, таким как аммиак, триметиламин, диэтанолламин, 2-метилтиопропиламин, бис-аллиламин, 2-бутоксипропиламин, морфолин, циклододециламин, 2-метилгептиламин или бензиламин, или гидроксидом тетраалкиламмония, таким как гидроксид тетраметиламмония или гидроксид холина. Аминные соли соединений формулы (I) являются пригодными формами или производными соединений формулы (I), поскольку они являются растворимыми в воде и обеспечивают возможность получения желаемых гербицидных композиций на водной основе.

Подходящие приемлемые с точки зрения сельского хозяйства сложные эфиры включают алкильные группы с прямой или разветвленной цепью. Типичные C_1 - C_{12} алкильные группы включают без ограничения метил, этил, пропил, 1-метилэтил, бутил, 1,1-диметилэтил, 1-метилпропил, пентил, гексил, гептил, 1-метилгексил, октил, 2-этилгексил, 2-метилгептил, нонил, децил и додецил. Часто предпочтительными являются метил и этил. Также включены алкиловые сложные эфиры, замещенные группами, такими как галогены или CN. Другие предпочтительные сложные эфиры включают C_1 - C_8 гетероциклические алкиловые сложные эфиры, включающие пиридин-2-илметил, пиридин-3-илметил и пиридин-4-илметил; C_7 - C_{10} арилалкиловые сложные эфиры, включающие бензил, замещенный бензил и фенэтил, такие как 2,4-дихлорбензил, 3-(трифторметил)бензил и 3-(трифторметил)бензил; алкениловые сложные эфиры, такие как 2-метилаллил; и алкиниловые сложные эфиры, такие как пропаргил.

При использовании в данном документе "алкил" может подразумевать включение насыщенных прямоцепочечных или разветвленных углеводородных фрагментов. Если не указано иное, то подразумеваются C_1 - C_{12} алкильные группы. Примеры включают без ограничения метил, этил, пропил, 1-метилэтил, бутил, 1-метилпропил, 2-метилпропил, 1,1-диметилэтил, пентил, 1-метилбутил, 2-метилбутил, 3-метилбутил, 2,2-диметилпропил, 1-этилпропил, гексил, 1,1-диметилпропил, 1,2-диметилпропил, 1-метилпентил, 2-метилпентил, 3-метилпентил, 4-метилпентил, 1,1-диметилбутил, 1,2-диметилбутил, 1,3-диметилбутил, 2,2-диметилбутил, 2,3-диметилбутил, 3,3-диметилбутил, 1-этилбутил, 2-этилбутил, 1,1,2-триметилпропил, 1,2,2-триметилпропил, 1-этил-1-метилпропил и 1-этил-2-метилпропил.

При использовании в данном документе "галогеналкил" может подразумевать включение прямоцепочечных или разветвленных алкильных групп, где в данных группах атомы водорода могут быть частично или полностью замещены одним или несколькими атомами галогена. Если не указано иное, то подразумеваются группы C_1 - C_8 . Примеры включают без ограничения хлорметил, бромметил, дихлорметил, трихлорметил,

фторметил, дифторметил, трифторметил, хлорфторметил, дихлорфторметил, хлордифторметил, 1-хлорэтил, 1-бромэтил, 1-фторэтил, 2-фторэтил, 2,2-дифторэтил, 2,2,2-трифторэтил, 2-хлор-2-фторэтил, 2-хлор-2,2-дифторэтил, 2,2-дихлор-2-фторэтил, 2,2,2-трихлорэтил, пентафторэтил и 1,1,1-трифторпроп-2-ил.

При использовании в данном документе "циклоалкил" может подразумевать включение насыщенных циклических углеводородных фрагментов. Если не указано иное, то подразумеваются C_3 - C_8 циклоалкильные группы. Примеры включают циклопропил, 2,2-диметилциклопропил, циклобутил, циклопентил, циклогексил, циклогептил и циклооктил.

При использовании в данном документе "галогенциклоалкил" может подразумевать включение циклоалкильной группы, определенной выше, где атомы углерода частично или полностью замещены одним или несколькими атомами галогена.

При использовании в данном документе "алкенил" может подразумевать включение ненасыщенных прямоцепочечных или разветвленных углеводородных фрагментов, содержащих одну или несколько двойных связей. Если не указано иное, то подразумеваются C_2 - C_8 алкенильные группы. Алкенильные группы могут содержать более одной ненасыщенной связи. Примеры включают без ограничения этенил, 1-пропенил, 2-пропенил, 1-метилэтенил, 1-бутенил, 2-бутенил, 3-бутенил, 1-метил-1-пропенил, 2-метил-1-пропенил, 1-метил-2-пропенил, 2-метил-2-пропенил, 2-метилаллил, 1-пентенил, 2-пентенил, 3-пентенил, 4-пентенил, 1-метил-1-бутенил, 2-метил-1-бутенил, 3-метил-1-бутенил, 1-метил-2-бутенил, 2-метил-2-бутенил, 3-метил-2-бутенил, 1-метил-3-бутенил, 2-метил-3-бутенил, 3-метил-3-бутенил, 1,1-диметил-2-пропенил, 1,2-диметил-1-пропенил, 1,2-диметил-2-пропенил, 1-этил-1-пропенил, 1-этил-2-пропенил, 1-гексенил, 2-гексенил, 3-гексенил, 4-гексенил, 5-гексенил, 1-метил-1-пентенил, 2-метил-1-пентенил, 3-метил-1-пентенил, 4-метил-1-пентенил, 1-метил-2-пентенил, 2-метил-2-пентенил, 3-метил-2-пентенил, 4-метил-2-пентенил, 1-метил-3-пентенил, 2-метил-3-пентенил, 3-метил-3-пентенил, 4-метил-3-пентенил, 1-метил-4-пентенил, 2-метил-4-пентенил, 3-метил-4-пентенил, 4-метил-4-пентенил, 1,1-диметил-2-бутенил, 1,1-диметил-3-бутенил, 1,2-диметил-1-бутенил, 1,2-диметил-2-бутенил, 1,2-диметил-3-бутенил, 1,3-диметил-1-бутенил, 1,3-диметил-2-бутенил,

1,3-диметил-3-бутенил, 2,2-диметил-3-бутенил, 2,3-диметил-1-бутенил, 2,3-диметил-2-бутенил, 2,3-диметил-3-бутенил, 3,3-диметил-1-бутенил, 3,3-диметил-2-бутенил, 1-этил-1-бутенил, 1-этил-2-бутенил, 1-этил-3-бутенил, 2-этил-1-бутенил, 2-этил-2-бутенил, 2-этил-3-бутенил, 1,1,2-триметил-2-пропенил, 1-этил-1-метил-2-пропенил, 1-этил-2-метил-1-пропенил и 1-этил-2-метил-2-пропенил.

При использовании в данном документе "галогеналкенил" может подразумевать включение прямоцепочечных или разветвленных алкенильных групп, где в данных группах атомы водорода могут быть частично или полностью замещены одним или несколькими атомами галогена. Если не указано иное, то подразумеваются группы C_2 - C_8 . Примеры

включают без ограничения 1-хлорэтинил, 1-хлор-1-пропенил, 2-хлор-1-пропенил, 1-хлор-2-пропенил, 2-хлор-2-пропенил, 1-хлор-1-бутенил, 2-хлор-1-бутенил, 3-хлор-1-бутенил, 1-хлор-2-бутенил, 2-хлор-2-бутенил, 3-хлор-2-бутенил, 1-хлор-3-бутенил, 2-хлор-3-бутенил, 3-хлор-3-бутенил, 1-фторэтинил, 1-фтор-1-пропенил, 2-фтор-1-пропенил, 1-фтор-2-пропенил, 2-фтор-2-пропенил, 1-фтор-1-бутенил, 2-фтор-1-бутенил, 3-фтор-1-бутенил, 1-фтор-2-бутенил, 2-фтор-2-бутенил, 3-фтор-2-бутенил, 1-фтор-3-бутенил, 2-фтор-3-бутенил и 3-фтор-3-бутенил.

При использовании в данном документе "алкинил" представляет собой прямоцепочечные или разветвленные углеводородные фрагменты, содержащие одну или несколько тройных связей. Если не указано иное, то подразумеваются C_2 - C_8 алкинильные группы. Алкинильные группы могут содержать более одной ненасыщенной связи. Примеры включают без ограничения C_2 - C_8 -алкинил, такой как этинил, 1-пропинил, 2-пропинил (или пропаргил), 1-бутинил, 2-бутинил, 3-бутинил, 1-метил-2-пропинил, 1-пентинил, 2-пентинил, 3-пентинил, 4-пентинил, 3-метил-1-бутинил, 1-метил-2-бутинил, 1-метил-3-бутинил, 2-метил-3-бутинил, 1,1-диметил-2-пропинил, 1-этил-2-пропинил, 1-гексинил, 2-гексинил, 3-гексинил, 4-гексинил, 5-гексинил, 3-метил-1-пентинил, 4-метил-1-пентинил, 1-метил-2-пентинил, 4-метил-2-пентинил, 1-метил-3-пентинил, 2-метил-3-пентинил, 1-метил-4-пентинил, 2-метил-4-пентинил, 3-метил-4-пентинил, 1,1-диметил-2-бутинил, 1,1-диметил-3-бутинил, 1,2-диметил-3-бутинил, 2,2-диметил-3-бутинил, 3,3-диметил-1-бутинил, 1-этил-2-бутинил, 1-этил-3-бутинил, 2-этил-3-бутинил и 1-этил-1-метил-2-пропинил.

При использовании в данном документе "галогеналкинил" может подразумевать включение прямоцепочечных или разветвленных алкинильных групп, где в данных группах атомы водорода могут быть частично или полностью замещенными одним или несколькими атомами галогена. Если не указано иное, то подразумеваются группы C_2 - C_8 . Примеры включают без ограничения 1-хлор-2-бутинил, 1-хлор-3-бутинил, 2-хлор-3-бутинил, 1,1-дихлор-2-пропинил, 1-хлор-2-пропинил, 3-хлор-1-пентинил, 4-хлор-1-пентинил, 1-хлор-2-пентинил, 4-хлор-2-пентинил, 1-хлор-3-пентинил, 2-хлор-3-пентинил, 1-хлор-4-пентинил, 2-хлор-4-пентинил, 3-хлор-4-пентинил, 1,1-дихлор-2-бутинил, 1,1-дихлор-3-бутинил, 1,2-дихлор-3-бутинил, 2,2-дихлор-3-бутинил, 3,3-дихлор-1-бутинил, 1-фтор-2-бутинил, 1-фтор-3-бутинил, 2-фтор-3-бутинил и 1,1-дифтор-2-пропинил, 1-фтор-2-пропинил, 3-фтор-1-пентинил, 4-фтор-1-пентинил, 1-фтор-2-пентинил, 4-фтор-2-пентинил, 1-фтор-3-пентинил, 2-фтор-3-пентинил, 1-фтор-4-пентинил, 2-фтор-4-пентинил, 3-фтор-4-пентинил, 1,1-дифтор-2-бутинил, 1,1-дифтор-3-бутинил, 1,2-дифтор-3-бутинил, 2,2-дифтор-3-бутинил и 3,3-дифтор-1-бутинил.

При использовании в данном документе "алкокси" может подразумевать включение группы формулы R-O-, где R представляет собой алкил, определенный выше. Если не указано иное, то подразумеваются алкоксигруппы, где R представляет собой C_1 -

С₈алкильную группу. Примеры включают без ограничения метокси, этокси, пропокси, 1-метилэтокси, бутокси, 1-метилпропокси, 2-метилпропокси, 1,1-диметилэтокси, пентокси, 1-метилбутилокси, 2-метилбутокси, 3-метилбутокси, 2,2-диметилпропокси, 1-этилпропокси, гексокси, 1,1-диметилпропокси, 1,2-диметилпропокси, 1-метилпентокси, 2-метилпентокси, 3-метилпентокси, 4-метилпентокси, 1,1-диметилбутокси, 1,2-диметилбутокси, 1,3-диметилбутокси, 2,2-диметилбутокси, 2,3-диметилбутокси, 3,3-диметилбутокси, 1-этилбутокси, 2-этилбутокси, 1,1,2-триметилпропокси, 1,2,2-триметилпропокси, 1-этил-1-метилпропокси и 1-этил-2-метилпропокси.

При использовании в данном документе "галогеналкокси" может подразумевать включение группы формулы R-O-, где R представляет собой галогеналкил, определенный выше. Если не указано иное, то подразумеваются галогеналкоксигруппы, где R представляет собой С₁-С₈алкильную группу. Примеры включают без ограничения хлорметокси, бромметокси, дихлорметокси, трихлорметокси, фторметокси, дифторметокси, трифторметокси, хлорфторметокси, дихлорфторметокси, хлордифторметокси,

1-хлорэтокси, 1-бромэтокси, 1-фторэтокси, 2-фторэтокси, 2,2-дифторэтокси, 2,2,2-трифторэтокси, 2-хлор-2-фторэтокси, 2-хлор-2,2-дифторэтокси, 2,2-дихлор-2-фторэтокси, 2,2,2-трихлорэтокси, пентафторэтокси и 1,1,1-трифторпроп-2-окси.

При использовании в данном документе "алкилтио" или "алкилсульфанил" может подразумевать включение группы формулы R-S-, где R представляет собой алкил, определенный выше. Если не указано иное, то подразумеваются алкилтио- или алкилсульфанильные группы, где R представляет собой С₁-С₈алкильную группу. Примеры включают без ограничения метилтио, этилтио, пропилтио, 1-метилэтилтио, бутилтио, 1-метилпропилтио, 2-метилпропилтио, 1,1-диметилэтилтио, пентилтио, 1-метилбутилтио, 2-метилбутилтио, 3-метилбутилтио, 2,2-диметилпропилтио, 1-этилпропилтио, гексилтио, 1,1-диметилпропилтио, 1,2-диметилпропилтио, 1-метилпентилтио, 2-метилпентилтио, 3-метилпентилтио, 4-метилпентилтио, 1,1-диметилбутилтио, 1,2-диметилбутилтио, 1,3-диметилбутилтио, 2,2-диметилбутилтио, 2,3-диметилбутилтио, 3,3-диметилбутилтио, 1-этилбутилтио, 2-этилбутилтио, 1,1,2-триметилпропилтио, 1,2,2-триметилпропилтио, 1-этил-1-метилпропилтио и 1-этил-2-метилпропилтио.

При использовании в данном документе "галогеналкилтио" или "галогеналкилсульфанил" может подразумевать включение алкилтиогруппы, определенной выше, где атомы углерода частично или полностью замещены одним или несколькими атомами галогена. Если не указано иное, то предусматриваются галогеналкилтио- или галогеналкилсульфанильные группы, где R представляет собой С₁-С₈алкильную группу. Примеры включают без ограничения хлорметилтио, бромметилтио, дихлорметилтио, трихлорметилтио, фторметилтио, дифторметилтио, трифторметилтио, хлорфторметилтио, дихлорфторметилтио, хлордифторметилтио, 1-хлорэтилтио, 1-бромэтилтио, 1-

фторэтилтио, 2-фторэтилтио, 2,2-дифторэтилтио, 2,2,2-трифторэтилтио, 2-хлор-2-фторэтилтио, 2-хлор-2-дифторэтилтио, 2,2-дихлор-2-фторэтилтио, 2,2,2-трихлорэтилтио, пентафторэтилтио и 1,1,1-трифторпроп-2-илтио.

При использовании в данном документе "арил", а также производные термины, такие как "арилокси", могут подразумевать включение фенильной, инданильной или нафтильной группы. В некоторых аспектах предпочтительным является фенил. Если не указано иное, то арильные группы могут быть незамещенными или замещенными одним или несколькими заместителями, выбранными, например, из галогена, гидроксид, нитро, циано, формил, C₁-C₆алкил, C₂-C₆алкенил, C₂-C₆алкинил, C₁-C₆алкокси, C₁-C₆галогеналкил, C₁-C₆галогеналкокси, C₁-C₆ацил, C₁-C₆алкилтио или алкилсульфанил, C₁-C₆алкилсульфинил, C₁-C₆алкилсульфонил, (C₁-C₆алкокси)карбонил, C₁-C₆карбамоил, гидроксикарбонил, (C₁-C₆алкил)карбонил, аминокарбонил, (C₁-C₆алкиламино)карбонил, (ди(C₁-C₆алкил)амино)карбонил, при условии, что заместители являются стерически совместимыми и удовлетворяются правила химического связывания и энергии деформации. В некоторых аспектах предпочтительные заместители включают, например, галоген, C₁-C₂алкил и C₁-C₂галогеналкил.

При использовании в данном документе "гетероцикл" может подразумевать включение фенильной, инданильной или нафтильной группы. В некоторых аспектах предпочтительным является фенил. Если не указано иное, то арильные группы могут быть незамещенными или замещенными одним или несколькими заместителями, выбранными, например, из галогена, гидроксид, нитро, циано, формил, C₁-C₆алкил, C₂-C₆алкенил, C₂-C₆алкинил, C₁-C₆алкокси, C₁-C₆галогеналкил, C₁-C₆галогеналкокси, C₁-C₆ацил, C₁-C₆алкилтио или алкилсульфанил, C₁-C₆алкилсульфинил, C₁-C₆алкилсульфонил, (C₁-C₆алкокси)карбонил, C₁-C₆карбамоил, гидроксикарбонил, (C₁-C₆алкил)карбонил, аминокарбонил, (C₁-C₆алкиламино)карбонил, (ди(C₁-C₆алкил)амино)карбонил, при условии, что заместители являются стерически совместимыми и удовлетворяются правила химического связывания и энергии деформации. В некоторых аспектах предпочтительные заместители включают, например, галоген, C₁-C₂алкил и C₁-C₂галогеналкил.

При использовании в данном документе "арилалкил", "арилалкенил" и "арилалкинил" могут подразумевать включение алкильной, алкенильной или алкинильной группы, замещенной арильной группой, определенной в данном документе.

При использовании в данном документе "гетероциклилалкил" может подразумевать включение алкильной группы, замещенной гетероциклильной группой, определенной в данном документе. В некоторых аспектах замещенная либо незамещенная пиридинилметильная группа является предпочтительной.

При использовании в данном документе "алкоксикарбонил" может подразумевать

включение группы формулы , где R представляет собой алкил.

При использовании в данном документе "алкиламино" или "диалкиламино" может подразумевать включение аминогруппы, замещенной одной или двумя алкильными группами, которые могут быть одинаковыми или различными.

При использовании в данном документе "алкилкарбамил" может подразумевать включение карбамильной группы, замещенной по атому азота алкильной группой.

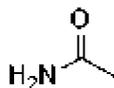
При использовании в данном документе "алкилсульфинил" может подразумевать включение $-S(O)R$, где R представляет собой алкил (например, C_1 - C_{10} алкил).

При использовании в данном документе "галогеналкилсульфинил" может подразумевать включение алкилсульфинильной группы, определенной выше, где атомы углерода частично или полностью замещены одним или несколькими атомами галогена.

При использовании в данном документе "алкилсульфонил" может подразумевать включение $-SO_2R$, где R представляет собой алкил (например, C_1 - C_{10} алкил).

При использовании в данном документе "галогеналкилсульфонил" может подразумевать включение алкилсульфонильной группы, определенной выше, где атомы углерода являются частично или полностью замещенными одним или несколькими атомами галогена.

При использовании в данном документе "карбамил" (также называемый карбамоилом или аминокарбонилем) может подразумевать включение группы формулы



При использовании в данном документе "галогеналкиламино" может подразумевать включение алкиламиногруппы, где атомы углерода в алкиле частично или полностью замещены одним или несколькими атомами галогена.

При использовании в данном документе "Me" означает метильную группу.

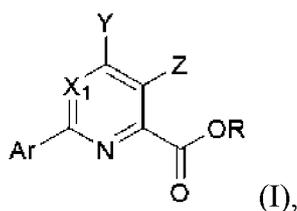
При использовании в данном документе термин "галоген", в том числе производные термины, такие как "галогено", означают фтор, хлор, бром или йод (или фторид, хлорид, бромид или йодид).

При использовании в данном документе растения и растительность включают без ограничения проросшие семена, всходящие проростки, растения, развивающиеся из вегетативных черенков, незрелую растительность и сформированную растительность.

При использовании в данном документе "замещенный" означает замещение одного или нескольких атомов водорода в основной цепи углеводорода или гетероатомов другим атомом или группой атомов. Примеры заместителей включают без ограничения галоген, гидроксил, нитро, циано, амино, формил, ацил, карбоксил, амид, алкил, алкенил, алкинил, кето, тиол, сульфоновую кислоту, сульфонатный сложный эфир, сульфоксид, сульфон, алкокси, фосфоновую кислоту и фосфат.

II. Соединения

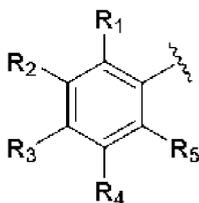
В данном документе описаны соединения формулы (I) и их приемлемые с точки зрения сельского хозяйства производные:



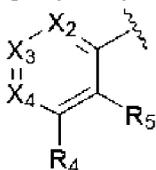
где

Ar представляет собой ароматическую или гетероароматическую группу.

В некоторых аспектах Ar представляет собой ароматическую группу, характеризующуюся формулой:



В некоторых аспектах Ar представляет собой гетероароматическую группу, характеризующуюся формулой:



X_1 представляет собой N или CR_6 ; X_2 представляет собой N или CR_1 ; X_3 представляет собой N или CR_2 ; X_4 представляет собой N или CR_3 ;

R представляет собой водород, замещенный либо незамещенный алкил, замещенный либо незамещенный фенил, замещенный либо незамещенный бензил, замещенный либо незамещенный алкенил или замещенный либо незамещенный алкинил;

R_1 , R_2 , R_3 , R_4 и R_5 независимо выбраны из водорода, галогена, замещенного либо незамещенного алкила, замещенного либо незамещенного галогеналкила, замещенного либо незамещенного алкенила, замещенного либо незамещенного галогеналкенила, замещенного либо незамещенного алкинила, замещенного либо незамещенного алкокси, замещенного либо незамещенного галогеналкокси, замещенного либо незамещенного тиоалкила, аминоалкила, нитро и циано, или R_1 и R_2 , R_2 и R_3 , R_3 и R_4 или R_4 и R_5 вместе могут образовывать замещенное либо незамещенное 5- или 6-членное алифатическое, ароматическое или гетероароматическое кольцо;

R_6 представляет собой H, галоген, замещенный либо незамещенный алкил, замещенный либо незамещенный галогеналкил, замещенный либо незамещенный алкинил, замещенный либо незамещенный тиоалкил, гидроксид, амино, циано и ациламино;

Y выбран из водорода, галогена, замещенного либо незамещенного алкила, замещенного либо незамещенного галогеналкила, замещенного либо незамещенного алкенила, замещенного либо незамещенного галогеналкенила, замещенного либо незамещенного алкинила, замещенного либо незамещенного алкокси, замещенного либо незамещенного галогеналкокси, замещенного либо незамещенного тиоалкила, нитро, циано или $S(O)_n$ алкила, где n равняется 0, 1 или 2;

Z выбран из галогена, алкила, галогеналкила, алкинила, алкокси, галогеналкокси, тиоалкила и циано; при условии, что если X_1 представляет собой N, то Y не является алкокси.

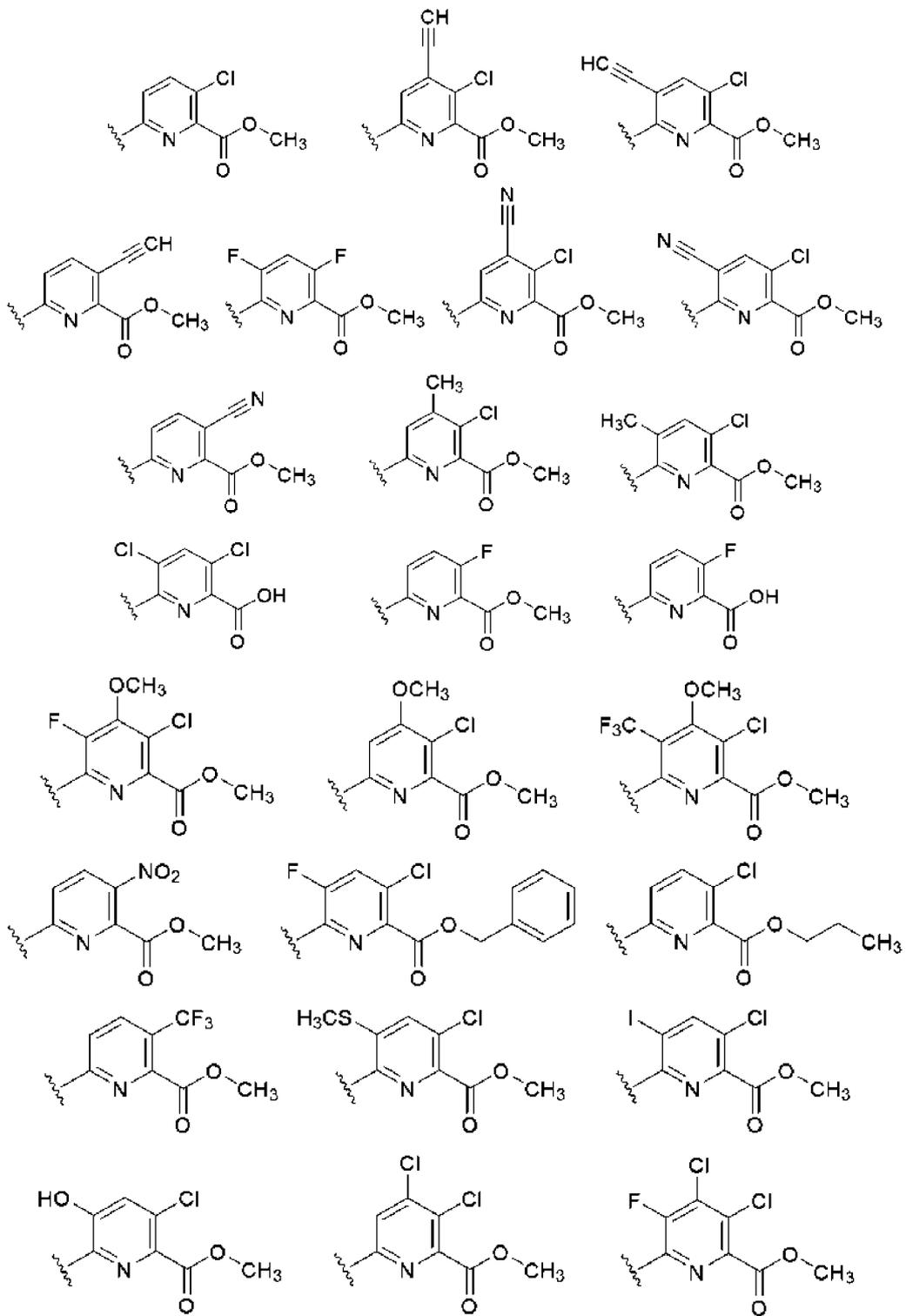
В некоторых аспектах R представляет собой H, алкил (например, метил или этил), замещенный алкил, бензил и алкинил (например, этинил).

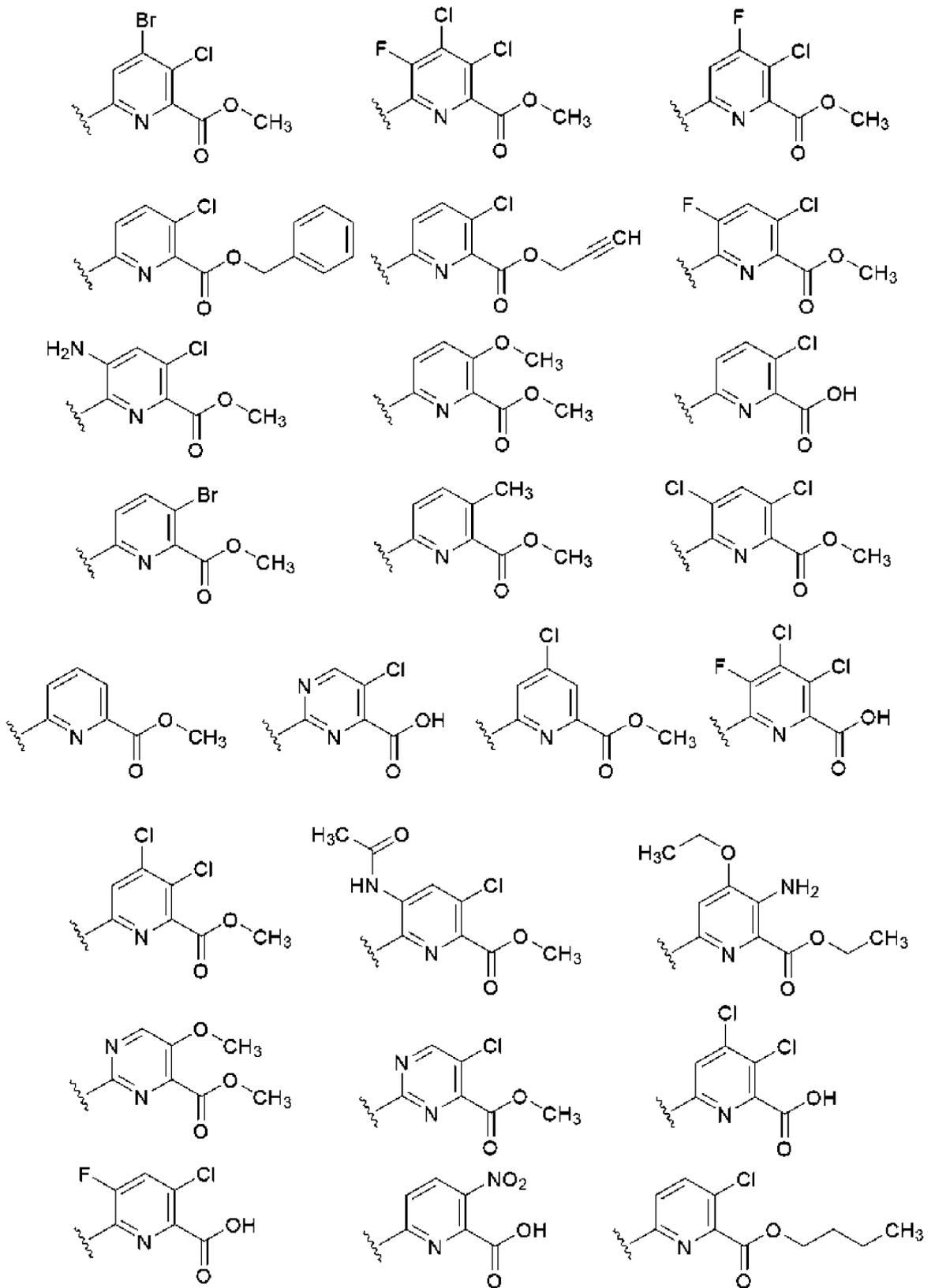
В некоторых аспектах R определен выше, и Z представляет собой водород, амина, галоген (например, хлор или бром), алкил (например, метил), алкинил (например, этинил), циано, галогеналкил (например, трифторметил) и алкокси (например, метокси).

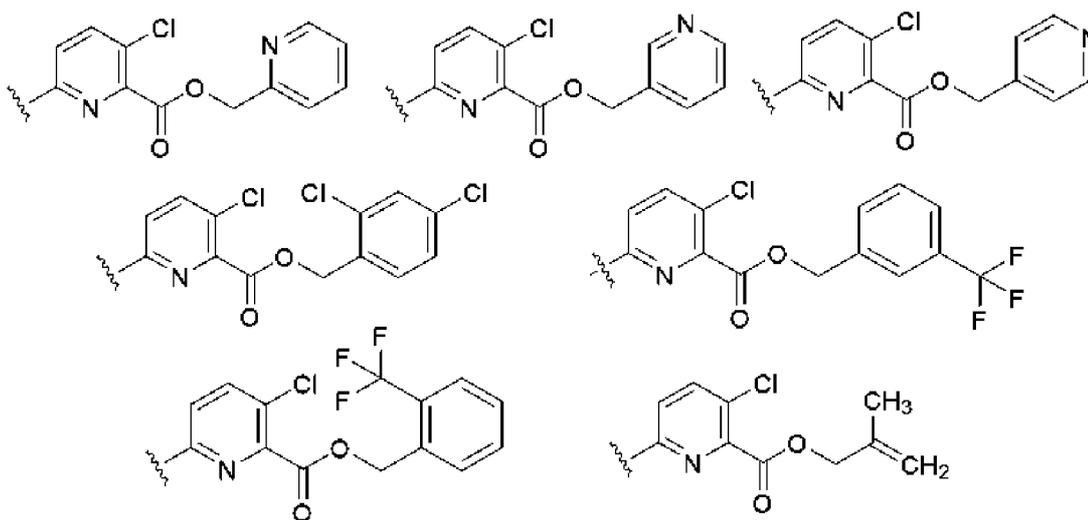
В некоторых аспектах R и Z определены выше, и Y представляет собой водород, галоген (например, хлор, фтор или бром), алкинил (например, этинил), циано, алкил (например, метил), алкокси (например, метокси или этокси).

В некоторых аспектах R, Z и Y определены выше, и X_1 представляет собой N или CR_6 , где R_6 представляет собой водород, алкинил (например, этинил), циано, алкил (например, метил), галоген (например, хлор, фтор или йод), гидроксил, галогеналкил (например, трифторметил), тиоалкил (например, тиометил), амина и ацетамид.

В некоторых аспектах пиридиновое или пиримидиновое кольцо характеризуется следующей структурой:

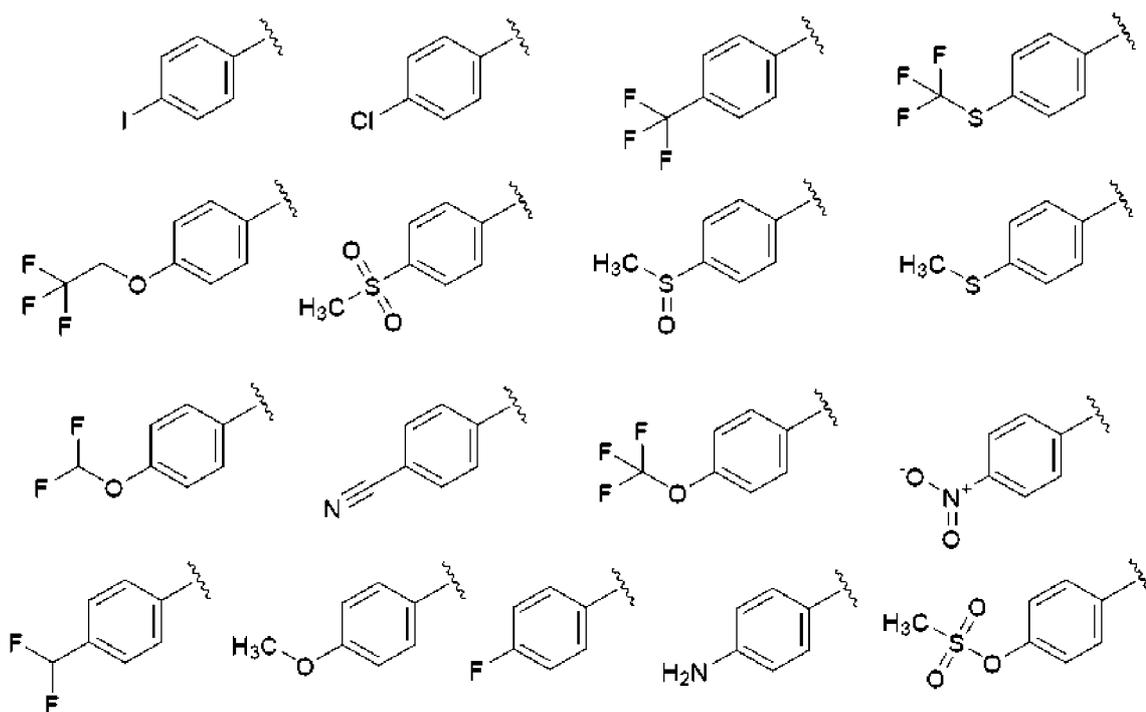






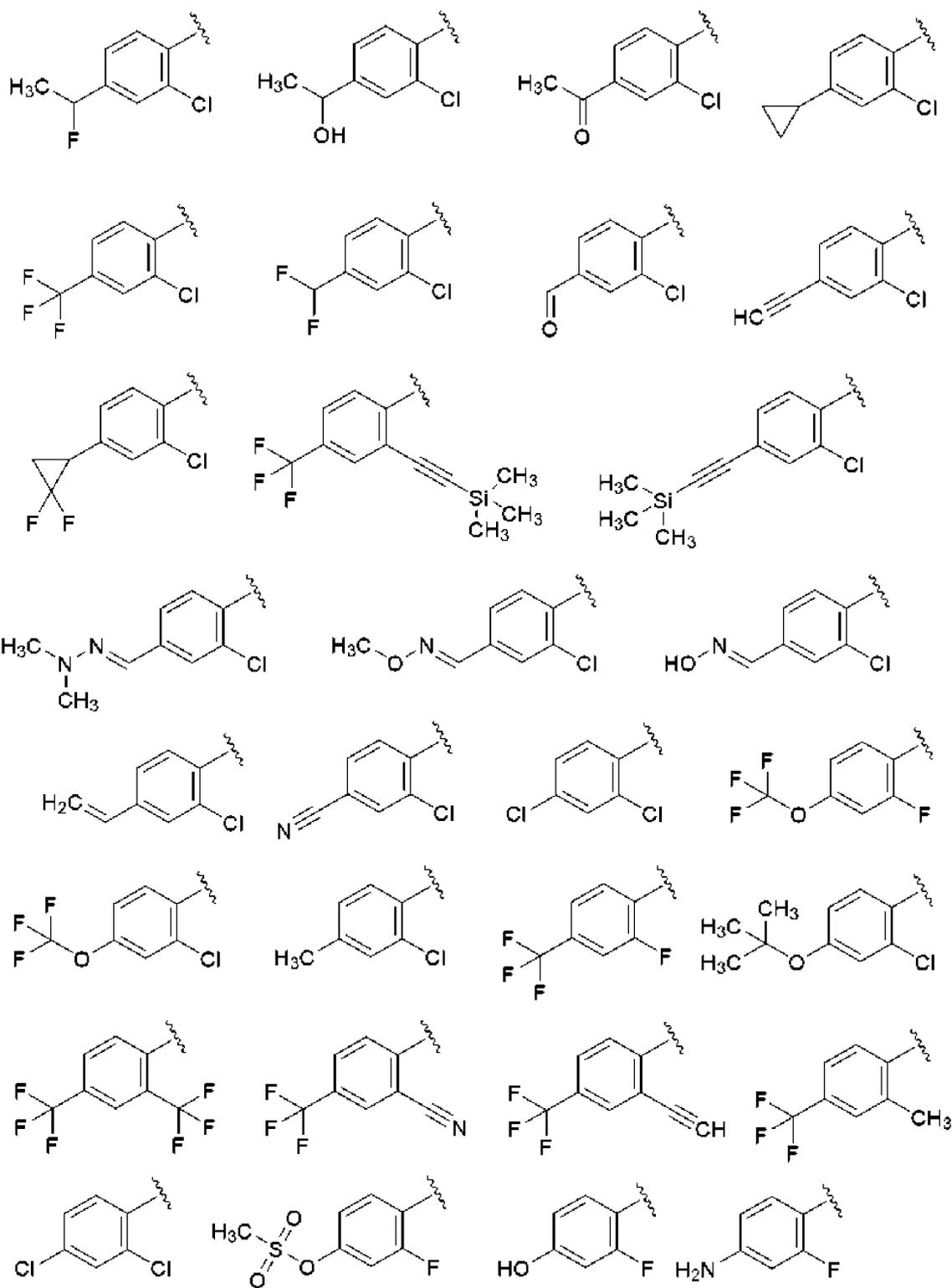
В некоторых аспектах R, Z, Y и X определены выше, и Ag представляет собой фенил или бифенил. В некоторых аспектах Ag представляет собой замещенный либо незамещенный фенил.

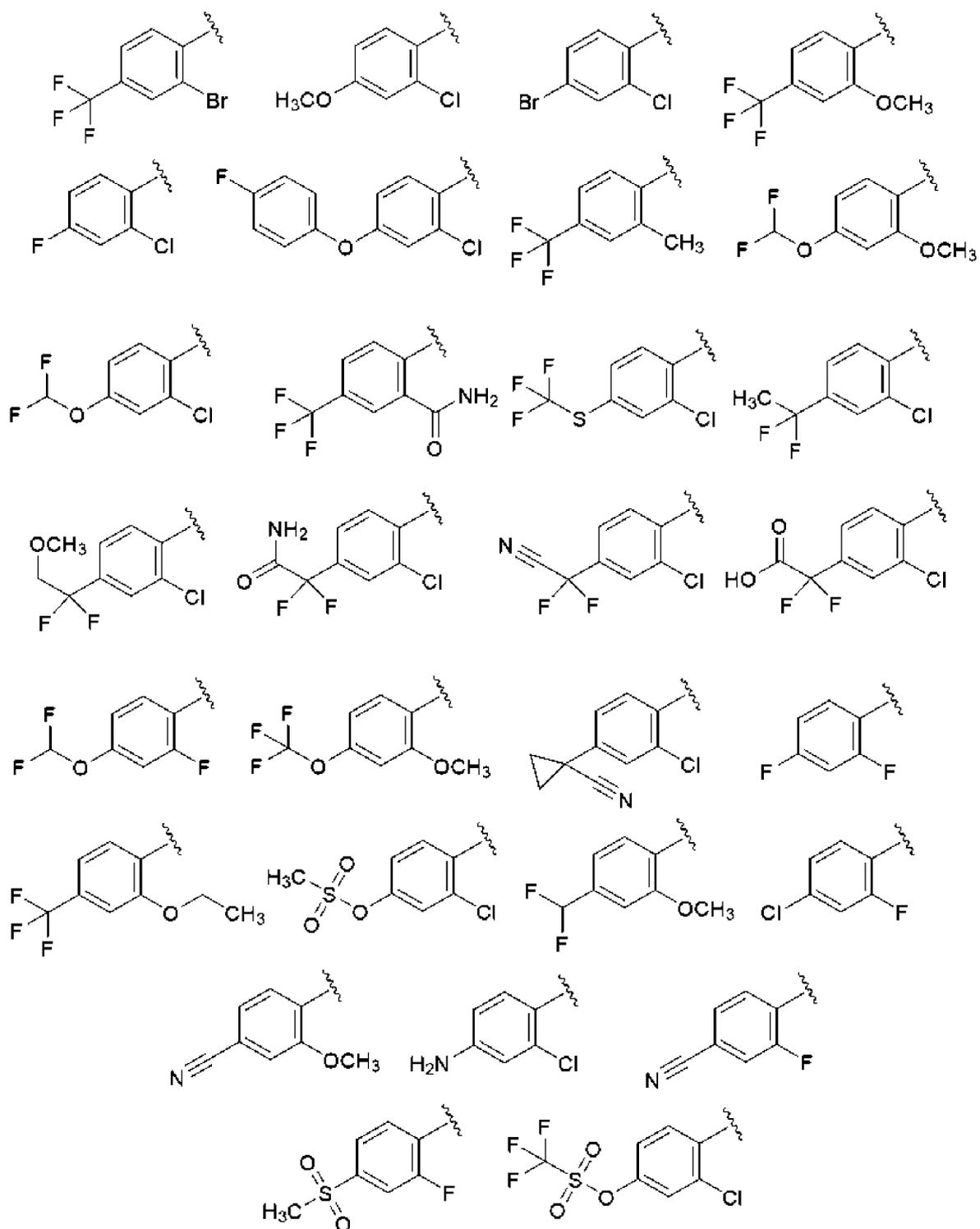
В некоторых аспектах Ag представляет собой монозамещенный фенил, такой как 4-замещенный фенил. В некоторых аспектах R₃ (положение 4) представляет собой галоген (например, бром, хлор, йод или фтор), алкил (например, метил), алкокси (например, метокси или *трет*-бутокси), алкилтио (например, метилтио), алкилсульфинил (например, метилсульфинил), алкилсульфонил (например, метилсульфонил), алкилсульфонил(окси) (например, (метилсульфонил)(окси)), галогеналкокси (например, трифторметокси, дифторметокси, фторметокси), галогеналкил (например, 1-фторэтил, трифторметил, дифторметил), галогеналкилтио (например, (трифторметил)тио), замещенный алкил (например, 1-гидроксиэтил), алкилкарбонил (например, ацетил), формил, замещенный либо незамещенный циклоалкил (например, циклопропил, 2,2-дифторциклопропил), этенил (например, винил), замещенный либо незамещенный алкинил (например, этинил или триметилсилилэтинил), нитро, amino или циано. Примеры включают без ограничения



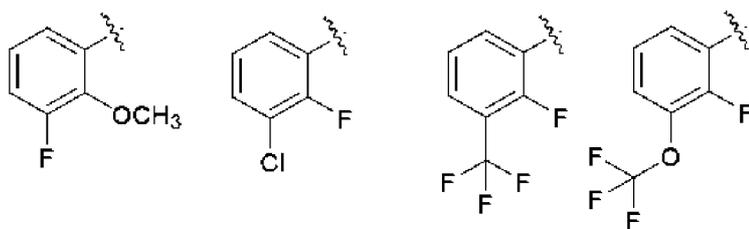
В некоторых аспектах R_4 представляет собой дизамещенный фенил, например, фенил, замещенный в положениях 2 и 4 (относительно положения 1, точки присоединения к кольцу пиридина, пиримидина, пиридиния или пиримидиния). В некоторых аспектах R_5 (положение 2) представляет собой галоген (например, бром, хлор или фтор), алкинил (например, этинил), замещенный алкинил (например, триметилсилилэтинил), галогеналкил (например, трифторметил), циано, амидо, алкокси (например, метокси) или алкил (например, метил). В некоторых аспектах R_5 определен выше, и R_3 (положение 4) представляет собой галоген (например, бром, хлор или фтор), алкил (например, метил), замещенный либо незамещенный алкокси (например, метокси, *трет*-бутокси или трифторметокси), алкилсульфонил (например, метилсульфонил), алкилсульфонил(окси) (например, (метилсульфонил)(окси)), галогеналкилсульфонил(окси) (например, (трифторметилсульфонил)(окси)), галогеналкилтио (например, (трифторметил)тио), галогеналкил (например, 1-фторэтил, трифторметил, дифторметил), замещенный алкил (например, 1-гидроксиэтил, 1,1-дифтор-2-метоксиэтил, карбоксидифторметил, цианодифторметил, 2-амино-1,1-дифтор-2-оксоэтил), алкилкарбонил (например, ацетил), формил, 2,2-диметилгидразоно, метоксиимино, гидроксимино, замещенный либо незамещенный циклоалкил (например, циклопропил, 2,2-дифторциклопропил, 1-цианоциклопропил), этенил (например, винил), замещенный либо незамещенный алкинил (например, этинил или триметилсилилэтинил), гидрокси, amino, замещенный либо незамещенный фенокси (например, 4-фторфенокси) или циано.

В некоторых аспектах R_4 является таким, как показано ниже:

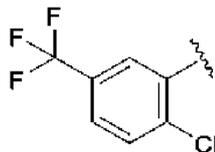




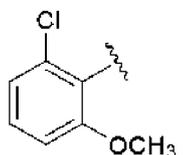
В других аспектах Ar представляет собой 2,3-дизамещенный фенил. Примеры включают без ограничения



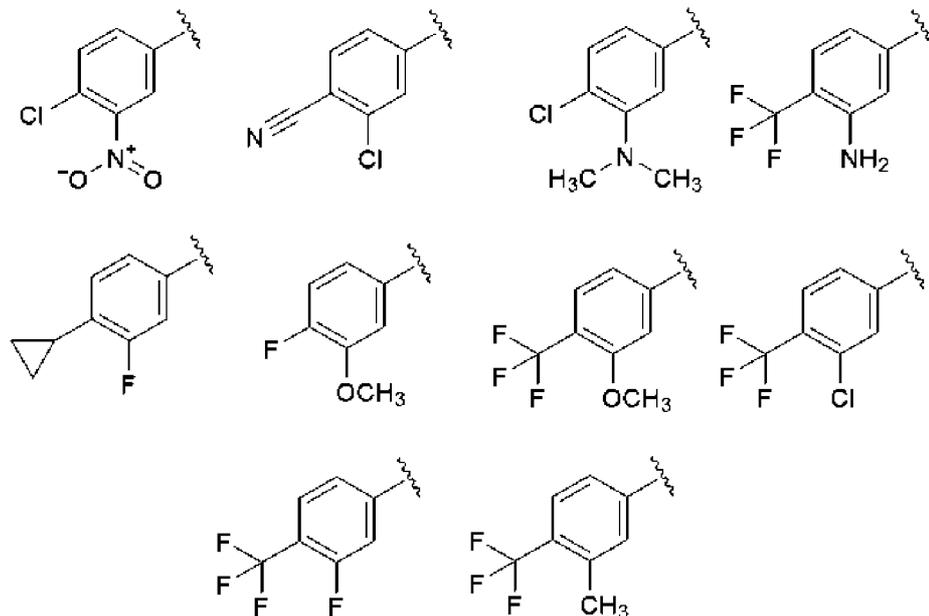
В других аспектах Ar представляет собой 2,5-дизамещенный фенил, например, без ограничения



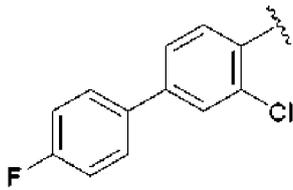
В других аспектах Ar представляет собой 2,6-дизамещенный фенил, например, без ограничения



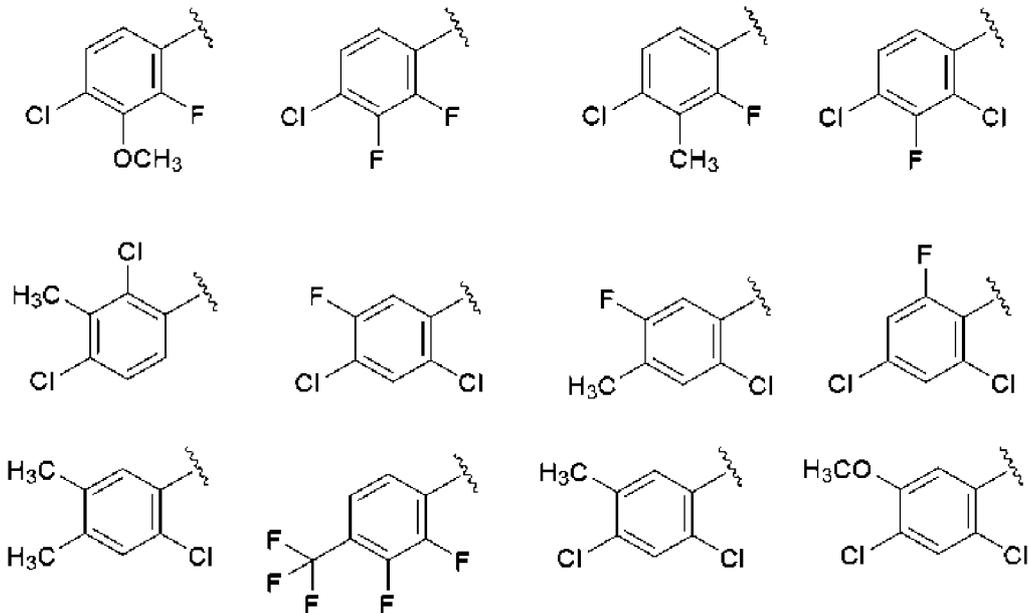
В других аспектах Ar представляет собой 3,4-дизамещенный фенил. Примеры включают без ограничения

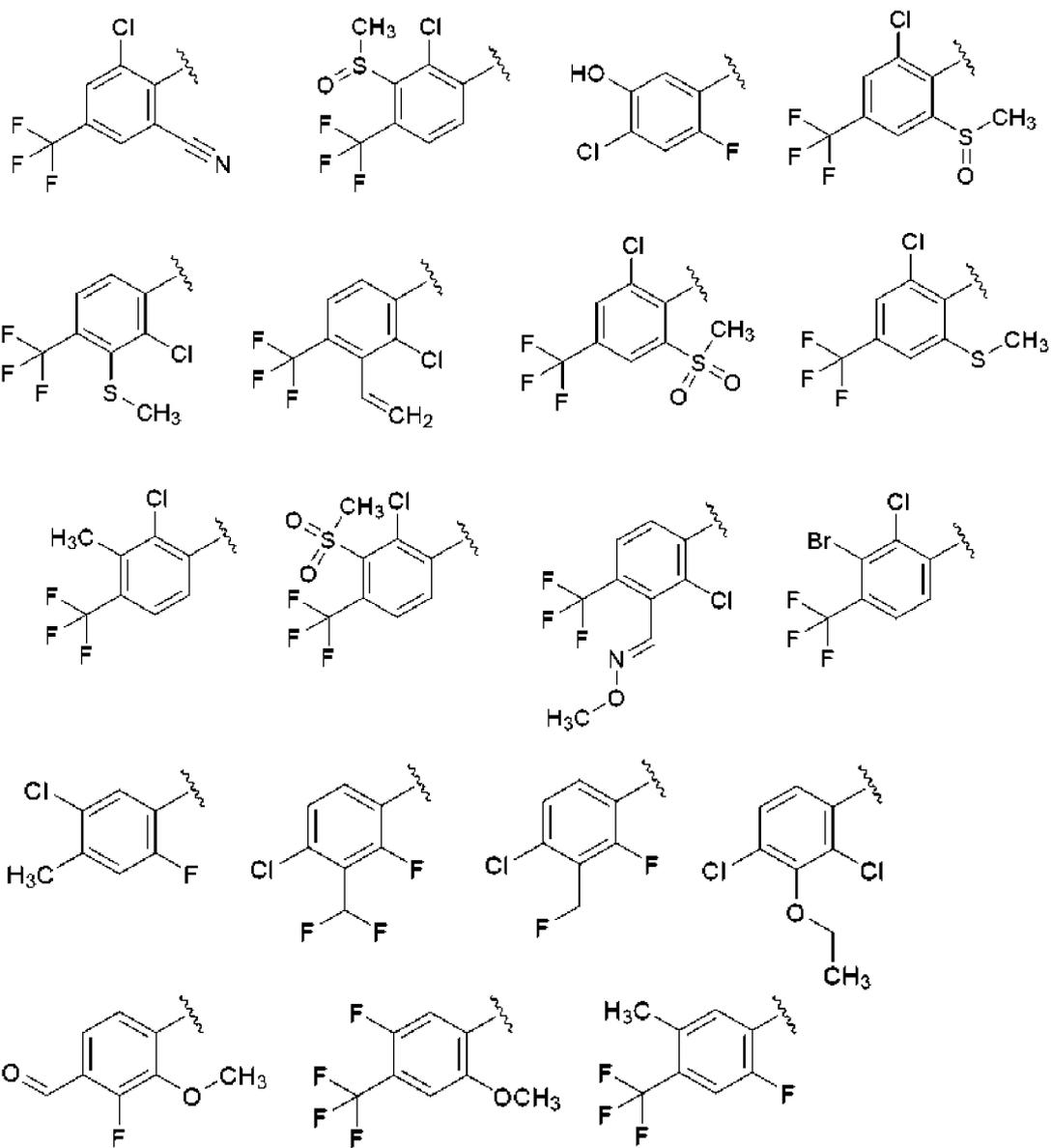


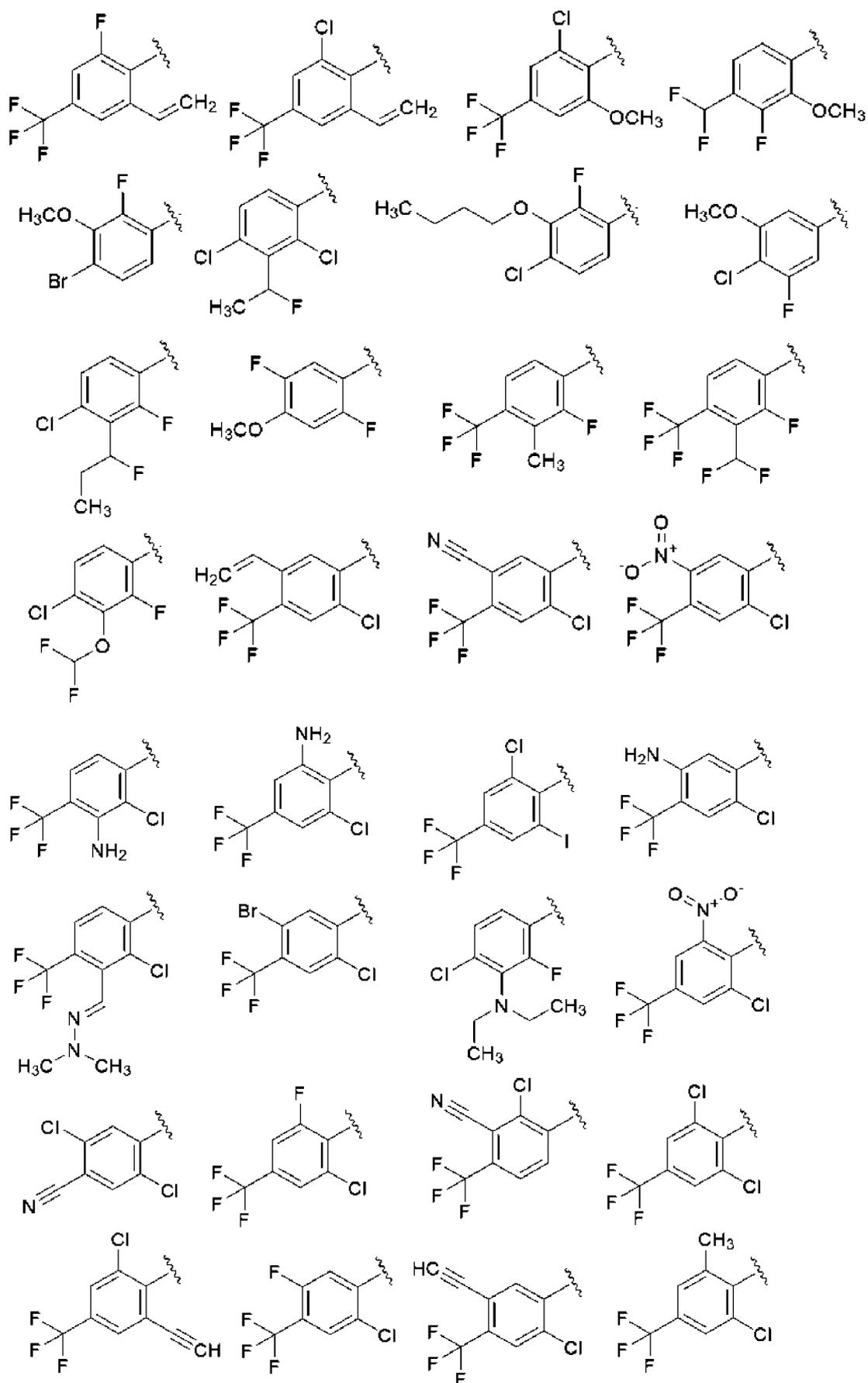
В других аспектах Ar представляет собой бифенил. Одно или оба из фенильных колец могут быть замещенными либо незамещенными, например, без ограничения

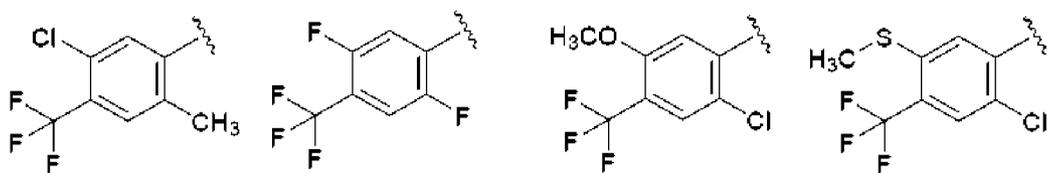


В некоторых аспектах Ag представляет собой тризамещенный фенил, такой как 2,3,4-тризамещенный фенил, 2,4,5-тризамещенный фенил, 2,4,6-тризамещенный фенил или 2,3,5-тризамещенный фенил. В некоторых аспектах R_1 - R_5 независимо представляют собой водород, галоген (например, бром, хлор, йод или фтор), алкил (например, метил), алкокси (например, метокси или *трет*-бутокс), галогеналкокси (например, трифторметокси), галогеналкил (например, 1-фторэтил, трифторметил, дифторметил), замещенный алкил (например, 1-гидроксиэтил), алкилкарбонил (например, ацетил), формил, 2,2-диметилгидразоно, метоксиимино, гидроксимино, алкилтио или алкилсульфанил (например, метилсульфанил), алкилсульфинил (например, метилсульфинил), алкилсульфонил (например, метилсульфонил), замещенный либо незамещенный циклоалкил (например, циклопропил, 2,2-дифторциклопропил), этенил (например, винил), замещенный либо незамещенный алкинил (например, этинил или триметилсилил этинил), гидроксид, нитро, замещенный либо незамещенный амино (например, амино, метиламино, диметиламино, диэтиламино) или циано. Примеры включают без ограничения

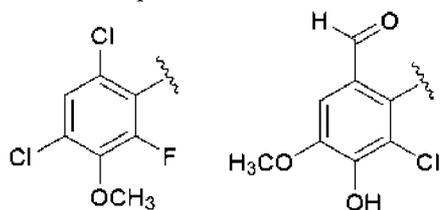




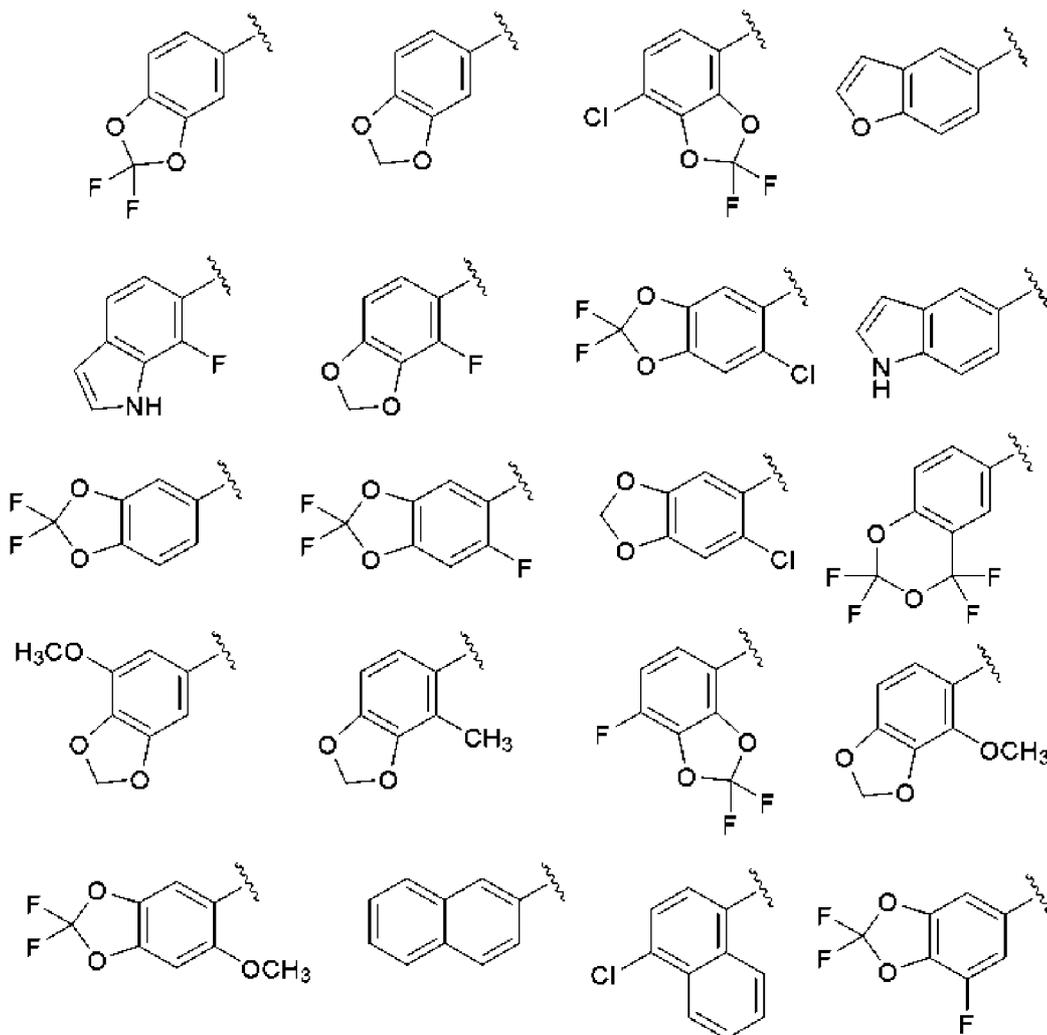


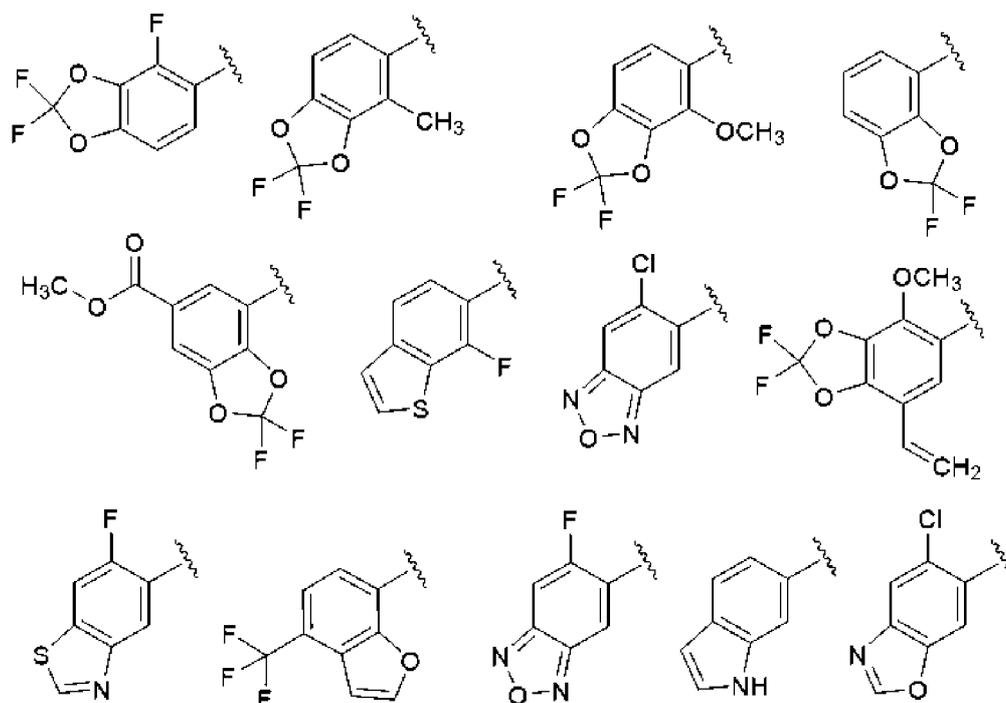


В некоторых аспектах Ag представляет собой тетразамещенный фенил. Примеры включают без ограничения

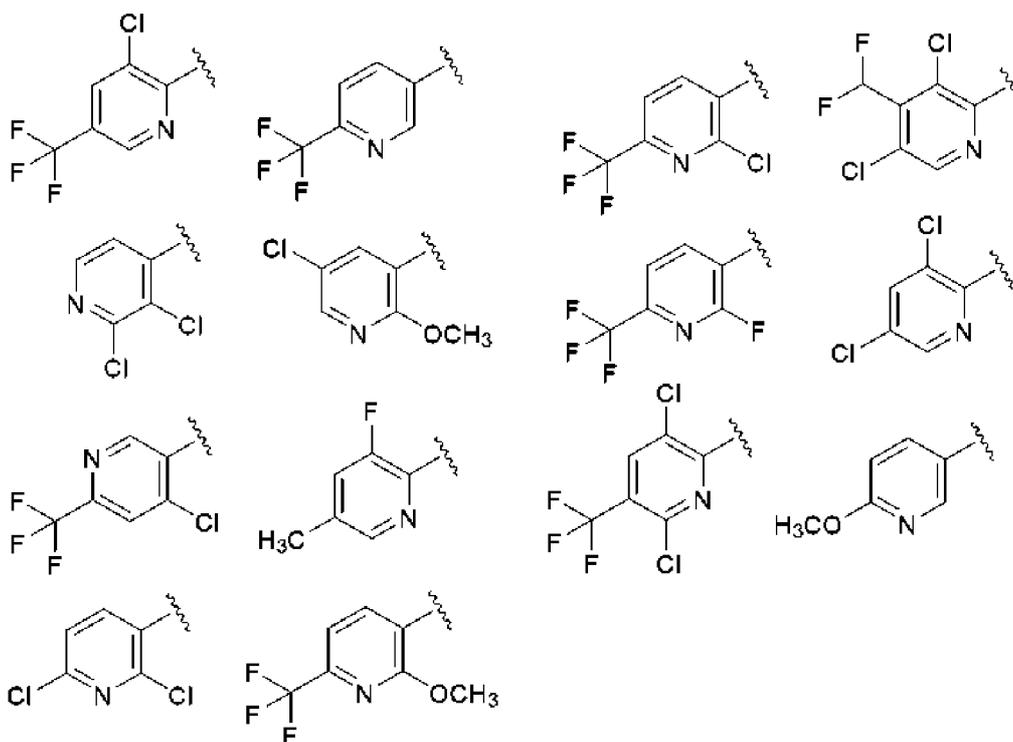


В некоторых аспектах Ag представляет собой фенил, и R₃ и R₄ или R₄ и R₅, взятые вместе, образуют 5- или 6-членное алифатическое или ароматическое кольцо, содержащее 0-3 гетероатома, выбранных из кислорода (O), азота (N) и серы (S). Примеры включают без ограничения





В некоторых аспектах Ar представляет собой гетероциклическое кольцо. В некоторых аспектах Ar представляет собой замещенное либо незамещенное пиридиновое кольцо. В некоторых аспектах Ar представляет собой 2,3,5-тризамещенный, 3,4,5-тризамещенный, 2,3-дизамещенный, 2,4-дизамещенный, 2,5-дизамещенный, 3,5-дизамещенный, 6-замещенный или 2,6-дизамещенный пиридил (относительно атома азота в кольце пиридина или пиримидина). В некоторых аспектах R_1 - R_5 независимо представляют собой водород, галоген (например, хлор) и галогеналкил (например, трифторметил). Примеры включают без ограничения



III. Способы получения

Иллюстративные процедуры синтеза соединений формулы (I) представлены ниже.

На стадии *a* схемы 1 арил- или гетероарилгалогенид **1.1**, где R_4 , R_5 , X_2 , X_3 и X_4 определены ранее, и Y_x представляет собой Br или I, может быть превращен в соответствующую бороновую кислоту или боронат **1.2**, где R_4 , R_5 , R_x , X_2 , X_3 и X_4 определены ранее, с применением способов, известных в уровне техники, в том числе без ограничения путем проведения реакции обмена галоген-металл с последующей реакцией с источником бора, таким как триметилборат, или реакцией кросс-сочетания, катализируемой металлом, с источником бора, таким как без ограничения бис(пинаколато)дифтор. Металлы, применяемые в реакции обмена галоген-металл, могут представлять собой литий или магний, и таковые в реакции кросс-сочетания могут представлять собой палладий, никель или медь.

Пиридинкарбоксилат **1.4**, где R , R_4 , R_5 , X_1 , X_2 , X_3 , X_4 , Y и Z определены ранее, может быть синтезирован в условиях реакции кросс-сочетания Сузуки из пиридина или пиримидингалогенида **1.3**, где R , X_1 , Y , Y_2 и Z описаны ранее, с подходящей бороновой кислотой или боронатом **1.2**, где R_4 , R_5 , R_x , X_2 , X_3 и X_4 определены ранее, в присутствии катализатора с добавленным лигандом или без него и основания в различных растворителях при повышенной температуре, как на стадии *b* на схеме 1. В одном аспекте катализаторы могут представлять собой катализаторы на основе палладия, такие как катализаторы на основе палладия(II) (например, ацетат палладия(II) $Pd(OAc)_2$, хлорид палладия(II) ($PdCl_2$)) и тетраakis(трифенилфосфин)палладий(0) ($Pd(PPh_3)_4$); катализаторы на основе никеля, такие как $NiCl_2(dppf)$ и $G_3DenP-Ni$; катализаторы на основе железа; катализаторы на основе

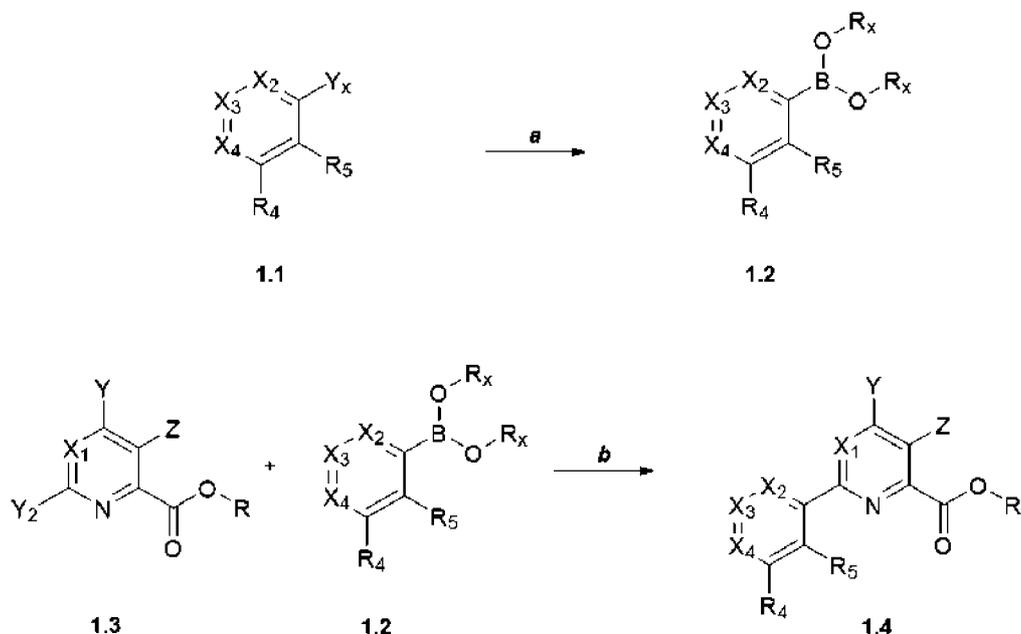
меди и катализаторы на основе рутения.

Подходящие лиганды для каталитической системы включают без ограничения триалкилфосфины и триарилфосфины. Они включают без ограничения три-*трет*-бутилфосфин, трициклогексилфосфин, ди-*трет*-бутилфенилфосфин, дициклогексилфенилфосфин, трифенилфосфин, сшитую с 4-дифенилфосфинометилом полистирольную смолу, дифенилфосфинобензол-3-сульфонат натрия с 2% DVB, три-(*n*-толил)фосфин, (\pm)-2,2'-бис(дифенилфосфино)-1,1'-бинафтил.

Можно регулировать pH с применением одного или нескольких оснований, таких как карбонат калия, бикарбонат калия, карбонаты натрия (в том числе бикарбонаты), ацетат калия, ацетат натрия, основной фосфат калия (одно-, двух- и трехосновный), тетраборат натрия, гидроксид калия, гидроксид натрия, фторид цезия и фторид калия и органические основания, такие как триэтиламин, триизопропиламин, диизопропиламин, диэтиламин и диизопропилэтиламин. В другом аспекте реакционная смесь может быть предварительно обработана диоксидом углерода (CO₂) для регулирования pH перед реакцией сочетания Сузуки.

В качестве альтернативы, реакцию сочетания Сузуки можно проводить в присутствии CO₂, например, с барботированием CO₂ через реакционную смесь. Реакцию можно проводить в смеси органических растворителей, содержащих метилизобутилкетон (МИБК), диметоксиэтан (DME), ацетонитрил (MeCN или CH₃CN), толуол, бензиловый спирт и метанол (MeOH), в том числе в смеси с водой и без нее. Соединение **1.4** может быть дополнительно обработано с применением способов, известных в данной области техники.

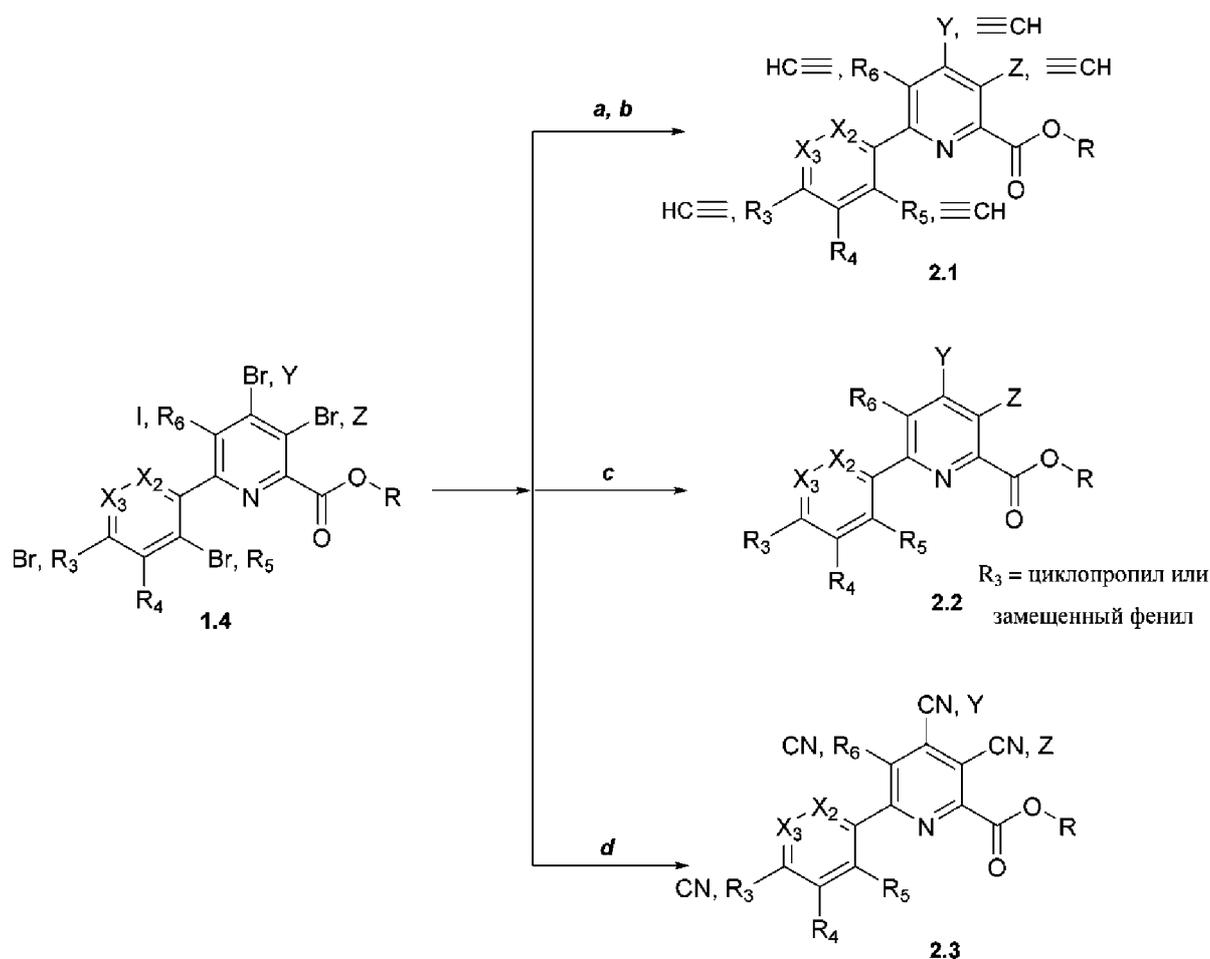
Схема 1



На стадии *a* на схеме 2 пиридинкарбоксилат **1.4**, где R, R₄, X₂ и X₃ определены ранее; каждый из R₃, R₅, Y и Z независимо представляет собой Br; и R₆ независимо представляет

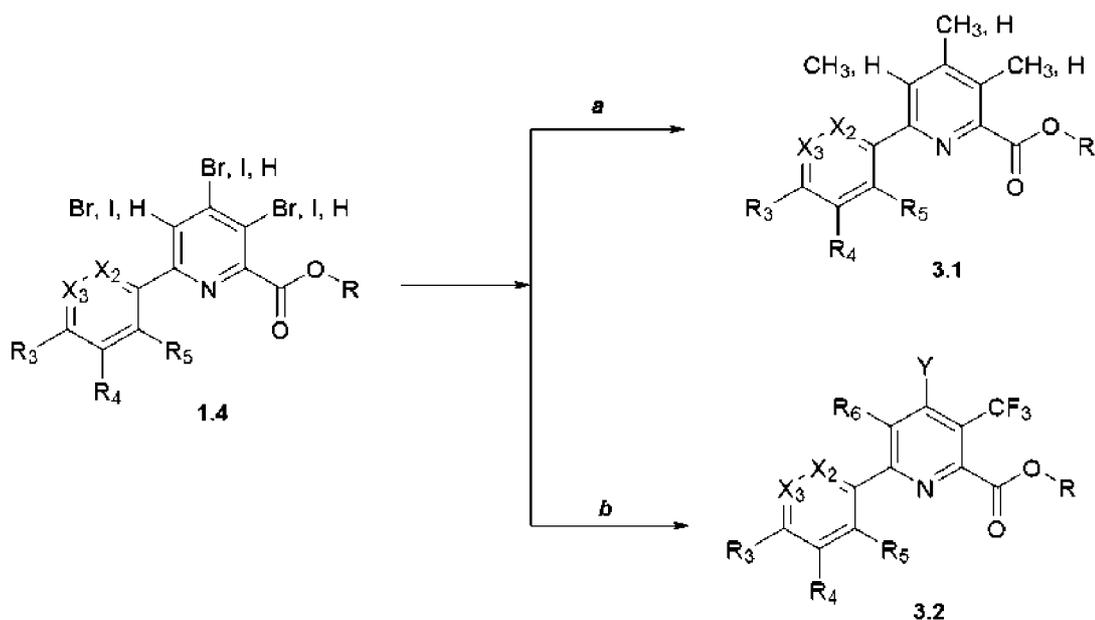
собой I, может быть превращен в промежуточное соединение, где R, R₄, X₂ и X₃ определены ранее; каждый из R₃, R₅, Y и Z независимо представляет собой -C≡CSi(CH₃)₃; и R₆ независимо представляет собой -C≡CSi(CH₃)₃, путем реакции кросс-сочетания Соногаширы с триметилсилилацетиленом в присутствии основания, такого как триэтиламин, и катализаторов, таких как Pd(PPh₃)₂Cl₂ и йодид меди(I), в полярном апротонном растворителе, таком как THF, при температуре от приблизительно 50°C до приблизительно 75°C. Силильная защитная группа может быть удалена с помощью способов, известных специалистам в данной области техники, включающих без ограничения применение фторида тетрабутиламмония в полярном апротонном растворителе, таком как THF, при температуре от приблизительно -10°C до приблизительно 10°C с получением соединения **2.1**, где R, R₄, X₂ и X₃ определены ранее; каждый из R₃, R₅, Y и Z независимо представляет собой -C≡CH; и R₆ независимо представляет собой -C≡CH. Пиридинкарбоксилат **1.4**, где R, R₄, R₅, R₆, X₂, X₃, Y и Z определены ранее, и R₃ представляет собой Br, может быть превращен в соединение **2.2**, где R, R₄, R₅, R₆, X₂, X₃, Y и Z определены ранее, и R₃ представляет собой циклопропил или замещенный либо незамещенный фенил, в условиях реакции кросс-сочетания Сузуки, например путем обработки подходящей бороновой кислотой или боронатом, в присутствии катализатора на основе палладия, такого как Pd(PPh₃)₄ или Pd(PPh₃)₂Cl₂, в присутствии основания, такого как фосфат калия или фторид калия, в различных растворителях, таких как толуол или смеси ацетонитрил-вода, при температуре от приблизительно 80°C до приблизительно 120°C, как на стадии *c* на схеме 2. На стадии *d* на схеме 2 пиридинкарбоксилат **1.4**, где R, R₄, R₅, X₂ и X₃ определены ранее; каждый из R₃, Y и Z независимо представляет собой Br; и R₆ независимо представляет собой I, может быть превращен в соединение **2.3**, где R, R₄, R₅, X₂ и X₃ определены ранее; R₃, Y и Z независимо представляют собой -C≡N; и R₆ независимо представляет собой -C≡N, путем обработки цианидом цинка(II) в присутствии катализатора на основе палладия, такого как Pd(PPh₃)₄ или Pd(PPh₃)₂Cl₂, в полярном апротонном растворителе, таком как *N,N*-диметилформамид (DMF), при температуре от приблизительно 140°C до приблизительно 160°C. Соединения **2.1**, **2.2** и **2.3** могут быть дополнительно обработаны с применением способов, известных в данной области техники.

Схема 2



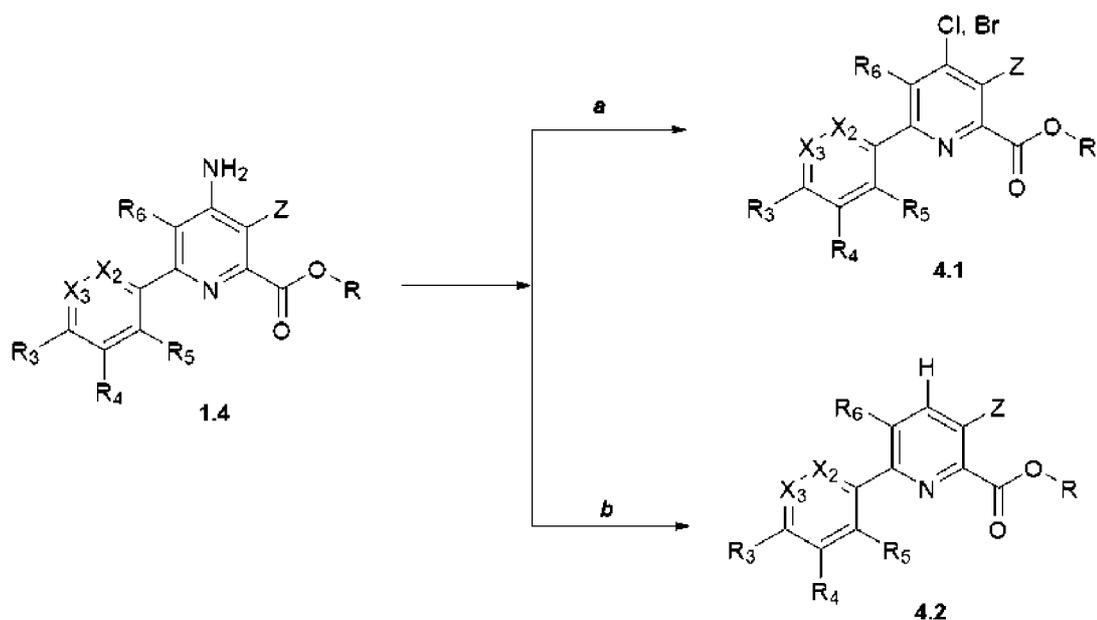
На стадии *a* на схеме 3 пиридинкарбоксилат **1.4**, где R, R₃, R₄, R₅, X₂ и X₃ определены ранее; каждый из Y и Z независимо представляет собой Br или I; и R₆ независимо представляет собой I, может быть превращен в соединение **3.1**, где R, R₃, R₄, R₅, X₂ и X₃ определены ранее; каждый из Y и Z независимо представляет собой Br или I; и R₆ независимо представляет собой CH₃, путем реакции кросс-сочетания, катализируемой палладием, с метилбороновой кислотой в присутствии основания, такого как фосфат калия, и катализатора, такого как тетраakis(трифенилфосфин)палладий(0) (Pd(PPh₃)₄), в неполярном апротонном растворителе, таком как толуол, при температуре от приблизительно 90°C до приблизительно 110°C. Пиридинкарбоксилат **1.4**, где R, R₃, R₄, R₅, R₆, X₂, X₃ и Y определены ранее, и Z представляет собой Br или I, может быть превращен в соединение **3.2**, где R, R₃, R₄, R₅, R₆, X₂, X₃ и Y определены ранее, и Z представляет собой CF₃, путем обработки метил-2,2-дифтор-2-(фторсульфонил)ацетатом в присутствии каталитического количества йодида меди(I) в полярном апротонном растворителе, таком как DMF, при температуре от приблизительно 90°C до приблизительно 110°C в условиях микроволнового излучения, как на стадии *b* на схеме 3. Оба из соединений **3.1** и **3.2** могут быть дополнительно обработаны с применением способов, известных в данной области техники.

Схема 3



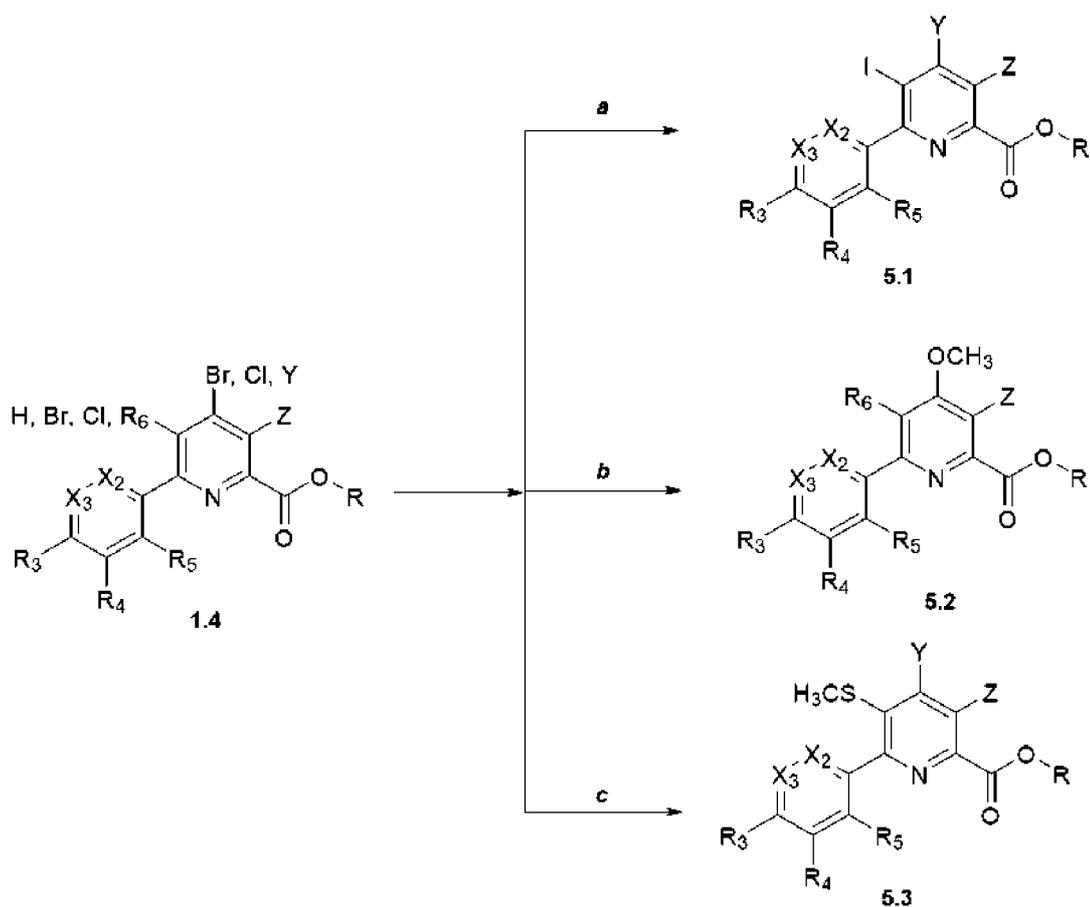
На стадии *a* на схеме 4 пиридинкарбоксилат **1.4**, где R, R₃, R₄, R₅, R₆, X₂, X₃ и Z определены ранее, и Y представляет собой NH₂, может быть превращен в соединение **4.1**, где R, R₃, R₄, R₅, R₆, X₂, X₃ и Z определены ранее, и Y представляет собой Cl или Br, в условиях реакции Зандмейера с источником хлора или брома, таким как хлорид меди(II) или бромид меди(II) соответственно, в присутствии *трет*-бутилнитрита в полярном апротонном растворителе, таком как ацетонитрил, при температуре от приблизительно 15°C до приблизительно 40°C. Пиридинкарбоксилат **1.4**, где R, R₃, R₄, R₅, R₆, X₂, X₃ и Z определены ранее, и Y представляет собой NH₂, может быть превращен в соединение **4.2**, где R, R₃, R₄, R₅, R₆, X₂, X₃ и Z определены ранее, и Y представляет собой H, путем обработки изоамилнитритом в полярном апротонном растворителе, таком как тетрагидрофуран (THF), при температуре от приблизительно 45°C до приблизительно 65°C или нитритом натрия в присутствии кислоты, такой как серная кислота, в системе полярных протонных растворителей, такой как этанол-толуол, при температуре от приблизительно 70°C до приблизительно 90°C, как на стадии *b* на схеме 4. Оба из соединений **4.1** и **4.2** могут быть дополнительно обработаны с применением способов, известных в данной области техники.

Схема 4



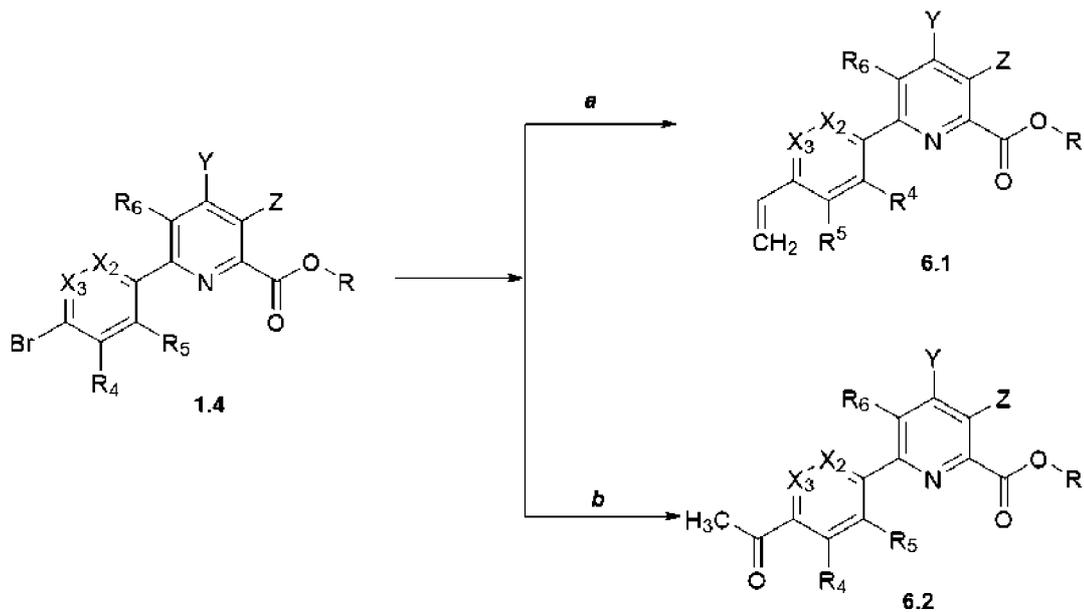
На стадии *a* на схеме 5 пиридинкарбоксилат **1.4**, где R, R₃, R₄, R₅, X₂, X₃, Y и Z определены ранее, и R₆ представляет собой H, может быть превращен в соединение **4.1**, где R, R₃, R₄, R₅, X₂, X₃, Y и Z определены ранее, и R₆ представляет собой I, путем реакции с периодной кислотой и йодом в полярном протонном растворителе, таком как метанол, при температуре от приблизительно 50°C до приблизительно 75°C. Пиридинкарбоксилат **1.4**, где R, R₃, R₄, R₅, R₆, X₂, X₃ и Z определены ранее, и Y представляет собой Br или Cl, может быть превращен в соединение **5.2**, где R, R₃, R₄, R₅, R₆, X₂, X₃ и Z определены ранее, и Y представляет собой OCH₃, путем обработки метоксидом натрия, в полярном протонном растворителе, таком как метанол, при температуре от приблизительно 15°C до приблизительно 40°C, как на стадии *b* на схеме 5. На стадии *c* на схеме 5 пиридинкарбоксилат **1.4**, где R, R₃, R₄, R₅, X₂, X₃, Y и Z определены ранее, и R₆ представляет собой Br или Cl, может быть обработан тиометоксидом натрия в полярном апротонном растворителе, таком как DMF, при температуре от приблизительно 40°C до приблизительно 65°C, с получением соединения **5.3**, где R, R₃, R₄, R₅, X₂, X₃, Y и Z определены ранее, и R₆ представляет собой SCH₃. Соединения **5.1**, **5.2** и **5.3** могут быть дополнительно обработаны с применением способов, известных в данной области техники.

Схема 5



На стадии *a* на схеме 6 пиридинкарбоксилат **1.4**, где R, R₃, R₄, R₅, R₆, X₂, X₃, Y и Z определены ранее, и R₃ представляет собой Br, может быть превращен в соответствующий винил **6.1**, где R, R₃, R₄, R₅, R₆, X₂, X₃, Y и Z определены ранее, и R₃ представляет собой винил, путем реакции кросс-сочетания, катализируемой палладием, с источником винила, таким как калиевая соль трифторвинилбората, в присутствии основания, такого как карбонат калия, и катализатора, такого как Pd(PPh₃)₂Cl₂, в полярном апротонном растворителе, таком как диметилсульфоксид, при температуре от приблизительно 75°C до приблизительно 100°C. Пиридинкарбоксилат **1.4**, где R, R₃, R₄, R₅, R₆, X₂, X₃, Y и Z определены ранее, и R₃ представляет собой Br, может быть превращен в соответствующий кетон **6.2**, где R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, R₆, X₂ и X₃ определены ранее, и R₃ представляет собой C(O)CH₃, путем обработки трибутил-(1-этоксивинил)станнаном, в присутствии катализатора на основе палладия, такого как Pd(PPh₃)₂Cl₂, в полярном апротонном растворителе, таком как дихлорэтан (DCE), при температуре от приблизительно 100°C до приблизительно 140°C, как на стадии *b* на схеме 6. Оба из соединений **6.1** и **6.2** могут быть дополнительно обработаны с применением способов, известных в данной области техники (включающих без ограничения окисление/восстановление, циклопропанирование, фторирование) с получением других групп в R₃.

Схема 6



КОМПОЗИЦИИ И СПОСОБЫ

В некоторых аспектах соединения, предусмотренные в данном документе, используются в смеси, содержащей гербицидно эффективное количество соединения вместе с по меньшей мере одним приемлемым с точки зрения сельского хозяйства вспомогательным веществом или носителем. Иллюстративные вспомогательные вещества или носители включают те, которые не являются фитотоксичными или существенно фитотоксичными в отношении ценных сельскохозяйственных культур, например, в концентрациях, используемых при применении композиций для селективного контроля сорняков в присутствии сельскохозяйственных культур, и/или не вступают или в значительной степени не вступают в химические реакции с соединениями, предусмотренными в данном документе, или другими ингредиентами композиции. Такие смеси могут быть разработаны для применения непосредственно в отношении сорняков или мест их произрастания или могут представлять собой концентраты или составы, которые перед применением разбавляют дополнительными носителями и вспомогательными веществами. Они могут быть представлены в виде твердых веществ, таких как, например, пылевидные препараты, гранулы, диспергируемые в воде гранулы или смачиваемые порошки, или жидкостей, таких как, например, эмульгируемые концентраты, растворы, эмульсии или суспензии. Также они могут предусматриваться в форме премикса или баковой смеси.

Приемлемые с точки зрения сельского хозяйства вспомогательные вещества и носители, которые являются пригодными при получении гербицидных смесей по настоящему изобретению, широко известны специалистам в данной области техники. Некоторые из этих вспомогательных веществ включают без ограничения концентрат масляного вспомогательного средства (минеральное масло (85%) + эмульгаторы (15%)); нонилфенолэтоксилат; четвертичную аммониевую соль бензилкокоалкилдиметила; смесь

нефтяного углеводорода, алкиловых сложных эфиров, органической кислоты и анионного поверхностно-активного вещества; C₉-C₁₁алкилполиглицозид; этоксилат фосфорной кислоты и спирта; этоксилат натурального первичного спирта (C₁₂-C₁₆); ди-*втор*-бутилфенол блок-сополимер EO-PO; полисилоксан с концевой метильной группой; этоксилат нонилфенола+мочевино-аммониевый нитрат; эмульгированное метилированное масло семян; этоксилат тридецилового спирта (синтетического) (8EO); этоксилат таллового амина (15 EO); PEG(400) диолеат-99.

Жидкие носители, которые можно применять, включают воду и органические растворители. Органические растворители включают без ограничения нефтяные фракции или углеводороды, такие как минеральное масло, ароматические растворители, парафиновые масла и т. п.; растительные масла, такие как соевое масло, рапсовое масло, оливковое масло, касторовое масло, подсолнечное масло, кокосовое масло, кукурузное масло, хлопковое масло, льняное масло, пальмовое масло, арахисовое масло, сафлоровое масло, кунжутное масло, тунговое масло и т. п.; сложные эфиры указанных выше растительных масел; сложные эфиры моноспиртов или двухосновных, трехосновных или других низших полиспиртов (содержащих 4-6 гидроксильных групп), такие как 2-этилгексилстеарат, *n*-бутилолеат, изопропилмирилат, диолеат пропиленгликоля, диоктилсукцинат, дибутиладипат, диоктилфталат и т. п.; сложные эфиры моно-, ди- и поликарбоновых кислот и т. п. Конкретные органические растворители включают толуол, ксилол, лигроин, масляное вспомогательное средство, ацетон, метилэтилкетон, циклогексанон, трихлорэтилен, перхлорэтилен, этилацетат, амилацетат, бутилацетат, монометиловый эфир пропиленгликоля и монометиловый эфир диэтиленгликоля, метиловый спирт, этиловый спирт, изопропиловый спирт, амиловый спирт, этиленгликоль, пропиленгликоль, глицерин, *N*-метил-2-пирролидинон, *N*, *N*-диметилалкиламида, диметилсульфоксид, жидкие удобрения и т. п. В некоторых аспектах вода является носителем для разбавления концентратов.

Подходящие твердые носители включают без ограничения тальк, пиррофиллитовую глину, диоксид кремния, аттапульгитовую глину, каолиновую глину, кизельгур, мел, диатомовую землю, известь, карбонат кальция, бентонитовую глину, фуллерову землю, шелуху семян хлопчатника, пшеничную муку, соевую муку, пемзу, древесную муку, муку из ореховой скорлупы, лигнин и т. п.

В некоторых аспектах в композициях по настоящему изобретению используют одно или несколько поверхностно-активных средств. Такие поверхностно-активные средства в некоторых аспектах используются как в твердых, так и в жидких композициях, например, в тех, которые предназначены для разбавления носителем перед применением. Поверхностно-активные средства могут быть анионными, катионными или неионогенными по природе и могут использоваться в качестве эмульгирующих средств, смачивающих средств, суспендирующих средств или для других целей. Поверхностно-активные

вещества, традиционно применяемые в области составления, и которые также можно применять в составах по настоящему изобретению, описаны, среди прочего, в *McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual*, MC Publishing Corporation: Ridgewood, NJ, 1998 и в *Encyclopedia of Surfactants*, Vol. I-III, Chemical Publishing Company: New York, 1980-81. Типичные поверхностно-активные средства включают без ограничения соли алкилсульфатов, такие как лаурилсульфат диэтаноламмония; соли алкиларилсульфонатов, такие как додецилбензолсульфонат кальция; продукты присоединения алкиленоксидов и алкилфенолов, такие как этоксилат нонилфенола-С₁₈; продукты присоединения алкиленоксидов и спиртов, такие как этоксилат тридецилового спирта-С₁₆; мыла, такие как стеарат натрия; соли алкилнафталинсульфонатов, такие как дибутилнафталинсульфонат натрия; диалкиловые сложные эфиры солей сульфосукцината, такие как ди(2-этилгексил)сульфосукцинат натрия; сложные эфиры сорбита, такие как олеат сорбита; четвертичные амины, такие как хлорид лаурилтриметиламмония; полиэтиленгликолевые сложные эфиры жирных кислот, такие как стеарат полиэтиленгликоля; блок-сополимеры этиленоксида и пропиленоксида; соли сложных эфиров моно- и диалкилфосфатов; растительные масла или масла из семян, такие как соевое масло, рапсовое/каноловое масло, оливковое масло, касторовое масло, подсолнечное масло, кокосовое масло, кукурузное масло, хлопковое масло, льняное масло, пальмовое масло, арахисовое масло, сафлоровое масло, кунжутное масло, тунговое масло и т. п.; и сложные эфиры вышеуказанных растительных масел, например, метиловые сложные эфиры.

В некоторых аспектах данные материалы, такие как растительные масла или масла из семян и их сложные эфиры, можно применять взаимозаменяемо в качестве сельскохозяйственного вспомогательного вещества, в качестве жидкого носителя или в качестве поверхностно-активного средства.

Другие иллюстративные добавки для применения в предусмотренных в данном документе композициях включают без ограничения средства, улучшающие совместимость, противовспениватели, связывающие средства, нейтрализующие средства и буферы, ингибиторы коррозии, красители, отдушки, средства, улучшающие распределение, добавки, улучшающие проникновение, средства, способствующие слипанию, диспергирующие средства, загустители, средства, снижающие температуру замерзания, антимикробные средства и т. п. Композиции также могут содержать другие совместимые компоненты, например, другие гербициды, регуляторы роста растений, фунгициды, инсектициды и т. п. и могут быть составлены с носителями на основе жидких удобрений или твердых дисперсных удобрений, таких как нитрат аммония, мочевины и т. п.

Концентрация активных ингредиентов в гербицидных композициях по настоящему изобретению, как правило, составляет от приблизительно 0,001 до приблизительно 98 процентов по весу. Часто применяют концентрации от приблизительно 0,01 до приблизительно 90 процентов по весу. В композициях, разработанных для применения в

качестве концентратов, активный ингредиент, как правило, присутствует в концентрации от приблизительно 5 до приблизительно 98 процентов по весу, предпочтительно от приблизительно 10 до приблизительно 90 процентов по весу. Перед применением такие композиции, как правило, разбавляют инертным носителем, таким как вода. Разбавленные композиции, обычно применяемые в отношении сорняков или мест произрастания сорняков, как правило, содержат от приблизительно 0,0001 до приблизительно 1 процента по весу активного ингредиента и предпочтительно содержат от приблизительно 0,001 до приблизительно 0,05 процента по весу.

Композиции по настоящему изобретению можно применять в отношении сорняков или мест их произрастания посредством применения традиционных наземных или авиационных опылителей, опрыскивателей и разбрасывателей гранул путем добавления к оросительной или паводковой воде и с помощью других традиционных средств, известных специалистам в данной области техники.

В некоторых аспектах соединения и композиции, описанные в данном документе, применяются в качестве послевсходового применения, предвсходового применения, применения в воде в отношении затопленных рисовых полей или водоемов (*например*, прудов, озер и потоков) или контактного применения.

В некоторых аспектах соединения и композиции, предусмотренные в данном документе, применяют для контроля сорняков в сельскохозяйственных культурах, включая без ограничения цитрусовые, яблоки, каучук, масличную пальму, лесное хозяйство, рис с посевом семян в грунт, с посевом семян в воду и рассадный рис, пшеницу, ячмень, овес, рожь, сорго, кукурузу/маис, на пастбищах, лугах, выгонах, земле под паром, газоне, в древесных и виноградных садах, водных средах или пропашных культурах, а также несельскохозяйственных установках, например, для контроля растительности в промышленных зонах (IVM) или полосах землеотвода. В некоторых аспектах соединения и композиции применяют для контроля древесных растений, широколиственных и злаковых сорняков или осок.

В некоторых аспектах соединения и композиции, предусмотренные в данном документе, применяют для контроля нежелательной растительности в рисе. В определенных аспектах нежелательная растительность представляет собой *Brachiaria platyphylla* (Groseb.) Nash (ветвянка широколистная, BRAPP), *Digitaria sanguinalis* (L.) Scop. (росичка кроваво-красная, DIGSA), *Echinochloa crus-galli* (L.) P. Beauv. (ежовник обыкновенный, ECHCG), *Echinochloa colomum* (L.) LINK (ежовник крестьянский, ECHCO), *Echinochloa oryzoides* (Ard.) Fritsch (ежовник рисовидный, ECHOR), *Echinochloa oryzicola* (Vasinger) Vasinger (ежовник бородчатый, ECHPH), *Ischaemum rugosum* Salisb. (исхеум, ISCRU), *Leptochloa chinensis* (L.) Nees (тонкоколосник китайский, LEFCH), *Leptochloa fascicularis* (Lam.) Gray (тонкоколосник пучковатый, LEFFA), *Leptochloa panicoides* (Presl.) Hitchc. (тонкоколосник амазонский, LEFPA), *Panicum dichotomiflorum* (L.) Michx. (просо

раздвоенноцветковое, PANDI), *Paspalum dilatatum* Poir. (гречка расширенная, PASDI), *Cyperus difformis* L. (сыть разнородная, CYPDI), *Cyperus esculentus* L. (сыть съедобная, CYPES), *Cyperus iria* L. (сыть ирия, CYPPIR), *Cyperus rotundus* L. (сыть круглая, CYPRO), виды *Eleocharis* (ELOSS), *Fimbristylis miliacea* (L.) Vahl (фимбристилис, FIMMI), *Schoenoplectus juncooides* Roxb. (японский камыш, SCPJU), *Schoenoplectus maritimus* L. (клубнекамыш морской, SCPMA), *Schoenoplectus mucronatus* L. (схеноплект остроконечный, SCPMU), виды *Aeschynomene*, (вид бобовых, AESSS), *Alternanthera philoxeroides* (Mart.) Griseb. (альтернантера филоксероидная, ALRPH), *Alisma plantago-aquatica* L. (частуха обыкновенная, ALSPA), виды *Amaranthus*, (разновидности щирицы и амаранты, AMASS), *Ammannia coccinea* Rottb. (аммания пурпурная, AMMCO), *Eclipta alba* (L.) Hassk. (эклипта белая, ECLAL), *Heteranthera limosa* (Sw.) Willd./Vahl (гетерантера илистая, HETLI), *Heteranthera reniformis* R. & P. (гетерантера почковидная, HETRE), *Ipomoea hederacea* (L.) Jacq. (ипомея плющевидная, IPOHE), *Lindernia dubia* (L.) Pennell (линдерния сомнительная, LIDDU), *Monochoria korsakowii* Regel & Maack (монохория, MOOKA), *Monochoria vaginalis* (Burm. F.) C. Presl ex Kuhth (монохория, MOOVA), *Murdannia nudiflora* (L.) Brenan (мурдания узлоцветковая, MUDNU), *Polygonum pensylvanicum* L. (горец пенсильванский, POLPY), *Polygonum persicaria* L. (горец почечуйный, POLPE), *Polygonum hydropiperoides* Michx. (горец перечновидный, POLHP), *Rotala indica* (Willd.) Koehne (ротала индийская, ROTIN), виды *Sagittaria* (стрелolist, SAGSS), *Sesbania exaltata* (Raf.) Cory/Rydb. ex Hill (сесбания рослая, SEBEX) или *Sphenoclea zeylanica* Gaertn. (сфеноклея цейлонская, SPDZE).

В некоторых аспектах соединения и композиции, предусмотренные в данном документе, применяют для контроля нежелательной растительности в злаковых культурах. В определенных аспектах нежелательная растительность представляет собой *Alopecurus myosuroides* Huds. (лисохвост мышехвостниковидный, ALOMY), *Apera spica-venti* (L.) Beauv. (метлица обыкновенная, APESV), *Avena fatua* L. (овес пустой, AVEFA), *Bromus tectorum* L. (костер кровельный, BROTE), *Lolium multiflorum* Lam. (плевел многоцветковый, LOLMU), *Phalaris minor* Retz. (канареечник малый, PHAMI), *Poa annua* L. (мятлик однолетний, POAAN), *Setaria pumila* (Poir.) Roemer & J.A. Schultes (щетинник низкий, SETLU), *Setaria viridis* (L.) Beauv. (щетинник зеленый, SETVI), *Cirsium arvense* (L.) Scop. (бодяк полевой, CIRAR), *Galium aparine* L. (подмаренник цепкий, GALAP), *Kochia scoparia* (L.) Schrad. (кохия, KCHSC), *Lamium purpureum* L. (ясотка пурпурная, LAMPU), *Matricaria recutita* L. (ромашка аптечная, MATCH), *Matricaria matricarioides* (Less.) Porter (ромашка пахучая, МАТМТ), *Papaver rhoeas* L. (мак самосейка, PAPRH), *Polygonum convolvulus* L. (горец вьюнковый, POLCO), *Salsola tragus* L. (солянка русская, SASKR), *Stellaria media* (L.) Vill. (звездчатка средняя, STEME), *Veronica persica* Poir. (вероника персидская, VERPE), *Viola arvensis* Murr. (фиалка полевая, VIOAR) или *Viola tricolor* L. (фиалка трехцветная, VIOTR).

В некоторых аспектах соединения и композиции, предусмотренные в данном документе, применяют для контроля нежелательной растительности на выгонах и пастбищах. В определенных аспектах нежелательная растительность представляет собой *Ambrosia artemisiifolia* L. (амброзия полыннолистная, AMBEL), *Cassia obtusifolia* (сенна туполистная, CASOB), *Centaurea maculosa* auct. non Lam. (василек пятнистый, CENMA), *Cirsium arvense* (L.) Scop. (бодяк полевой, CIRAR), *Convolvulus arvensis* L. (вьюнок полевой, CONAR), *Euphorbia esula* L. (молочай острый, EPHE), *Lactuca serriola* L./Torn. (латук дикий, LACSE), *Plantago lanceolata* L. (подорожник ланцетолистный, PLALA), *Rumex obtusifolius* L. (щавель туполистный, RUMOB), *Sida spinosa* L. (грудинка колючая, SIDSP), *Sinapis arvensis* L. (горчица полевая, SINAR), *Sonchus arvensis* L. (осот полевой, SONAR), виды *Solidago* (золотарник, SOOSS), *Taraxacum officinale* G.H. Weber ex Wiggers (одуванчик обыкновенный, TAROF), *Trifolium repens* L. (клевер ползучий, TRFRE) или *Urtica dioica* L. (крапива двудомная, URTDI).

В некоторых аспектах соединения и композиции, предусмотренные в данном документе, применяют для контроля нежелательной растительности, которая встречается в пропашных культурах. В определенных аспектах нежелательная растительность представляет собой *Alopecurus myosuroides* Huds. (лисохвост мышехвостниковидный, ALOMY), *Avena fatua* L. (овес пустой, AVEFA), *Brachiaria platyphylla* (Groseb.) Nash (ветвянка широколистная, BRAPP), *Digitaria sanguinalis* (L.) Scop. (росичка кроваво-красная, DIGSA), *Echinochloa crus-galli* (L.) P. Beauv. (ежовник обыкновенный, ECHCG), *Echinochloa colomum* (L.) Link (ежовник крестьянский, ECHCO), *Lolium multiflorum* Lam. (плевел многоцветковый, LOLMU), *Panicum dichotomiflorum* Michx. (просо раздвоенноцветковое, PANDI), *Panicum miliaceum* L. (просо обыкновенное, PANMI), *Setaria faberi* Herrm. (щетинник Фабера, SETFA), *Setaria viridis* (L.) Beauv. (щетинник зеленый, SETVI), *Sorghum halepense* (L.) Pers. (сорго алеппское, SORHA), *Sorghum bicolor* (L.) Moench ssp. *Arundinaceum* (сорго травянистое, SORVU), *Cyperus esculentus* L. (сыть съедобная, CYPES), *Cyperus rotundus* L. (сыть круглая, CYPRO), *Abutilon theophrasti* Medik. (канатник Теофраста, ABUTH), виды *Amaranthus* (разновидности щирицы и амаранты, AMASS), *Ambrosia artemisiifolia* L. (амброзия полыннолистная, AMBEL), *Ambrosia psilostachya* DC. (амброзия голометельчатая, AMBPS), *Ambrosia trifida* L. (амброзия трехраздельная, AMBTR), *Asclepias syriaca* L. (ваточник сирийский, ASCSY), *Chenopodium album* L. (марь белая, CHEAL), *Cirsium arvense* (L.) Scop. (бодяк полевой, CIRAR), *Commelina benghalensis* L. (коммелина бенгальская, COMBE), *Datura stramonium* L. (дурман обыкновенный, DATST), *Daucus carota* L. (морковь дикая, DAUCA), *Euphorbia heterophylla* L. (молочай разнолистный, EPHL), *Erigeron bonariensis* L. (мелколепестник буэносайресский, ERIBO), *Erigeron canadensis* L. (мелколепестник канадский, ERICA), *Helianthus annuus* L. (подсолнечник однолетний, HELAN), *Jacquemontia tamnifolia* (L.) Griseb. (джакемонтia тамнифолия, IAQTA), *Ipomoea hederacea* (L.) Jacq. (ипомея

плющевидная, IPOHE), *Ipomoea lacunosa* L. (ипомея ямчатая, IPOLA), *Lactuca serriola* L./Торн. (латук дикий, LACSE), *Portulaca oleracea* L. (портулак огородный, POROL), *Sida spinosa* L. (грудинка колючая, SIDSP), *Sinapis arvensis* L. (горчица полевая, SINAR), *Solanum ptychanthum* Dunal (паслен черный восточный, SOLPT) или *Xanthium strumarium* L. (дурнишник обыкновенный, XANST).

В некоторых аспектах нормы внесения, составляющие от приблизительно 1 до приблизительно 4000 грамм/гектар (г/га), используются в послевсходовых операциях. В некоторых аспектах нормы, составляющие от приблизительно 1 до приблизительно 4000 г/га, используются в предвсходовых операциях.

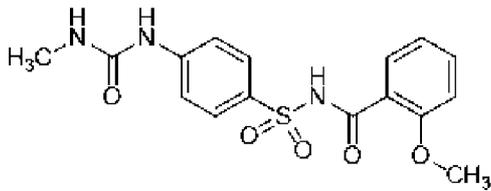
В некоторых аспектах соединения, композиции и способы, предусмотренные в данном документе, применяют в сочетании с одним или несколькими другими гербицидами для контроля более широкого ряда нежелательной растительности. В случае применения в сочетании с другими гербицидами соединения по настоящему изобретению можно составлять с другим гербицидом или гербицидами, смешивать в баке с другим гербицидом или гербицидами или применять последовательно с другим гербицидом или гербицидами. Некоторые из гербицидов, которые можно использовать в сочетании с соединениями по настоящему изобретению, включают: 4-CPA, 4-CPB, 4-CPD, 2,4-D, холиновую соль 2,4-D, сложные эфиры и амины 2,4-D, 2,4-DB, 3,4-DA, 3,4-DB, 2,4-DEB, 2,4-DEP, 3,4-DP, 2,3,6-TBA, 2,4,5-T, 2,4,5-TB, ацетохлор, ацифлуорфен, аклонифен, акролеин, алахлор, аллидохлор, аллоксидим, аллиловый спирт, алорак, аметридион, аметрин, амибузин, амикарбазон, амидосульфурон, аминоциклопирахлор, аминопиралид, амипрофос-метил, амитрол, сульфамат аммония, анилофос, анизурон, асулам, атратон, атразин, азафенидин, азимсульфурон, азипротрин, барбан, ВСПС, бифлутамид, беназолин, бенкарбазон, бенфлуралин, бенфуресат, бенсульфурон-метил, бенсулид, бентиокарб, бентазон-натрий, бензадокс, бензфендизон, бензипрам, бензобициклон, бензофенап, бензофлуор, бензоилпроп, бензтиазурон, бициклопирон, бифенокс, биланафос, биспирибак-натрий, бикслозон, буру, бромацил, бромобонил, бромобутид, бромофеноксим, бромоксинил, бромпиразон, бутахлор, бутафенацил, бутамифос, бутенахлор, бутидазол, бутиурон, бутралин, бутроксицим, бутурон, бутилат, какодиловую кислоту, кафенстрол, хлорат кальция, цианамид кальция, камбендихлор, карбасулам, карбетамид, карбоксазол, хлорпрокарб, карфентразон-этил, CDEA, CEPС, хлоретоксифен, хлорамбен, хлоранокрил, хлоразифоп, хлоразин, хлорбромурон, хлорбуфам, хлоретурон, хлорфенак, хлорфенпроп, хлорфлуразол, хлорфлуренол, хлоридазон, хлоримурон, хлорнитрофен, хлоропон, хлоротолурон, хлороксурон, хлороксинил, хлорпрофам, хлорсульфурон, хлортал, хлортиамид, цинидон-этил, цинметилин, циносульфурон, цисанилид, клетодим, клиодинат, клодинафоп-пропаргил, клофоп, кломазон, кломепроп, клопроп, клопроксицим, клопиралид, клорансулам-метил, СМА, сульфат меди, СРМФ, СРРС, кредазин, крезол, кумилурон, цианатрин, цианазин, циклоат, циклопиранил, циклосульфамурон,

циклоксидим, циклурон, цигалофоп-бутил, циперкват, ципразин, ципразол, ципромид, даимурон, далапон, дазомет, делахлор, десмедифам, десметрин, диаллат, дикамбу, дихлобенил, дихлоральмочевину, дихлормат, дихлорпроп, дихлорпроп-Р, диклофоп, диклосулам, диетамкват, диетатил, дифенопентен, дифеноксурон, дифензокват, дифлуфеникан, дифлуфензопир, димефурон, димепиперат, диметахлор, диметаметрин, диметенамид, диметенамид-Р, димексано, димидазон, динитрамин, динофенат, динопроп, диносам, диносеб, динотерб, дифенамид, дипропетрин, дикват, дизул, дитиопир, диурон, DMPA, DNOC, DSMA, EBER, эглиназин, эндотал, эпроназ, EPTC, эрбон, эспрокарб, эталфлуралин, этбензамид, этаметсульфурон, этидимурон, этиолат, этобензамид, этобензамид, этофумезат, этоксифен, этокисульфурон, этинофен, этнипромид, этобензанид, EXD, фенасулам, фенопроп, феноксапроп, феноксапроп-Р-этил, феноксапроп-Р-этил+изоксадифен-этил, феноксасульфен, фентеракол, фентиапроп, фентразамид, фенурон, сульфат железа, флампроп, флампроп-М, флазасульфурон, флорасулам, флорпирауксифен-бензил, флауазифоп, флауазифоп-Р-бутил, флауазолат, флаукарбазон, флусетосульфурон, флухлоралин, флуфенацет, флуфеникан, флуфенпир-этил, флуметсулам, флумезин, флумиклорак-пентил, флумиоксазин, флумипропин, флуометурон, флуородифен, флуорогликофен, флуоромидин, флуоронитрофен, флуотиурон, флупоксам, флупропацил, флупропанат, флупирсульфурон, флуридон, флуорохлоридон, флуорокспир, флуртамон, флутиацет, фомесафен, форамсульфурон, фосамин, фурилоксифен, глюфосинат, глюфосинат-аммоний, глифосат, галауксифен-метил, галосафен, галосульфурон-метил, галоксидин, галоксифоп-метил, галоксифоп-Р-метил, гексахлорацетон, гексафлурат, гексазион, имазаметабенз, имазамокс, имазапик, имазапир, имазаквин, имазетапир, имазосульфурон, инданофан, индазифлам, йодобонил, йодметан, йодосульфурон, иофенсульфурон, иоксинил, ипазин, ипфенкарбазон, ипримидам, изокарбамид, изоцил, изометиозин, изонорурон, изополинат, изопропалин, изопротурон, изоурон, изоксабен, изоксахлортол, изоксафлютол, изоксапирифоп, карбутилат, кетоспирадокс, ланкотрион, лактофен, ленацил, линурон, МАА, МАМА, сложные эфиры и амины МСРА, МСРА-тиоэтил, МСРВ, мекопроп, мекопроп-Р, мединотерб, мефенацет, мефлуидид, мезопразин, мезосульфурон, мезотрион, метам, метамифоп, метамитрон, метазахлор, метаосульфурон, метфлуразон, метабензтиазурон, металпропалин, метазол, метиобенкарб, метиозолин, метиурон, метометон, метопротрин, метилбромид, метилизотиоцианат, метилдимрон, метобензулон, метобромурон, метолахлор, метосулам, метоксурон, метрибузин, метсульфурон, молинат, моналид, монисоурон, монохлоруксусную кислоту, монолинулон, монурон, морфамкват, MSMA, напроанилид, напропамид, напропамид-М, напталам, небурон, никосульфурон, нипираклофен, нитралин, нитрофен, нитрофлуорфен, норфлуразон, норурон, ОСН, орбенкарб, *орто*-дихлорбензол, ортосульфамурон, оризалин, оксадиаргил, оксадиазон, оксапиразон, оксасульфурон, оксазикломефон, оксифлуорфен, парафлуфен-этил,

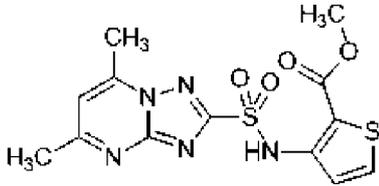
парафлурон, паракват, пебулат, пеларгоновую кислоту, пендиметалин, пеноксилам, пентахлорфенол, пентанохлор, пентоксазон, перфлуидон, петоксамид, фенизофам, фенмедифам, фенмедифам-этил, фенобензулон, фенилмеркурацетат, пихлорам, пиколинафен, пиноксаден, пиперофос, арсенит калия, азид калия, цианат калия, претилахлор, примисульфурон-метил, проциазин, продиамин, профлуазол, профлуралин, профоксидим, проглиназин, прогексадион-кальций, прометон, прометрин, пропахлор, пропанил, пропаквизафоп, пропазин, профам, пропизохлор, пропоксикарбазон, пропирисульфурон, пропизамид, просульфалин, просульфокарб, просульфурон, проксан, принахлор, пиданон, пираклонил, пирафлуфен, пирасульфотол, пиразогил, пиразолинат, пиразосульфурон-этил, пиразоксифен, пирибензоксим, пирибутикарб, пирихлор, пиридафол, пиридат, пирифталид, пириминобак, пиримисульфам, пиритиобак-метил, пироксасульфон, пироксилам, квинкlorак, квинмерак, квинокламин, квинонамид, квизалофоп, квизалофоп-Р-этил, родетанил, римсульфурон, сафлуфенацил, S-метолахлор, себутилазин, секбуметон, сетоксидим, сидурон, симазин, симетон, симетрин, SMA, арсенит натрия, азид натрия, хлорат натрия, сулькотрион, сульфаллат, сульфентразон, сульфометурон, сульфосат, сульфосульфурон, серную кислоту, сулгликапин, свеп, ТСА, тебутам, тебутиурон, тефурилтрион, темботрион, тепралоксидим, тербацил, тербукарб, тербухлор, тербуметон, тербутилазин, тербутрин, тетрафлурон, тенилхлор, тиазафлурон, тиазопир, тидиазимин, тидиазулон, тиенкарбазон-метил, тифенсульфурон, тиобенкарб, тиокарбазил, тиоклорим, толпиралат, топрамезон, тралкоксидим, триафамон, триаллат, триасульфурон, триазилам, трибенурон, трикамбу, сложные эфиры и амины трихлопира, тридифан, триэтазин, трифлорисульфурон, трифлудимоксазин, трифлуралин, трифлусульфурон, трифоп, трифопсим, тригидрокситриазин, триметурон, трипропиндан, тритак, тритосульфурон, вернолат и ксилахлор.

Соединения и композиции по настоящему изобретению обычно можно использовать в комбинации с одним или несколькими гербицидными антидотами, такими как AD-67 (MON 4660), беноксакор, бентиокарб, брассинолид, клоквинтосет (например, мексил), циометринил, даимурон, дихлормид, дициклонон, димепиперат, дисульфотон, фенхлоразол-этил, фенклорим, флуразол, флуксофенил, фурилазол, гарпиновые белки, изоксадифен-этил, цзецаовань, цзецаоси, мефенпир-диэтил, мефенат, MG-191, нафталиновый ангидрид (NA), оксабетринил, R29148 и амиды *N*-фенилсульфонилбензойной кислоты, чтобы повысить их селективность.

В некоторых аспектах композиции и способы, описанные в данном документе, можно применять в комбинации с одним или несколькими средствами для обработки семян, известными в использовании для защиты риса, и соединениями формулы (I), в том числе с нафталиновым ангидридом и соединением с регистрационным номером по CAS 129531-12-0 (*N*-(2-метоксибензоил)-4-[(метиламинокарбонил)амино]бензолсульфонамид или меткамифен), которое характеризуется следующей структурой,



и соединением с регистрационным номером по CAS 98967-94-3 (метил-3-((5,7-диметил-[1,2,4]триазоло[1,5-*a*]пиримидин)-2-сульфонамидо)тиофен-2-карбоксилат), которое характеризуется следующей структурой,



Соединения, композиции и способы, описанные в данном документе, применяются для контроля нежелательной растительности в сельскохозяйственных культурах, выносливых в отношении глифосата, выносливых в отношении глюфосината, выносливых в отношении дикамбы, выносливых в отношении феноксиауксина, выносливых в отношении пиридилоксиауксина, выносливых в отношении арилоксифеноксипропионата, выносливых в отношении ингибитора ацетил-СоА-карбоксилазы (АССазы), выносливых в отношении имидазолинона, выносливых в отношении ингибитора ацетолактатсинтазы (ALS), выносливых в отношении ингибитора 4-гидроксифенилпируватдиоксигеназы (HPPD), выносливых в отношении ингибитора протопорфириногенаоксидазы (PPO), выносливых в отношении триазина и выносливых в отношении бромксинила (таких как без ограничения соя, хлопчатник, канола/масличный рапс, рис, злаковые культуры, кукуруза, газонная трава и т. д.), например, в сочетании с глифосатом, глюфосинатом, дикамбой, феноксиауксинами, пиридилоксиауксинами, арилоксифеноксипропионатами, ингибиторами АССазы, имидазолинонами, ингибиторами ALS, ингибиторами HPPD, ингибиторами PPO, триазинами и бромксинилом. Композиции и способы можно применять при осуществлении контроля нежелательной растительности в сельскохозяйственных культурах, обладающих множественными или пакетированными признаками, которые придают выносливость в отношении множества химических веществ и/или ингибиторов с несколькими механизмами действия.

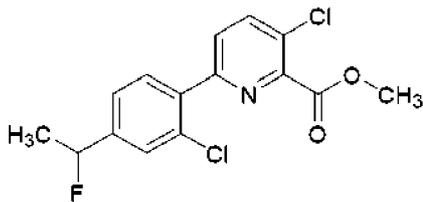
Соединения и композиции, предусмотренные в данном документе, также можно применять для контроля устойчивых или выносливых в отношении гербицидов сорняков. Иллюстративные устойчивые или выносливые сорняки включают без ограничения биотипы, устойчивые или выносливые в отношении ингибиторов ALS, ингибиторов фотосистемы II, ингибиторов АССазы, синтетических ауксинов, ингибиторов фотосистемы I, ингибиторов синтазы 5-енолпирувилшикимат-3-фосфата (EPSP), ингибиторов сборки микротрубочек, ингибиторов синтеза липидов, ингибиторов PPO, ингибиторов биосинтеза

каротиноидов, ингибиторов жирных кислот с очень длинной цепью (VLCFA), ингибиторов фитоендесатуразы (PDS), ингибиторов глутаминсинтетазы, ингибиторов HPPD, ингибиторов митоза, ингибиторов биосинтеза целлюлозы, гербицидов с несколькими механизмами действия, таких как квинклолак, и неклассифицированных гербицидов, таких как ариламинопропионовые кислоты, дифензокват, эндотал и мышьякорганические соединения. Иллюстративные устойчивые или выносливые сорняки включают без ограничения биотипы, обладающие устойчивостью или выносливостью в отношении нескольких гербицидов, нескольких классов химических веществ и гербицидов с несколькими механизмами действия.

Описанные аспекты и следующие примеры предназначены только для иллюстративных целей и не должны ограничивать объем формулы изобретения. Другие модификации, применения или комбинации в отношении композиций, описанных в данном документе, будут очевидны для среднего специалиста в данной области техники без отступления от сути и объема заявленного объекта изобретения.

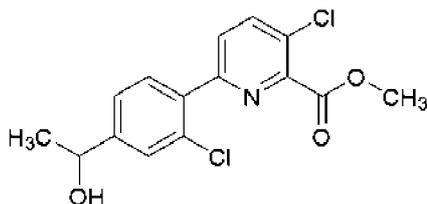
ПРИМЕРЫ

Пример 1. Получение метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(1-фторэтил)фенил)пиколината (F14)



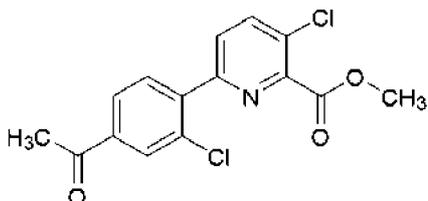
Растворяли метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(1-гидроксиэтил)фенил)пиколинат (F1; 80 миллиграмм (мг), 0,246 миллимоль (ммоль)) в дихлорметане (DCM; 2 мл) и смесь охлаждали до 0°C. Добавляли бис(2-метоксиэтил)аминосеры трифторид (Deохо-Fluor®; 437 мг, 1,97 ммоль) и реакционную смесь перемешивали в течение 3 часов (ч.) при комнатной температуре. Реакционную смесь гасили холодной водой и бикарбонатом натрия (NaHCO₃) и экстрагировали этилацетатом (EtOAc). Объединенные органические слои промывали солевым раствором, высушивали над сульфатом натрия (Na₂SO₄) и концентрировали. В результате очистки остатка с помощью среднеэффективной жидкостной хроматографии (MPLC) получали указанное в заголовке соединение в виде грязно-белого твердого вещества (55 мг, 70%).

Пример 2. Получение метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(1-гидроксиэтил)фенил)пиколината (F1)



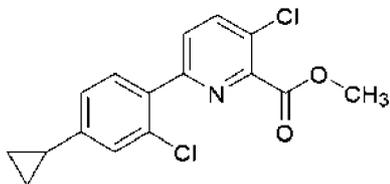
Растворяли метил-6-(4-ацетил-2-хлорфенил)-3-хлорпиколинат (**F26**; 150 мг, 0,46 ммоль) в метаноле (MeOH, 2 мл) и охлаждали до 0°C. Добавляли борогидрид натрия (NaBH₄; 170 мг, 0,75 ммоль) и смесь перемешивали в течение 1 ч. при комнатной температуре. Реакционную смесь гасили холодной водой и экстрагировали с помощью EtOAc. Объединенный органический слой промывали солевым раствором, высушивали над Na₂SO₄ и концентрировали. В результате очистки с помощью MPLC получали указанное в заголовке соединение в виде грязно-белого твердого вещества (60 мг, 50%).

Пример 3. Получение метил-6-(4-ацетил-2-хлорфенил)-3-хлорпиколината (F26)



Метил-6-(4-бром-2-хлорфенил)-3-хлорпиколинат (**F27**; 1 г, 2,7 ммоль) поглощали 1,2-дихлорэтаном (DCE; 10 мл) и дегазировали. Добавляли трибутил-(1-этоксивинил)станнан (3 г, 8,1 ммоль) и дихлорбис(трифенилфосфин)палладий(II) (Pd(PPh₃)₂Cl₂; 190 мг, 0,27 ммоль) и смесь нагревали до 130°C в течение 4 ч. в герметизированной пробирке или в условиях микроволнового излучения. Реакционную смесь фильтровали с удалением остатка и фильтрат разбавляли холодной водой и экстрагировали с помощью EtOAc. Органический слой концентрировали, полученное неочищенное соединение поглощали водным раствором хлористоводородной кислоты (6-нормальным (н.) раствором HCl) и смесь перемешивали в течение ночи. Остаток удаляли посредством фильтрации и фильтрат разбавляли холодной водой. Смесь экстрагировали с помощью EtOAc и объединенный органический слой промывали солевым раствором, высушивали над Na₂SO₄ и концентрировали. В результате очистки с помощью MPLC получали указанное в заголовке соединение в виде грязно-белого твердого вещества (280 мг, 30%).

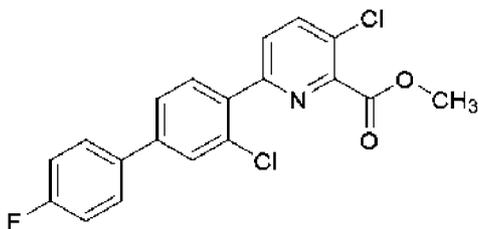
Пример 4. Получение метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-циклопропилфенил)пиколината (F15)



Метил-6-(4-бром-2-хлорфенил)-3-хлорпиколинат (**F27**; 200 мг, 0,55 ммоль) поглощали толуолом (4 мл) и дегазировали. Добавляли циклопропилбороновую кислоту (96 мг, 1,1 ммоль), фосфат калия (K₃PO₄; 350 мг, 1,65 ммоль) и тетраakis(трифенилфосфин)палладий(0) (Pd(PPh₃)₄; 64 мг, 0,055 ммоль). Реакционную смесь нагревали до 90°C в течение приблизительно 8 ч. Реакционную смесь разбавляли с

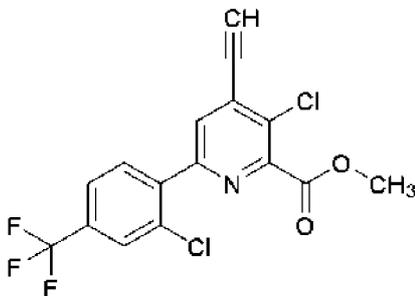
помощью EtOAc и нерастворимый остаток удаляли посредством фильтрации. Органический слой промывали водой, высушивали над Na₂SO₄ и концентрировали. В результате очистки с помощью MPLC получали указанное в заголовке соединение в виде бледно-желтого твердого вещества (200 мг, 40%).

Пример 5. Получение метил-3-хлор-6-(3-хлор-4'-фтор-[1,1'-бифенил]-4-ил)пиколината (F25)



Метил-6-(4-бром-2-хлорфенил)-3-хлорпиколинат (F27; 200 мг, 0,55 ммоль) растворяли в ацетонитриле (CH₃CN; 6 мл) и воде (2 мл). Смесь дегазировали и добавляли 4-фторфенилбороновую кислоту (92 мг, 0,66 ммоль), фторид калия (KF; 96 мг, 1,65 ммоль) и Pd(PPh₃)₂Cl₂ (39 мг, 0,055 ммоль). Реакционную смесь нагревали до 120°C в течение ~6 ч., охлаждали и фильтровали. Фильтрат разбавляли холодной водой и экстрагировали с помощью EtOAc. Объединенные органические слои промывали солевым раствором, высушивали над Na₂SO₄ и концентрировали. В результате очистки с помощью MPLC получали указанное в заголовке соединение в виде грязно-белого твердого вещества (90 мг, 40%).

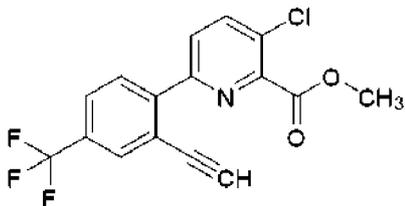
Пример 6. Получение метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-4-этинилпиколината (F40)



В раствор метил-4-бром-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)пиколината (F41; 0,2 г, 0,46 ммоль) в тетрагидрофуране (THF) добавляли трифенилфосфин (0,003 г, 0,012 ммоль) и триэтиламин (Et₃N; 0,069 г, 0,69 ммоль). Реакционную смесь продували аргоном в течение 15 минут (мин.). Добавляли триметилсилилацетилен (0,067 г, 0,69 ммоль), йодид меди (0,002 г, 0,009 ммоль) и Pd(PPh₃)₂Cl₂ (0,016 г, 0,023 ммоль) и реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение приблизительно 6 ч. Реакционную смесь фильтровали через Celite® и фильтрат концентрировали при пониженном давлении. Полученный черный остаток растворяли в сухом THF (5 мл) и охлаждали до 0°C. Добавляли тетра-*n*-бутиламмония фторид (TBAF; 0,5 мл, 0,53 ммоль) и

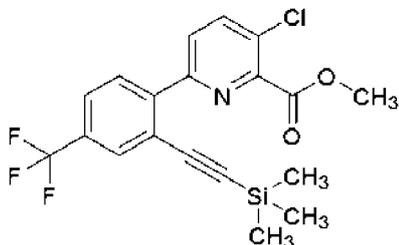
смесь перемешивали при 0°C в течение 30 мин. Реакционную смесь разбавляли водой и экстрагировали с помощью EtOAc. Органический слой промывали солевым раствором, высушивали над Na₂SO₄ и концентрировали. В результате очистки с помощью флэш-хроматографии с применением 10% EtOAc в гексане в качестве элюента получали указанное в заголовке соединение в виде белого твердого вещества (0,04 г, 23%).

Пример 7. Получение метил-3-хлор-6-(2-этинил-4-(трифторметил)фенил)пиколината (F16)



Добавляли TBAF (0,32 г, 5,4 ммоль) в раствор метил-3-хлор-6-(4-(трифторметил)-2-((триметилсилил)этинил)фенил)пиколината (C1; 0,17 г, 0,41 ммоль) в THF (4 мл) при 0°C. Перемешивание продолжали при комнатной температуре в течение 1 ч. Реакционную смесь разбавляли ледяной водой и экстрагировали с помощью EtOAc. Объединенный органический слой высушивали над Na₂SO₄ и концентрировали. В результате очистки с помощью MPLC получали указанное в заголовке соединение в виде бледно-коричневого твердого вещества (30 мг, 30%).

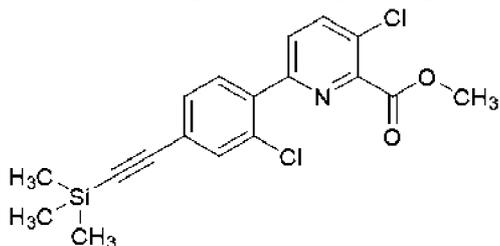
Пример 8. Получение метил-3-хлор-6-(4-(трифторметил)-2-((триметилсилил)этинил)фенил)пиколината (C1)



Метил-6-(2-бром-4-трифторметил)фенил-3-хлорпиколинат (F30; 0,4 г, 1,01 ммоль) поглощали с помощью THF (5 мл) и дегазировали. Добавляли триметилсилилацетилен (0,2 г, 2,05 ммоль), йодид меди (19 мг, 0,101 ммоль), Pd(PPh₃)₂Cl₂ (70 мг, 0,1 ммоль) и Et₃N (4 мл) и реакционную смесь перемешивали в течение 10 мин. при комнатной температуре и нагревали до 70°C в течение приблизительно 2 ч. Реакционную смесь фильтровали через слой Celite®. К фильтрату добавляли ледяную воду и смесь экстрагировали с помощью EtOAc. Объединенный органический слой высушивали над Na₂SO₄ и концентрировали. В результате очистки с помощью MPLC получали указанное в заголовке соединение в виде бледно-коричневого твердого вещества (170 мг, 40%): ¹H ЯМР (300 МГц, CDCl₃) δ 8,15 (d, J=8,54 Гц, 1H), 7,93 (d, J=8,16 Гц, 1H), 7,86-7,82 (m, 1H), 7,69-7,62 (m, 1H), 7,33 (d, J=2,08 Гц, 1H), 4,02 (s, 3H), 0,20 (s, 9H).

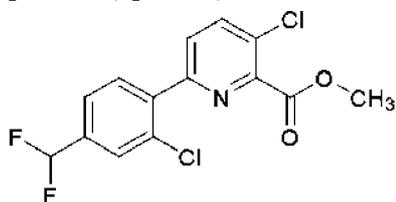
Следующее соединение получали аналогично процедуре, указанной в примере 8.

Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-((триметилсилил)этинил)фенил)пиколинат (C2)



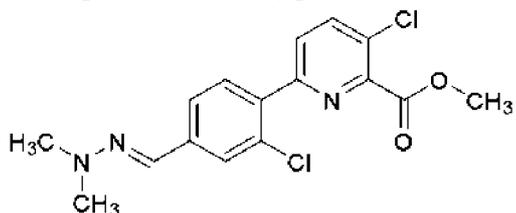
С использованием подходящих исходных материалов выделяли указанное в заголовке соединение: ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,15 (d, $J=8,32$ Гц, 1H), 7,93 (d, $J=8,25$ Гц, 1H), 7,86-7,82 (m, 1H), 7,66 (dd, $J=1,88, 8,20$ Гц, 1H), 7,36-7,28 (m, 1H), 4,03 (s, 3H), 0,20 (s, 9H).

Пример 9. Получение метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(дифторметил)фенил)пиколината (F19)



Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-формилфенил)пиколинат (**F22**; 150 мг, 0,48 ммоль) поглощали с помощью DCM (2 мл) и смесь охлаждали до 0°C . Добавляли диэтиламиносеры трифторид (DAST; 390 мг, 2,42 ммоль) и смесь перемешивали в течение 3 ч. при комнатной температуре. Реакционную смесь гасили с помощью холодной воды и NaHCO_3 и экстрагировали с помощью EtOAc. Объединенный органический слой промывали солевым раствором, высушивали над Na_2SO_4 и концентрировали с получением неочищенного соединения. В результате очистки с помощью MPLC получали указанное в заголовке соединение в виде грязно-белого твердого вещества (85 мг, 60%).

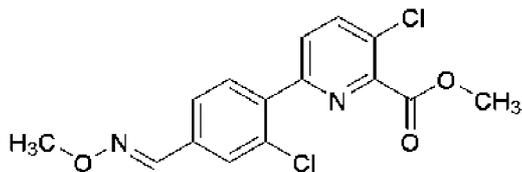
Пример 10. Получение метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-((2,2-диметилгидразо)метил)фенил)пиколината (F20)



Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-формилфенил)пиколинат (**F22**; 100 мг, 0,32 ммоль) поглощали с помощью DMF (2 мл). Добавляли *N, N*-диметилгидразин (81 мг, 0,96 ммоль) и реакционную смесь нагревали до 60°C в течение приблизительно 2 ч. Реакционную смесь разбавляли холодной водой и экстрагировали с помощью EtOAc. Объединенный органический слой промывали солевым раствором, высушивали над Na_2SO_4 и концентрировали. В результате очистки с помощью MPLC получали указанное в заголовке

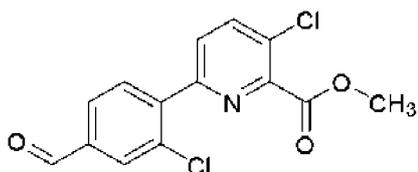
соединение в виде грязно-белого твердого вещества (55 мг, 50%).

Пример 11. Получение метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-((метоксиимино)метил)фенил)пиколината (F21)



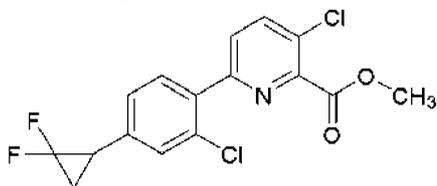
Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-формилфенил)пиколинат (**F22**; 140 мг, 0,45 ммоль) поглощали с помощью DMF (2 мл). Добавляли гидрохлорид метоксиламина (192 мг, 2,30 ммоль) и реакционную смесь нагревали до 60°C в течение приблизительно 2 ч. Реакционную смесь разбавляли холодной водой и экстрагировали с помощью EtOAc. Объединенный органический слой промывали солевым раствором, высушивали над Na₂SO₄ и концентрировали. В результате очистки с помощью MPLC получали указанное в заголовке соединение в виде грязно-белого твердого вещества (110 мг, 70%).

Пример 12. Получение метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-формилфенил)пиколината (F22)



Растворяли метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-винилфенил)пиколинат (**F23**; 800 мг, 1,61 ммоль) в смеси 9:1 DCM-MeOH (10 мл) при -78°C и продували газообразным озоном в течение 30 мин. Обеспечивали нагревание реакционной смеси до 0°C и добавляли диметилсульфид (DMS; 4 мл). Реакционную смесь перемешивали в течение 1 ч. и добавляли холодную воду. Смесь экстрагировали с помощью EtOAc и объединенный органический слой промывали солевым раствором, высушивали над Na₂SO₄ и концентрировали. В результате очистки с помощью MPLC получали указанное в заголовке соединение в виде грязно-белого твердого вещества (600 мг, 65%).

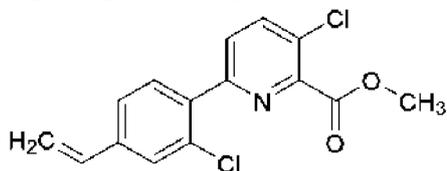
Пример 13. Получение метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(2,2-дифторциклопропил)фенил)пиколината (F13)



Растворяли метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-винилфенил)пиколинат (**F23**; 250 мг, 0,80 ммоль) в CH₃CN и добавляли йодид натрия (600 мг, 8,0 ммоль) и триметилсилилтрифторметан (560 мг, 8,0 ммоль). Реакционную смесь нагревали до 60°C в

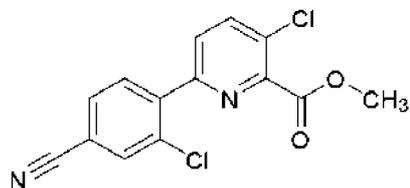
течение приблизительно 6 ч. Реакционную смесь разбавляли холодной водой и экстрагировали с помощью EtOAc. Объединенный органический слой промывали солевым раствором, высушивали над Na₂SO₄ и концентрировали. В результате очистки с помощью MPLC получали указанное в заголовке соединение в виде грязно-белого твердого вещества (110 мг, 55%).

Пример 14. Получение метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-винилфенил)пиколината (F23)



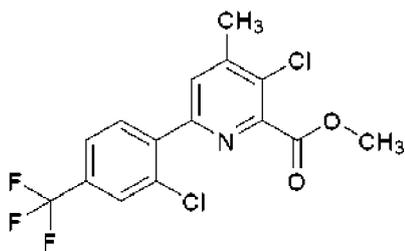
Метил-6-(4-бром-2-хлорфенил)-3-хлорпиколинат (F27; 250 мг, 0,69 ммоль) поглощали диметилсульфоксидом (4 мл). Добавляли карбонат калия (280 мг, 2,06 ммоль) и смесь дегазировали в течение 10 мин. Добавляли калиевую соль трифторвинилбората (285 мг, 2,86 ммоль) и Pd(PPh₃)₂Cl₂ (50 мг, 0,069 ммоль) и реакционную смесь нагревали до 90°C в течение приблизительно 6 ч. Смесь фильтровали и фильтрат разбавляли холодной водой и экстрагировали с помощью EtOAc. Объединенный органический слой промывали солевым раствором, высушивали над Na₂SO₄ и концентрировали. В результате очистки с помощью MPLC получали указанное в заголовке соединение в виде грязно-белого твердого вещества (160 мг, 55%).

Пример 15. Получение метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-цианофенил)пиколината (F59)



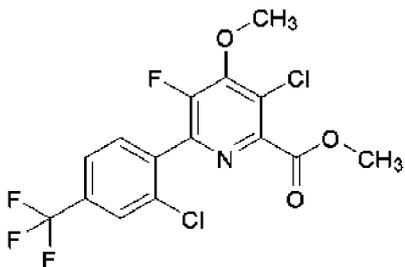
Растворили метил-6-(4-бром-2-хлорфенил)-3-хлорпиколинат (F27; 200 мг, 0,55 ммоль) с помощью DMF (4 мл). Смесь дегазировали и добавляли цианид цинка (130 мг, 1,11 ммоль) и Pd(PPh₃)₂Cl₂ (60 мг, 0,055 ммоль). Реакционную смесь нагревали до 150°C в течение приблизительно 6 ч., охлаждали и фильтровали. Фильтрат разбавляли холодной водой и экстрагировали с помощью EtOAc. Объединенный органический слой промывали солевым раствором, высушивали над Na₂SO₄ и концентрировали. В результате очистки с помощью MPLC получали указанное в заголовке соединение в виде грязно-белого твердого вещества (70 мг, 40%).

Пример 16. Получение метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-4-метилпиколината (F33)



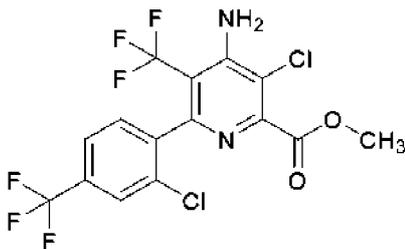
В раствор метил-4-бром-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)пиколината (**F41**; 0,4 г, 0,93 ммоль) в сухом толуоле (10 мл) добавляли метилбороновую кислоту (0,08 г, 1,4 ммоль) и фосфат калия (0,63 г, 2,8 ммоль) при комнатной температуре. Через реакционную смесь продували аргон в течение 15 мин. Добавляли $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$ (0,11 г, 0,093 ммоль) и реакционную смесь нагревали при 100°C в течение 12 ч. Добавляли воду и реакционную смесь экстрагировали с помощью EtOAc . Объединенный органический слой промывали солевым раствором, высушивали над Na_2SO_4 и концентрировали. В результате очистки с помощью флэш-хроматографии с 10% EtOAc в гексане в качестве элюента получали указанное в заголовке соединение в виде белого твердого вещества (0,16 г, 47%).

Пример 17. Получение метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-5-фтор-4-метоксипиколината (F42)



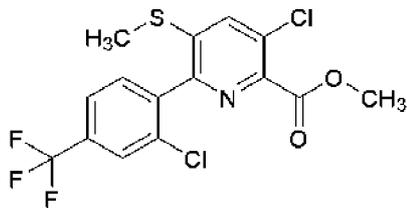
В раствор метил-3,4-дихлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-5-фторпиколината (**F43**; 0,18 г, 0,45 ммоль) в сухом MeOH (2 мл) добавляли свежеполученный раствор метоксида натрия (0,029 г, 0,53 ммоль) в MeOH при 0°C и обеспечивали перемешивание смеси при комнатной температуре в течение 2 ч. Реакционную смесь охлаждали до 0°C , гасили с помощью 1 н. HCl и экстрагировали с помощью EtOAc . Органический слой промывали солевым раствором, высушивали над Na_2SO_4 и концентрировали. В результате очистки с помощью флэш-хроматографии с 10% EtOAc в гексане в качестве элюента получали указанное в заголовке соединение в виде белого твердого вещества (0,06 г, 33%).

Пример 18. Получение метил-4-амино-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-5-(трифторметил)пиколината (C3)



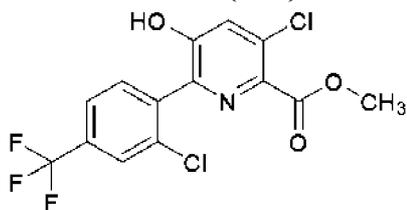
Раствор метил-4-амино-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-5-йодпиколината (C5; 0,2 г, 0,41 ммоль) в сухом DMF продували аргоном в течение приблизительно 10 мин. Добавляли метил-2,2-дифтор-2-(фторсульфонил)ацетат (0,3 г, 1,6 ммоль) и йодид меди(I) (CuI; 0,015 г, 0,08 ммоль) и реакционную смесь нагревали в микроволновом реакторе Biotage в течение 1 ч. при 100°C. В реакционную смесь добавляли воду и смесь экстрагировали с помощью EtOAc. Органический слой промывали солевым раствором, высушивали над Na₂SO₄ и концентрировали. В результате очистки с помощью флэш-хроматографии с 10% EtOAc в гексане в качестве элюента получали указанное в заголовке соединение в виде белого твердого вещества (0,08 г, 46%).

Пример 19. Получение метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-5-(метилтио)пиколината (F7)



В раствор метил-4-амино-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-5-(метилтио)пиколината (C4; 0,12 г, 0,3 ммоль) в сухом THF (5 мл) добавляли изоамилнитрит (0,08 г, 0,7 ммоль) при комнатной температуре. Полученную смесь нагревали при 60°C в течение 12 ч. Реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры и разделяли между водой и EtOAc. Органический слой промывали солевым раствором, высушивали над Na₂SO₄ и концентрировали. В результате очистки с помощью флэш-хроматографии с 5% EtOAc в гексане в качестве элюента получали указанное в заголовке соединение в виде белого твердого вещества (0,08 г, 67%).

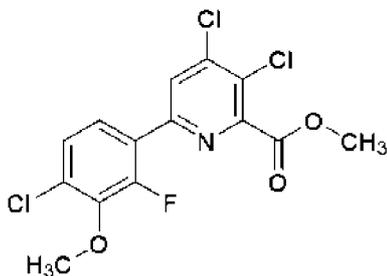
Пример 20. Получение метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-5-гидроксипиколината (F34)



В раствор метил-4-амино-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-5-фторпиколината (C6; 0,35 г, 0,91 ммоль) в этаноле (EtOH; 10 мл) добавляли толуол (3 мл) и серную кислоту (1,5 мл) и полученную смесь охлаждали до 0°C. Добавляли твердый нитрит натрия (1,25 г, 18,1 ммоль) и смесь нагревали при 80°C в течение 3 ч. Растворитель удаляли из реакционной смеси, остаток нейтрализовали с помощью NaHCO₃. Смесь экстрагировали с помощью EtOAc. Органический слой промывали солевым раствором, высушивали над Na₂SO₄ и концентрировали. В результате очистки с помощью препаративной

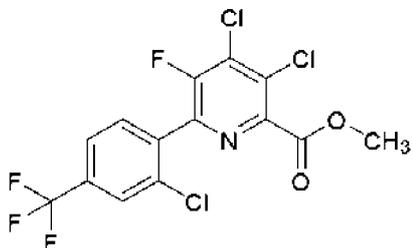
высокоэффективной жидкостной хроматографии (HPLC) получали указанное в заголовке соединение в виде белого твердого вещества (0,15 г, 53%).

Пример 21. Получение метил-3,4-дихлор-6-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифенил)пиколината (F76)



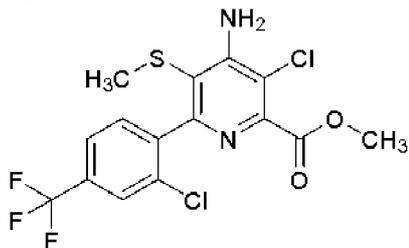
Растворяли нитрит натрия (210 мг, 3,0 ммоль) в минимальном количестве (~1 мл) воды и добавляли по каплям в перемешиваемую суспензию 4-амино-3-хлор-6-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифенил)пиколиновой кислоты (полученной как в Valko, et al., патент США № 7314849 В2; 200 мг, 0,60 ммоль) в концентрированной HCl (2,0 мл) при 0°C. Обеспечивали непосредственное нагревание полученной густой неоднородной желтой смеси до комнатной температуры и ее перемешивали в течение 20 ч. Реакционную смесь фильтровали в вакууме и несколько раз промывали водой с получением указанного в заголовке соединения в виде желтовато-коричневого порошка (170 мг, 81%).

Пример 22. Получение метил-3,4-дихлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-5-фторпиколината (F43)



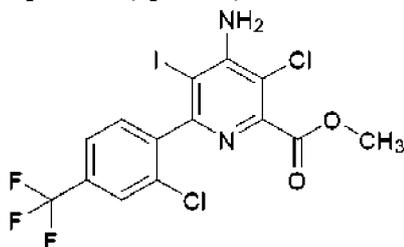
В раствор хлорида меди(II) (0,12 г, 0,94 ммоль) в CH₃CN (5 мл) добавляли *tert*-бутилнитрит (0,12 г, 1,17 ммоль) при комнатной температуре. Смесь перемешивали в течение 15 мин. и охлаждали до 0°C. Медленно добавляли раствор метил-4-амино-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-5-фторпиколината (С6; 0,3 г, 0,78 ммоль) в CH₃CN и реакционную смесь перемешивали при 0°C в течение 1 ч. и при комнатной температуре в течение 12 ч. Реакционную смесь разбавляли водой и экстрагировали с помощью EtOAc. Органический слой промывали солевым раствором, высушивали над Na₂SO₄ и концентрировали. В результате очистки с помощью флэш-хроматографии с 10% EtOAc в гексане в качестве элюента получали указанное в заголовке соединение в виде белого твердого вещества (0,25 г, 80%): т. пл. 86-88°C; ¹H ЯМР (300 МГц, CDCl₃) δ 7,78 (s, 1H), 7,69-7,64 (m, 1H), 7,61 (d, J=8,05 Гц, 1H), 4,01 (s, 3H); ESIMS масса/заряд 402 ([M+H]⁺).

Пример 23. Получение метил-4-амино-3-хлор-6-(2-хлор-4-

(трифторметил)фенил)-5-(метилтио)пиколината (С4)

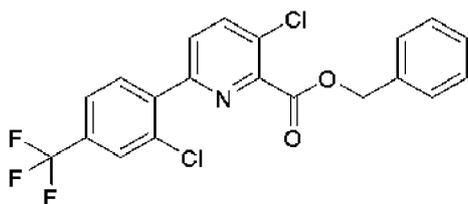
В раствор метил-4-амино-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-5-фторпиколината (С6; 0,2 г, 0,52 ммоль) в сухом DMF (2 мл) добавляли тиометоксид натрия (0,036 г, 0,52 ммоль) при комнатной температуре. Смесь нагревали до 55°C в течение 2 ч., охлаждали до комнатной температуры и разделяли между водой и EtOAc. Органический слой промывали насыщенным (насыщ.) раствором хлорида аммония (NH₄Cl) и соевым раствором, высушивали над Na₂SO₄ и концентрировали. В результате очистки с помощью флэш-хроматографии с 10% EtOAc в гексане в качестве элюента получали указанное в заголовке соединение в виде бесцветного масла (0,12 г, 57%): ¹H ЯМР (300 МГц, CDCl₃) δ 7,72 (d, *J*=1,65 Гц, 1H), 7,62-7,56 (m, 1H), 7,46 (d, *J*=8,01 Гц, 1H), 5,74 (s, 2H), 3,96 (s, 3H), 2,07 (s, 3H).

Пример 24. Получение метил-4-амино-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-5-йодпиколината (С5)



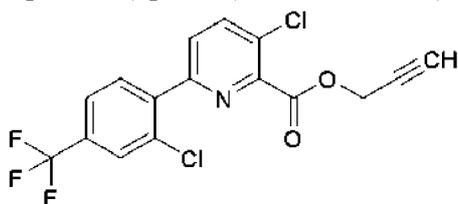
В раствор метил-4-амино-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)пиколината (С7; 0,2 г, 0,55 ммоль) в сухом MeOH (5 мл) добавляли периодную кислоту (0,05 г, 0,22 ммоль) и йод (0,07 г, 0,55 ммоль) при комнатной температуре. Полученную смесь коричневого цвета перемешивали при нагревании с обратным холодильником (65°C) в течение 12 ч. В реакционную смесь добавляли 5% раствор тиосульфата натрия. Твердое вещество удаляли посредством фильтрации и высушивали. Указанное в заголовке соединение выделяли в виде бесцветного твердого вещества (0,23 г, 85%): т. пл. 128-130°C; ¹H ЯМР (300 МГц, CDCl₃) δ 7,73 (s, 1H), 7,62 (d, *J*=7,99 Гц, 1H), 7,43 (d, *J*=7,95 Гц, 1H), 5,52 (s, 2H), 3,95 (s, 3H); ESIMS масса/заряд 491 ([M+H]⁺).

Пример 25. Получение бензил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)пиколината (F44)



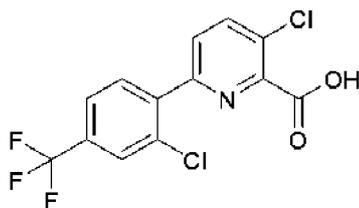
Перемешивали смесь 3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)пиколиновой кислоты (**F61**; 0,205 г, 0,610 ммоль), карбоната калия (0,126 г, 0,915 ммоль) и бензилбромида (0,087 мл, 0,732 ммоль) в DMF (3,1 мл) при комнатной температуре в течение ночи. Реакционную смесь выливали в насыщ. водный раствор (водн.) NaHCO_3 и экстрагировали с помощью EtOAc (2x). Объединенные органические слои высушивали над сульфатом магния (MgSO_4), фильтровали и концентрировали. В результате очистки с помощью колоночной хроматографии с градиентом гексан-EtOAc получали масло, которое кристаллизовалось при высушивании *in vacuo*. Указанное в заголовке соединение выделяли в виде белого твердого вещества (237 мг, 91%).

Пример 26. Получение проп-2-ин-1-ил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)пиколината (F45)



Перемешивали смесь 3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)пиколиновой кислоты (**F61**; 0,205 г, 0,610 ммоль), карбоната калия (0,126 г, 0,915 ммоль) и пропаргилбромида (0,082 мл, 0,732 ммоль) в DMF (3,1 мл) при комнатной температуре в течение ночи. Реакционную смесь выливали в насыщ. водн. раствор NaHCO_3 и экстрагировали с помощью EtOAc (2x). Объединенные органические слои высушивали над MgSO_4 , фильтровали и концентрировали. В результате очистки с помощью колоночной хроматографии с градиентом гексан-EtOAc получали масло, которое кристаллизовалось после применения минимального количества диэтилового эфира (Et_2O) и высушивания *in vacuo*. Указанное в заголовке соединение выделяли в виде белого твердого вещества (220 мг, 96%).

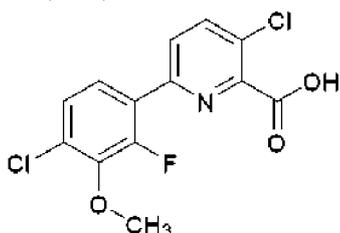
Пример 27. Получение 3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)пиколиновой кислоты (F61)



В раствор метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)пиколината (**F66**; 1,22 г,

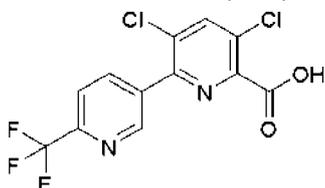
3,48 ммоль) в THF (8,7 мл) и MeOH (8,7 мл) добавляли 2 н. раствор гидроксида натрия (NaOH; 5,23 мл, 10,5 ммоль). Реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение ночи. Смесь выливали в 1 н. раствор HCl и экстрагировали с помощью EtOAc (2x). Объединенные органические слои высушивали над MgSO₄, фильтровали, концентрировали и высушивали *in vacuo*. Указанное в заголовке соединение выделяли в виде белого твердого вещества (1,13 г, 96%).

Пример 28. Получение 3-хлор-6-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифенил)пиколиновой кислоты (F78)



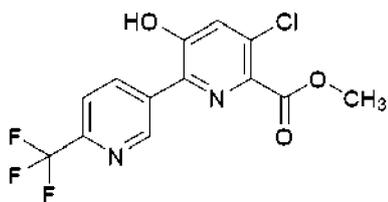
В раствор метил-3-хлор-6-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифенил)пиколината (полученного как в Ерр, J. V. et al. *Bioorg. Med. Chem.* **2016**, *24*, 362-371; 275 мг, 3,48 ммоль) в MeOH (30 мл) добавляли 1 н. раствор NaOH (30 мл, 10,5 ммоль). Реакционную смесь перемешивали при нагревании с обратным холодильником в течение 1 ч., охлаждали и подкисляли. Твердое вещество собирали и высушивали *in vacuo*. Указанное в заголовке соединение выделяли в виде белого твердого вещества (200 мг, 76%).

Пример 29. Получение 3,5-дихлор-6'-(трифторметил)-[2,3'-бипиридин]-6-карбоновой кислоты (F84)



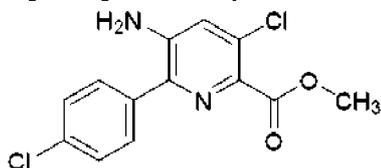
В раствор метил-3,5-дихлор-6'-(трифторметил)-[2,3'-бипиридин]-6-карбоксилата (F99; 0,119 г, 0,339 ммоль) в MeOH (0,7 мл) добавляли гидроксид натрия (1 М раствор; 1,0 мл, 1,0 ммоль). Раствор нагревали с обратным холодильником в течение 1 ч. и охлаждали до комнатной температуры. Реакционную смесь подкисляли с помощью HCl и разбавляли с помощью воды и DCM. Фазы разделяли и органический слой концентрировали с получением указанного в заголовке соединения в виде белого твердого вещества (0,093 г, 81%).

Пример 30. Получение метил-5-хлор-3-гидрокси-6'-(трифторметил)-[2,3'-бипиридин]-6-карбоксилата (F87)



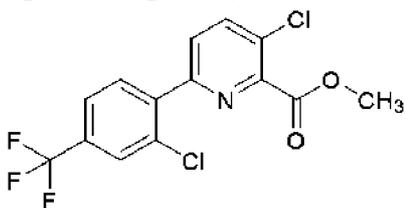
В раствор метил-5-хлор-3-фтор-6'-(трифторметил)-[2,3'-бипиридин]-6-карбоксилата (**F92**; 0,211 г, 0,671 ммоль) в MeOH (1,3 мл) добавляли NaOH (1 М раствор; 1,4 мл, 1,4 ммоль). Раствор нагревали с обратным холодильником в течение 30 мин. и охлаждали до комнатной температуры. Реакционную смесь подкисляли с помощью HCl и разбавляли с помощью DCM. Двухфазную смесь пропускали через разделитель фаз и фильтрат концентрировали с получением указанного в заголовке соединения в виде белого твердого вещества (0,052 г, 90%).

Пример 31. Получение метил-5-амино-3-хлор-6-(4-хлорфенил)пиколината (F72)



Суспендировали метил-5-ацетидамо-3-хлор-6-(4-хлорфенил)пиколинат (**C8**; 0,415 г, 1,224 ммоль) в MeOH (20 мл) и добавляли по каплям ацетилхлорид (1,740 мл, 24,47 ммоль). Реакционную смесь перемешивали в течение ночи при комнатной температуре и концентрировали в вакууме. Остаток разделяли между EtOAc и 5% водн. раствором NaHCO₃. Органическую фазу концентрировали на силикагеле. В результате очистки с помощью флэш-хроматографии с градиентом EtOAc-гексаны с последующей очисткой с помощью HPLC с обращенной фазой получали указанное в заголовке соединение в виде белого твердого вещества (0,080 г, 22%).

Пример 32. Получение метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)пиколината (F66)

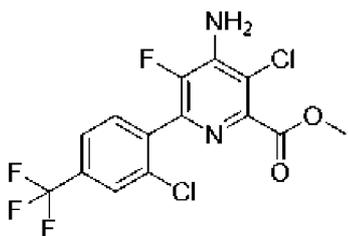


Перемешивали смесь (2-хлор-4-(трифторметил)фенил)бороновой кислоты (2,40 г, 10,7 ммоль), метил-3,6-дихлорпиколината (2 г, 9,71 ммоль), Pd(PPh₃)₂Cl₂ (0,681 г, 0,971 ммоль) и фторида калия (1,69 г, 29,1 ммоль) в CH₃CN (29 мл) и воде (9,7 мл) при нагревании с обратным холодильником (~85°C) в течение 4 ч. Реакционную смесь выливали в насыщ. водн. раствор NaHCO₃ и экстрагировали с помощью EtOAc (2x). Объединенные органические слои высушивали над MgSO₄, фильтровали и концентрировали. В результате очистки с помощью флэш-хроматографии с градиентом гексан-EtOAc получали твердое

вещество, которое растирали со смесью Et₂O-гексан (1:9). Твердое вещество фильтровали, промывали гексаном и высушивали *in vacuo*. Фильтрат концентрировали и полученное твердое вещество растирали с гексаном, фильтровали и промывали гексаном. Две партии твердого вещества объединяли и высушивали *in vacuo* с получением указанного в заголовке соединения в виде белого твердого вещества (1,97 г, 58%).

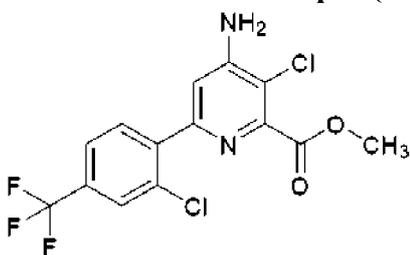
Следующие соединения получали аналогично процедуре, указанной в примере 32.

Метил-4-амино-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-5-фторпиколинат (С6)



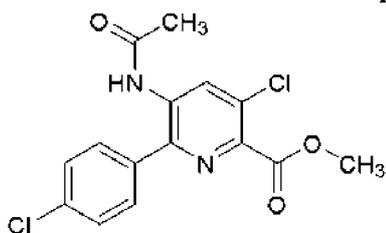
С использованием подходящих исходных материалов при нагревании в герметизированной пробирке для работы под давлением при 80°C в течение 12 ч. указанное в заголовке соединение синтезировали и выделяли в виде грязно-белого твердого вещества (300 мг, 37%): т. пл. 138-140°C; ¹H ЯМР (300 МГц, CDCl₃) δ 7,74 (d, *J*=1,64 Гц, 1H), 7,67-7,55 (m, 2H), 4,99 (s, 2H), 3,97 (s, 3H); LCMS(M+1)= 382,9.

Метил-4-амино-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)пиколинат (С7)



С использованием подходящих исходных материалов при нагревании в герметизированной пробирке для работы под давлением при 80°C в течение 12 ч. указанное в заголовке соединение синтезировали и выделяли в виде белой пены (2 г, 30%): ¹H ЯМР (300 МГц, CDCl₃) δ 7,72 (d, *J*=8,37 Гц, 2H), 7,63-7,59 (m, 1H), 7,59-7,53 (m, 1H), 4,90 (s, 2H), 3,99 (s, 3H).

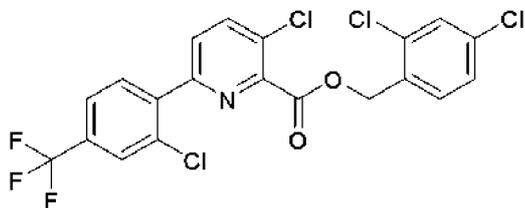
Метил-5-ацетидамо-3-хлор-6-(4-хлорфенил)пиколинат (С8)



С использованием подходящих исходных материалов в смеси 1:1 CH₃CN-вода при нагревании в микроволновом реакторе при 110°C в течение 20 мин. указанное в заголовке

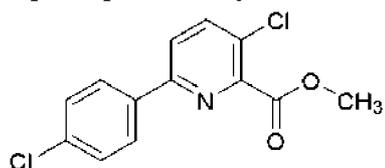
соединение синтезировали и выделяли в виде белого твердого вещества (0,415 г, 80%): т. пл. 146-150°C; ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,97 (s, 1H), 7,53 (d, $J=1,6$ Гц, 4H), 3,97 (s, 3H), 2,13 (s, 3H); ESIMS *масса/заряд* 338 ($[\text{M}-\text{H}]^-$).

Пример 33. Получение 2,4-дихлорбензил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)пиколината (F116)



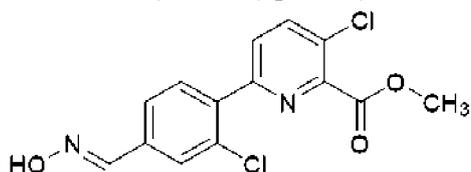
В раствор 3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)пиколиновой кислоты (F61; 0,077 г, 0,229 ммоль) в DCM (2,3 мл) добавляли (2,4-дихлорфенил)метанол (0,041 г, 0,229 ммоль), *N*-(3-диметиламинопропил)-*N'*-этилкарбодиимида гидрохлорид (EDC; 0,036 г, 0,229 ммоль) и 4-диметиламинопиридин (DMAP; 0,028 г, 0,229 ммоль). Реакционную смесь перемешивали в течение ночи и затем загружали непосредственно на Celite[®]. В результате очистки на силикагеле (градиент от 0 до 10% EtOAc-гексан) получали указанное в заголовке соединение в виде прозрачного масла (0,032 г, 28%).

Пример 34. Получение метил-3-хлор-6-(4-хлорфенил)пиколината (F82)



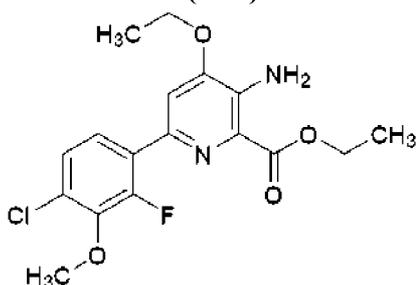
Перемешивали смесь 4-хлорфенилбороновой кислоты (7,0 г, 44,8 ммоль), метил-6-бром-3-хлорпиколината (7,5 г, 29,9 ммоль), dppb (2,0 г, 4,7 ммоль), Et_3N (20 мл, 143 ммоль) и $\text{Pd}(\text{OAc})_2$ (1,0 г, 4,5 ммоль) в CH_3CN при нагревании с обратным холодильником в течение ночи. Реакционную смесь выливали в воду и экстрагировали с помощью EtOAc. Объединенные органические экстракты промывали солевым раствором, высушивали над (Na_2SO_4), фильтровали и концентрировали. В результате очистки с помощью флэш-хроматографии со смесью 4:1 гексаны-EtOAc в качестве элюента получали смесь исходного материала и указанного в заголовке соединения. В результате очистки с помощью флэш-хроматографии со смесью 2:1 гексаны-DCM в качестве элюента (2x) получали указанное в заголовке соединение (1,9 г, 23%).

Пример 35. Получение метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-((гидроксиимино)метил)фенил)пиколината (F145)



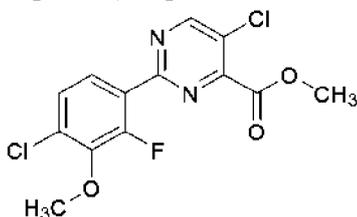
В раствор метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-формилфенил)пиколината (**F22**; 40 мг, 0,129 ммоль) в смеси H₂O/MeOH (5 мл, 1:2) добавляли последовательно гидрохлорид гидроксилamina (8,96 мг, 0,129 ммоль) и карбонат натрия (7,52 мг, 0,071 ммоль) и смесь перемешивали в течение ночи при 25°C. Реакционную смесь разбавляли водой (50 мл) и экстрагировали с помощью Et₂O (3×100 мл). Объединенные органические экстракты высушивали над безводным сульфатом магния, фильтровали и концентрировали. Твердое вещество высушивали в вакууме. Указанное в заголовке соединение выделяли в виде белого твердого вещества (24 мг, 56%) в виде смеси 5:1 *E/Z*.

Пример 36. Получение этил-3-амино-6-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифенил)-4-этоксипиколината (F77)



В раствор этил-(*E*)-3-хлор-6-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифенил)-4-(((метилсульфонил)окси)имино)-1,4,5,6-тетрагидропиридин-2-карбоксилата (полученного как в Renga, et al., патент США № 8598086; 200 мг, 0,440 ммоль) в EtOH (1,5 мл) добавляли последовательно карбонат калия (182 мг, 1,32 ммоль) и этюксид натрия (21% в EtOH; 427 мг, 1,32 ммоль). Реакционная смесь темнела. Через 10 мин. реакцию смесь гасили 1-молярным (M) раствором HCl и экстрагировали с помощью Et₂O. Объединенные органические экстракты промывали солевым раствором, высушивали с помощью Na₂SO₄, фильтровали и концентрировали. В результате очистки с помощью хроматографии на силикагеле с 30% Et₂O-пентан в качестве элюента получали указанное в заголовке соединение в виде грязно-белого твердого вещества (56 мг, 35%).

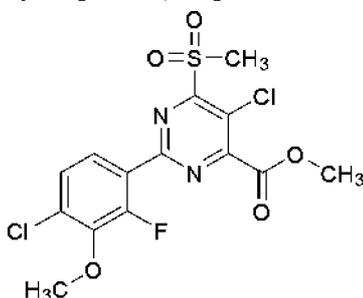
Пример 37. Получение метил-5-хлор-2-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифенил)пиримидин-4-карбоксилата (F115)



Растворяли метил-5-хлор-2-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифенил)-6-(метилсульфонил)пиримидин-4-карбоксилат (205 мг, 0,5 ммоль) в DMF (3 мл) и добавляли NaBH₄ (34 мг, 0,9 ммоль) порциями по 0,3 ммоль, пока исходный материал не израсходовался. Реакционную смесь концентрировали в вакууме и разделяли между EtOAc и водой. Органическую фазу высушивали и концентрировали. В результате очистки с

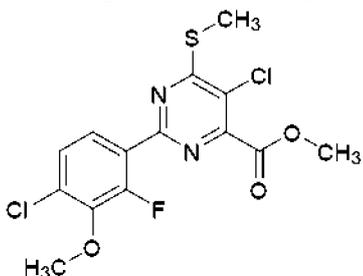
помощью флэш-хроматографии с градиентом EtOAc-гексаны получали указанное в заголовке соединение в виде белого твердого вещества (0,100 г, 60%).

Пример 38. Получение метил-5-хлор-2-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифенил)-6-(метилсульфонил)пиримидин-4-карбоксилата (C9)



Метил-5-хлор-2-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифенил)-6-(метилтио)пиримидин-4-карбоксилат (**C10**; 590 мг, 1,62 ммоль) и *мета*-хлорпероксибензойную кислоту (*m*-CPBA; 933 мг, 3,25 ммоль) объединяли в DCM (20 мл) и перемешивали при комнатной температуре в течение ночи. Затем реакционную смесь концентрировали и разделяли между EtOAc и водой. Органическую фазу промывали водой, высушивали и концентрировали. В результате очистки с помощью флэш-хроматографии с градиентом EtOAc-DCM получали указанное в заголовке соединение в виде неочищенного белого твердого вещества, которое переносили на следующую стадию (400 мг, 60%): ^1H ЯМР (300 МГц, CDCl_3) δ 7,90 (dd, $J=8,8, 7,4$ Гц, 1H), 7,31 (dd, $J=8,6, 1,8$ Гц, 1H), 4,09 (s, 3H), 4,02 (d, $J=1,1$ Гц, 3H), 3,52 (s, 3H); ESIMS *масса/заряд* 410 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

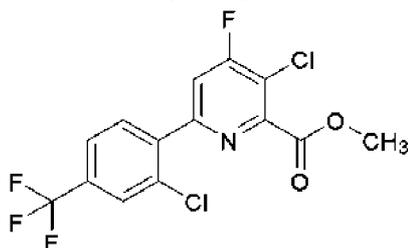
Пример 39. Получение метил-5-хлор-2-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифенил)-6-(метилтио)пиримидин-4-карбоксилата (C10)



Метил-2-бром-5-хлор-6-(метилтио)пиримидин-4-карбоксилат (полученный как в Ерр et al., WO 2007082076 A1; 3 г, 10 ммоль), (4-хлор-2-фтор-3-метоксифенил)бороновую кислоту (2,46 г, 12 ммоль), $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_2\text{Cl}_2$ (702 мг, 1 ммоль) и триэтиламин (4,2 мл, 30 ммоль) объединяли в диоксане (20 мл) и нагревали с обратным холодильником в течение 4 ч. Охлажденную реакционную смесь концентрировали в вакууме. В результате очистки с помощью флэш-хроматографии с градиентом EtOAc-гексаны получали указанное в заголовке соединение в виде неочищенного белого твердого вещества, которое переносили на следующую стадию (590 мг, 16%): ^1H ЯМР (300 МГц, CDCl_3) δ 7,85 (dd, $J=8,8, 7,4$ Гц, 1H), 7,31-7,23 (m, 1H), 4,05 (s, 3H), 4,03 (d, $J=1,1$ Гц, 3H), 2,69 (s, 3H); ESIMS *масса/заряд*

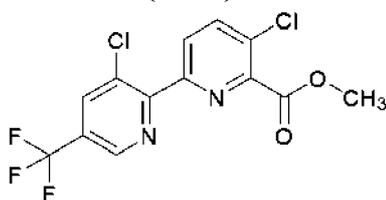
378 ($[M+H]^+$).

Пример 40. Получение метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-4-фторпиколината (F109)



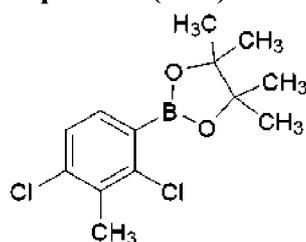
Перемешивали фторид цезия (160 мг, 1,0 ммоль) в безводном диметилсульфоксиде (DMSO; 10 мл) и нагревали до 100°C в течение 90 мин. Смесь нагревали в вакууме (20-50 мм рт. ст.), пока не отбирали 1-2 мл дистиллята с верхнего слоя. После охлаждения добавляли метил-3,4-дихлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)пиколинат (F108; 200 мг, 0,52 ммоль) и смесь нагревали при 100°C в течение 18 ч. Смесь разделяли между водой (10 мл) и EtOAc (30 мл). Органическую фазу промывали водой (5 мл) и солевым раствором (5 мл), высушивали и выпаривали. В результате очистки с помощью хроматографии на силикагеле с применением градиента 0-30% EtOAc-гексан получали указанное в заголовке соединение в виде белого твердого вещества (24 мг, 12%).

Пример 41. Получение метил-3',5'-дихлор-5'-(трифторметил)-[2,2'-бипиридин]-6-карбоксилата (F101)



Перемешивали дегазированную (аргоном) смесь метил-3-хлор-6-(триметилстаннил)пиколината (C16; 0,1 г, 0,299 ммоль), 3-хлор-2-йод-5-(трифторметил)пиридина (0,11 г, 0,359 ммоль), Pd(PPh₃)₂Cl₂ (0,031 г, 0,045 ммоль) в DCE (1,5 мл) под воздействием микроволнового излучения при 120°C в течение 30 мин. Реакционную смесь концентрировали с получением остатка. В результате очистки с помощью колоночной хроматографии на силикагеле с градиентом гексан-EtOAc получали указанное в заголовке соединение в виде желтого масла (0,069 г, 66%).

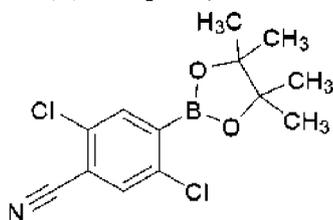
Пример 42. Получение 2-(2,4-дихлор-3-метилфенил)-4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолана (C11)



В перемешиваемый раствор 1-бром-2,4-дихлор-3-метилбензола (500 мг, 2,09 ммоль) и 4,4,4',4',5,5,5',5'-октаметил-2,2'-би(1,3,2-диоксаборолан) (637 мг, 2,51 ммоль) в 1,4-диоксане добавляли ацетат калия (304 мг, 3,10 ммоль) и смесь дегазировали в течение 10 мин. Добавляли [1,1'-бис(дифенилфосфино)ферроцен]дихлорпалладий(II) ($\text{Pd}(\text{dppf})\text{Cl}_2$; 152 мг, 0,2 ммоль) и смесь дегазировали в течение 10 мин. Смесь нагревали при 90°C в течение 5 ч., охлаждали и разбавляли с помощью EtOAc. Органический слой промывали водой и солевым раствором, высушивали над Na_2SO_4 и концентрировали. В результате очистки с помощью MPLC с 5% EtOAc-гексан в качестве элюента получали указанное в заголовке соединение в виде бесцветной жидкости (430 мг): ^1H ЯМР (300 МГц, CDCl_3) δ 7,41 (dd, $J=2,07, 8,10$ Гц, 1H), 7,26-7,23 (m, 1H), 2,47 (s, 3H), 1,37 (s, 12H). Примечание: полученное указанное в заголовке соединение было неочищенным (содержало диборан), и его применяли на следующей стадии без дополнительной очистки.

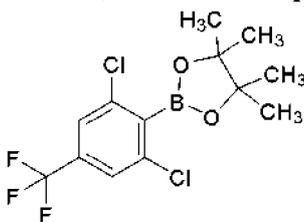
Следующее соединение получали подобно процедуре, указанной в примере 42.

2,5-Дихлор-4-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)бензонитрил (C12)



С использованием подходящих исходных материалов указанное в заголовке соединение синтезировали и выделяли: ^1H ЯМР (300 МГц, CDCl_3) δ 7,81 (d, $J=10,5$ Гц, 1H), 7,63 (d, $J=6,24$ Гц, 1H), 1,37 (s, 12H).

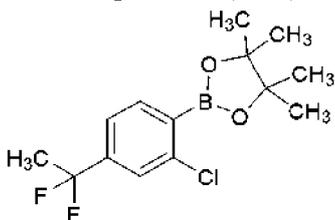
Пример 43. Получение 2-(2,6-дихлор-4-(трифторметил)фенил)-4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолана (C13)



В высушенной в печи, продутой азотом круглодонной колбе объемом 100 мл растворяли 1,3-дихлор-2-йод-5-(трифторметил)бензол (1,78 г, 5,22 ммоль) в THF (10 мл) и полученный раствор охлаждали на ледяной бане в атмосфере азота. Добавляли по каплям хлорид изопропилмагния(II) и лития (1,3 М в THF; 4,42 мл, 5,74 ммоль) при перемешивании в течение 5 мин. Через 1 ч. добавляли 2-изопропокси-4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан (1,17 мл, 5,74 ммоль) и обеспечивали нагревание реакционной смеси до комнатной температуры и перемешивали ее в течение ночи. Реакционную смесь разделяли между EtOAc и насыщ. водн. раствором NH_4Cl ; слои разделяли и органический слой высушивали над Na_2SO_4 . В результате фильтрации и концентрирования при пониженном

давлении получали указанное в заголовке соединение в виде оранжевого масла (1,74 г, 98%, в виде смеси 5:1 с 1,3-дихлор-5-(трифторметил)бензолом: ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 7,48 (s, 2H), 1,43 (s, 12H); ^{13}C ЯМР (101 МГц, CDCl_3) δ 138,83, 133,70 (q, $J=33,8$ Гц), 123,71 (q, $J=3,8$ Гц), 122,54 (q, $J=274,72$ Гц), 85,45, 24,70, замещенный бором углерод слишком широкий, чтобы быть наблюдаемым; ^{19}F ЯМР (376 МГц, CDCl_3) δ -63,23; EIMS масса/заряд 340.

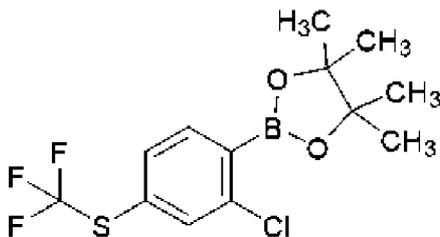
Пример 44. Получение 2-(2-хлор-4-(1,1-дифторэтил)фенил)-4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолана (C14)



Стадия 1 - получение 1-бром-2-хлор-4-(1,1-дифторэтил)бензола. В герметизированном сосуде перемешивали смесь 1-(4-бром-3-хлорфенил)этан-1-она (1 г, 4,28 ммоль) и Deoxofluor (3,16 мл, 17,1 ммоль) при 85°C в течение 2 ч. Реакционную смесь выливали в насыщ. NaHCO_3 и экстрагировали с помощью EtOAc (2x). Объединенные органические слои высушивали над MgSO_4 , фильтровали и концентрировали. В результате очистки остатка с помощью колоночной хроматографии с обращенной фазой (C_{18}) с градиентом вода-ацетонитрил получали указанные в заголовке соединения в виде коричневого масла (0,802 г, 62%, чистота 85%): ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 7,68 (dd, $J=8,3$, 1,0 Гц, 1H), 7,60 (dd, $J=2,1$, 1,0 Гц, 1H), 7,29-7,20 (m, 1H), 1,90 (t, $J=18,1$ Гц, 3H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, CDCl_3) δ -88,19; EIMS масса/заряд 256.

Стадия 2 - получение 2-(2-хлор-4-(1,1-дифторэтил)фенил)-4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолана. В раствор 1-бром-2-хлор-4-(1,1-дифторэтил)бензола (0,4 г, 1,33 ммоль) в THF (5,3 мл) при 0°C добавляли по каплям хлорид изопропилмагния(II) и лития (1,3 М раствор в THF; 1,23 мл, 1,60 ммоль). Реакционную смесь перемешивали при 0°C в течение 1 ч., затем добавляли 2-изопропокси-4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан (0,407 мл, 1,99 ммоль) и реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 2 ч. Смесь выливали в полунасыщенный раствор NH_4Cl и экстрагировали с помощью EtOAc (2x). Объединенные органические слои высушивали над MgSO_4 , фильтровали и высушивали *in vacuo*. Указанное в заголовке соединение выделяли в виде коричневого масла и применяли без дополнительной очистки на следующей стадии (361 мг, 90%). EIMS масса/заряд 302.

Пример 45. Получение 2-(2-хлор-4-((трифторметил)тио)фенил)-4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолана (C15)



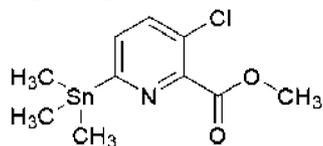
Стадия 1 - получение 2-хлор-4-((трифторметил)тио)фенола. Последовательно добавляли 4-((трифторметил)тио)фенол (0,971 г, 5 ммоль), толуол (12,5 мл) и диизобутиламин (87 мкл, 0,5 ммоль) в круглодонную колбу объемом 100 мл. Добавляли по каплям сульфурилдихлорид (0,405 мл, 5 ммоль) и реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 1 ч. Реакционную смесь концентрировали. В результате очистки остатка с помощью хроматографии на силикагеле с градиентом 0-10% EtOAc-гексан получали указанное в заголовке соединение в виде прозрачного масла (0,888 г, 78%): ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 7,65 (d, $J=2,2$ Гц, 1H), 7,48 (dd, $J=8,5, 2,2$ Гц, 1H), 7,06 (d, $J=8,5$ Гц, 1H); ^{13}C ЯМР (101 МГц, CDCl_3) δ 154,0, 137,1 (d, $J=10,5$ Гц), 130,9, 127,8, 120,6, 117,2, 115,9 (d, $J=2,3$ Гц); EIMS *масса/заряд* 228.

Стадия 2 - получение 2-хлор-4-((трифторметил)тио)фенилтрифторметансульфоната. Помещали 2-хлор-4-((трифторметил)тио)фенол (0,492 г, 2,15 ммоль) в сцинтилляционный флакон и растворяли в сухом DCM (4,3 мл). Раствор охлаждали до 0°C и последовательно добавляли пиридин (0,348 мл, 4,3 ммоль) и трифторметансульфоновый ангидрид (0,434 мл, 2,58 ммоль). Обеспечивали нагревание реакционной смеси до комнатной температуры. Через 2 ч. реакционную смесь гасили с помощью насыщ. NaHCO_3 , разбавляли с помощью воды и DCM и пропускали через разделитель фаз. Фильтрат концентрировали. В результате очистки с помощью хроматографии на силикагеле с градиентом 0-10% EtOAc-гексан получали указанное в заголовке соединение в виде прозрачного масла (0,633 г, 82%): ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 7,85 (d, $J=2,2$ Гц, 1H), 7,65 (dd, $J=8,6, 2,2$ Гц, 1H), 7,43 (d, $J=8,6$ Гц, 1H); ^{13}C ЯМР (101 МГц, CDCl_3) δ 147,4, 138,3, 135,8, 132,1, 130,9, 130,5, 129,9, 128,3, 127,4, 126,2, 123,8, 120,2, 116,9; EIMS *масса/заряд* 360.

Стадия 3 - получение 2-(2-хлор-4-((трифторметил)тио)фенил)-4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолана. Помещали 2-хлор-4-((трифторметил)тио)фенилтрифторметансульфонат (0,614 г, 1,702 ммоль), 4,4,4',4',5,5,5',5'-октаметил-2,2'-би(1,3,2-диоксаборолан) (0,562 г, 2,21 ммоль), ацетат калия (0,334 г, 3,4 ммоль) и $\text{Pd}(\text{dppf})\text{Cl}_2$ (0,124 г, 0,170 ммоль) в сцинтилляционный флакон и добавляли диоксан (8,5 мл). Реакционную смесь нагревали при 90°C в течение ночи. Реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры и разбавляли с помощью воды и EtOAc. Слои разделяли и водный слой экстрагировали с помощью EtOAc (2x). Объединенные органические экстракты промывали солевым раствором, высушивали над Na_2SO_4 , фильтровали и концентрировали. В результате очистки с помощью хроматографии на

силикагеле с градиентом EtOAc-гексан, 0-25%, получали указанное в заголовке соединение в виде прозрачного масла, которое затвердевало со временем (0,303 г, 53%): ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 7,73 (d, $J=7,8$ Гц, 1H), 7,65 (d, $J=1,7$ Гц, 1H), 7,51 (dd, $J=7,8, 1,6$ Гц, 1H), 1,37 (s, 12H); ^{13}C ЯМР (126 МГц, CDCl_3) δ 140,1, 137,0, 136,0, 133,0, 130,5, 129,2-126,5 (m), 84,6, 24,8; EIMS *масса/заряд* 338.

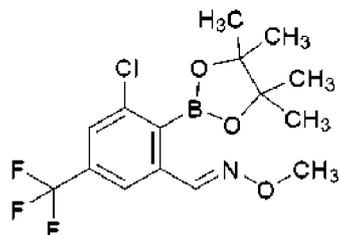
Пример 46. Получение метил-3-хлор-6-(триметилстаннил)пиколината (C16)



Перемешивали дегазированную (азотом) смесь метил-3,6-дихлорпиколината (0,577 г, 2,80 ммоль), $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_2\text{Cl}_2$ (0,197 г, 0,28 ммоль) и 1,1,1,2,2,2-гексаметилдистаннана (0,917 г, 2,80 ммоль) в сухом диоксане (10 мл) при 80°C в течение 2 ч. и затем охлаждали до 20°C . Коричневый раствор адсорбировали на нейтральном оксиде алюминия. В результате очистки с помощью колоночной хроматографии с применением 0-20% этилацетат-гексан получали указанное в заголовке соединение в виде прозрачной жидкости (870 мг, 79%): ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 7,60 (d, $J=8,0$ Гц, 1H), 7,48 (d, $J=8,0$ Гц, 1H), 4,00 (s, 3H), 0,36 (s, 9H); EIMS *масса/заряд* 334.

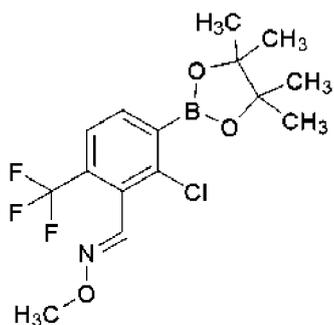
Следующие соединения получали аналогично процедуре, указанной в примере 42.

(E)-3-Хлор-2-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)-5-(трифторметил)бензальдегид-O-метилоксим (C17)



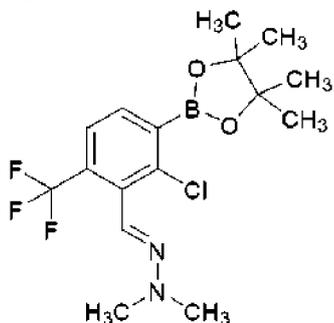
С использованием подходящих исходных материалов указанное в заголовке соединение синтезировали и выделяли в виде белого твердого вещества (150 мг, 52%): ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,15 (s, 1H), 7,86 (d, $J=1,2$ Гц, 1H), 7,56 (d, $J=1,5$ Гц, 1H), 4,00 (s, 3H), 1,43 (s, 12H).

(E)-2-Хлор-3-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)-6-(трифторметил)бензальдегид-O-метилоксим (C18)



С использованием подходящих исходных материалов указанное в заголовке соединение синтезировали и выделяли в виде белого твердого вещества (25 мг, 44%): ^1H ЯМР (300 МГц, CDCl_3) δ 8,25 (d, $J=2,1$ Гц, 1H), 7,76 (d, $J=7,8$ Гц, 1H), 7,60 (d, $J=8,0$ Гц, 1H), 3,99 (s, 3H), 1,37 (s, 12H).

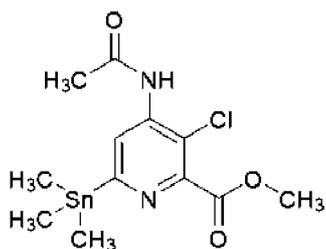
(E)-2-(2-Хлор-3-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)-6-(трифторметил)бензилден)-1,1-диметилгидразин (C19)



С использованием подходящих исходных материалов указанное в заголовке соединение синтезировали и выделяли в виде белого твердого вещества (180 мг, 63%): ^1H ЯМР (300 МГц, CDCl_3) δ 7,58 (m, 2H), 7,30 (s, 1H), 2,99 (s, 6H), 1,37 (s, 12H).

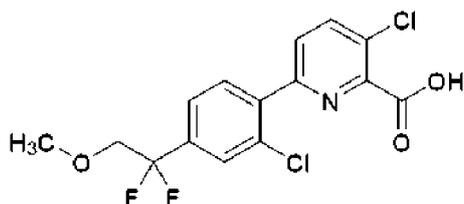
Следующее соединение получали подобно процедуре, указанной в **примере 46**.

Метил-4-ацетидамо-3-хлор-6-(триметилстаннил)пиколинат (C20)



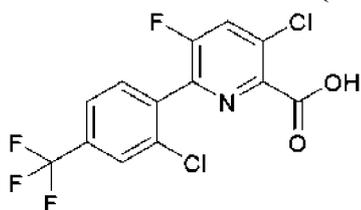
С использованием подходящих исходных материалов и следуя процедуре, указанной в WO 2003011853, указанное в заголовке соединение синтезировали и выделяли в виде светло-желтого твердого вещества (3,05 г, 84%).

Пример 47. Получение 3-хлор-6-(2-хлор-4-(1,1-дифтор-2-метоксиэтил)фенил)пиколиновой кислоты (F179)



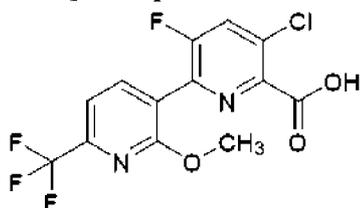
В раствор метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(1,1-дифтор-2-метоксиэтил)фенил)пиколината (**F177**; 0,07 г, 0,186 ммоль) в THF:MeOH:H₂O (соотношение 2:1:1; 10 мл) добавляли гидрат гидроксида лития (LiOH·H₂O; 0,02 г, 0,37 ммоль) при 0°C и реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 16 ч. Реакционную смесь концентрировали при пониженном давлении. Остаток поглощали водой; смесь подкисляли с помощью 1 н. HCl (pH ~ 2) и раствор экстрагировали с помощью DCM (2×30 мл). Органический слой промывали солевым раствором, высушивали над безводным Na₂SO₄, фильтровали и концентрировали при пониженном давлении с получением указанного в заголовке соединения в виде коричневой жидкости (0,04 г, 70%).

Пример 48. Получение 3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-5-фторпиколиновой кислоты (F352)



Добавляли бромид лития (0,236 г, 2,72 ммоль) в раствор метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-5-фторпиколината (**F107**; 0,100 г, 0,272 ммоль) и триэтиламина (0,082 г, 0,815 ммоль) и реакционную смесь нагревали при 60°C. Через 5 мин. образовывался белый осадок, и реакционную смесь разбавляли с помощью воды и DCM и пропускали через разделитель фаз. Фильтрат концентрировали и осадок растворяли в DCM, промывали с помощью 2 М HCl и пропускали через разделитель фаз. Фильтрат концентрировали. Указанное в заголовке соединение извлекали в виде белого твердого вещества (81 мг, 84%).

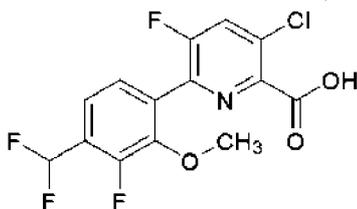
Пример 49. Получение 5-хлор-3-фтор-2'-метокси-6'-(трифторметил)-[2,3'-бипиридин]-6-карбоновой кислоты (F386)



В реакционный сосуд, содержащий метил-5-хлор-2',3-дифтор-6'-(трифторметил)-[2,3'-бипиридин]-6-карбоксилат (**F354**; 0,100 г, 0,284 ммоль), добавляли THF (2,8 мл) и гидроксид натрия (0,851 мл, 0,851 ммоль). Через 1 ч. завершали гидролиз метилового

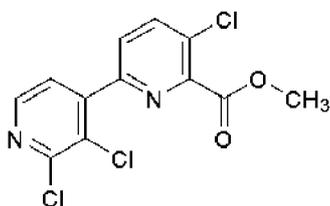
сложного эфира. Добавляли метанол (1,15 мл, 28,4 ммоль) и полученную реакционную смесь перемешивали в течение ночи при комнатной температуре. Смесь подкисляли путем добавления небольшого избытка 2 н. HCl. Смесь фильтровали и концентрировали в вакууме, но не до сухого состояния. Осадок, который образовывался, промывали водой и высушивали в вакууме. Указанное в заголовке соединение выделяли в виде белого твердого вещества (80 мг, 77%).

Пример 50. Получение 3-хлор-6-(4-(дифторметил)-3-фтор-2-метоксифенил)-5-фторпиколиновой кислоты (F391)



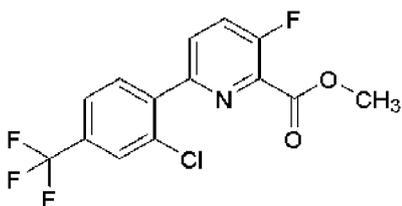
В реакционный сосуд, содержащий метил-3-хлор-6-(4-(дифторметил)-3-фтор-2-метоксифенил)-5-фторпиколинат (**F253**; 0,130 г, 0,357 ммоль), добавляли THF (3,57 мл) и гидроксид натрия (0,715 мл, 0,715 ммоль). Реакционную смесь перемешивали в течение ночи при комнатной температуре и подкисляли путем добавления небольшого избытка 2 н. HCl. Смесь концентрировали и осадок, который образовывался, промывали водой и высушивали в вакууме. Указанное в заголовке соединение выделяли в виде белого твердого вещества (100 мг, 77%).

Пример 51. Получение метил-2',3',5-трихлор-[2,4'-бипиридин]-6-карбоксилата (F86)



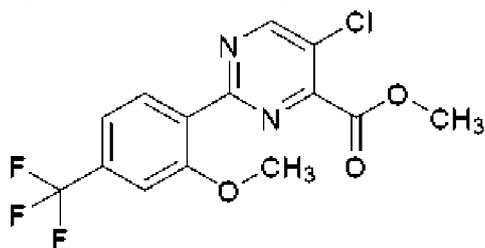
Раствор (2,3-дихлорпиридин-4-ил)бороновой кислоты (200 мг, 1,04 ммоль), фторида цезия (475 мг, 3,13 ммоль) и метил-3,6-дихлорпиколината (215 мг, 1,04 ммоль) в ацетонитриле (3910 мкл) и воде (1303 мкл) дегазировали (азотом) в течение 20 мин. перед добавлением Pd(PPh₃)₂Cl₂ (73 мг, 0,104 ммоль) и полученное нагревали до 60-65°C. После нагревания в течение 2 ч. реакционную смесь охлаждали и загружали непосредственно на силикагель. В результате очистки с помощью хроматографии с обращенной фазой получали указанное в заголовке соединение в виде белого твердого вещества (62 мг, 18%).

Пример 52. Получение метил-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-3-фторпиколината (F113)



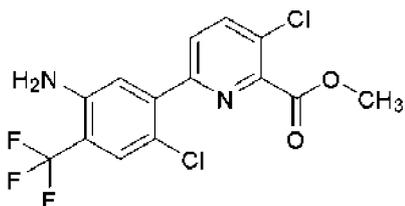
Раствор метил-6-хлор-3-фторпиколината (300 мг, 1,58 ммоль), (2-хлор-4-(трифторметил)фенил)бороновой кислоты (533 мг, 2,37 ммоль), фторида цезия (1,242 г, 8,18 ммоль) в ацетонитриле (6 мл) и воде (2 мл) дегазировали (азотом) в течение 20 мин. перед добавлением $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_2\text{Cl}_2$ (0,111 г, 0,158 ммоль) и полученное нагревали до 60-65°C в течение 6 ч. После первых 30 мин. реакционная смесь становилась прозрачно-красной/оранжевой, что сохранялось в течение реакции. Реакционную смесь загружали непосредственно на силикагель. В результате очистки с помощью автоматизированной колоночной хроматографии с градиентным элюированием подвижной фазой гексаны-этилацетат (от 0 до 20% за 12 объемов колонки; 40% этилацетата за 4 объема колонки) получали указанное в заголовке соединение в виде белого твердого вещества (174 мг, 31%).

Пример 53. Получение метил-5-хлор-2-(2-метокси-4-(трифторметил)фенил)пиримидин-4-карбоксилата (F313)



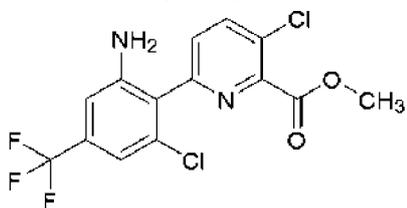
Растворяли фторид калия (0,146 г, 2,51 ммоль) в воде (2,4 мл) в сосуде для микроволновой обработки. Добавляли метил-2,5-дихлорпиримидин-4-карбоксилат (0,4 г, 1,9 ммоль), (2-метокси-4-(трифторметил)фенил)бороновую кислоту (0,446 г, 2,03 ммоль) и бис(трифенилфосфин)палладия хлорид (0,068 г, 0,097 ммоль) с последующим добавлением 1,4-диоксана (7,25 мл). Полученную реакционную смесь нагревали в микроволновом реакторе Biotage при 110°C в течение 20 мин. Охлажденную реакционную смесь разделяли между DCM и солевым раствором. Органическую фазу высушивали и концентрировали. В результате очистки с помощью флэш-хроматографии (от 1 до 10% этилацетата в гексанах) получали указанное в заголовке соединение в виде белого твердого вещества (255 мг, 37%).

Пример 54. Получение метил-6-(5-амино-2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-3-хлорпиколината (F211)



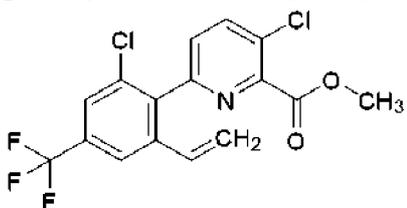
Помещали 1-бутил-3-метилимидазолия трифторметансульфонат (0,33 мл, 0,150 ммоль) и хлорид железа(III) (8,1 мг, 0,050 ммоль) в 1-драхмовый флакон и перемешивали при комнатной температуре в течение 30 мин. Последовательно добавляли *N*-хлорсукцинимид (0,140 г, 1,05 ммоль) и раствор метил-6-(3-амино-4-(трифторметил)фенил)-3-хлорпиколината (**F218**; 0,331 г, 1,0 ммоль) в THF (0,63 мл). Реакционную смесь нагревали при 60°C в течение ночи. Реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры, разбавляли этилацетатом и промывали насыщ. раствором тиосульфата натрия и соевым раствором. Анализ спектров ¹H ЯМР показал смесь изомеров, содержащих хлор в положениях 2 и 6. В результате очистки с помощью хроматографии на силикагеле получали указанное в заголовке соединение в виде бежевого твердого вещества (102 мг, 28%).

Пример 55. Получение метил-6-(2-амино-6-хлор-4-(трифторметил)фенил)-3-хлорпиколината (F213)



Разбавляли метил-3-хлор-6-(2-хлор-6-нитро-4-(трифторметил)фенил)пиколинат (**F206**; 309 мг, 0,782 ммоль) этанолом (1738 мкл), водой (869 мкл) и уксусной кислотой (470 мг, 7,82 ммоль) в сосуде объемом 5 мл. Добавляли порошок железа (87 мг, 1,56 ммоль) и реакцию перемешивали при комнатной температуре. Скорость реакции снижалась через 1 ч., и применяли четыре порции очищенного железа для полного расходования исходного материала. Анализ с помощью TLC показал 3 пятна - исходный материал, промежуточное соединение гидросиламина и продукт. Обеспечивали протекание реакции, пока не оставалось одно пятно. Реакционную смесь разбавляли этилацетатом и водой и нейтрализовали с помощью насыщ. водн. NaHCO₃. Слои разделяли и органическую фазу экстрагировали этилацетатом (3х). Проводили очистку остатка с помощью хроматографии с градиентом 0-50% этилацетат-гексаны. Указанное в заголовке соединение выделяли в виде белого твердого вещества (108 мг, 38%).

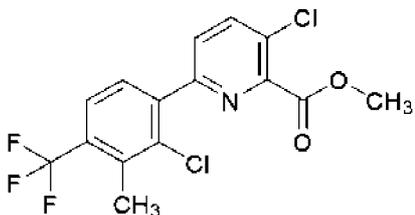
Пример 56. Получение метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)-6-винилфенил)пиколината (F216)



Метил-3-хлор-6-(2-хлор-6-йод-4-(трифторметил)фенил)пиколинат (**F214**; 95 мг,

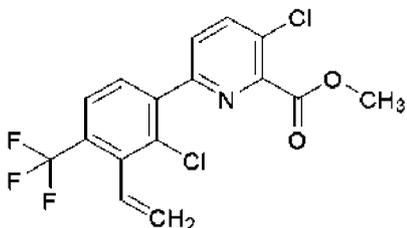
0,200 ммоль), трибутил(винил)станнан (79 мг, 0,249 ммоль) и толуол добавляли в сосуд объемом 25 мл. Смесь дегазировали азотом в течение 10 мин. перед добавлением Pd(dppf)Cl₂ в виде комплекса с дихлорметаном (1:1; 15 мг, 0,020 ммоль) и нагревали при 100°C в течение 16 ч. Смесь концентрировали при пониженном давлении, поглощали этилацетатом (100 мл) и обрабатывали насыщ. раствором фторида калия (50 мл) в течение ночи. Смесь фильтровали через слой Celite® и органический слой разделяли и высушивали над сульфатом натрия, фильтровали и концентрировали при пониженном давлении с получением остатка. Проводили очистку с помощью хроматографии (силикагель, гептан-этилацетат) с получением белого твердого вещества (46 мг, 55%).

Пример 57. Получение метил-3-хлор-6-(2-хлор-3-метил-4-(трифторметил)фенил)пиколината (F136)



Раствор метил-6-(3-бром-2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-3-хлорпиколината (F140; 150 мг, 0,349 ммоль), 2,4,6-триметил-1,3,5,2,4,6-триоксатриборинана (0,06 мл, 0,419 ммоль) и карбоната цезия (228 мг, 0,699 ммоль) в 1,4-диоксане (10 мл) и воде (1 мл) продували аргоном в течение 10 мин. В вышеуказанную смесь добавляли комплекс [1,1'-бис(дифенилфосфино)ферроцен]дихлорпалладия(II) (26 мг, 0,034 ммоль). Смесь продували аргоном в течение 10 мин. и нагревали до 100°C в течение 3 ч. Реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры, фильтровали через слой Celite® и промывали с помощью EtOAc. Слой фильтрата промывали водой и солевым раствором и концентрировали в вакууме. В результате очистки остатка с помощью колоночной хроматографии с 15% EtOAc в гексане в качестве элюента получали указанное в заголовке соединение в виде белого твердого вещества (80 мг, 31%).

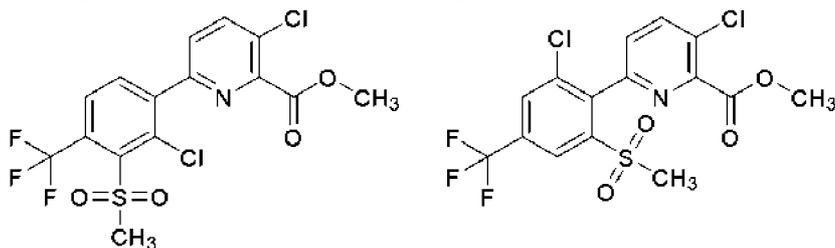
Пример 58. Получение метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)-3-винилфенил)пиколината (F137)



Раствор метил-6-(3-бром-2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-3-хлорпиколината (F140; 150 мг, 0,349 ммоль), 4,4,5,5-тетраметил-2-винил-1,3,2-диоксаборолана (0,09 мл, 0,524 ммоль) и карбоната натрия (110 мг, 1,048 ммоль) в 1,4-диоксане (10 мл) и воде (1 мл) продували аргоном в течение 10 мин. В вышеуказанную смесь добавляли

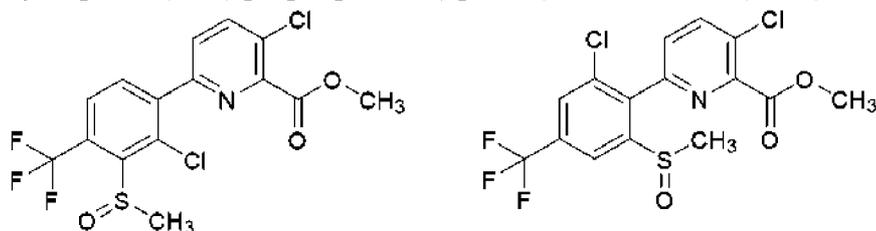
тетракис(трифенилфосфин)палладий(0) (40 мг, 0,034 ммоль), ее снова продували аргоном в течение 10 мин. и нагревали до 100°C в течение 2 ч. Реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры, фильтровали через слой Celite® и промывали с помощью EtOAc. Фильтрат промывали водой и солевым раствором и затем концентрировали в вакууме. В результате очистки с помощью колоночной хроматографии с 15% EtOAc в гексане в качестве элюента получали указанное в заголовке соединение в виде белого твердого вещества (25 мг, 19%).

Пример 59. Получение метил-3-хлор-6-(2-хлор-3-(метилсульфонил)-4-(трифторметил)фенил)пиколината (F139) и метил-3-хлор-6-(2-хлор-6-(метилсульфонил)-4-(трифторметил)фенил)пиколината (F138)



В раствор метил-3-хлор-6-(2-хлор-3-(метилсульфинил)-4-(трифторметил)фенил)пиколината и метил-3-хлор-6-(2-хлор-6-(метилсульфинил)-4-(трифторметил)фенил)пиколината (F119 и F120; 250 мг, 0,630 ммоль) в уксусной кислоте (2 мл) добавляли тетрагидрат пербората натрия (194 мг, 1,261 ммоль) при комнатной температуре. Реакционную смесь нагревали до 100°C в течение 16 ч., охлаждали до комнатной температуры и медленно выливали в насыщ. раствор бикарбоната натрия. Смесь экстрагировали с помощью EtOAc. Органический слой промывали водой и солевым раствором и концентрировали в вакууме. В результате очистки полученного материала с помощью колоночной хроматографии с применением 30% EtOAc в гексане в качестве элюента с последующей очисткой с помощью препаративной HPLC получали указанные в заголовке соединения в виде белого твердого вещества (40 мг, 15%) и в виде белого твердого вещества (15 мг, 6%) соответственно.

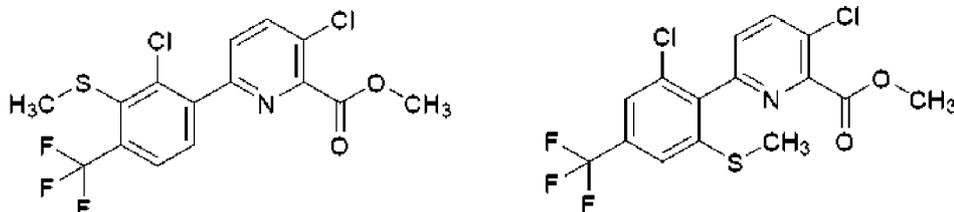
Пример 60. Получение метил-3-хлор-6-(2-хлор-3-(метилсульфинил)-4-(трифторметил)фенил)пиколината (F119) и метил-3-хлор-6-(2-хлор-6-(метилсульфинил)-4-(трифторметил)фенил)пиколината (F120)



В раствор метил-3-хлор-6-(2-хлор-3-(метилтио)-4-(трифторметил)фенил)пиколината и метил-3-хлор-6-(2-хлор-6-(метилтио)-4-

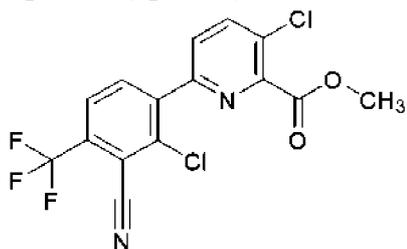
(трифторметил)фенил)пиколината (**F121** и **F122**; 200 мг, 0,504 ммоль) в уксусной кислоте (2 мл) добавляли тетрагидрат пербората натрия (78 мг, 0,504 ммоль) при комнатной температуре. Реакционную смесь нагревали до 100°C в течение 2 ч., охлаждали до комнатной температуры, медленно выливали в насыщ. раствор бикарбоната натрия. Смесь экстрагировали с помощью EtOAc. Органический слой промывали водой и соевым раствором и концентрировали в вакууме. В результате очистки полученного материала с помощью колоночной хроматографии с применением 30% EtOAc в гексане в качестве элюента с последующей очисткой с помощью препаративной HPLC получали указанные в заголовке соединения в виде бесцветной жидкости (33 мг, 16%) и в виде коричневого твердого вещества (70 мг, 34%) соответственно.

Пример 61. Получение метил-3-хлор-6-(2-хлор-3-(метилтио)-4-(трифторметил)фенил)пиколината (F121) и метил-3-хлор-6-(2-хлор-6-(метилтио)-4-(трифторметил)фенил)пиколината (F122)



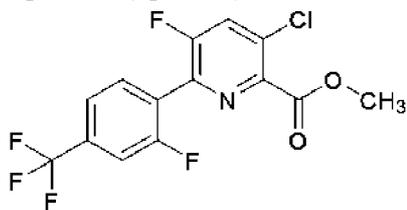
Раствор метил-3,6-дихлорпиколината (245 мг, 1,189 ммоль), 2-(2-хлор-3-(метилтио)-4-(трифторметил)фенил)-4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолана, 2-(2-хлор-6-(метилтио)-4-(трифторметил)фенил)-4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолана (500 мг, 1,427 ммоль) и фторида калия (207 мг, 3,567 ммоль) в ацетонитриле (15 мл) и воде (5 мл) продували аргоном в течение 10 мин. В вышеуказанную смесь добавляли бис(трифенилфосфин)палладия(II) дихлорид (83 мг, 0,118 ммоль) и смесь продували аргоном в течение 10 мин. и нагревали до 90°C в течение 5 ч. Реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры, фильтровали через слой Celite® и промывали с помощью EtOAc. Фильтрат промывали водой и соевым раствором и концентрировали в вакууме. В результате очистки полученного материала с помощью колоночной хроматографии с применением 15% EtOAc в гексане с последующей очисткой с помощью препаративной HPLC получали указанные в заголовке соединения в виде бесцветной жидкости (50 мг, 9%) и в виде белого твердого вещества (200 мг, 36%) соответственно.

Пример 62. Получение метил-3-хлор-6-(2-хлор-3-циано-4-(трифторметил)фенил)пиколината (F143)



Раствор метил-6-(3-бром-2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-3-хлорпиколината (**F140**; 150 мг, 0,349 ммоль), цианида цинка (62 мг, 0,52 ммоль) и тетраакс(трифенилфосфин)палладия(0) (40 мг, 0,034 ммоль) в DMF (5 мл) продували аргоном в течение 10 мин. Реакционную смесь нагревали до 150°C в течение 6 ч. и охлаждали до комнатной температуры. Реакционную смесь выливали в ледяную воду и экстрагировали с помощью EtOAc. Органический слой промывали водой и солевым раствором и концентрировали в вакууме. В результате очистки полученного материала с помощью колоночной хроматографии с применением 20% EtOAc в гексане получали указанное в заголовке соединение в виде грязно-белого твердого вещества (40 мг, 30%).

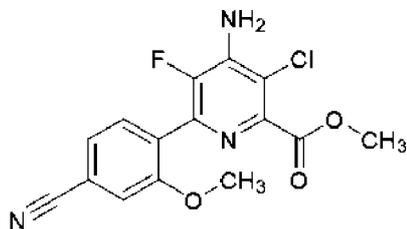
Пример 63. Получение метил-3-хлор-5-фтор-6-(2-фтор-4-(трифторметил)фенил)пиколината (F158)



Растворяли карбонат калия (0,241 г, 1,74 ммоль) в воде (1,67 мл) в сосуде для микроволновой обработки. Добавляли (2-фтор-4-(трифторметил)фенил)бороновую кислоту (0,292 г, 1,406 ммоль), метил-3,6-дихлор-5-фторпиколинат (0,300 г, 1,339 ммоль) и бис(трифенилфосфин)палладия дихлорид (0,094 г, 0,134 ммоль) с последующим добавлением 1,4-диоксана (5,02 мл). Полученную реакционную смесь нагревали в микроволновом реакторе Biotage при 110°C в течение 20 мин. Охлажденную реакционную смесь разделяли между DCM и водой. Органическую фазу высушивали и концентрировали. В результате очистки с помощью хроматографии с обращенной фазой с последующей очисткой с помощью флэш-хроматографии (от 1 до 10% EtOAc в гексанах) получали указанное в заголовке соединение в виде белого твердого вещества (353 мг, 71%).

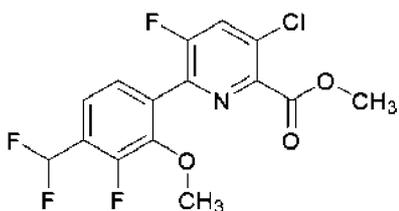
Следующее соединение получали подобно процедуре, указанной в примере 63.

Метил-4-амино-3-хлор-6-(4-циано-2-метоксифенил)-5-фторпиколинат (C21)



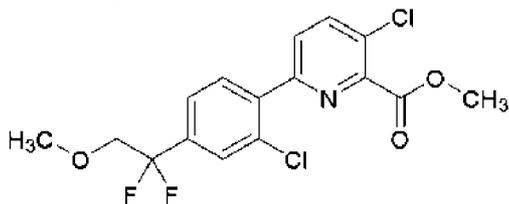
С использованием подходящих исходных материалов указанное в заголовке соединение синтезировали и выделяли в виде грязно-белого твердого вещества (118 мг, 13%).

Пример 64. Получение метил-3-хлор-6-(4-(дифторметил)-3-фтор-2-метоксифенил)-5-фторпиколината (F253)



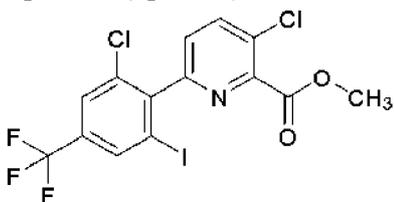
Добавляли бис(2-метоксиэтил)аминосеры трифторид (0,370 г, 1,674 ммоль) в раствор метил-3-хлор-5-фтор-6-(3-фтор-4-формил-2-метоксифенил)пиколината (**F357**; 0,260 г, 0,761 ммоль) в DCM (7,61 мл), охлажденный на ледяной бане. Ледяную баню удаляли и реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 2 ч. Добавляли метанол и реакционную смесь перемешивали в течение 10 мин. и затем концентрировали на силикагеле. В результате очистки полученного материала с помощью флэш-хроматографии (градиент 0-30% EtOAc в гексанах) получали указанное в заголовке соединение в виде белого твердого вещества (271 мг, 93%).

Пример 65. Получение метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(1,1-дифтор-2-метоксиэтил)фенил)пиколината (F177)



В раствор 1-бром-2-хлор-4-(1,1-дифтор-2-метоксиэтил)бензола (**C89**; 0,5 г, 1,75 ммоль) и метил-3-хлор-6-(триметилстаннил)пиколината (**C16**; 0,5 г, 1,50 ммоль) в толуоле (10 мл) добавляли Pd(PPh₃)₄ (0,28 г, 0,24 ммоль) и реакционную смесь перемешивали при 110°C в течение 16 ч. Реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры и добавляли воду. Смесь экстрагировали с помощью EtOAc. Органический слой промывали солевым раствором, высушивали над безводным Na₂SO₄, фильтровали и концентрировали при пониженном давлении. В результате очистки полученного материала с помощью колоночной хроматографии (силикагель 100-200 меш) с элюированием 40-50% EtOAc в петролейном эфире получали указанное в заголовке соединение в виде бледно-желтой жидкости (0,15 г, 30%).

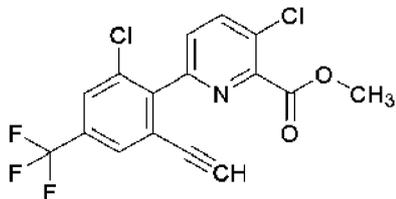
Пример 66. Получение метил-3-хлор-6-(2-хлор-6-йод-4-(трифторметил)фенил)пиколината (F214)



В сосуд объемом 5 мл добавляли метил-6-(2-амино-6-хлор-4-(трифторметил)фенил)-3-хлорпиколинат (**F213**; 96 мг, 0,263 ммоль), *трет*-бутилнитрит (67,8 мг, 0,657 ммоль) и

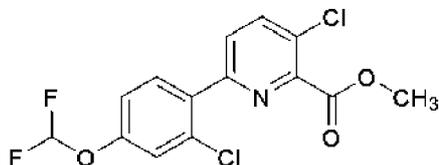
дийодметан (704 мг, 2,63 ммоль). Сосуд герметизировали и реакционную смесь нагревали до 65°C в течение 2 ч. Реакционную смесь загружали непосредственно на колонку с силикагелем. В результате очистки с помощью колоночной хроматографии с элюированием смесью гексаны-EtOAc получали указанное в заголовке соединение в виде желтого твердого вещества (92 мг, 74%).

Пример 67. Получение метил-3-хлор-6-(2-хлор-6-этинил-4-(трифторметил)фенил)пиколината (F239)



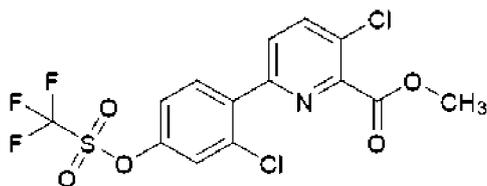
В сосуд объемом 25 мл добавляли этинилтриметилсилан (0,028 г, 0,284 ммоль), Pd(PPh₃)₂Cl₂ (0,013 г, 0,019 ммоль) и CuI (0,004 г, 0,019 ммоль) в раствор метил-3-хлор-6-(2-хлор-6-йод-4-(трифторметил)фенил)пиколината (F214; 0,090 г, 0,189 ммоль) в DMF (1 мл) и Et₃N (4 мл). Реакционную смесь перемешивали при 50°C в течение 8 ч. Реакционную смесь наносили на силикагель. Проводили очистку с помощью колоночной хроматографии с элюированием линейным градиентом гексан-EtOAc (от 0% до 100% EtOAc). Указанное в заголовке соединение выделяли в виде коричневого масла (35 мг, 50%).

Пример 68. Получение метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(дифторметокси)фенил)пиколината (F157)



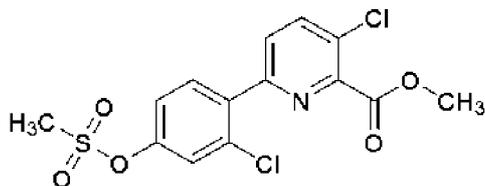
Метил-3,6-дихлорпиколинат (0,290 г, 1,408 ммоль), (2-хлор-4-(дифторметокси)фенил)триметилстаннан (C93; 0,481 г, 1,408 ммоль), Pd(PPh₃)₂Cl₂ (0,296 г, 0,422 ммоль) и йодид меди(I) (0,080 г, 0,422 ммоль) объединяли с DMF (5,63 мл) в сосуде для микроволновой обработки и нагревали при 130°C в микроволновом реакторе Biotage в течение 30 мин. Реакционную смесь фильтровали и концентрировали. В результате очистки полученного продукта с помощью HPLC с обращенной фазой получали указанное в заголовке соединение в виде грязно-белого твердого вещества (125 мг, 24%).

Пример 69. Получение метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(((трифторметил)сульфонил)окси)фенил)пиколината (F364)



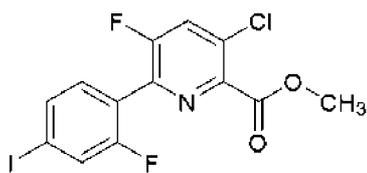
Добавляли трифторметансульфоновый ангидрид (0,298 мл, 1,76 ммоль) в раствор метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-гидроксифенил)пиколината (**F355**; 0,350 г, 1,17 ммоль) и пиридина (0,190 мл, 2,35 ммоль) в DCM (11,7 мл), охлажденный на ледяной бане. Обеспечивали нагревание реакционной смеси до комнатной температуры, ее перемешивали в течение 2 ч. и разделяли между DCM и водой. Органическую фазу пропускали через разделитель фаз Biotage и концентрировали в вакууме на силикагеле. В результате очистки полученного продукта с помощью флэш-хроматографии (от 0 до 20% EtOAc в гексанах) получали указанное в заголовке соединение в виде грязно-белого твердого вещества (243 мг, 47%).

Пример 70. Получение метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-((метилсульфонил)окси)фенил)пиколината (F288)



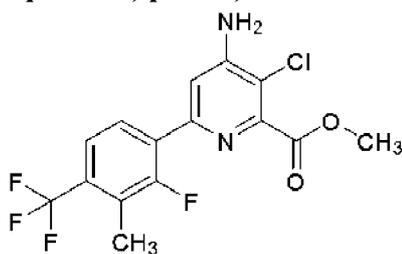
Добавляли по каплям метансульфонилхлорид (0,131 мл, 1,68 ммоль) в раствор метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-гидроксифенил)пиколината (**F355**; 0,250 г, 0,839 ммоль) и Et₃N (0,234 мл, 1,68 ммоль) в DCM (8,39 мл), охлажденный на ледяной бане. Реакционную смесь перемешивали в течение 1 ч. при комнатной температуре и разделяли между DCM и водой. Органическую фазу высушивали путем пропускания через разделитель фаз и концентрировали на силикагеле. В результате очистки полученного продукта с помощью флэш-хроматографии (градиент 0-40% EtOAc в гексанах) получали указанное в заголовке соединение в виде белого твердого вещества (293 мг, 90%).

Пример 71. Получение метил-3-хлор-5-фтор-6-(2-фтор-4-йодфенил)пиколината (F328)



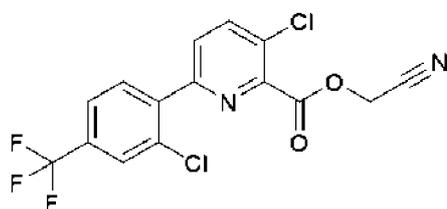
Объединяли метил-6-(4-амино-2-фторфенил)-3-хлор-5-фторпиколинат (полученный как в патенте США № 9113629 B2; 0,500 г, 1,674 ммоль) с дийодметаном (1,35 мл, 16,7 ммоль) и добавляли по каплям *трет*-бутилнитрит (0,398 мл, 3,35 ммоль). Реакционную смесь нагревали до 100°C в течение 30 мин. Охлажденную реакционную смесь разбавляли с помощью DCM и промывали водным раствором тиосульфата натрия (1,323 г, 8,37 ммоль). Органическую фазу высушивали путем пропускания через разделитель фаз и концентрировали на силикагеле. В результате очистки с помощью флэш-хроматографии (от 0 до 50% EtOAc в гексанах) получали указанное в заголовке соединение в виде белого твердого вещества (320 мг, 46%).

Пример 72. Получение метил-4-амино-3-хлор-6-(2-фтор-3-метил-4-(трифторметил)фенил)пиколината (С22)



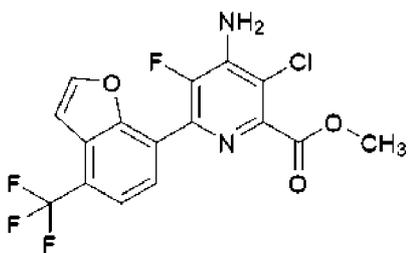
В сосуд для микроволновой обработки объемом 5 мл добавляли метил-4-амино-3,6-дихлорпиколинат (400 мг, 1,81 ммоль), 2-(2-фтор-3-метил-4-(трифторметил)фенил)-4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан (С75; 660 мг, 2,17 ммоль), фторид калия (273 мг, 4,71 ммоль) и Pd(PPh₃)₂Cl₂ (127 мг, 0,181 ммоль). Добавляли смесь 1:1 ацетонитрил-вода (5,58 мл (каждого по 2,79 мл)). Затем реакционный сосуд герметизировали и нагревали в микроволновом реакторе Biotage до 115°C в течение 20 мин. Реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры, разбавляли с помощью EtOAc и промывали водой. Органическую фазу высушивали над Na₂SO₄, фильтровали и концентрировали. В результате очистки с помощью флэш-хроматографии (силикагель, градиент гексан-EtOAc) получали указанное в заголовке соединение в виде белого твердого вещества (567 мг, 86%).

Пример 73. Цианометил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)пиколинат (F382)



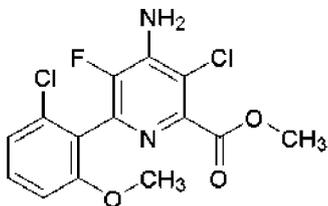
Перемешивали смесь 3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)пиколиновой кислоты (F61; 1 экв.), карбоната калия (1,5 экв.) и бензилбромида (1,2 экв.) в DMF (0,2 М) при комнатной температуре в течение ночи. Затем реакционную смесь выливали в насыщ. водн. раствор NaHCO₃ и экстрагировали с помощью EtOAc (2x). Объединенные органические слои высушивали над сульфатом магния, фильтровали и концентрировали. В результате очистки с помощью колоночной хроматографии с градиентом гексан-EtOAc получали указанное в заголовке соединение.

Пример 74. Получение метил-4-амино-3-хлор-5-фтор-6-(4-(трифторметил)бензофуран-7-ил)пиколината (С23)



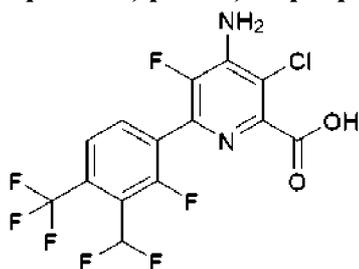
Растворяли 7-бром-4-(трифторметил)бензофуран (150 мг, 0,566 ммоль), метил-4-амино-3-хлор-5-фтор-6-(триметилстаннил)пиколинат (полученный как в патенте США № 9113629 В2; 270 мг, 0,736 ммоль) и фторид цезия (215 мг, 1,415 ммоль) в DMF (5 мл) и смесь продували азотом в течение 10 мин. Добавляли йодид меди(I) (21,6 мг, 0,113 ммоль) и Pd(PPh₃)₄ (65,4 мг, 0,057 ммоль) и смесь продували в течение дополнительных 5 мин., закрывали пробкой и нагревали с помощью микроволнового излучения (Biotage) при 85°C в течение 30 мин. Смесь разбавляли с помощью EtOAc, промывали солевым раствором (x3), высушивали с помощью MgSO₄, фильтровали и концентрировали в вакууме с получением коричневой смолы. В результате очистки на силикагеле с элюированием с помощью DCM и метанола получали указанное в заголовке соединение в виде светло-коричневого твердого вещества (183 мг, 79%): ¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ 7,89-7,74 (m, 1H), 7,73-7,61 (m, 2H), 7,11-7,00 (m, 1H), 5,00 (s, 2H), 3,99 (s, 3H); ¹⁹F ЯМР (376 МГц, CDCl₃) δ -61,42 (d, J=31,4 Гц), -137,04; ESIMS масса/заряд 389,0 ([M+H]⁺).

Пример 75. Получение метил-4-амино-3-хлор-6-(2-хлор-6-метоксифенил)-5-фторпиколината (C24)



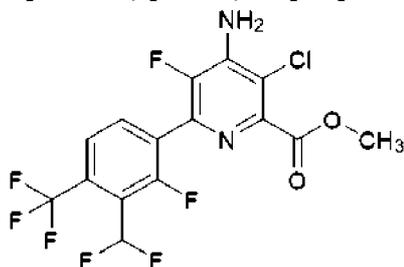
В сосуд для микроволновой обработки добавляли метил-4-амино-3,6-дихлор-5-фторпиколинат (800 мг, 3,35 ммоль), (2-хлор-6-метоксифенил)бороновую кислоту (811 мг, 4,35 ммоль), фторид цезия (1,02 г, 6,69 ммоль) и Pd(PPh₃)₂Cl₂ (235 мг, 0,335 ммоль). Добавляли смесь 1:1 ацетонитрил-вода (10 мл). Затем реакционный сосуд герметизировали и нагревали в микроволновом реакторе Biotage до 115°C в течение 30 мин. Смесь встряхивали с EtOAc (35 мл) и насыщ. водн. раствором хлорида натрия (10 мл). Органическую фазу промывали насыщ. водн. раствором хлорида натрия (10 мл), высушивали и концентрировали. В результате очистки с помощью хроматографии на силикагеле с применением 0-50% EtOAc-гексан в качестве элюента получали указанное в заголовке соединение в виде белого твердого вещества (400 мг, 35%): ¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ 7,31 (t, J=8,3 Гц, 1H), 7,08 (dd, J=8,1, 0,9 Гц, 1H), 6,87 (dd, J=8,4, 0,7 Гц, 1H), 4,88 (s, 2H), 3,95 (s, 3H), 3,74 (s, 3H); ¹⁹F ЯМР (376 МГц, CDCl₃) δ -137,86; ESIMS масса/заряд 343,4 ([M+H]⁺).

Пример 76. Получение 4-амино-3-хлор-6-(3-(дифторметил)-2-фтор-4-(трифторметил)фенил)-5-фторпиколиновой кислоты (С25)



В раствор метил-4-амино-3-хлор-6-(3-(дифторметил)-2-фтор-4-(трифторметил)фенил)-5-фторпиколината (С26; 250 мг, 0,600 ммоль) в MeOH (1 мл) добавляли 2 М NaOH (0,300 мл, 0,600 ммоль). Реакционную смесь перемешивали при 25°C в течение 15 ч. Затем реакционную смесь концентрировали и подкисляли с помощью 2 М HCl. Продукт осаждался из раствора, и его собирали в воронке Бюхнера. Указанное в заголовке соединение выделяли в виде грязно-белого твердого вещества (197 мг, 82%): ^1H ЯМР (400 МГц, DMSO- d_6) δ 8,03 (t, $J=7,4$ Гц, 1H), 7,92 (d, $J=8,3$ Гц, 1H), 7,61-7,24 (m, 1H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, DMSO- d_6) δ -55,95 - -57,22 (m), -111,58 - -112,73 (m), -113,96 (ddd, $J=28,3, 14,1, 6,9$ Гц), -138,51 (d, $J=26,3$ Гц); ESIMS масса/заряд 403,08 ([M+H]⁺).

Пример 77. Получение метил-4-амино-3-хлор-6-(3-(дифторметил)-2-фтор-4-(трифторметил)фенил)-5-фторпиколината (С26)

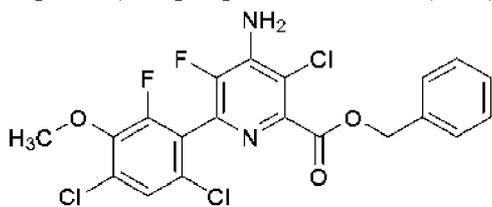


Стадия 1 - получение 2-(3-(дифторметил)-2-фтор-4-(трифторметил)фенил)-4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолана. Добавляли по каплям 2-(дифторметил)-1-фтор-3-(трифторметил)бензол (1,756 г, 8,20 ммоль) в раствор бутиллития (3,61 мл, 9,02 ммоль) в THF (20,5 мл), который охлаждали до -78°C в атмосфере азота. Реакционную смесь перемешивали при от -70 до -75°C в течение 10 мин. и добавляли по каплям 2-изопропоксид-4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан (1,02 мл, 5,00 ммоль) при поддержании температуры ниже -65°C. Затем обеспечивали нагревание реакционной смеси до 0°C. Добавляли воду и полученную смесь экстрагировали с помощью Et₂O. Водную фазу осторожно подкисляли с помощью 2 М HCl и экстрагировали с помощью Et₂O. Органическую фазу высушивали и концентрировали с получением указанного в заголовке соединения в виде оранжевого масла (1,2 г), которое применяли без очистки на стадии реакции Сузуки, приведенной ниже.

Стадия 2 - получение метил-4-амино-3-хлор-6-(3-(дифторметил)-2-фтор-4-

(трифторметил)фенил)-5-фторпиколината. В сосуд для микроволновой обработки объемом 5 мл добавляли метил-4-амино-3,6-дихлор-5-фторпиколинат (224 мг, 0,937 ммоль), 2-(3-(дифторметил)-2-фтор-4-(трифторметил)фенил)-4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан (382 мг, 1,13 ммоль), фторид калия (142 мг, 2,44 ммоль) и Pd(PPh₃)₂Cl₂ (65,8 мг, 0,094 ммоль). Добавляли смесь 1:1 ацетонитрил-вода (5,58 мл (каждого по 2,79 мл)). Затем реакционный сосуд герметизировали и нагревали в микроволновом реакторе Biotage до 115°C в течение 20 мин. Реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры, разбавляли с помощью EtOAc и промывали с помощью H₂O. Органический слой высушивали над Na₂SO₄, фильтровали и концентрировали. В результате очистки полученного материала с помощью флэш-хроматографии (силикагель, EtOAc-гексан) получали указанное в заголовке соединение в виде (296 мг, 76%): ¹⁹F ЯМР (376 МГц, DMSO-*d*₆) δ -56,63 (t, *J*=8,2 Гц), -111,34 - -113,42 (m), -113,42 - -115,06 (m), -135,94 (s), -137,47 (d, *J*=27,0 Гц); ИК (CH₂Cl₂) 3334, 3190, 1735, 1622, 1318, 1236, 1126 см⁻¹; ESIMS масса/заряд 417,1 ([M+H]⁺).

Пример 78. Получение бензил-4-амино-3-хлор-6-(4,6-дихлор-2-фтор-3-метоксифенил)-5-фторпиколината (C27)



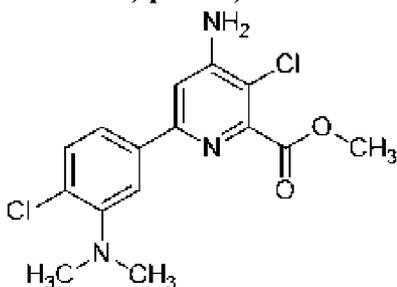
Стадия 1 - получение метил-4-амино-3-хлор-6-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифенил)-5-фторпиколината. Метил-4-амино-3,6-дихлор-5-фторпиколинат (1,5 г, 6,28 ммоль), 2-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифенил)-1,3,2-диоксаборинан (1,99 г, 8,16 ммоль), фторид калия (0,948 г, 16,3 ммоль) и Pd(PPh₃)₂Cl₂ (0,440 г, 0,628 ммоль) объединяли в ацетонитриле (13,5 мл) и воде (4,48 мл). Затем реакционную смесь нагревали в микроволновой печи при 115°C в герметизированном сосуде в течение 20 мин. Охлажденную реакционную смесь разделяли между EtOAc и водой. Органическую фазу промывали водой (2x) и концентрировали на силикагеле (7 г). В результате очистки с помощью автоматизированной флэш-хроматографии на силикагеле с элюированием 2-20% EtOAc в DCM получали метил-4-амино-3-хлор-6-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифенил)-5-фторпиколинат в виде белого твердого вещества (1,5 г, 66%): ¹H ЯМР (400 МГц, DMSO-*d*₆) δ 7,47 (dd, *J*=8,6, 1,6 Гц, 1H), 7,30 (dd, *J*=8,5, 7,0 Гц, 1H), 7,13 (s, 2H), 3,93 (d, *J*=1,1 Гц, 3H), 3,87 (s, 3H); ¹⁹F ЯМР (376 МГц, DMSO-*d*₆) δ -137,67 (d, *J*=26,9 Гц), -129,19 (d, *J*=27,2 Гц); EIMS масса/заряд 362,1

Стадия 2 - получение метил-4-амино-3-хлор-6-(4,6-дихлор-2-фтор-3-метоксифенил)-5-фторпиколината. В раствор метил-4-амино-3-хлор-6-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифенил)-5-фторпиколината (10,0 г, 27,6 ммоль) и хлорида алюминия (AlCl₃; 0,37 г, 2,76 ммоль) в сульфурилхлориде (SO₂Cl₂; 12 мл) добавляли дифенилсульфид (0,51 г, 2,76

ммоль) при 20°C. После добавления реакционную смесь перемешивали при 75°C в течение 10 ч. Реакционную смесь гасили водой (100 мл) и смесь экстрагировали с помощью DCM (100 мл). Органическую фазу промывали водой (2×100 мл) и солевым раствором (100 мл), высушивали над Na₂SO₄ и концентрировали *in vacuo*. В результате очистки остатка с помощью колоночной хроматографии на силикагеле (смесь 4:1 гексаны-EtOAc) получали указанное в заголовке соединения в виде белого порошка (5,5 г, 50%): т. пл. 121-122°C; ¹H ЯМР (400 МГц, DMSO-*d*₆) 7,78 (d, 1H), 7,22 (s, 1H), 3,94 (d, 3H), 3,86 (s, 3H); ¹³C ЯМР (100 МГц, DMSO-*d*₆) 165,09, 155,08, 152,57, 143,75, 142,14, 134,76, 129,56, 126,50, 122,70, 114,05, 62,24- 62,29, 53,23; ESIMS *масса/заряд* ([M+H]⁺) 397.

*Стадия 3 - получение бензил-4-амино-3-хлор-6-(4,6-дихлор-2-фтор-3-метоксифенил)-5-фторпиридина. В раствор соединения со стадии 2 (5,5 г, 13,8 ммоль) в бензиловом спирте (3 мл, 27,7 ммоль) добавляли изопропоксид титана (Ti(OiPr)₄; 0,39 г, 1,38 ммоль) при 100°C. После добавления реакционную смесь перемешивали при 100°C в течение 16 ч. Реакционную смесь гасили водой (100 мл) и смесь экстрагировали с помощью DCM (100 мл). Органическую фазу промывали водой (2×100 мл) и солевым раствором (100 мл), высушивали над Na₂SO₄ и концентрировали *in vacuo*. В результате очистки остатка с помощью колоночной хроматографии на силикагеле с DCM в качестве элюента получали указанное в заголовке соединения в виде бесцветного твердого вещества (3,0 г, 50%): т. пл. 54,1-55,2°C; ¹H ЯМР (400 МГц, DMSO-*d*₆): 7,78-7,77 (d, *J*=4,0 Гц, 1H), 7,45-7,36 (m, 5H), 7,22 (s, 2H), 5,38 (s, 2H), 3,94-3,93 (d, *J*=4,0 Гц, 3H); ¹³C ЯМР (100 МГц, DMSO-*d*₆) 169,30, 149,92, 149,17, 148,37, 146,89, 139,56, 133,67, 132,73, 131,28, 118,70-118,67, 72,39, 67,02-66,98; ESIMS *масса/заряд* ([M+H]⁺) 473.*

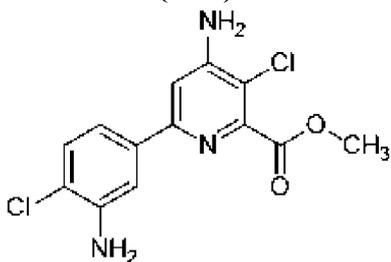
Пример 79. Получение метил-4-амино-3-хлор-6-(4-хлор-3-(диметиламино)фенил)пиридина (C28)



Растворяли метил-4-амино-6-(3-амино-4-хлорфенил)-3-хлорпиридинат (C29; 250 мг, 0,80 ммоль) в THF (1,6 мл) и последовательно обрабатывали формальдегидом (48 мг, 1,6 ммоль, 0,12 мл 37% водн. раствора), дибутилдихлорстаннаном (5 мг, 0,016 ммоль) и фенилсиланом (95 мг, 0,88 ммоль, 0,109 мл) при перемешивании при комнатной температуре. Через 26 ч. реакционную смесь концентрировали. В результате очистки с помощью хроматографии на силикагеле с применением смеси 2:1 гексан-EtOAc в качестве элюента получали указанное в заголовке соединения в виде белой пены (225 мг, 83%): ¹H ЯМР (300 МГц, CDCl₃) δ 7,62 (br s, 1H), 7,36 (ad, *J*=1,2 Гц, 2H), 7,03 (s, 1H), 4,88 (br s, 2H),

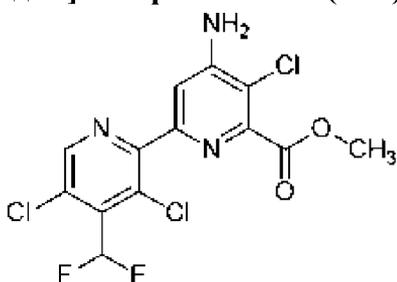
3,99 (s, 3H), 2,85 (s, 6H); IR (тонкая пленка) 3472, 3368, 2947, 1734, 1621, 1578, 1443, 1227, 1030 cm^{-1} ; ESIMS *масса/заряд* 340 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

Пример 80. Получение метил-4-амино-6-(3-амино-4-хлорфенил)-3-хлорпиколината (C29)



Во взвесь метил-4-амино-3-хлор-6-(4-хлор-3-нитрофенил)пиколината (**C35**; 125 мг, 0,365 ммоль) в уксусной кислоте (4 мл) добавляли порошок железа (204 мг, 36,5 ммоль) и смесь нагревали до 85°C при перемешивании в течение 0,25 ч. Реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры и фильтровали через Celite® с EtOH и концентрировали *in vacuo*. Реакционную смесь разделяли между EtOAc и насыщ. NaHCO_3 , слои разделяли и органический слой высушивали над Na_2SO_4 , фильтровали и концентрировали. Указанное в заголовке соединение выделяли в виде оранжевого твердого вещества (111 мг, 97%): т. пл. $130\text{--}131^\circ\text{C}$; ^1H ЯМР (300 МГц, CDCl_3) δ 7,36 (d, $J=2,1$ Гц, 1H), 7,25 (d, $J=8,1$ Гц, 1H), 7,09 (dd, $J=8,1, 2,1$ Гц, 1H), 6,98 (s, 1H), 4,85 (br s, 2H), 4,15 (br s, 2H), 3,98 (s, 3H); ESIMS *масса/заряд* 312 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

Пример 81. Получение метил-4-амино-3',5,5'-трихлор-4'-(дифторметил)-[2,2'-бипиридин]-6-карбоксилата (C30)

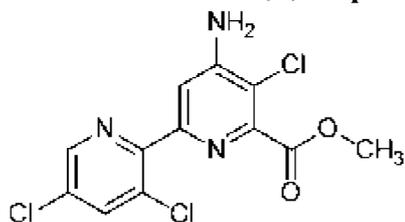


Добавляли по каплям ацетилхлорид (97 мг, 1,24 ммоль, 0,088 мл) во взвесь метил-4-ацетамидо-3',5,5'-трихлор-4'-(дифторметил)-[2,2'-бипиридин]-6-карбоксилата (**C36**; 105 мг, 0,247 ммоль) в MeOH (3 мл) при перемешивании при комнатной температуре. Через 16 ч. удаляли большую часть MeOH *in vacuo* и оставшуюся реакционную смесь добавляли в ледяной насыщ. водн. раствор NaHCO_3 при перемешивании. Полученный осадок собирали посредством фильтрации, промывали водой и высушивали. Указанное в заголовке соединение выделяли в виде грязно-белого твердого вещества (93 мг, 98%): ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,63 (s, 1H), 7,25 (t, $J=52,6$ Гц, 1H), 7,06 (s, 1H), 5,02 (s, 2H), 3,98 (s, 3H); ^{13}C ЯМР (101 МГц, CDCl_3) δ 165,15, 154,17, 152,87, 150,67, 148,31, 147,66, 137,03 (t, $J=23,1$ Гц), 130,99 (t, $J=2,4$ Гц), 130,13 (t, $J=3,5$ Гц), 115,23, 111,56, 111,18 (t, $J=242,7$ Гц), 53,05; ^{19}F ЯМР

(376 МГц, CDCl₃) δ -117,85; ESIMS *масса/заряд* 382 ([M+H]⁺).

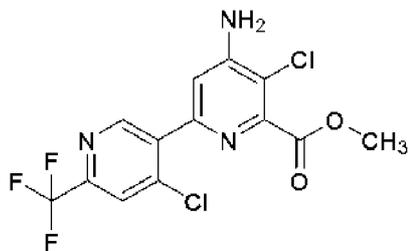
Следующие соединения получали подобно процедуре, указанной в примере 81.

Метил-4-амино-3',5,5'-трихлор-[2,2'-бипиридин]-6-карбоксилат (С31)



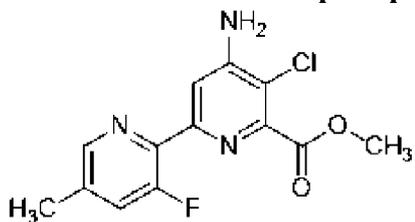
С использованием подходящих исходных материалов указанное в заголовке соединение синтезировали и выделяли в виде белой пены (126 мг, 62%): ¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ 8,52 (d, *J*=2,1 Гц, 1H), 7,82 (d, *J*=2,1 Гц, 1H), 7,11 (s, 1H), 5,09 (s, 2H), 3,97 (s, 3H); ¹³C ЯМР (101 МГц, CDCl₃) δ 165,31, 152,89, 151,98, 150,62, 147,54, 146,32, 137,85, 131,90, 130,91, 114,95, 111,55, 52,95; ESIMS *масса/заряд* 332 ([M+H]⁺).

Метил-4-амино-4',5-дихлор-6'-(трифторметил)-[2,3'-бипиридин]-6-карбоксилат (С32)



С использованием подходящих исходных материалов указанное в заголовке соединение синтезировали и выделяли в виде белого твердого вещества (158 мг, 93%): ¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ 8,87 (s, 1H), 7,77 (s, 1H), 7,06 (s, 1H), 5,00 (br s, 2H), 4,00 (s, 3H); ¹³C ЯМР (101 МГц, CDCl₃) δ 165,14, 152,23, 150,38, 150,28, 148,80 (q, *J*=35,6 Гц), 148,75, 143,44, 136,43, 121,99 (q, *J*=3,1 Гц), 120,84 (q, *J*=274,6 Гц), 115,01, 111,77, 53,10; ¹⁹F ЯМР (376 МГц, CDCl₃) δ -68,07; ESIMS *масса/заряд* 366 ([M+H]⁺).

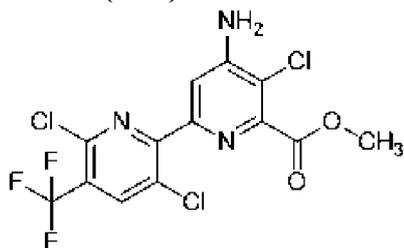
Метил-4-амино-5-хлор-3'-фтор-5'-метил-[2,2'-бипиридин]-6-карбоксилат (С33)



С использованием подходящих исходных материалов указанное в заголовке соединение синтезировали и выделяли в виде белого твердого вещества (37 мг, 77%): ¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ 8,36 (s, 1H), 7,37 (d, *J*=1,3 Гц, 1H), 7,32 (d, *J*=11,4 Гц, 1H), 4,94 (s, 2H), 3,99 (s, 3H), 2,40 (s, 3H); ¹³C ЯМР (101 МГц, CDCl₃) δ 165,44, 157,78 (d, *J*=264,6 Гц), 151,98 (d, *J*=6,4 Гц), 150,54, 147,99, 145,90 (d, *J*=4,5 Гц), 141,18 (d, *J*=9,2 Гц), 136,13 (d, *J*=4,3

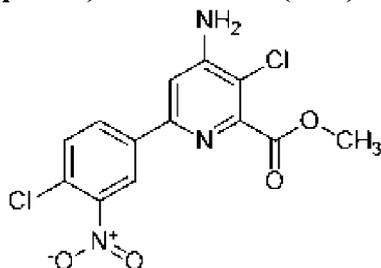
Гц), 125,11 (d, $J=19,7$ Гц), 114,81, 110,97 (d, $J=4,5$ Гц), 52,89, 17,97; ^{19}F ЯМР (376 МГц, CDCl_3) δ -122,64; ESIMS *масса/заряд* 296 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

Метил-4-амино-3',5,6'-трихлор-5'-(трифторметил)-[2,2'-бипиридин]-6-карбоксилат (С34)



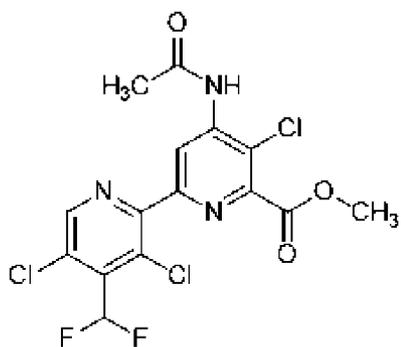
С использованием подходящих исходных материалов указанное в заголовке соединение синтезировали и выделяли в виде белой пены (30 мг, 66%): ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,10 (s, 1H), 7,22 (s, 1H), 5,04 (s, 2H), 3,99 (s, 3H); ^{13}C ЯМР (101 МГц, CDCl_3) δ 165,09, 155,99, 151,52, 150,75, 147,58, 145,77, 139,30 (q, $J=5,0$ Гц), 129,52, 125,81 (q, $J=34,1$ Гц), 121,31 (q, $J=273,4$ Гц), 115,65, 111,54, 53,02; ^{19}F ЯМР (376 МГц, CDCl_3) δ -63,73; ESIMS *масса/заряд* 400 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

Пример 82. Получение метил-4-амино-3-хлор-6-(4-хлор-3-нитрофенил)пиколината (С35)



Добавляли метил-4-амино-3-хлор-6-(4-хлорфенил)пиколинат (полученный как в Valko et al., WO 2003011853 A1; 1,58 г, 5,32 ммоль) в виде дисперсного порошка в ледяную конц. серную кислоту (26 мл) при перемешивании. Добавляли нитрит натрия (474 мг, 5,58 ммоль) и обеспечивали медленное нагревание смеси до комнатной температуры. В реакционную смесь добавляли большой избыток льда и полученное твердое вещество собирали посредством фильтрации, промывали водой и высушивали. Указанное в заголовке соединение выделяли в виде желтого твердого вещества (1,74 г, 96%): т. пл. 199-200°C; ^1H ЯМР (300 МГц, CDCl_3) δ 8,44 (d, $J=2,1$ Гц, 1H), 8,11 (dd, $J=2,1, 8,1$ Гц, 1H), 7,61 (d, $J=8,1$ Гц, 1H), 7,14 (s, 1H), 4,92 (br s, 2H), 4,02, (s, 3H); ESIMS *масса/заряд* 342 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

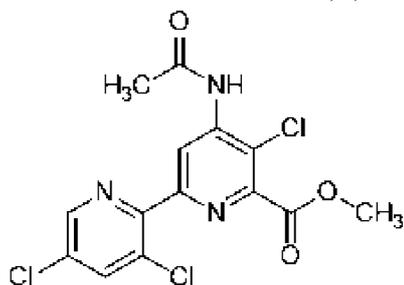
Пример 83. Получение метил-4-ацетида-3',5,5'-трихлор-4'-(дифторметил)-[2,2'-бипиридин]-6-карбоксилата (С36)



Раствор 2-бром-3,5-дихлор-4-(дифторметил)пиридина (**C99**; 253 мг, 0,914 ммоль) в DMF (2 мл) продували азотом через иглу в течение 30 мин. с последующим последовательным добавлением метил-4-ацетида-3-хлор-6-(триметилстаннил)пиколината (**C20**; 250 мг, 0,64 ммоль), Pd(PPh₃)₂Cl₂ (45 мг, 0,064 ммоль), CuI (24 мг, 128 ммоль) и фторида цезия (194 мг, 1,28 ммоль). Полученную смесь нагревали до 45-55°C с продуванием азотом в течение 4 ч. Охлажденную реакционную смесь разделяли между солевым раствором и EtOAc, слои разделяли и органический слой высушивали над Na₂SO₄, фильтровали и концентрировали. В результате очистки с помощью хроматографии на силикагеле с применением смеси 2:1 гексан-EtOAc в качестве элюента получали указанное в заголовке соединение в виде грязно-белого твердого вещества (105 мг, 39%): ¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ 8,95 (s, 1H), 8,68 (s, 1H), 8,07 (s, 1H), 7,26 (t, *J*=52,6 Гц, 1H), 4,01 (s, 3H), 2,33 (s, 3H); ¹⁹F ЯМР (376 МГц, CDCl₃) δ -117,83; ESIMS масса/заряд 424 ([M+H]⁺).

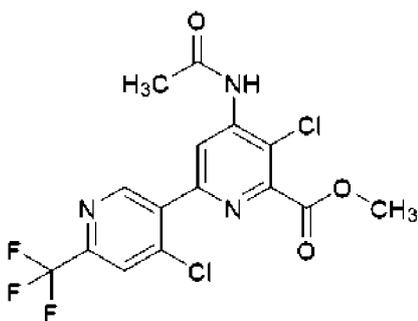
Следующие соединения получали подобно процедуре, указанной в *примере 83*.

Метил-4-ацетида-3',5,5'-трихлор-[2,2'-бипиридин]-6-карбоксилат (C37)



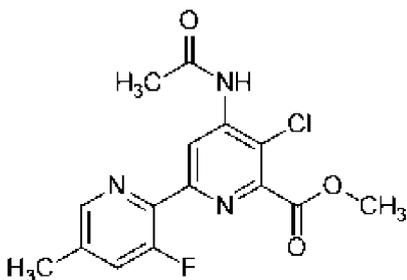
С использованием подходящих исходных материалов указанное в заголовке соединение синтезировали и выделяли в виде белого порошка (251 мг, 61%): т. пл. 212-217°C; ¹H ЯМР (400 МГц, DMSO-*d*₆) δ 10,02 (s, 1H), 8,75 (d, *J*=2,1 Гц, 1H), 8,61 (s, 1H), 8,41 (d, *J*=2,1 Гц, 1H), 3,93 (s, 3H), 2,25 (s, 3H); ¹³C ЯМР (101 МГц, DMSO-*d*₆) δ 170,12, 164,65, 153,26, 151,02, 148,72, 146,55, 144,04, 138,16, 131,58, 129,96, 118,27, 117,93, 52,98, 24,10; ESIMS масса/заряд 374 ([M+H]⁺).

Метил-4-ацетида-4',5-дихлор-6'-(трифторметил)-[2,3'-бипиридин]-6-карбоксилат (C38)



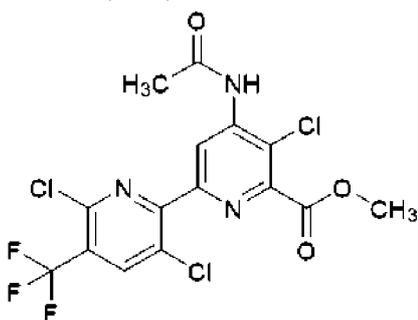
С использованием подходящих исходных материалов указанное в заголовке соединение синтезировали и выделяли в виде белого твердого вещества (189 мг, 40%): т. пл. 192-198°C; ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 9,02 (s, 1H), 8,91 (s, 1H), 8,10 (s, 1H), 7,82 (s, 1H), 4,03 (s, 3H), 2,35 (s, 3H); ^{13}C ЯМР (101 МГц, CDCl_3) δ 168,88, 164,44, 152,17, 151,36, 149,03 (q, $J=35,5$ Гц), 148,55, 143,75, 143,01, 136,03, 122,10 (q, $J=3,1$ Гц), 120,79 (q, $J=275,7$ Гц), 117,85, 116,75, 53,30, 25,12; ^{19}F ЯМР (376 МГц, CDCl_3) δ -68,09; ESIMS масса/заряд 408 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

Метил-4-ацетидамо-5-хлор-3'-фтор-5'-метил-[2,2'-бипиридин]-6-карбоксилат (C39)



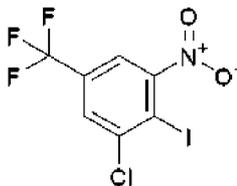
С использованием подходящих исходных материалов указанное в заголовке соединение синтезировали и выделяли в виде белого порошка (55 мг, 32%): ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 9,15 (d, $J=1,3$ Гц, 1H), 8,40 (s, 1H), 8,09 (s, 1H), 7,35 (d, $J=11,2$ Гц, 1H), 4,00 (s, 3H), 2,42 (s, 3H), 2,33 (s, 3H); ^{13}C ЯМР (101 МГц, CDCl_3) δ 168,68, 164,75, 157,86 (d, $J=264,8$ Гц), 153,04 (d, $J=6,3$ Гц), 147,89, 146,20 (d, $J=4,6$ Гц), 142,96, 140,79 (d, $J=9,5$ Гц), 136,55 (d, $J=4,2$ Гц), 125,04 (d, $J=19,7$ Гц), 117,57, 116,14 (d, $J=5,5$ Гц), 53,09, 25,10, 18,00; ^{19}F ЯМР (376 МГц, CDCl_3) δ -122,9; ESIMS масса/заряд 338 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

Метил-4-ацетидамо-3',5,6'-трихлор-5'-(трифторметил)-[2,2'-бипиридин]-6-карбоксилат (C40)



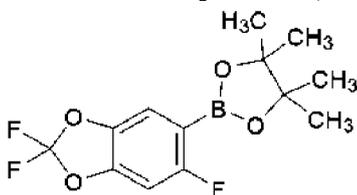
С использованием подходящих исходных материалов указанное в заголовке соединение синтезировали и выделяли в виде белого порошка (49 мг, 22%): ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 9,02 (s, 1H), 8,13 (s, 1H), 8,09 (br s, 1H), 4,01 (s, 3H), 2,34 (s, 3H); ^{13}C ЯМР (101 МГц, CDCl_3) δ 168,73, 164,33, 155,75, 152,53, 147,60, 146,19, 143,28, 139,11 (q, $J=5,0$ Гц), 129,53, 126,21 (q, $J=34,2$ Гц), 121,29 (q, $J=273,4$ Гц), 118,58, 116,64, 53,26, 25,12; ^{19}F ЯМР (376 МГц, CDCl_3) δ -63,79; ESIMS масса/заряд 442 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

Пример 84. Получение 1-хлор-2-йод-3-нитро-5-(трифторметил)бензола (C41)



В сосуд объемом 5 мл добавляли 2-хлор-6-нитро-4-(трифторметил)анилин (100 мг, 0,416 ммоль), *трет*-бутилнитрит (124 мкл, 1,039 ммоль) и дийодметан (1113 мг, 4,16 ммоль). Сосуд герметизировали и реакционную смесь нагревали до 65°C в течение 2 ч. Реакционную смесь загружали непосредственно на силикагель. В результате очистки с помощью хроматографии с элюированием смесью гексаны-EtOAc получали указанное в заголовке соединение в виде желтого твердого вещества (66 мг, 45%): ^1H ЯМР (500 МГц, CDCl_3) δ 7,90 (d, $J=1,9$ Гц, 1H), 7,76 (d, $J=1,9$ Гц, 1H); ^{19}F ЯМР (471 МГц, CDCl_3) δ -63,27; ^{19}F ЯМР (471 МГц, CDCl_3) δ -63,27; EIMS масса/заряд 350,9.

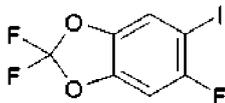
Пример 85. Получение 4,4,5,5-тетраметил-2-(2,2,6-трифторбензо[d][1,3]диоксол-5-ил)-1,3,2-диоксаборолана (C42)



Указанное в заголовке соединение получали в соответствии со способом получения 22 в Eckelbarger, et al., публикация заявки на патент США № 2014/0274701 A1. Растворили 2,2,5-трифтор-6-йодбензо[d][1,3]диоксол (C43; 1,0 г, 3,31 ммоль) в сухом THF (10 мл). Смесь охлаждали до 5°C, обрабатывали комплексом хлорида изопропилмагния и хлорида лития (2,67 мл 1,3 М раствора в THF, 3,48 ммоль) и перемешивали в течение 1 ч. Добавляли 2-изопропокси-4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан (0,723 мл, 3,31 ммоль) и перемешивание продолжали в течение 20 мин. Реакционную смесь гасили путем добавления насыщ. раствора NH_4Cl (5 мл). Реакционную смесь разбавляли с помощью EtOAc (20 мл) и насыщ. NaCl (10 мл). Органическую фазу промывали с помощью насыщ. NaCl (10 мл), высушивали и выпаривали. Остаток высушивали в вакууме. Указанное в заголовке соединение выделяли в виде белого твердого вещества (1,0 г, 100%): ^1H ЯМР (400 МГц, ацетон- d_6) δ 7,52 (d, $J=5,6$ Гц, 1H), 7,42 (d, $J=8,8$ Гц, 1H), 6,49 (s, 1H), 3,93 (s, 3H); ^{19}F

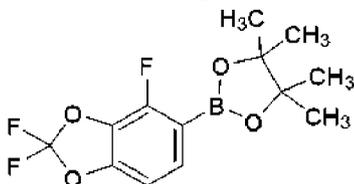
ЯМР (376 МГц, CDCl_3) δ -49,96 (s), -104,21 (s); ^{19}F ЯМР (376 МГц, CDCl_3) δ -49,96 (s), -104,21 (s); EIMS *масса/заряд* 302,0.

Пример 86. Получение 2,2,5-трифтор-6-йодбензо[*d*][1,3]диоксола (C43)



Указанное в заголовке соединение получали в соответствии со способом получения 21 в Eckelbarger, et al., публикация заявки на патент США № 2014/0274701 A1. Добавляли 2,2,6-трифторбензо[*d*][1,3]диоксол-5-амин (8,0 г, 41,9 ммоль) в концентрированную HCl (200 мл). Смесь охлаждали до 5°C и обрабатывали по каплям нитритом натрия (4,33 г, 62,8 ммоль) в воде (10 мл) в течение примерно 10 мин. Смесь перемешивали в течение 30 мин. при $5-10^\circ\text{C}$ и затем выливали в быстро перемешиваемую двухфазную смесь йодида натрия в воде (200 мл) и DCM (100 мл). Через 20 мин. смесь перемешивали с 10% раствором бисульфита натрия в течение 20 мин. Отделенную водную фазу экстрагировали с помощью DCM (75 мл) и объединенные экстракты промывали с помощью насыщ. NaCl (30 мл), высушивали и выпаривали. В результате очистки остатка с помощью хроматографии на силикагеле с элюированием гексаном получали указанное в заголовке соединение в виде белого твердого вещества (6,4 г, 51%): ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 7,41 (d, $J=5,0$ Гц, 1H), 6,90 (d, $J=6,6$ Гц, 1H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, CDCl_3) δ -49,63 (s), -95,24 (s); ^{19}F ЯМР (376 МГц, CDCl_3) δ -49,63 (s), -95,24 (s); EIMS *масса/заряд* 302,0.

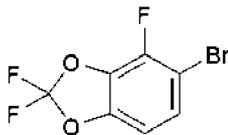
Пример 87. Получение 4,4,5,5-тетраметил-2-(2,2,4-трифторбензо[*d*][1,3]диоксол-5-ил)-1,3,2-диоксаборолана (C44)



Указанное в заголовке соединение получали в соответствии со способом получения 28 в Eckelbarger, et al., публикация заявки на патент США № 2014/0274701 A1. Растворили 5-бром-2,2,4-трифторбензо[*d*][1,3]диоксол (C45; 4,0 г, 15,7 ммоль) в сухом THF (20 мл). Смесь охлаждали до -20°C и обрабатывали порциями комплексом хлорида изопропилмагния и хлорида лития (12,7 мл 1,3 М раствора в THF, 16,5 ммоль) в течение примерно 10 мин. Смесь перемешивали в течение 30 мин., в это время температура повышалась до 0°C . Добавляли 2-изопропокси-4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан (3,42 мл, 16,8 ммоль) и смесь перемешивали в течение 30 мин. при $10-15^\circ\text{C}$. Смесь обрабатывали насыщ. раствором NH_4Cl (10 мл) и разбавляли с помощью EtOAc (50 мл). Органическую фазу промывали с помощью насыщ. NaCl (15 мл), высушивали и выпаривали. Указанное в заголовке соединение выделяли в виде белого твердого вещества (3,5 г, 74%): ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 7,46 (d, $J=26,5$ Гц, 1H), 6,90 (dd, $J=18,5, 4,5$ Гц, 1H),

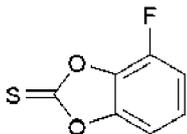
1,35 (s, 12H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, CDCl_3) δ -49,70 (s), -126,00 (s); ^{19}F ЯМР (376 МГц, CDCl_3) δ -49,70 (s), -126,00 (s); EIMS *масса/заряд* 302,0.

Пример 88. Получение 5-бром-2,2,4-трифторбензо[*d*][1,3]диоксола (С45)



Указанное в заголовке соединение получали в соответствии со способом получения 27 в Eckelbarger, et al., публикация заявки на патент США № 2014/0274701 А1. Растворяли 4-фторбензо[*d*][1,3]диоксол-2-тион (С46; 4,8 г, 28,2 ммоль) в DCM (75 мл). Смесь охлаждали до -30°C , обрабатывали с помощью раствора HF-пиридин (70%, 18,15 мл, 141 ммоль) и порциями с помощью 1,3-дибром-5,5-диметилимидазолидин-2,4-диона (9,68 г, 33,9 ммоль) в течение 30 мин. Смесь перемешивали в течение 2 ч. при от -20 до -30°C и затем перемешивали 5% раствором бисульфита натрия. Отделенную органическую фазу промывали с помощью насыщ. NaCl (20 мл), высушивали и большую часть DCM удаляли путем перегонки с помощью колонки Vigreux. Более летучие вещества удаляли путем перегонки (без колонки) при 150 мм. Колбу помещали в вакуум (4-6 мм рт. ст.) и отбирали 2,5 г дистиллята с верхнего слоя при температуре верхнего слоя $48-55^\circ\text{C}$. Он состоял из смеси 90:10 одного бромированного изомера и небромированного продукта. Анализ спектров ^1H ЯМР показал, что бромированный продукт представлял собой изомер, содержащий бром в положении 4. Продукт применяли без дополнительной очистки для превращения в боронат в виде коричневого масла (3,2 г, 45%): ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 7,28 (dd, $J=8,6$, 6,2 Гц, 1H), 6,81 (dd, $J=8,6$, 1,3 Гц, 1H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, CDCl_3) δ -49,25 (s), -126,72 (s); ^{19}F ЯМР (376 МГц, CDCl_3) δ -49,25 (s), -126,72 (s); EIMS *масса/заряд* 254,0.

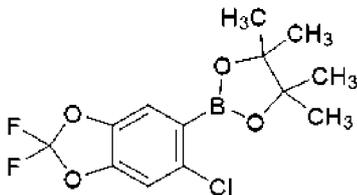
Пример 89. Получение 4-фторбензо[*d*][1,3]диоксол-2-тиона (С46)



Указанное в заголовке соединение получали в соответствии со способом получения 26 в Eckelbarger, et al., публикация заявки на патент США № 2014/0274701 А1. 3-Фторбензол-1,2-диол (5,0 г, 39,0 ммоль) и тиофосген (3,29 мл, 42,9 ммоль) объединяли в CHCl_3 (50 мл). Смесь охлаждали до 10°C и обрабатывали по каплям 10% раствором NaOH (36 г, 90 ммоль) в течение примерно 30 мин. Реакционную смесь перемешивали в течение 2 ч. при 20°C . Растворитель удаляли в вакууме и твердое вещество собирали посредством фильтрации и промывали водой. Твердое вещество растворяли в EtOAc (100 мл) и раствор промывали водой (30 мл), с помощью насыщ. NaCl (30 мл), высушивали и концентрировали. В результате очистки остатка с помощью хроматографии на силикагеле с применением 0-30% EtOAc-гексан получали указанное в заголовке соединение в виде

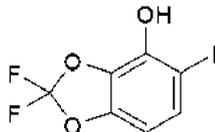
коричневого твердого вещества (5,1 г, 77%): т. пл. 58-59°C; ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 7,28 (m, 1H), 7,12 (m, 1H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, CDCl_3) δ -131,32; EIMS *масса/заряд* 170.

Пример 90. Получение 2-(6-хлор-2,2-дифторбензо[*d*][1,3]диоксол-5-ил)-4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолана (С47)



Указанное в заголовке соединение получали в соответствии со способом получения 47 в Eckelbarger, et al., публикация заявки на патент США № 2014/0274701 A1. Растворили 5-бром-6-хлор-2,2-дифторбензо[*d*][1,3]диоксол (1,0 г, 3,68 ммоль) в сухом THF (47,9 мл). Смесь охлаждали до 0-5°C и обрабатывали комплексом хлорида изопропилмагния и хлорида лития (2,9 мл 1,3 М раствора в THF, 3,87 ммоль) в течение 10 мин. Через 30 мин. добавляли раствор 2-изопропокси-4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолана (1,91 г, 10,3 ммоль) в THF (15 мл) в течение 5 мин. Перемешивание продолжали при 10-15°C в течение 30 мин. Через 45 мин. после добавления боролана добавляли насыщ. раствор NH_4Cl (10 мл). Смесь встряхивали совместно с EtOAc (20 мл) и насыщ. NaCl (10 мл). Органическую фазу промывали с помощью насыщ. NaCl (10 мл), высушивали и концентрировали. Указанное в заголовке соединение выделяли в виде белого твердого вещества (1,2 г, 100%), которое применяли без дополнительной очистки: ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 7,40 (s, 1H), 7,08 (s, 1H), 1,36 (s, 12H); EIMS *масса/заряд* 318.

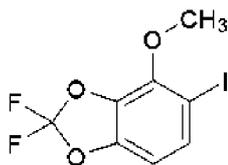
Пример 91. Получение 2,2-дифтор-5-йодбензо[*d*][1,3]диоксол-4-ола (С48)



Указанное в заголовке соединение получали в соответствии со способом в Altenbach, R. J., et al., WO 2017/009804 A1. Охлаждали раствор 2,2-дифторбензо[*d*][1,3]диоксол-4-ола (2,00 г, 11,5 ммоль) в MeOH (20,2 мл) до < 0°C и добавляли *N*-этил-*N*-изопропилпропан-2-амин (1,16 мл, 12,6 ммоль) и хлорид йода (1,27 мл, 25,3 ммоль) (по каплям при < 5°C). Через 30 мин. реакцию смесь гасили с помощью насыщ. водн. $\text{Na}_2\text{S}_2\text{O}_3$ (10 мл) и смесь разделяли между водой (10 мл) и Et_2O (30 мл). Органический слой промывали солевым раствором (5 мл), высушивали над Na_2SO_4 , фильтровали и концентрировали. В результате очистки остатка с помощью колоночной хроматографии на силикагеле с элюированием 0-20% EtOAc-гексан получали 2,2-дифтор-5,7-дийодбензо[*d*][1,3]диоксол-4-ол (1,03 г, 21%), 2,2-дифтор-5-йодбензо[*d*][1,3]диоксол-4-ол (0,487 г, 14%) и 2,2-дифтор-7-йодбензо[*d*][1,3]диоксол-4-ол (1,19 г, 35%). ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 7,39 (d, $J=8,5$ Гц, 1H), 6,52 (d, $J=8,5$ Гц, 1H), 6,24 (s, 1H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, CDCl_3) δ -49,42; ^{19}F ЯМР (376

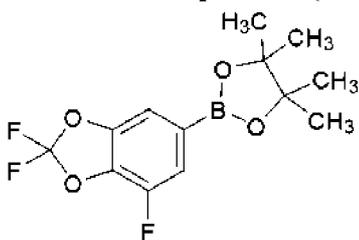
МГц, CDCl₃) δ -49,42; EIMS *масса/заряд* 300.

Пример 92. Получение 2,2-дифтор-5-йод-4-метоксибензо[*d*][1,3]диоксола (C49)

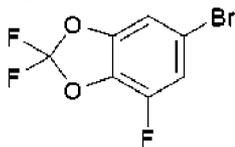


В охлажденный до 0°C раствор 2,2-дифтор-5-йодбензо[*d*][1,3]диоксол-4-ола (C48; 500 мг, 1,67 ммоль) в безводном THF добавляли карбонат калия (576 мг, 4,17 ммоль) и диметилсульфат (0,788 мл, 8,33 ммоль). Реакционную смесь нагревали до комнатной температуры и обеспечивали ее перемешивание в течение 3 ч. Реакционную смесь гасили с помощью насыщ. водн. NH₄Cl и экстрагировали с помощью EtOAc (3×25 мл). Органические экстракты объединяли, высушивали над Na₂SO₄ и концентрировали. В результате очистки полученного коричневого остатка с помощью хроматографии на силикагеле получали указанное в заголовке соединение в виде белого твердого вещества (448 мг, 69%): ¹H ЯМР (500 МГц, CDCl₃) δ 7,47 (d, *J*=8,4 Гц, 1H), 6,54 (d, *J*=8,4 Гц, 1H), 4,12 (s, 3H); ¹⁹F ЯМР (471 МГц, CDCl₃) δ -49,78; EIMS *масса/заряд* 314,0.

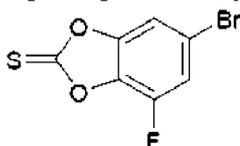
Пример 93. Получение 4,4,5,5-тетраметил-2-(2,2,7-трифторбензо[*d*][1,3]диоксол-5-ил)-1,3,2-диоксаборолана (C50)



Указанное в заголовке соединение получали в соответствии со способом получения 51 в Eckelbarger, et al., публикация заявки на патент США № 2014/0274701 A1. 6-Бром-2,2,4-трифторбензо[*d*][1,3]диоксол (C51; 2,00 г, 7,84 ммоль) растворяли в сухом THF (10 мл), охлаждали до -5-0°C и обрабатывали порциями комплексом хлорида изопропилмагния и хлорида лития (6,34 мл 1,3 М раствора в THF, 8,24 ммоль) с поддержанием температуры ниже 5°C. Охлаждающую баню удаляли и смесь перемешивали в течение 30 мин. Добавляли 2-изопропокси-4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан (1,56 г, 8,39 ммоль) и смесь перемешивали в течение 1 ч. Смесь обрабатывали с помощью насыщ. NH₄Cl (5 мл) и перемешивали в течение 5 мин. Смесь разбавляли с помощью EtOAc (40 мл) и насыщ. NaCl (10 мл). Регулировали pH до примерно 2 с помощью HCl и после экстракции органическую фазу промывали с помощью насыщ. NaCl (5 мл), высушивали и концентрировали. Указанное в заголовке соединение выделяли в виде коричневого масла (2,1 г, 89%), которое применяли без дополнительной очистки: ¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ 7,36 (d, *J*=9,8 Гц, 1H), 7,29 (d, *J*=6,5 Гц, 1H), 1,33 (s, 12H); ¹⁹F ЯМР (376 МГц, CDCl₃) δ -49,79, -136,26; EIMS *масса/заряд* 302,0.

Пример 94. Получение 6-бром-2,2,4-трифторбензо[*d*][1,3]диоксола (C51)

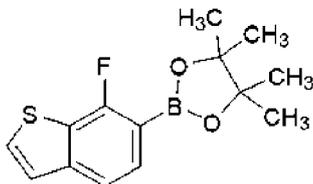
Указанное в заголовке соединение получали в соответствии со способом получения 50 в Eckelbarger, et al., публикация заявки на патент США № 2014/0274701 A1. 6-Бром-4-фторбензо[*d*][1,3]диоксол-2-тион (C52; 6,5 г, 26,1 ммоль) растворяли в DCM (150 мл). Раствор охлаждали до -35°C , обрабатывали раствором HF-пиридин (70%, 35,0 мл, 272 ммоль) и порциями 1-йодпирролидин-2,5-дионом (19,0 г, 84,4 ммоль). В течение 30 мин. реакционную смесь нагревали от -35 до 0°C . Охлаждающую баню удаляли и обеспечивали нагревание до 25°C в течение 30 мин., после чего превращение завершалось. Реакционную смесь обрабатывали порциями с помощью NaHSO_3 (8 г) в воде (50 мл) с внешним охлаждением ниже 15°C при перемешивании в течение 15 мин. Смесь дополнительно разбавляли водой (200 мл) с растворением твердых веществ. Органическую фазу промывали с помощью насыщ. NaCl (30 мл) и высушивали. Летучие вещества удаляли путем перегонки через колонку Oldershaw с 7 тарелками и затем через колонку Vigreux 200 мм при 1 атм. до достижения объема нижнего слоя примерно 50 мл. Перегонку останавливали, когда температуру верхнего слоя поддерживали на уровне 75°C во время удаления примерно 10 мл дистиллята и затем понижали по мере нагревания. После охлаждения продукт перегоняли при примерно 50 мм рт. ст. при температуре $75-80^{\circ}\text{C}$. Указанное в заголовке соединение выделяли в виде розовой жидкости (5,3 г, 74%): ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 7,11 (dd, $J=9,0, 1,7$ Гц, 1H), 7,07 (m, 1H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, CDCl_3) δ -49,56, -132,65; EIMS масса/заряд 254,0.

Пример 95. Получение 6-бром-4-фторбензо[*d*][1,3]диоксол-2-тиона (C52)

Указанное в заголовке соединение получали в соответствии со способом получения 49 в Eckelbarger, et al., публикация заявки на патент США № 2014/0274701 A1. Растворяли 5-бром-3-фторбензол-1,2-диол (2,0 г, 9,66 ммоль) в хлороформе (25 мл) и обрабатывали тиофосгеном (0,815 мл, 10,6 ммоль). Реакционную смесь охлаждали до $0-5^{\circ}\text{C}$. Добавляли по каплям 10% водн. раствор NaOH (8,89 г, 22,2 ммоль) при энергичном перемешивании в течение примерно 30 мин. Реакционную смесь перемешивали в течение еще 30 мин. после завершения добавления. Через 1 ч. хлороформ удаляли в вакууме и регулировали pH до примерно 2 путем добавления 6 М HCl . Твердый продукт поглощали с помощью EtOAc (120 мл). Органическую фазу промывали с помощью насыщ. NaCl (30 мл), высушивали и концентрировали. В результате очистки с помощью хроматографии на силикагеле с

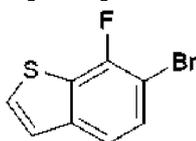
применением 0-30% EtOAc-гексан получали указанное в заголовке соединение в виде коричневого твердого вещества (1,5 г, 59%): ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 7,35-7,30 (m, 1H), 7,29 (d, $J=1,6$ Гц, 1H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, CDCl_3) δ -128,93; EIMS *масса/заряд* 248,0.

Пример 96. Получение 2-(7-фторбензо[*b*]тиофен-6-ил)-4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолана (C53)



6-Бром-7-фторбензо[*b*]тиофен (1,00 г, 4,33 ммоль), безводный ацетат калия (0,849 г, 8,65 ммоль) и 4,4,4',4',5,5,5',5'-октаметил-2,2'-би(1,3,2-диоксаборолан) (1,21 г, 4,76 ммоль) объединяли в сухом диоксане (15 мл) и смесь барботировали азотом в течение 10 мин. и обрабатывали с помощью $\text{Pd}(\text{dppf})\text{Cl}_2$ (0,177 г, 0,216 ммоль). Реакционную смесь нагревали до 90°C в течение 20 ч. Смесь охлаждали, перемешивали с EtOAc (50 мл) и водой (20 мл) и фильтровали через Celite[®]. Органическую фазу промывали с помощью насыщ. NaCl (10 мл), высушивали и концентрировали. В результате очистки с помощью хроматографии на силикагеле с применением 0-30% EtOAc-гексан получали указанное в заголовке соединение в виде белого твердого вещества (820 мг, 65%): т. пл. $107-108^\circ\text{C}$; ^1H ЯМР (400 МГц, $\text{DMSO}-d_6$) δ 7,98 (d, $J=5,3$ Гц, 1H), 7,74 (dd, $J=7,9, 1,0$ Гц, 1H), 7,64-7,57 (m, 1H), 1,33 (s, 12H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, $\text{DMSO}-d_6$) δ -104,03; EIMS *масса/заряд* 278.

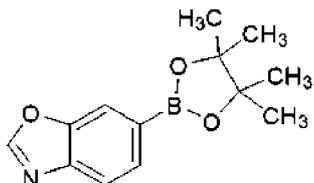
Пример 97. Получение 6-бром-7-фторбензо[*b*]тиофена (C54)



Добавляли этил-6-бром-7-фторбензо[*b*]тиофен-2-карбоксилат (4,1 г, 13,52 ммоль) в EtOH (50 мл) и воду (50 мл), обрабатывали гидроксидом калия (4,17 г, 74,4 ммоль) и нагревали до кипения с обратным холодильником в течение 3 ч. После охлаждения большую часть EtOH удаляли путем выпаривания в вакууме. Остаток поглощали водой и подкисляли с помощью 1 М HCl. Осажденную кислоту поглощали с помощью EtOAc (100 мл) и раствор промывали с помощью насыщ. NaCl (15 мл), высушивали и концентрировали с получением 3,5 г кислоты. Кислоту (2,5 г, 12 ммоль) и порошок меди (260 мг, 4,0 ммоль) объединяли в хиолине (12 мл) и смесь нагревали до 185°C . Наблюдали выделение газов. Через 45 мин. нагревания смесь охлаждали, разбавляли с помощью EtOAc (100 мл) и перемешивали с 1 М HCl (150 мл) в течение 10 мин. Смесь фильтровали через Celite[®] с удалением твердых веществ. Органическую фазу промывали водой (20 мл) и с помощью насыщ. NaCl (20 мл), высушивали и концентрировали. В результате очистки с помощью хроматографии на силикагеле с применением 0-5% EtOAc-гексаны получали материал,

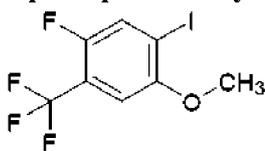
который содержал примерно 80% указанного в заголовке соединения. Материал дополнительно очищали с помощью RP-HPLC с применением 70% ацетонитрила, забуференного с помощью 0,20% H_3PO_4 , в качестве элюента. Указанное в заголовке соединение выделяли в виде белого кристаллического твердого вещества: т. пл. 45-46°C; ^1H ЯМР (400 МГц, $\text{DMSO}-d_6$) δ 7,92 (dd, $J=5,3$, 0,5 Гц, 1H), 7,72 (d, $J=8,4$ Гц, 1H), 7,67 (dd, $J=8,4$, 6,3 Гц, 1H), 7,58 (dd, $J=5,3$, 3,9 Гц, 1H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, $\text{DMSO}-d_6$) δ -110,20; EIMS *масса/заряд* 232.

Пример 98. Получение 6-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)бензо[d]оксазола (C55)



6-Бромбензо[d]оксазол (0,600 г, 3,03 ммоль), безводный ацетат калия (0,595 г, 6,06 ммоль) и 4,4,4',4',5,5,5',5'-октаметил-2,2'-би(1,3,2-диоксаборолан) (0,846 г, 3,33 ммоль) объединяли в сухом диоксане (10 мл) и смесь барботировали азотом в течение 15 мин. Реакционную смесь обрабатывали с помощью $\text{Pd}(\text{dppf})\text{Cl}_2$ (0,124 мг, 0,152 ммоль) и нагревали до 90°C в течение 16 ч. После охлаждения смесь встряхивали с EtOAc (45 мл) и насыщ. NaCl (10 мл) и фильтровали с удалением темных твердых веществ. Органическую фазу высушивали и концентрировали. В результате очистки с помощью хроматографии на силикагеле с применением 0-30% EtOAc -гексан получали указанное в заголовке соединение в виде белых кристаллов (600 мг, 74%): т. пл. 79-81°C; ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,13 (s, 1H), 8,04 (s, 1H), 7,80 (qt, $J=3,3$, 1,8 Гц, 2H), 1,37 (s, 12H); EIMS *масса/заряд* 245.

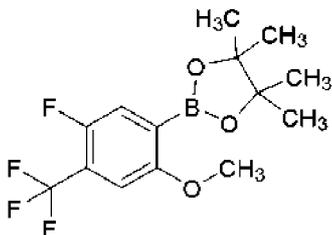
Пример 99. Получение 1-фтор-5-йод-4-метокси-2-(трифторметил)бензола (C56)



В колбу загружали DCM (95 мл) и 1-хлор-4-метокси-2-(трифторметил)бензол (5 г, 23,74 ммоль) с образованием прозрачного раствора. Последовательно добавляли йод (6,63 г, 26,1 ммоль) и трифторметансульфонат серебра (7,32 г, 28,5 ммоль). Обеспечивали перемешивание реакционной смеси при комнатной температуре в атмосфере азота. Через 1,5 ч. реакционную смесь фильтровали через Celite® с элюированием с помощью DCM, пока элюент не переставал быть фиолетовым. Фильтрат фиолетового цвета экстрагировали насыщ. водн. раствором тиосульфата натрия (50 мл), пока смесь полностью не становилась светло-желтой. Двухфазную смесь разбавляли водой (100 мл) и слои разделяли. Водный слой экстрагировали с помощью DCM (2×50 мл). Объединенные органические экстракты

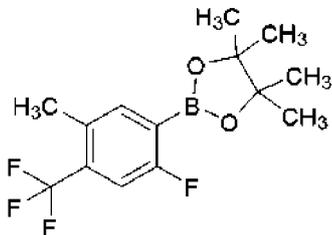
высушивали с помощью Na_2SO_4 , фильтровали и концентрировали путем ротационного выпаривания с получением 9,0 г коричневой жидкости, содержащей мелкие игловидные кристаллы. Проводили очистку смеси (которую загружали в минимальном количестве DCM непосредственно на сухую колонку) с помощью колоночной флэш-хроматографии на силикагеле с элюированием 0-3% EtOAc-гептан. Указанное в заголовке соединение выделяли в виде белого кристаллического твердого вещества (1,677 г, 85%): ^1H ЯМР (500 МГц, CDCl_3) δ 7,69-7,54 (m, 1H), 6,93 (d, $J=5,8$ Гц, 1H), 3,90 (s, 3H); ^{19}F ЯМР (471 МГц, CDCl_3) δ -61,54, -123,86; ^{19}F ЯМР (471 МГц, CDCl_3) δ -61,54, -123,86; EIMS *масса/заряд* 320,0.

Пример 100. Получение 2-(5-фтор-2-метокси-4-(трифторметил)фенил)-4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолана (C57)



В дегазированный раствор ацетата калия (1,023 г, 10,43 ммоль), 1-фтор-5-йод-4-метокси-2-(трифторметил)бензола (**C56**; 776 мг, 2,425 ммоль) и 4,4,4',4',5,5,5',5'-октаметил-2,2'-би(1,3,2-диоксаборолан) (739 мг, 2,91 ммоль) в 1,4-диоксане (12,1 мл) добавляли $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_2\text{Cl}_2$ (0,170 г, 0,242 ммоль). Реакционную смесь перемешивали при нагревании с обратным холодильником в течение ночи. Добавляли еще 0,10 экв. катализатора. Через 3 ч. реакционную смесь охлаждали и концентрировали. Остаток загружали на силикагель. В результате очистки с помощью колоночной хроматографии (гексаны-EtOAc) получали указанное в заголовке соединение в виде белого твердого вещества (313 мг, 34%): ^1H ЯМР (300 МГц, CDCl_3) δ 7,47 (d, $J=10,2$ Гц, 1H), 7,00 (d, $J=5,2$ Гц, 1H), 3,85 (s, 3H), 1,36 (s, 12H); ^{19}F ЯМР (471 МГц, CDCl_3) δ -61,67, -126,88; EIMS *масса/заряд* 320,1.

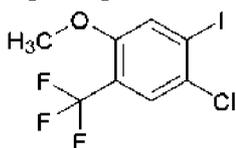
Пример 101. Получение 2-(2-фтор-5-метил-4-(трифторметил)фенил)-4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолана (C58)



Отвешивали бензойный пероксиангидрид (0,025 г, 0,104 ммоль) и 4,4,4',4',5,5,5',5'-октаметил-2,2'-би(1,3,2-диоксаборолан) (1,446 г, 5,70 ммоль) в герметизированную пробирку объемом 20 мл. Затем добавляли последовательно MeCN (15,7 мл), 2-фтор-5-метил-4-(трифторметил)анилин (1,00 г, 5,18 ммоль) и *трет*-бутилнитрит (0,924 мл, 7,77

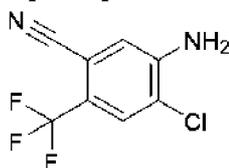
ммоль). Обеспечивали перемешивание полученного реакционного раствора в течение 1~2 ч. при 60°C (выделение газообразного азота завершалось в течение 5 мин.). Раствор концентрировали при пониженном давлении. В результате очистки остатка с помощью флэш-хроматографии получали указанное в заголовке соединение в виде оранжевого масла (0,745 г, 45%): ^1H ЯМР (500 МГц, CDCl_3) δ 7,63 (d, $J=5,7$ Гц, 1H), 7,32-7,24 (m, 1H), 2,44 (dd, $J=2,3,1,3$ Гц, 3H), 1,37 (s, 12H); ^{19}F ЯМР (471 МГц, CDCl_3) δ -62,71, -106,05; EIMS *масса/заряд* 289,1 ([M-Me]).

Пример 102. Получение 1-хлор-2-йод-4-метокси-5-(трифторметил)бензола (С59)



В сосуд объемом 5 мл добавляли 2-хлор-5-метокси-4-(трифторметил)анилин (429 мг, 1,90 ммоль), *трет*-бутилнитрит (23,1 мкл, 0,194 ммоль) и диодметан (208 мг, 0,776 ммоль). Сосуд герметизировали и реакционную смесь нагревали до 65°C в течение 2 ч. Реакционную смесь загружали непосредственно на колонку с силикагелем. В результате очистки с помощью колоночной хроматографии с элюированием смесью гексаны-EtOAc получали указанное в заголовке соединение в виде желтого твердого вещества (132 мг, 20,6%): ^1H ЯМР (500 МГц, CDCl_3) δ 7,58 (s, 1H), 7,44 (s, 1H), 3,89 (s, 3H); ^{19}F ЯМР (471 МГц, CDCl_3) δ -63,01; EIMS *масса/заряд* 336,0.

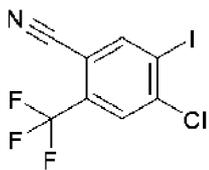
Пример 103. Получение 5-амино-4-хлор-2-(трифторметил)бензонитрила (С60)



В сосуд объемом 20 мл загружали 5-бром-2-хлор-4-(трифторметил)анилин (159 мг, 0,579 ммоль) и *N, N*-диметилформамид (1158 мкл). Смесь нагревали до 140°C в течение 12 ч. Реакционную смесь охлаждали и выливали в воду (20 мл), содержащую концентрированный гидроксид аммония (2 мл). Смесь разбавляли с помощью DCM (100 мл) и фильтровали через Celite[®]. Слои разделяли и водный слой экстрагировали с помощью DCM. Органические экстракты объединяли, высушивали над Na_2SO_4 и концентрировали при пониженном давлении. Полученный коричневый остаток загружали на силикагель. Проводили очистку с помощью колоночной хроматографии с градиентным элюированием от чистых гексанов (300 мл) до смеси гексаны-EtOAc (20:1, 300 мл; 10:1, 300 мл и 5:1, 300 мл). Элюирование с возрастающим градиентом с помощью систем с менее полярными растворителями является необходимым для отделения побочного продукта, представляющего собой цианобромид, от целевого продукта. Указанное в заголовке соединение выделяли в виде белого твердого вещества (41 мг, 32%): ^1H ЯМР (500 МГц, CDCl_3) δ 7,64 (s, 1H), 7,12 (s, 1H), 4,67 (s, 2H); ^{19}F ЯМР (471 МГц, CDCl_3) δ -60,60; EIMS

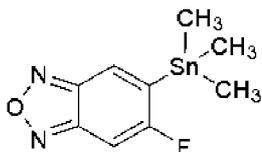
масса/заряд 221.

Пример 104. Получение 4-хлор-5-йод-2-(трифторметил)бензонитрила (С61)



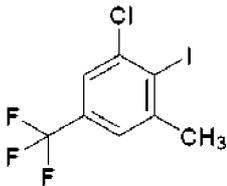
В сосуд объемом 20 мл добавляли 5-амино-4-хлор-2-(трифторметил)бензонитрил (С60; 0,041 г, 0,186 ммоль) и диодметан (0,299 мл, 3,72 ммоль). Смесь нагревали до 100°C перед добавлением трет-бутилнитрита (0,055 мл, 0,465 ммоль). При добавлении наблюдали энергичное выделение газа. Обеспечивали перемешивание реакционной смеси при повышенной температуре в течение 2 часов, после чего реакционную смесь охлаждали и загружали на силикагель с проведением хроматографии с применением гексанов/EtOAc с получением 4-хлор-5-йод-2-(трифторметил)бензонитрила (37,5 мг, 0,107 ммоль, выход 57,8%) в виде прозрачного масла (37,5 мг, 57,8%); ¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ 8,35-8,27 (m, 1H), 7,82 (s, 1H); ¹⁹F ЯМР (376 МГц, CDCl₃) δ -62,37.; ¹⁹F ЯМР (376 МГц, CDCl₃) δ -62,37.; EIMS масса/заряд 331,0.

Пример 105. Получение 5-фтор-6-(триметилстаннил)бензо[с][1,2,5]оксадиазола (С62)



В раствор 1,1,1,2,2,2-гексаметилдиистаннана (1,051 мл, 5,07 ммоль) в толуоле (9,22 мл) добавляли 5-бром-6-фторбензо[с][1,2,5]оксадиазол (1,000 г, 4,61 ммоль). Для получения 5-бром-6-фторбензо[с][1,2,5]оксадиазола (1,000 г, 4,61 ммоль) см. публикацию заявки на патент США № 2014/0274702. После дегазирования и заполнения азотом добавляли Pd(dppf)Cl₂ (0,376 г, 0,461 ммоль, 0,1 экв.). Реакционную смесь перемешивали при нагревании с обратным холодильником в течение ночи в атмосфере азота, охлаждали и концентрировали. Остаток очищали с помощью колоночной хроматографии на силикагеле с элюированием чистыми гексанами, затем смесью 10:1 гексаны-EtOAc. Фракции, содержащие продукт, собирали и концентрировали с получением 5-фтор-6-(триметилстаннил)бензо[с][1,2,5]оксадиазола (0,953 г, 69%).

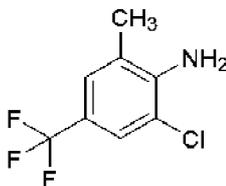
Пример 106. Получение 1-хлор-2-йод-3-метил-5-(трифторметил)бензола (С63)



В герметизированную пробирку объемом 50 мл добавляли 2-хлор-6-метил-4-

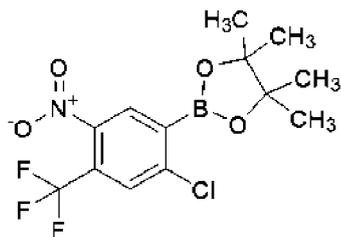
(трифторметил)анилин (**C64**; 0,895 г, 4,27 ммоль) и диодметан (22,88 г, 85 ммоль). Неоднородную смесь нагревали до 110°C. Добавляли одной порцией *трет*-бутилнитрит (1,10 г, 10,7 ммоль). После добавления реакционная смесь становилась оранжевой и однородной. Добавляли две дополнительные порции по 2,5 экв. (всего 5 экв.) *трет*-бутилнитрита в течение 4 ч. Через 4 ч. реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры и загружали на силикагель. В результате очистки с помощью колоночной хроматографии с элюированием гексанами получали указанное в заголовке соединение в виде прозрачного масла (634 мг, 46%): ¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ 7,52 (dt, *J*=2,3, 0,8 Гц, 1H), 7,34 (dt, *J*=2,2, 0,7 Гц, 1H), 2,59 (s, 3H); ¹⁹F ЯМР (376 МГц, CDCl₃) δ -63,05; EIMS *масса/заряд* 320,0.

Пример 107. Получение 2-хлор-6-метил-4-(трифторметил)анилина (C64)



В герметизированный сосуд объемом 50 мл загружали 2-метил-4-(трифторметил)анилин (2,50 г, 14,3 ммоль), 1-хлорпирролидин-2,5-дион (2,10 г, 15,7 ммоль) и MeCN (28,5 мл). Смесь нагревали до 80°C в течение 12 ч. Реакционную смесь загружали непосредственно на силикагель. В результате очистки с помощью колоночной хроматографии с элюированием линейным градиентом 0-100% EtOAc-гексаны получали указанное в заголовке соединение в виде прозрачного вязкого масла (0,895 г, 30%): ¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ 7,44-7,34 (m, 1H), 7,23-7,13 (m, 1H), 4,32 (s, 2H), 2,23 (s, 3H); ¹⁹F ЯМР (376 МГц, CDCl₃) δ -61,32; ESIMS *масса/заряд* 210,0 ([M+H]⁺).

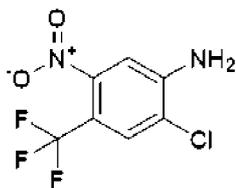
Пример 108. Получение 2-(2-хлор-5-нитро-4-(трифторметил)фенил)-4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолана (C65)



Отвешивали бензойный пероксиангидрид (0,020 г, 0,083 ммоль) и 4,4,4',4',5,5,5',5'-октаметил-2,2'-би(1,3,2-диоксаборолан) (1,16 г, 4,58 ммоль) в герметизированную пробирку объемом 20 мл. Затем добавляли последовательно MeCN (12,6 мл), 2-хлор-5-нитро-4-(трифторметил)анилин (**C66**; 1,00 г, 4,16 ммоль) и *трет*-бутилнитрит (0,742 мл, 6,24 ммоль). Обеспечивали перемешивание полученного реакционного раствора в течение 2 ч. при 60°C (выделение газообразного азота завершалось в течение 5 мин.). Затем раствор концентрировали при пониженном давлении и коричневый маслянистый остаток

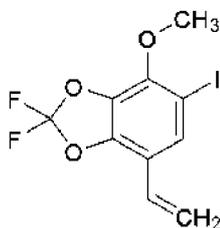
применяли без дополнительной очистки: ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,24 (s, 1H), 7,79 (s, 1H), 1,39 (s, 12H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, CDCl_3) δ -61,50.

Пример 109. Получение 2-хлор-5-нитро-4-(трифторметил)анилина (С66)



Отвешивали 3-нитро-4-(трифторметил)анилин (1,5 г, 7,28 ммоль) в круглодонную колбу объемом 25 мл, оснащенную перегородками. Добавляли метанол (14,6 мл) и смесь перемешивали до достижения полного растворения. Добавляли одной порцией 1-хлорпирролидин-2,5-дион (0,972 г, 7,28 ммоль) при перемешивании. Обеспечивали перемешивание реакционной смеси при комнатной температуре, пока не наблюдали полное расходование исходного материала. Через 24 ч. реакционную смесь концентрировали и загружали непосредственно на силикагель. В результате очистки с помощью колоночной хроматографии с элюированием с помощью 90% гексанов и EtOAc получали указанное в заголовке соединение в виде оранжевого твердого вещества (1,00 г, 57%): ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 7,66 (s, 1H), 7,25 (s, 1H), 4,78 (s, 3H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, CDCl_3) δ -58,75; EIMS масса/заряд 240.

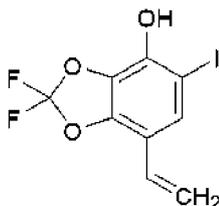
Пример 110. Получение 2,2-дифтор-5-йод-4-метокси-7-винилбензо[d][1,3]диоксола (С67)



В охлажденный до 0°C раствор 2,2-дифтор-5-йод-7-винилбензо[d][1,3]диоксол-4-ола (С68; 36,0 мг, 0,110 ммоль) в безводном THF добавляли карбонат калия (76 мг, 0,552 ммоль). Обеспечивали перемешивание реакционной смеси при 0°C в течение 30 мин. перед добавлением диметилсульфата (0,1 мл, 1,06 ммоль) в виде 2,0 М раствора в *трет*-бутилметиловом простом эфире. Реакционную смесь нагревали до комнатной температуры и обеспечивали ее перемешивание в течение 3 ч., после чего ее концентрировали и загружали непосредственно на силикагель. В результате очистки с помощью колоночной хроматографии с элюированием гексанами и этилацетатом получали указанное в заголовке соединение в виде прозрачного масла (40 мг, 100%): ^1H ЯМР (500 МГц, CDCl_3) δ 7,50 (s, 1H), 6,55-6,48 (m, 1H), 5,83 (dd, $J=17,7$, 0,7 Гц, 1H), 5,42 (dd, $J=11,2$, 0,7 Гц, 1H), 4,11 (s, 3H); ^{19}F ЯМР (471 МГц, CDCl_3) δ -49,39; ESIMS масса/заряд 341,4 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

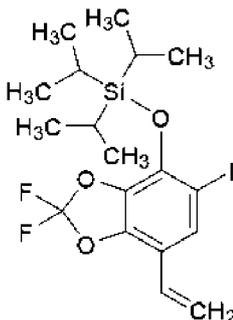
Пример 111. Получение 2,2-дифтор-5-йод-7-винилбензо[d][1,3]диоксол-4-ола

(С68)



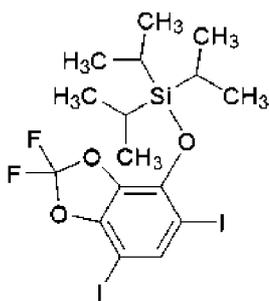
В раствор ((2,2-дифтор-5-йод-7-винилбензо[*d*][1,3]диоксол-4-ил)окси)триизопропилсилана (С69; 140 мг, 0,290 ммоль) в THF (2 мл) добавляли одной порцией гидрат фторида тетрабутиламмония (81 мг, 0,290 ммоль) при комнатной температуре. Обеспечивали перемешивание реакционной смеси в течение ночи. Реакционную смесь концентрировали и остаток загружали на силикагель. В результате очистки с помощью колоночной хроматографии с линейным градиентом гексаны-EtOAc получали указанное в заголовке соединение в виде прозрачного масла (36 мг, 36%): ^1H ЯМР (500 МГц, CDCl_3) δ 7,41 (s, 1H), 6,51 (dd, $J=17,8, 11,3$ Гц, 1H), 5,82 (d, $J=17,8$ Гц, 1H), 5,42 (d, $J=11,3$ Гц, 1H); ^{19}F ЯМР (471 МГц, CDCl_3) δ -48,98; EIMS *масса/заряд* 326,0.

Пример 112. Получение ((2,2-дифтор-5-йод-7-винилбензо[*d*][1,3]диоксол-4-ил)окси)триизопропилсилана (С69)



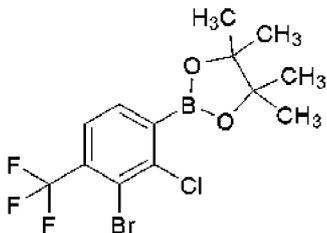
Процедура адаптирована из публикации заявки на патент США № 20140080862, 20 марта 2014 г. В сосуд объемом 25 мл добавляли ((2,2-дифтор-5,7-дийодбензо[*d*][1,3]диоксол-4-ил)окси)триизопропилсилан (С70; 200 мг, 0,344 ммоль), трибутил(винил)станнан (120 мг, 0,378 ммоль) и толуол. Смесь дегазировали азотом в течение 10 мин. перед добавлением Pd(dppf) в виде комплекса с дихлорметаном (1:1). Реакционную смесь нагревали при 100°C в течение 16 ч. и концентрировали при пониженном давлении. В результате очистки остатка с помощью хроматографии (силикагель, гептан-EtOAc) получали указанное в заголовке соединение в виде прозрачного масла (140 мг, 84%): ^1H ЯМР (500 МГц, CDCl_3) δ 7,50 (s, 1H), 6,51 (dd, $J=17,7, 11,3$ Гц, 1H), 5,81 (dd, $J=17,8, 0,7$ Гц, 1H), 5,39 (dd, $J=11,3, 0,7$ Гц, 1H), 1,44-1,36 (m, 3H), 1,14 (d, $J=7,6$ Гц, 18H); ^{19}F ЯМР (471 МГц, CDCl_3) δ -49,40; EIMS *масса/заряд* 482,2.

Пример 113. Получение ((2,2-дифтор-5,7-дийодбензо[*d*][1,3]диоксол-4-ил)окси)триизопропилсилана (С70)



Охлаждали раствор 2,2-дифтор-5,7-дйодбензо[*d*][1,3]диоксол-4-ола (C72; 491 мг, 1,15 ммоль) в DCM (2023 мкл) и 2,6-диметилпиридина (267 мкл, 2,306 ммоль) в DCM (2023 мкл) до $< 0^{\circ}\text{C}$. Добавляли триизопропилсилилтрифторметансульфонат (465 мкл, 1,73 ммоль) (по каплям при $< 5^{\circ}\text{C}$) и обеспечивали перемешивание реакционной смеси при комнатной температуре в течение 2 ч., после чего ее загружали непосредственно на силикагель. В результате очистки с помощью хроматографии на силикагеле с элюированием смесью гексаны-EtOAc (от 100% до 10%) получали указанное в заголовке соединение в виде прозрачного масла (510 мг, 76%): ^1H ЯМР (500 МГц, CDCl_3) δ 7,76 (s, 1H), 1,43-1,34 (m, 3H), 1,13 (d, $J=7,5$ Гц, 18H); ^{19}F ЯМР (471 МГц, CDCl_3) δ -49,18; EIMS масса/заряд 582,1.

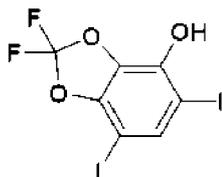
Пример 114. Получение 2-(3-бром-2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолана (C71)



Помещали 2,2,6,6-тетраметилпиперидин-1-ид лития (2,84 г, 19,27 ммоль) в высушенную в печи круглодонную колбу объемом 250 мл в перчаточном боксе и удаляли. Добавляли диэтиловый эфир (75 мл) и раствор охлаждали до -78°C (реакционная смесь не была однородной). Добавляли по каплям 2-бром-1-хлор-3-(трифторметил)бензол (5,00 г, 19,3 ммоль, 1,0 экв.) в виде раствора в простом эфире (25 мл) в течение 10 минут и обеспечивали перемешивание смеси при -78°C в течение 1 часа. Затем добавляли 2-изопропокси-4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан (3,9 мл, 19,27 ммоль, 1,0 экв.) в неоднородную реакционную смесь в течение 10 минут и обеспечивали медленное нагревание реакционной смеси до комнатной температуры в течение ночи. Реакционную смесь гасили насыщенным раствором NH_4Cl при 0°C и нагревали до комнатной температуры, слои разделяли. Водный слой дополнительно экстрагировали диэтиловым эфиром (2) и объединенные органические слои высушивали над сульфатом натрия, фильтровали и концентрировали. В результате очистки на силикагеле с применением градиента от 0 до 5% этилацетат/гексан получали указанное в заголовке соединение (3,87

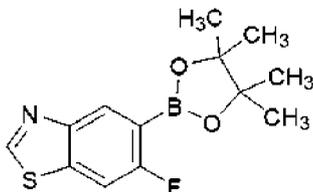
г, выход 52%) в виде вязкого желтого масла.

Пример 115. Получение 2,2-дифтор-5,7-дйодбензо[*d*][1,3]диоксол-4-ола (С72)



Указанное в заголовке соединение получали в соответствии со способом в Altenbach, R. J., et al., WO 2017/009804 A1. Охлаждали раствор 2,2-дифторбензо[*d*][1,3]диоксол-4-ола (2,00 г, 11,5 ммоль) в MeOH (20,2 мл) до $< 0^{\circ}\text{C}$ и добавляли *N*-этил-*N*-изопропилпропан-2-амин (1,16 мл, 12,6 ммоль) и хлорид йода (1,27 мл, 25,3 ммоль) (по каплям при $< 5^{\circ}\text{C}$). Через 30 мин. реакцию смесь гасили с помощью насыщ. водн. $\text{Na}_2\text{S}_2\text{O}_3$ (10 мл) и смесь разделяли между водой (10 мл) и Et_2O (30 мл). Органический слой промывали солевым раствором (5 мл), высушивали над Na_2SO_4 , фильтровали и концентрировали. В результате очистки остатка с помощью колоночной хроматографии на силикагеле с элюированием 0-20% EtOAc-гексан получали 2,2-дифтор-5,7-дйодбензо[*d*][1,3]диоксол-4-ол (1,03 г, 21%), 2,2-дифтор-5-йодбензо[*d*][1,3]диоксол-4-ол (0,487 г, 14%) и 2,2-дифтор-7-йодбензо[*d*][1,3]диоксол-4-ол (1,19 г, 35%). Структуру 2,2-дифтор-7-йодбензо[*d*][1,3]диоксол-4-ола подтверждали с применением двухмерных экспериментов ЯМР. Соединение выделяли в виде белого твердого вещества (1,03 г, 21%): ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 7,69 (s, 1H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, CDCl_3) δ -49,42; EIMS масса/заряд 425,9.

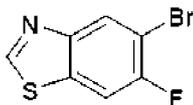
Пример 116. Получение 6-фтор-5-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)бензо[*d*]тиазола (С73)



5-Бром-6-фторбензо[*d*]тиазол (2,5 г, 10,8 ммоль) и ацетат калия (KOAc; 2,11 г, 21,5 ммоль) объединяли в сухом диоксане (20 мл), барботировали с помощью потока азота в течение 15 мин., обрабатывали с помощью 4,4,4',4',5,5,5',5'-октаметил-2,2'-би(1,3,2-диоксаборолан) (3,01 г, 11,9 ммоль) и $\text{Pd}(\text{dppf})\text{Cl}_2$ (0,440 г, 0,539 ммоль) и нагревали до 95°C в течение 6 ч. Добавляли дополнительное количество катализатора (240 мг) и нагревание продолжали в течение еще 6 ч. Охлажденную реакцию смесь перемешивали с EtOAc (50 мл) и водой (20 мл) в течение 20 мин. и фильтровали с удалением темных твердых веществ. Органическую фазу промывали с помощью насыщ. NaCl (10 мл), высушивали и концентрировали. В результате очистки с помощью хроматографии с применением 0-30% EtOAc-гексан в качестве элюента получали указанное в заголовке соединение в виде желтовато-коричневых кристаллов (1,5 г, 45%): ^1H ЯМР (400 МГц, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9,39 (s, 1H),

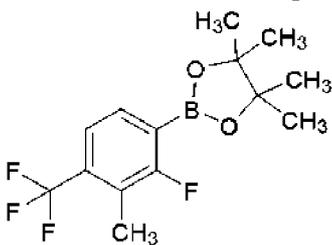
8,26 (d, $J=5,1$ Гц, 1H), 8,05 (d, $J=9,0$ Гц, 1H), 1,34 (s, 12H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, $\text{DMSO-}d_6$) δ -106,91; EIMS масса/заряд 231/233.

Пример 117. Получение 5-бром-6-фторбензо[d]тиазола (С74)



Объединяли *o*-этилкарбондифитоат калия (5,36 г, 33,5 ммоль), 5-бром-2,4-дифторанилин (5,8 г, 27,9 ммоль) в сухом *N*-метил-2-пирролидоне (NMP; 40 мл) и нагревали до 100°C в течение 18 ч. После охлаждения смесь разделяли между EtOAc (50 мл) и водой (30 мл). Водную фазу экстрагировали с помощью EtOAc (30 мл) и объединенные органические фазы промывали водой (2×25 мл), с помощью насыщ. NaCl (25 мл), высушивали и концентрировали с получением промежуточного соединения тиола (5,4 г) в виде желтовато-коричневого твердого вещества. Данный материал объединяли в метаноле (120 мл) с гексагидратом хлорида никеля (3,3 г, 14 ммоль) и порошком цинка (3,7 г, 56 ммоль), нагревали до кипения с обратным холодильником и обрабатывали по каплям концентрированной HCl (20 мл). Реакционную смесь нагревали в течение 2 ч. после завершения добавления. Охлажденную смесь перемешивали с EtOAc (200 мл) и обрабатывали концентрированным водн. раствором аммиака до получения pH > 10. Органическую фазу промывали с помощью насыщ. NaCl (40 мл), высушивали и концентрировали. В результате очистки с помощью хроматографии с применением 0-40% EtOAc-гексаны получали указанное в заголовке соединение в виде желтого твердого вещества (3,2 г, 47%): т. пл. 86-88°C; ^1H ЯМР (400 МГц, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9,44 (s, 1H), 8,47 (d, $J=6,3$ Гц, 1H), 8,30 (d, $J=8,6$ Гц, 1H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, $\text{DMSO-}d_6$) δ -111,18; EIMS масса/заряд 232.

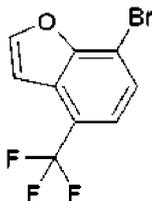
Пример 118. Получение 2-(2-фтор-3-метил-4-(трифторметил)фенил)-4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолана (С75)



В перемешиваемый раствор бис(изопропил)амина (2,36 мл, 16,8 ммоль) в THF (46,8 мл) при -78°C добавляли бутиллитий (6,18 мл, 15,44 ммоль). Полученный бледно-желтый раствор перемешивали при -78°C в течение 15 мин., нагревали до 0°C в течение 15 мин., затем повторно охлаждали до -78°C в течение 15 мин. Затем добавляли 1-фтор-2-метил-3-(трифторметил)бензол (2,5 г, 14,0 ммоль) и полученный раствор перемешивали при -78°C в течение 2 ч. Затем добавляли 2-изопропокси-4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан (2,86 мл, 14,02 ммоль) и обеспечивали медленное нагревание раствора до комнатной

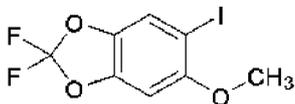
температуры и его перемешивали в течение ночи. Реакционную смесь разбавляли с помощью 0,1 М HCl и экстрагировали с помощью DCM. Объединенные органические экстракты высушивали над Mg₂SO₄, фильтровали и концентрировали. В результате очистки остатка с помощью флэш-хроматографии на силикагеле (от 5 до 30% EtOAc-гексан) получали указанное в заголовке соединение в виде прозрачного масла (2,45 г, 57%): ¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ 7,68-7,56 (m, 1H), 7,39 (d, J=7,8 Гц, 1H), 2,39-2,33 (m, 3H), 1,37 (s, 13H); ¹⁹F ЯМР (376 МГц, CDCl₃) δ -61,39 (s), -104,31 (s).

Пример 119. Получение 7-бром-4-(трифторметил)бензофурана (C76)



К 1-бром-2-(2,2-диэтоксиэтокси)-4-(трифторметил)бензолу (1,5 г, 4,20 ммоль) в толуоле (4,94 мл) добавляли водородную форму Amberlyst® 15 (252 мг, 4,20 ммоль). Реакционную смесь нагревали при 120°C в течение ~24 ч. и затем при комнатной температуре в течение ~72 ч. Реакционную смесь непосредственно загружали с помощью шприца на картридж Celite® с декантированием раствора от гранул смолы. В результате очистки с помощью флэш-хроматографии (от 0 до 30% EtOAc-гексаны) получали указанное в заголовке соединение в виде прозрачного масла (450 мг, 40%): ¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ 7,82 (d, J=2,2 Гц, 1H), 7,56 (d, J=8,1 Гц, 1H), 7,42 (d, J=8,1 Гц, 1H), 7,04 (t, J=1,9 Гц, 1H); ¹⁹F ЯМР (376 МГц, CDCl₃) δ -61,37; EIMS масса/заряд 262, 264.

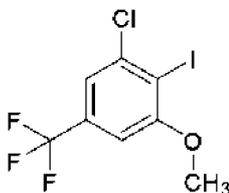
Пример 120. Получение 2,2-дифтор-5-йод-6-метоксибензо[d][1,3]диоксола (C77)



Указанное в заголовке соединение получали в соответствии со способом получения 45 в Eckelbarger, et al., публикация заявки на патент США № 2014/0274701 A1. Растворили 2,2-дифтор-6-метоксибензо[d][1,3]диоксол-5-амин (способ получения 44 в публикации заявки на патент США № 2014/0274701 A1; 1,40 г, 6,89 ммоль) в DCM (5 мл) и полученное добавляли порциями в концентрированную HCl (75 мл) при быстром перемешивании с образованием разбавленной белой взвеси. Смесь охлаждали до 3-5°C и обрабатывали порциями нитритом натрия (0,713 г, 10,3 ммоль), растворенным в воде (10 мл), в течение примерно 5 мин. Раствор диазония выливали в раствор йодида натрия (3,10 г, 20,7 ммоль) в воде (75 мл), перемешивали с DCM (50 мл). Через в общей сложности 30 мин. смесь перемешивали с помощью 15% NaHSO₃ (20 мл) в течение 10 мин. Водную фазу дополнительно экстрагировали с помощью DCM (30 мл) и объединенные органические фазы промывали с помощью насыщ. NaCl (15 мл), высушивали и концентрировали. В результате очистки остатка на силикагеле с применением 0-15% EtOAc-гексан получали

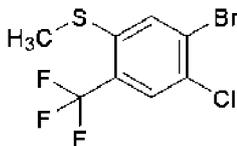
указанное в заголовке соединение в виде белого кристаллического твердого вещества (1,8 г, 83%): 50-51°C; ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 7,45 (s, 1H), 6,69 (s, 1H), 3,86 (s, 3H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, CDCl_3) δ -49,81 (s).

Пример 121. Получение 1-хлор-2-йод-3-метокси-5-(трифторметил)бензола (С78)



В сосуд объемом 5 мл добавляли 2-хлор-6-метокси-4-(трифторметил)анилин (106 мг, 0,470 ммоль) и диодметан (208 мг, 0,776 ммоль). Сосуд герметизировали и реакционную смесь нагревали до 100°C перед добавлением *трет*-бутилнитрита (121 мг, 1,175 ммоль). Реакционную смесь выдерживали при повышенных значениях температуры в течение 2 ч. Охлажденную реакционную смесь загружали непосредственно на силикагель. В результате очистки с помощью колоночной хроматографии со смесью гексаны-EtOAc получали указанное в заголовке соединение в виде коричневого масла (227 мг, 100%): ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 7,38 (s, 1H), 6,30 (s, 1H), 3,78 (s, 3H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, CDCl_3) δ -60,73; EIMS масса/заряд 336,0.

Пример 122. Получение (5-бром-4-хлор-2-(трифторметил)фенил)(метил)сульфана (С79)

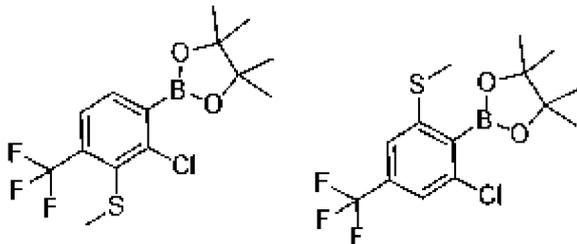


Стадия 1 - получение 2-бром-4-(метилтио)-5-(трифторметил)анилина. Отвешивали 4-(метилтио)-3-(трифторметил)анилин (500 мг, 2,41 ммоль) в круглодонную колбу объемом 25 мл, оснащенную перегородкой. Добавляли метанол (12,1 мл) и смесь перемешивали до достижения полного растворения. Добавляли одной порцией 1-бромпирролидин-2,5-дион (472 мг, 2,65 ммоль) при перемешивании. Обеспечивали перемешивание реакционной смеси при комнатной температуре, пока не наблюдали полное расходование исходного материала. Реакционную смесь концентрировали, поглощали простым эфиром и промывали с помощью насыщ. водн. NaCl. Органическую фазу отделяли, высушивали и концентрировали с получением указанного в заголовке соединения, которое применяли без дополнительной очистки на стадии 2.

Стадия 2 - получение (5-бром-4-хлор-2-(трифторметил)фенил)(метил)сульфана. В сосуд объемом 5 мл добавляли 2-бром-4-(метилтио)-5-(трифторметил)анилин (236 мг, 0,825 ммоль), *трет*-бутилнитрит (196 мкл, 1,65 ммоль) и хлорид меди(II) (222 мг, 1,65 ммоль). Сосуд герметизировали и реакционную смесь нагревали до 65°C в течение 2 ч. Реакционную смесь загружали непосредственно на колонку с силикагелем. В результате

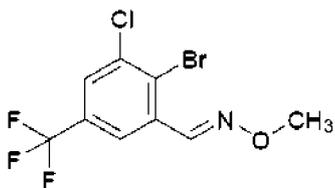
очистки полученного продукта с элюированием смесью гексаны-EtOAc получали указанное в заголовке соединение в виде белого твердого вещества (82 мг, 33%): ^1H ЯМР (500 МГц, CDCl_3) δ 7,66 (s, 1H), 7,53 (s, 1H), 2,52 (s, 4H); ^{19}F ЯМР (471 МГц, CDCl_3) δ -62,24; EIMS *масса/заряд* 305,9.

Пример 123. Получение 2-(2-хлор-3-(метилтио)-4-(трифторметил)фенил)-4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолана (C80) и 2-(2-хлор-6-(метилтио)-4-(трифторметил)фенил)-4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолана (C81)



В раствор тетраметилэтилендиамина (2,92 мл, 13,1 ммоль) в Et_2O (75 мл) добавляли с помощью шприца *n*-бутиллитий (2,5 М раствор в гексане; 5,2 мл, 13,1 ммоль) в течение 10 мин. при -78°C и смесь перемешивали в течение 15 мин. В вышеуказанную смесь добавляли с помощью шприца (3-бром-2-хлор-6-(трифторметил)фенил)(метил)сульфан и (2-бром-3-хлор-5-(трифторметил)фенил)(метил)сульфан (C87 и C88; 4 г, 13,1 ммоль) в Et_2O (70 мл) в течение 15 мин. Смесь перемешивали в течение 1 ч. при -78°C . В вышеуказанную реакционную смесь добавляли с помощью шприца 2-изопропокси-4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан (3,21 мл, 15,7 ммоль) в течение 10 мин. Реакционную смесь перемешивали в течение 1 ч. при -78°C , медленно нагревали до комнатной температуры и перемешивали в течение дополнительных 2 ч. Реакционную смесь гасили насыщ. раствором NH_4Cl при -78°C , нагревали до комнатной температуры и экстрагировали с помощью Et_2O . Органический слой промывали водой и солевым раствором и концентрировали в вакууме. В результате очистки полученной смеси, содержащей соединение, с помощью колоночной хроматографии с применением 2% EtOAc в гексане в качестве элюента получали смесь, содержащую указанное в заголовке соединение, в виде бесцветной жидкости (800 мг, 17%): ^1H ЯМР (300 МГц, CDCl_3) δ 7,67 (d, $J=8,0$ Гц, 1H), 7,59 (d, $J=7,7$ Гц, 1H), 7,36 (d, $J=6,9$ Гц, 2H), 2,50 (s, 3H), 2,40 (s, 3H), 1,43 (s, 12H), 1,39 (s, 12H).

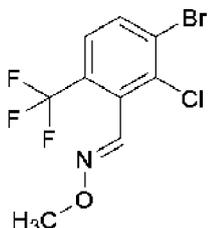
Пример 124. Получение (E)-2-бром-3-хлор-5-(трифторметил)бензальдегид-*O*-метилоксима (C82)



В раствор 2-бром-3-хлор-5-(трифторметил)бензальдегида и 3-бром-2-хлор-6-(трифторметил)бензальдегида (C85 и C86; 1,8 г, 6,26 ммоль) в этаноле последовательно

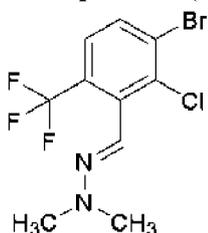
добавляли гидрохлорид метоксиламина (1,05 г, 12,5 ммоль) и Et₃N (1,74 мл, 12,5 ммоль) при комнатной температуре. Реакционную смесь перемешивали при нагревании с обратным холодильником в течение 16 ч. Реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры и концентрировали в вакууме. Остаток выливали в воду и экстрагировали с помощью EtOAc. Органический слой промывали водой и солевым раствором и концентрировали в вакууме. В результате очистки смеси, содержащей соединение, с помощью колоночной хроматографии с применением 5% EtOAc в гексане получали указанное в заголовке соединение в виде белого твердого вещества (250 мг, 13%): ¹H ЯМР (300 МГц, CDCl₃) δ 8,48 (s, 1H), 8,03 (d, *J*=2,5 Гц, 1H), 7,70 (d, *J*=2,1 Гц, 1H), 4,04 (s, 3H).

Пример 125. Получение (*E*)-3-бром-2-хлор-6-(трифторметил)бензальдегид-*O*-метилоксима (C83)



В раствор 2-бром-3-хлор-5-(трифторметил)бензальдегида и 3-бром-2-хлор-6-(трифторметил)бензальдегида (C85 и C86; 1,8 г, 6,26 ммоль) в этаноле последовательно добавляли гидрохлорид метоксиламина (1,05 г, 12,5 ммоль) и Et₃N (1,74 мл, 12,5 ммоль) при комнатной температуре. Реакционную смесь перемешивали при нагревании с обратным холодильником в течение 16 ч. Реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры и концентрировали в вакууме. Остаток выливали в воду и экстрагировали с помощью EtOAc. Органический слой промывали водой и солевым раствором и концентрировали в вакууме. В результате очистки смеси, содержащей соединение, с помощью колоночной хроматографии с применением 5% EtOAc в гексане получали указанное в заголовке соединение в виде белого твердого вещества (50 мг, 5%): ¹H ЯМР (300 МГц, CDCl₃) δ 8,23 (d, *J*=1,8 Гц, 1H), 7,78 (d, *J*=8,3 Гц, 1H), 7,50 (d, *J*=8,6 Гц, 1H), 4,00 (s, 3H).

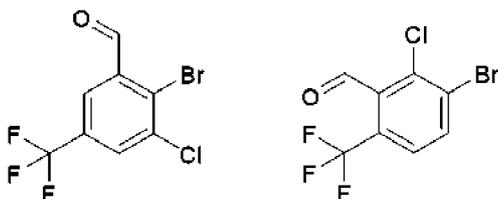
Пример 126. Получение (*E*)-2-(3-бром-2-хлор-6-(трифторметил)бензилиден)-1,1-диметилгидразина (C84)



В раствор 2-бром-3-хлор-5-(трифторметил)бензальдегида и 3-бром-2-хлор-6-(трифторметил)бензальдегида (C85 и C86; 2,5 г, 8,696 ммоль) в этаноле последовательно добавляли *N,N*-диметилгидразин (0,627 г, 10,436 ммоль) Et₃N (1,45 мл, 10,4 ммоль) при

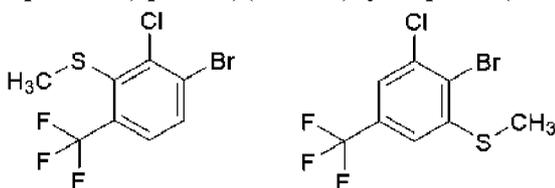
комнатной температуре и смесь нагревали до кипения с обратным холодильником в течение 16 ч. Реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры и концентрировали в вакууме. Остаток выливали в воду и экстрагировали с помощью EtOAc. Органический слой промывали водой и солевым раствором и концентрировали в вакууме. В результате очистки полученной смеси с помощью колоночной хроматографии с применением 5% EtOAc в гексане получали указанное в заголовке соединение в виде белого твердого вещества (125 мг, 4%): ^1H ЯМР (300 МГц, CDCl_3) δ 7,63 (d, $J=8,5$ Гц, 1H), 7,45 (d, $J=8,7$ Гц, 1H), 7,23 (s, 1H), 3,03 (s, 6H).

Пример 127. Получение 2-бром-3-хлор-5-(трифторметил)бензальдегида (С85) и 3-бром-2-хлор-6-(трифторметил)бензальдегида (С86)



В раствор диизопропиламина (5,7 мл, 40,5 ммоль) в Et₂O (50 мл) добавляли с помощью шприца *n*-бутиллитий (2,5 М раствор в гексане; 10,8 мл, 27,0 ммоль) при 0°C в течение 10 мин. и смесь перемешивали в течение 15 мин. Реакционную смесь охлаждали до -78°C и перемешивали в течение 1 ч. В вышеуказанную смесь добавляли с помощью шприца 1-бром-2-хлор-4-(трифторметил)бензол (7 г, 27,0 ммоль) в Et₂O (75 мл) в течение 15 мин. и реакционную смесь перемешивали в течение 1 ч. при -78°C. Добавляли с помощью шприца диметилформаид (2,52 мл, 32,4 ммоль) в течение 10 мин. и смесь перемешивали в течение 1 ч. при -78°C. Реакционную смесь гасили насыщ. раствором NH₄Cl при -78°C, нагревали до комнатной температуры и экстрагировали с помощью Et₂O. Органический слой промывали водой и солевым раствором и концентрировали в вакууме. Смесь, содержащую указанное в заголовке соединение, выделяли в виде оранжевой жидкости (4,8 г), которую применяли на следующей стадии без дополнительной очистки.

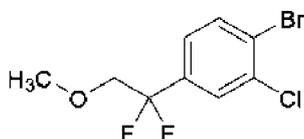
Пример 128. Получение (3-бром-2-хлор-6-(трифторметил)фенил)(метил)сульфана (С87) и (2-бром-3-хлор-5-(трифторметил)фенил)(метил)сульфана (С88)



В раствор диизопропиламина (10,8 мл, 77,1 ммоль) в Et₂O (75 мл) добавляли с помощью шприца *n*-бутиллитий (2,5 М раствор в гексане; 15,4 мл, 38,5 ммоль) при 0°C в течение 10 мин. и смесь перемешивали в течение 15 мин. Реакционную смесь охлаждали до -78°C и перемешивали в течение 1 ч. В вышеуказанную реакционную смесь добавляли с

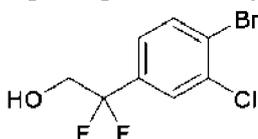
помощью шприца 1-бром-2-хлор-4-(трифторметил)бензол (10 г, 38,5 ммоль) в Et₂O (75 мл) в течение 15 мин. и реакционную смесь перемешивали в течение 1 ч. при -78°C. Добавляли с помощью шприца диметилдисульфид (4,11 мл, 46,3 ммоль) в течение 10 мин. и смесь перемешивали в течение 1 ч. при -78°C. Реакционную смесь медленно нагревали до комнатной температуры и перемешивали в течение 2 ч. Реакционную смесь гасили насыщ. раствором NH₄Cl при -78°C и экстрагировали с помощью Et₂O. Органический слой промывали водой и солевым раствором и концентрировали в вакууме. В результате очистки неочищенного остатка с помощью колоночной хроматографии с применением 0,5% EtOAc в гексане в качестве элюента получали смесь указанных в заголовке соединений в виде бесцветной жидкости (4 г, 34%): ¹H ЯМР (300 МГц, CDCl₃) δ 7,73 (d, J=8,5 Гц, 1H), 7,51-7,44 (m, 2H), 7,15 (d, J=2,0 Гц, 1H), 2,52 (s, 3H), 2,43 (s, 3H).

Пример 129. Получение 1-бром-2-хлор-4-(1,1-дифтор-2-метоксиэтил)бензола (С89)



В раствор 2-(4-бром-3-хлорфенил)-2,2-дифторэтан-1-ола (С90; 1 г, 3,69 ммоль) в DMF (10 мл) последовательно добавляли гидрид натрия (NaH, 60% суспензия в минеральном масле; 0,13 г, 5,53 ммоль) при 0°C и йодметан (CH₃I; 0,62 г, 4,42 ммоль). Реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 16 ч. и гасили ледяной водой. Смесь экстрагировали с помощью EtOAc. Органический слой промывали солевым раствором, высушивали над безводным Na₂SO₄, фильтровали и концентрировали при пониженном давлении. В результате очистки полученного продукта с помощью колоночной хроматографии (силикагель 100-200 меш) с элюированием 10-30% EtOAc в петролейном эфире получали указанное в заголовке соединение в виде бледно-желтой жидкости (0,4 г, 40%): ¹H ЯМР (300 МГц, CDCl₃) δ 7,68 (d, J=8,4 Гц, 1H), 7,61-7,60 (m, 1H), 7,28-7,26 (m, 1H), 3,78 (t, J=12,3 Гц, 2H), 3,42 (s, 3H); ESIMS масса/заряд 284,00 ([M]⁺).

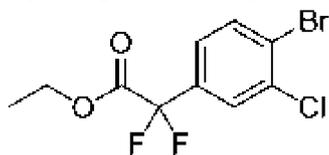
Пример 130. Получение 2-(4-бром-3-хлорфенил)-2,2-дифторэтан-1-ола (С90)



В раствор этил-2-(4-бром-3-хлорфенил)-2,2-дифторацетата (С91; 1,5 г, 4,80 ммоль) в MeOH (15 мл) добавляли NaBH₄ (0,27 г, 7,21 ммоль) при 0°C и реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 16 ч. Реакционную смесь выливали в воду и экстрагировали с помощью DCM. Органический слой промывали солевым раствором, высушивали над безводным Na₂SO₄, фильтровали и концентрировали при пониженном давлении. В результате очистки неочищенного продукта с помощью

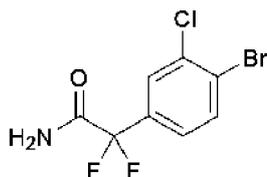
колоночной хроматографии (силикагель 100-200 меш) с элюированием 20-40% EtOAc в петролейном эфире получали указанное в заголовке соединение в виде коричневой жидкости (0,7 г, 50%): ^1H ЯМР (400 МГц, DMSO- d_6) δ 7,91 (d, $J=8,4$ Гц, 1H), 7,75 (d, $J=1,2$ Гц, 1H), 7,42 (dd, $J=1,6, 8,0$ Гц, 1H), 5,67 (t, $J=6,4$ Гц, 1H), 3,92-3,83 (m, 2H); ESIMS масса/заряд 270,00 ($[\text{M}]^+$).

Пример 131. Получение этил-2-(4-бром-3-хлорфенил)-2,2-дифторацетата (C91)



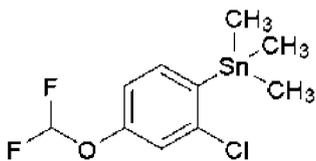
В раствор этил-2-бром-2,2-дифторацетата (13 г, 126,18 ммоль) в DMSO (60 мл) добавляли порошок меди (4 г, 126,18 ммоль) при комнатной температуре и реакционную смесь перемешивали в течение 2 ч. Добавляли 1-бром-2-хлор-4-йодбензол (10 г, 63,1 ммоль) и реакционную смесь перемешивали при 95°C в течение 16 ч. Реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры, добавляли EtOAc (150 мл) и реакционную смесь перемешивали в течение 1 ч. Смесь фильтровали через слой Celite®, который промывали с помощью EtOAc (30 мл). Фильтрат промывали с помощью насыщ. NH_4Cl (100 мл) и солевого раствора (50 мл), высушивали над безводным Na_2SO_4 , фильтровали и концентрировали при пониженном давлении. В результате очистки полученного продукта с помощью колоночной хроматографии (силикагель 100-200 меш) с элюированием 10-20% EtOAc в петролейном эфире получали указанное в заголовке соединение в виде бледно-коричневой жидкости (4,5 г, 46%): ^1H ЯМР (300 МГц, CDCl_3) δ 7,73-7,68 (m, 1H), 7,40-7,34 (m, 1H), 7,20-7,16 (m, 1H), 4,31 (q, $J=6,9$ Гц, 2H), 1,32 (t, $J=7,2$ Гц, 3H); ESIMS масса/заряд 312,00 ($[\text{M}]^+$).

Пример 132. Получение 2-(4-бром-3-хлорфенил)-2,2-дифторацетамида (C92)



В раствор этил-2-(4-бром-3-хлорфенил)-2,2-дифторацетата (C91; 1 г, 3,20 ммоль) в MeOH (20 мл) добавляли раствор аммиака в метаноле (7 M в метаноле; 10 мл) при 0°C и реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 4 ч. Реакционную смесь концентрировали при пониженном давлении. Указанное в заголовке соединение выделяли в виде белого твердого вещества (0,85 г, 95%): ^1H ЯМР (300 МГц, CDCl_3) δ 7,74-7,71 (m, 2H), 7,41-7,37 (m, 1H), 6,38 (br s, 1H), 5,68 (br s, 1H); ESIMS масса/заряд 282,31 ($[\text{M}-\text{H}]^+$).

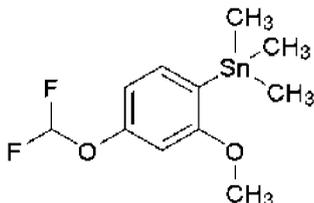
Пример 133. Получение (2-хлор-4-(дифторметокси)фенил)триметилстаннана (C93)



1-Бром-2-хлор-4-(дифторметокси)бензол (1,440 г, 5,59 ммоль), 1,1,1,2,2,2-гексаметилдиэтанн (3,66 г, 11,19 ммоль), Pd(PPh₃)₂Cl₂ (0,393 г, 0,559 ммоль) объединяли в 1,4-диоксане (5,59 мл) и нагревали при 90°C в течение 24 ч. Охлажденную реакционную смесь фильтровали через силикагель с диэтиловым эфиром и концентрировали в вакууме. В результате очистки с помощью флэш-хроматографии (силикагель, гексаны) получали указанное в заголовке соединение в виде прозрачного масла (0,7 г, 36%): ¹H ЯМР (500 МГц, CDCl₃) δ 7,37 (d, J=8,0 Гц, 1H), 7,14 (d, J=2,3 Гц, 1H), 7,00 (ddd, J=8,0, 1,9, 1,2 Гц, 1H), 6,49 (t, J=73,5 Гц, 1H), 0,37 (s, 8H); EIMS масса/заряд 327 ([M-CH₃]).

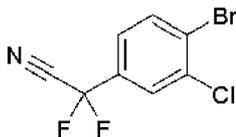
Следующее соединение получали подобно процедуре, указанной в примере 133.

(4-(Дифторметокси)-2-метоксифенил)триметилстаннан (C94)



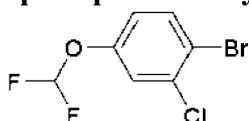
С использованием подходящих исходных материалов указанное в заголовке соединение синтезировали и выделяли в виде прозрачного масла (550 мг, 39%): ¹H ЯМР (500 МГц, CDCl₃) δ 7,30 (d, J=7,8 Гц, 1H), 6,75-6,67 (m, 1H), 6,57 (dd, J=7,5, 2,1 Гц, 1H), 6,51 (t, J=74,3 Гц, 1H), 3,78 (s, 3H), 0,26 (s, 9H); EIMS масса/заряд 323 ([M-CH₃]).

Пример 134. Получение 2-(4-бром-3-хлорфенил)-2,2-дифторацетонитрила (C95)



В раствор 2-(4-бром-3-хлорфенил)-2,2-дифторацетамида (0,5 г, 1,76 ммоль) в DCM (10 мл) добавляли триэтиламин (0,27 г, 2,65 ммоль) с последующим добавлением трифторуксусного ангидрида (0,5 г, 2,65 ммоль) при 0°C. Реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 4 ч. и концентрировали при пониженном давлении. Указанное в заголовке соединение выделяли в виде бледно-желтой жидкости (0,3 г, 64%): ¹H ЯМР (300 МГц, CDCl₃) δ 7,82 (d, J=8,4 Гц, 1H), 7,76-7,75 (m, 1H), 7,44-7,41 (m, 1H); ESIMS масса/заряд 265,00 ([M]⁺).

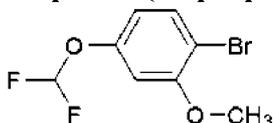
Пример 135. Получение 1-бром-2-хлор-4-(дифторметокси)бензола (C96)



4-Бром-3-хлорфенол (2,00 г, 9,64 ммоль), трис(2-фенилпиридин)иридий(III) (0,032 г, 0,048 ммоль), бромдифторацетат калия (4,11 г, 19,3 ммоль) и карбонат цезия (9,42 г, 28,9 ммоль) объединяли в DMF (16,1 мл) в круглодонной колбе в атмосфере азота. Реакционную смесь энергично перемешивали и подвергали облучению синим LED-светом. Реакция почти завершалась через 30 мин., но смесь перемешивали и подвергали облучению в течение еще 15 мин. Реакционную смесь разделяли между Et₂O и водой. Органическую фазу высушивали и концентрировали на силикагеле. В результате очистки с помощью флэш-хроматографии (градиент системы растворителей 0-10% EtOAc в гексанах) получали указанное в заголовке соединение в виде прозрачного масла (1,44 г, 56%): ¹H ЯМР (500 МГц, CDCl₃) δ 7,60 (d, J=8,8 Гц, 1H), 7,27 (d, J=2,8 Гц, 1H), 6,94 (dd, J=8,8, 2,6 Гц, 1H), 6,49 (t, J=72,8 Гц, 1H); EIMS масса/заряд 258.

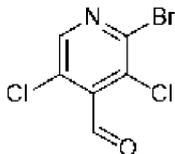
Следующее соединение получали подобно процедуре, указанной в **примере 135**.

1-Бром-4-(дифторметокси)-2-метоксибензол (C97)



С использованием подходящих исходных материалов указанное в заголовке соединение синтезировали и выделяли в виде прозрачного масла (1,05 г, 41%): ¹H ЯМР (500 МГц, Хлороформ-d) δ 7,50 (d, J=8,6 Гц, 1H), 6,68 (d, J=2,6 Гц, 1H), 6,64-6,60 (m, 1H), 6,65-6,33 (m, 1H), 3,89 (s, 3H); EIMS масса/заряд 253.

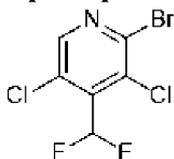
Пример 136. Получение 2-бром-3,5-дихлоризоникотинальдегида (C98)



В раствор диизопропиламина (2,45 г, 24,2 ммоль, 3,39 мл) в THF (50 мл), охлажденный до -25°C (внутренняя температура), в атмосфере азота добавляли по каплям с помощью шприца *n*-бутиллитий (1,55 г, 24,2 ммоль, 9,68 мл 2,5 М раствора). Полученный раствор диизопропиламида лития охлаждали до -60°C и обрабатывали раствором 2-бром-3,5-дихлоризоникотинальдегида (C98; 5,0 г, 22 ммоль) в THF (8 мл) со скоростью, достаточной для поддержания внутренней температуры ниже -50°C. Через 1 ч. добавляли метилформиат (2,65 г, 44,1 ммоль, 2,72 мл) со скоростью, достаточной для поддержания внутренней температуры ниже -50°C. Через 1 ч. реакцию смесь выливали в насыщ. NaHCO₃ и экстрагировали с помощью EtOAc (X2). Объединенные органические слои высушивали над Na₂SO₄, фильтровали и концентрировали. В результате очистки с помощью хроматографии на силикагеле с применением смеси 20:1 гексан-EtOAc в качестве элюента получали указанное в заголовке соединение в виде грязно-белого твердого вещества (3,42 г, 61%): т. пл. 61-62°C; ¹H ЯМР (300 МГц, CDCl₃) δ 10,34 (s, 1H), 8,43 (s, 1H);

EIMS *масса/заряд* 254 ($[M+H]^+$).

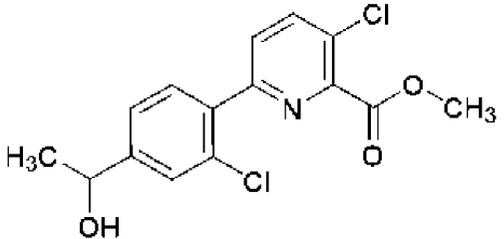
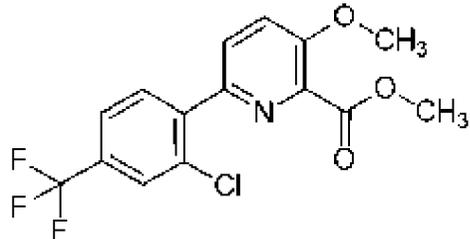
Пример 137. Получение 2-бром-3,5-дихлор-4-(дифторметил)пиридина (С99)

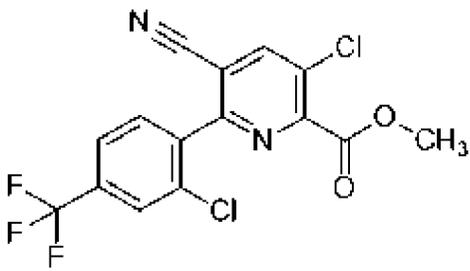
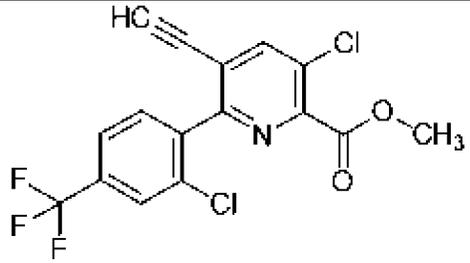
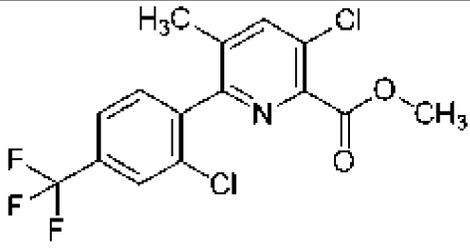


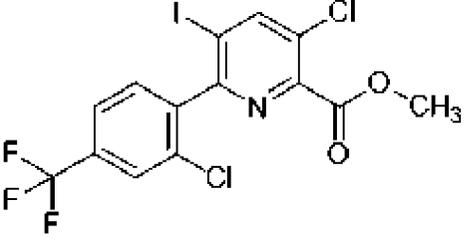
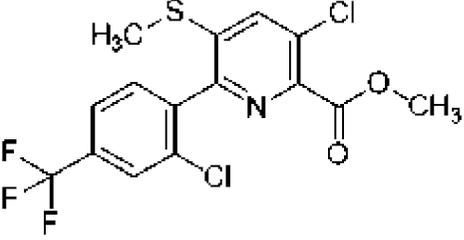
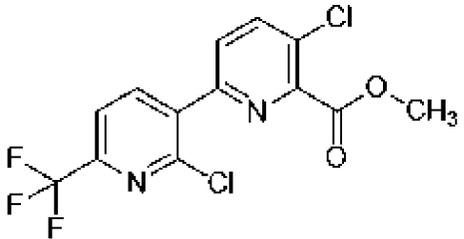
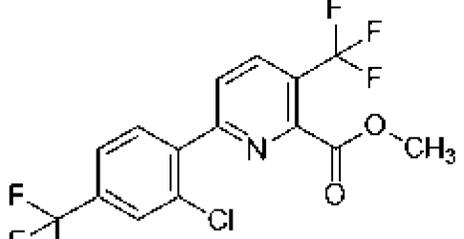
Перемешивали раствор 2-бром-3,5-дихлоризоникотинальдегида (**С98**; 1,5 г, 5,9 ммоль) в DCM (25 мл) при 0°C в атмосфере азота, обрабатывали тремя равными порциями DAST (3,0 г, 18,5 ммоль, 2,5 мл) с обеспечением нагревания реакционной смеси до комнатной температуры между операциями добавления и повторного охлаждения на ледяной бане перед добавлением 2-й и 3-й аликвот. После перемешивания при комнатной температуре в течение 3 дней реакционную смесь осторожно гасили с помощью насыщ. NaHCO_3 , переносили в делительную воронку и слои разделяли. Водную фазу экстрагировали с помощью DCM и объединенные органические слои высушивали над Na_2SO_4 , фильтровали и концентрировали. В результате очистки с помощью хроматографии на силикагеле с применением смеси 20:1 гексан-EtOAc в качестве элюента получали указанное в заголовке соединение в виде грязно-белого твердого вещества (1,49 г, 91%): т. пл. 51-52°C; ^1H ЯМР (300 МГц, CDCl_3) δ 8,39 (s, 1H), 7,16, (t, $J=52,5$ Гц, 1H); EIMS *масса/заряд* 276 ($[M+H]^+$).

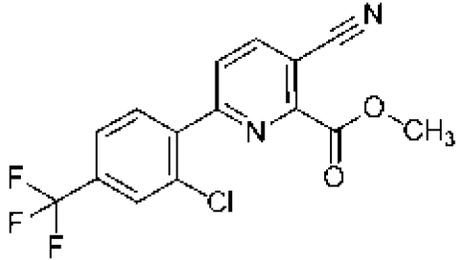
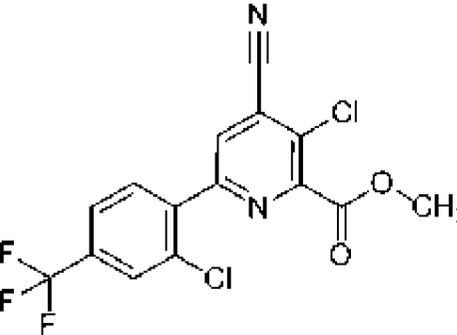
Таблица 1 включает, среди прочего, данные для соединений **F1-F381**, в том числе данные в отношении синтеза, описанные ниже и соответствующие примерам выше. Аналитические данные для вышеуказанных соединений можно найти в таблице 2, также приведенной ниже.

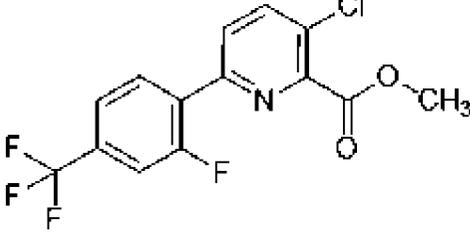
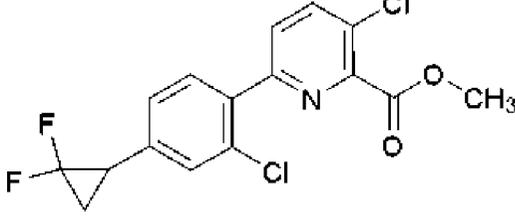
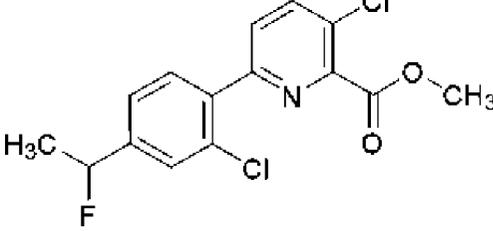
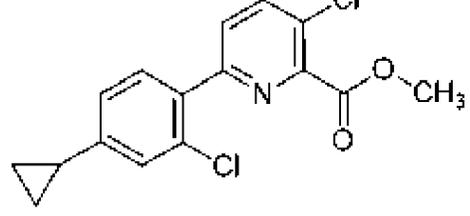
Таблица 1. Данные в отношении структур и получения для соединений F

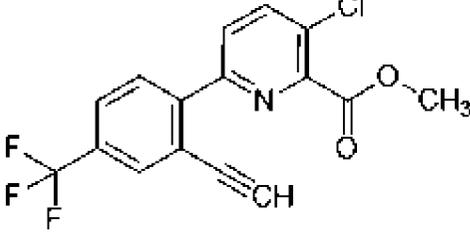
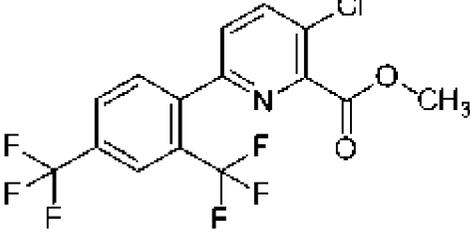
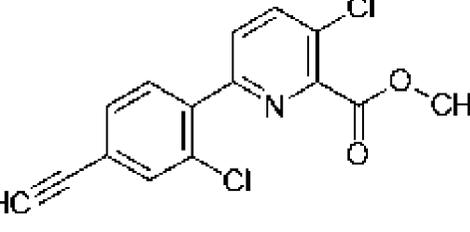
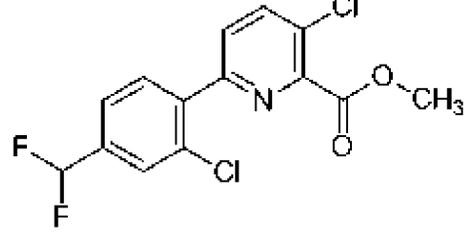
№	Структура	Химическое название	Получение	Внешний вид	Выход (колич., %)
F1		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(1-гидроксиэтил)фенил)пиколинат	Пример 2 с применением F26	Грязно-белое твердое вещество	60 мг, 50%
F2		Метил-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-3-метоксипиколинат	Пример 32 с нагреванием в герметизированной пробирке при 80°C в течение 12 ч.	Белое твердое вещество	0,08 г, 56%

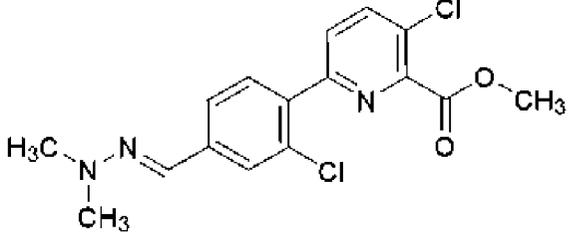
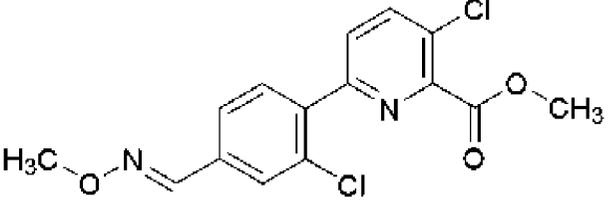
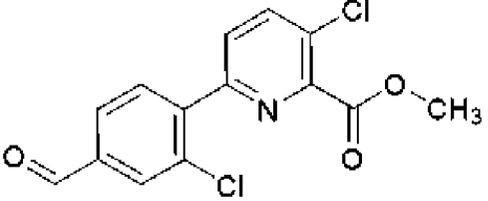
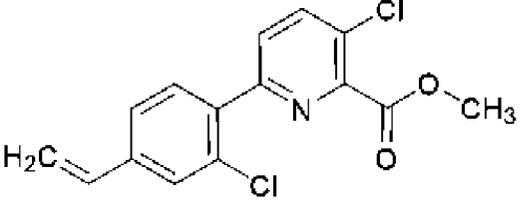
F3		<p>Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-5-цианопиколинат</p>	<p>Пример 15 с применением Pd(PPh₃)₄ в качестве катализатора и с нагреванием в микроволновом реакторе Biotage в течение 30 мин. при 150°C</p>	<p>Желтое твердое вещество</p>	<p>0,012 г, 15%</p>
F4		<p>Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-5-этинилпиколинат</p>	<p>Пример 6</p>	<p>Белое твердое вещество</p>	<p>0,04 г, 51%</p>
F5		<p>Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-5-метилпиколинат</p>	<p>Пример 16</p>	<p>Бесцветное твердое вещество</p>	<p>0,017 г, 23%</p>

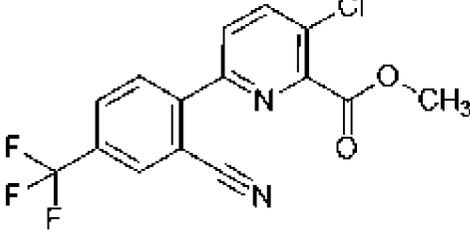
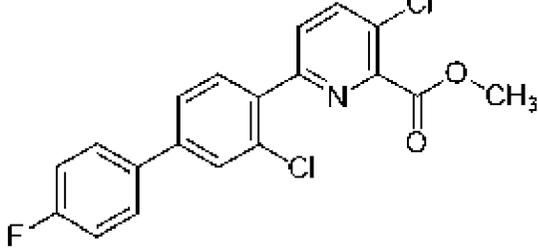
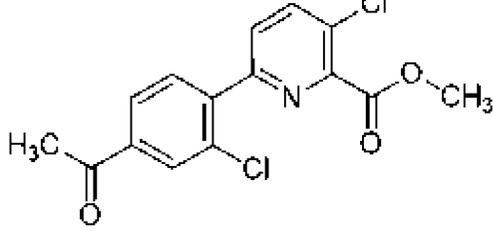
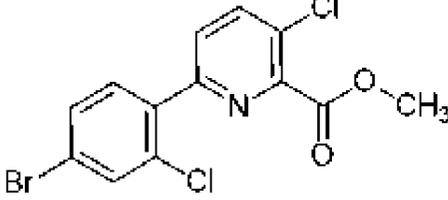
F6		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-5-йодпиколинат	Пример 19	Белое твердое вещество	0,3 г, 77%
F7		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-5-(метилтио)пиколинат	Пример 19	Белое твердое вещество	0,08 г, 67%
F8		Метил-2',5-дихлор-6'-(трифторметил)-[2,3'-бипиридин]-6-карбоксилат	Пример 32 с нагреванием в герметизированной пробирке при 80°C в течение 12 ч.	Бесцветное твердое вещество	0,04 г, 26%
F9		Метил-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-3-(трифторметил)пиколинат	Пример 18	Белое твердое вещество	0,05 г, 50%

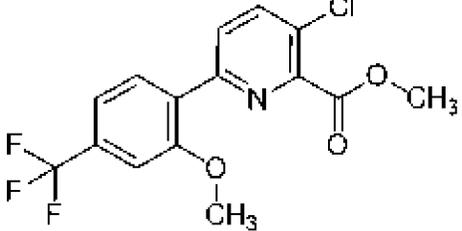
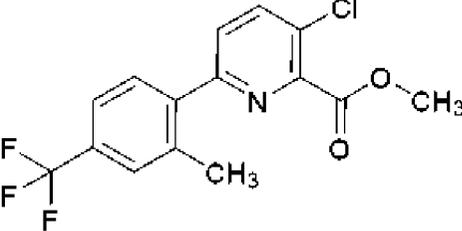
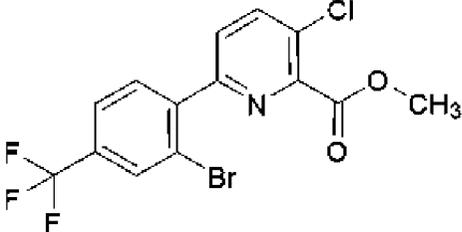
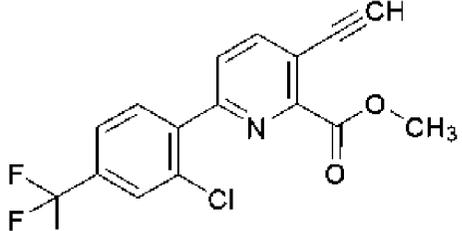
F10		Метил-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-3-цианопиколинат	Пример 15 с применением $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$ в качестве катализатора и с нагреванием в микроволновом реакторе Biotage в течение 30 мин. при 150°C	Грязно-белое твердое вещество	0,03 г, 34%
F11		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-4-цианопиколинат	Пример 15 с применением $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$ в качестве катализатора и с нагреванием в микроволновом реакторе Biotage в течение 30 мин. при 150°C	Грязно-белое твердое вещество	0,015 г, 34%

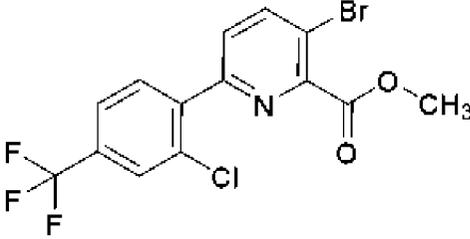
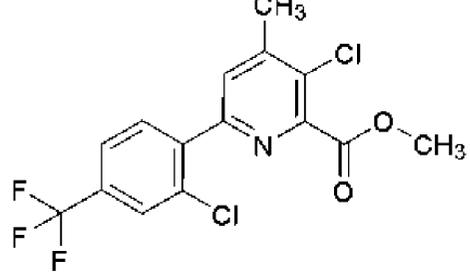
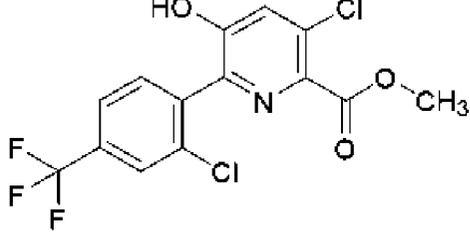
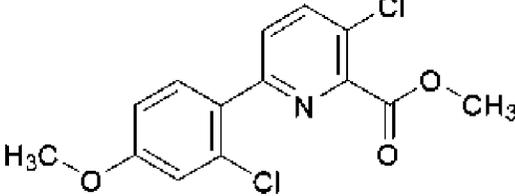
F12		Метил-3-хлор-6-(2-фтор-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 32 с нагреванием при 120°C в течение 6 ч.	Белое твердое вещество	90 мг
F13		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(2,2-дифторциклопропил)фенил)пиколинат	Пример 13 с применением F23	Грязно-белое твердое вещество	110 мг, 55%
F14		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(1-фторэтил)фенил)пиколинат	Пример 1 с применением F1	Грязно-белое твердое вещество	55 мг, 70%
F15		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-циклопропилфенил)пиколинат	Пример 4 с применением F27	Бледно-желтое твердое вещество	200 мг, 40%

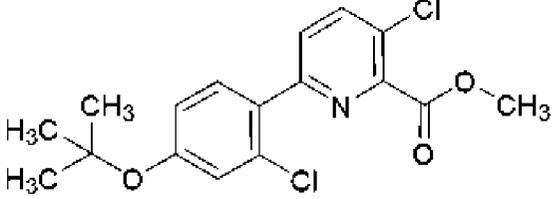
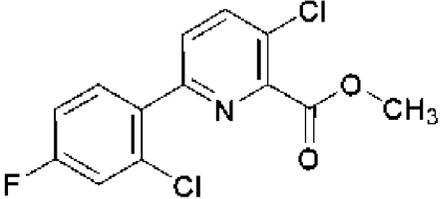
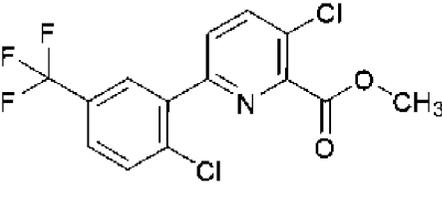
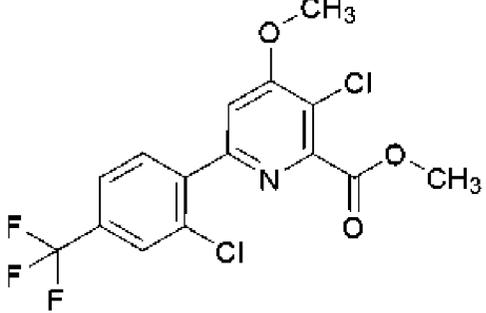
F16		Метил-3-хлор-6-(2-этинил-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 7 с применением С1	Коричневое твердое вещество	30 мг, 30%
F17		Метил-6-(2,4-бис(трифторметил)фенил)-3-хлорпиколинат	Пример 32 с нагреванием при 120°C в течение 6 ч.	Белое твердое вещество	125 мг
F18		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-этинилфенил)пиколинат	Пример 7	Грязно-белое твердое вещество	0,035 г
F19		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(дифторметил)фенил)пиколинат	Пример 9 с применением F22	Грязно-белое твердое вещество	85 мг, 60%

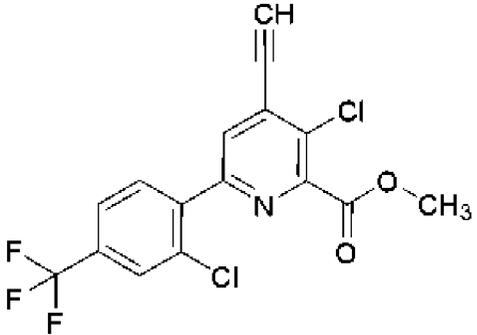
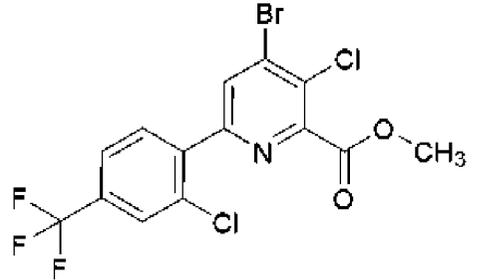
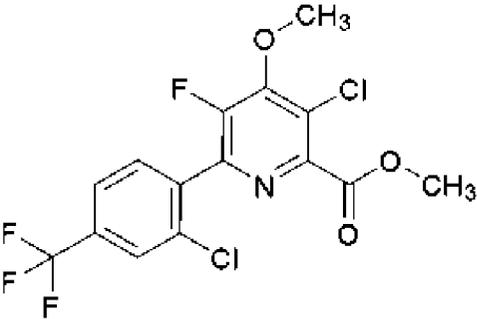
F20		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-((2,2-диметилгидразоно)метил)фенил)пиколинат	Пример 10 с применением F22	Грязно-белое твердое вещество	55 мг, 50%
F21		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-((метоксиимино)метил)фенил)пиколинат	Пример 11 с применением F22	Грязно-белое твердое вещество	110 мг, 70%
F22		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-формилфенил)пиколинат	Пример 12 с применением F23	Грязно-белое твердое вещество	600 мг, 65%
F23		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-винилфенил)пиколинат	Пример 14 с применением F27	Грязно-белое твердое вещество	160 мг, 55%

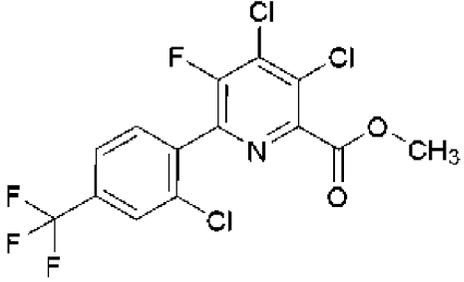
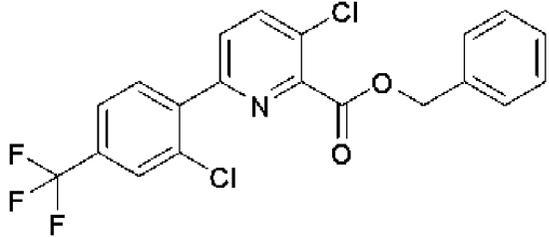
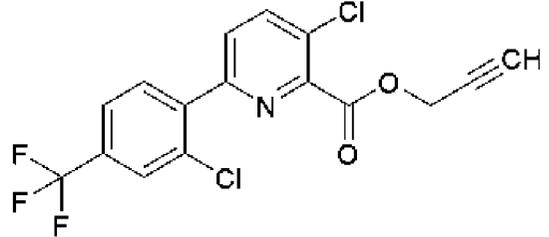
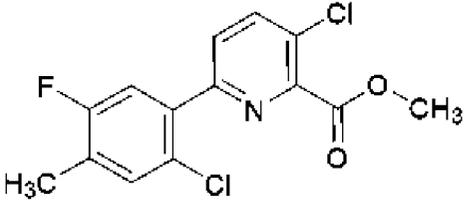
F24		Метил-3-хлор-6-(2-циано-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 32 с нагреванием при 120°C в течение 6 ч.	Белое твердое вещество	45 мг
F25		Метил-3-хлор-6-(3-хлор-4'-фтор-[1,1'-бифенил]-4-ил)пиколинат	Пример 5 с применением F27	Грязно-белое твердое вещество	90 мг, 40%
F26		Метил-6-(4-ацетил-2-хлорфенил)-3-хлорпиколинат	Пример 3 с применением F27	Грязно-белое твердое вещество	280 мг, 30%
F27		Метил-6-(4-бром-2-хлорфенил)-3-хлорпиколинат	Пример 32 с нагреванием при 120°C в течение 6 ч.	Грязно-белое твердое вещество	280 мг, 50%

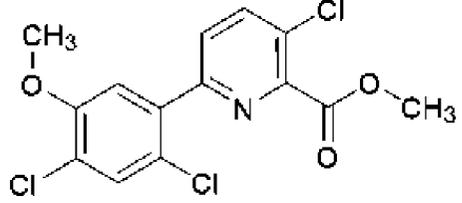
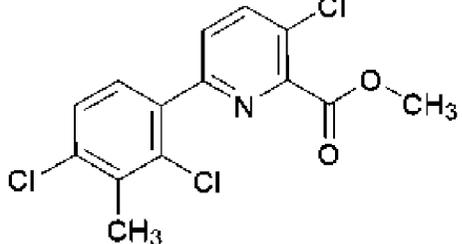
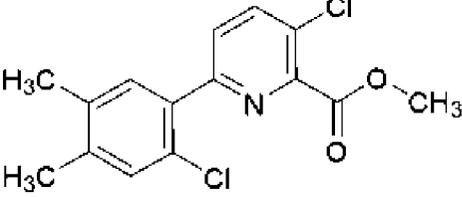
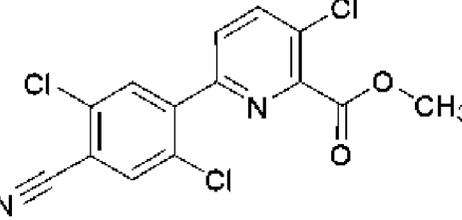
F28		Метил-3-хлор-6-(2-метокси-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 32 с нагреванием при 120°C в течение 6 ч.	Белое твердое вещество	100 мг
F29		Метил-3-хлор-6-(2-метил-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 32 с нагреванием при 120°C в течение 6 ч.	Белое твердое вещество	136 мг
F30		Метил-6-(2-бром-4-(трифторметил)фенил)-3-хлорпиколинат	Пример 32 с нагреванием при 120°C в течение 6 ч.	Белое твердое вещество	97 мг
F31		Метил-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-3-этинилпиколинат	Пример 6	Грязно-белое твердое вещество	0,08 г, 47%

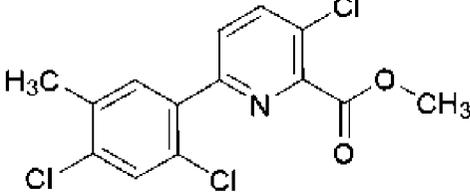
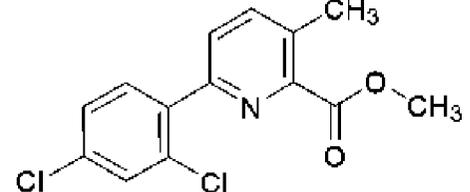
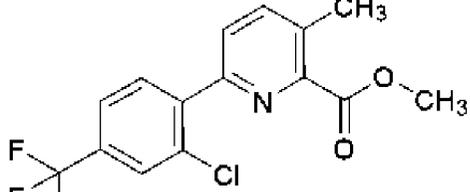
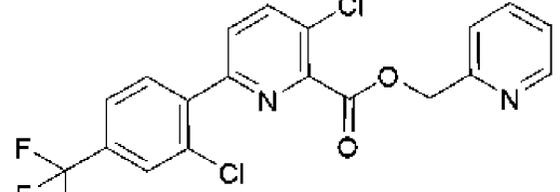
F32		Метил-3-бром-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 32 с нагреванием в герметизированной пробирке при 80°C в течение 12 ч.	Бесцветное твердое вещество	0,7 г, 53%
F33		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-4-метилпиколинат	Пример 16 с применением F41	Белое твердое вещество	0,16 г, 47%
F34		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-5-гидроксипиколинат	Пример 20 с применением С6	Белое твердое вещество	0,15 г, 53%
F35		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-метоксифенил)пиколинат	Пример 32 с нагреванием при 120°C в течение 6 ч.	Белое твердое вещество	245 мг

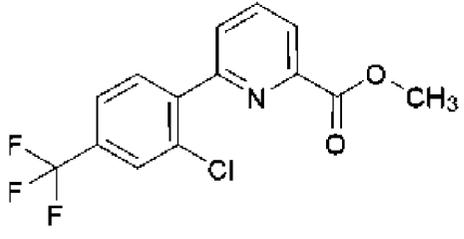
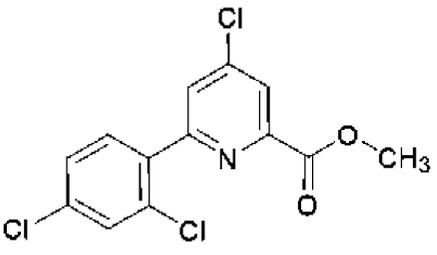
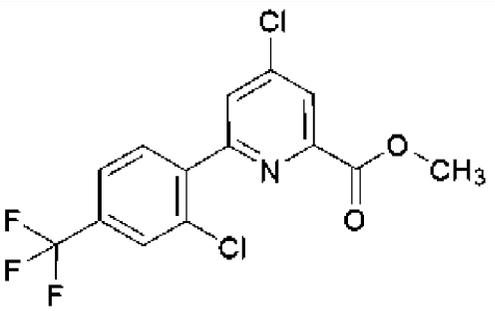
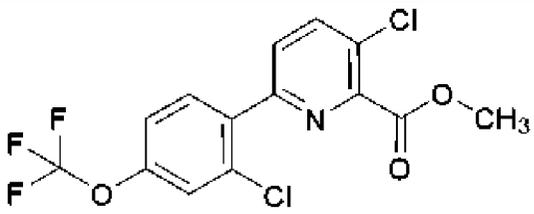
F36		Метил-6-(4-(<i>tert</i> -бутоксн)-2-хлорфенил)-3-хлорпиколинат	Пример 32 с нагреванием при 120°C в течение 6 ч.	Белое твердое вещество	65 мг
F37		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-фторфенил)пиколинат	Пример 32 с нагреванием при 120°C в течение 6 ч.	Белое твердое вещество	180 мг, 50%
F38		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-5-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 32 с нагреванием при 120°C в течение 6 ч.	Белое твердое вещество	170 мг
F39		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-4-метоксипиколинат	Пример 17	Белое твердое вещество	0,03 г, 34%

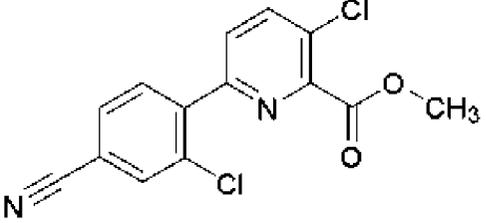
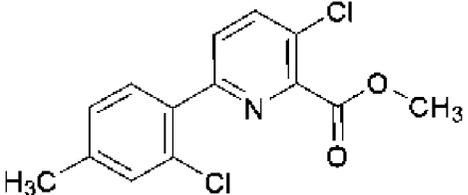
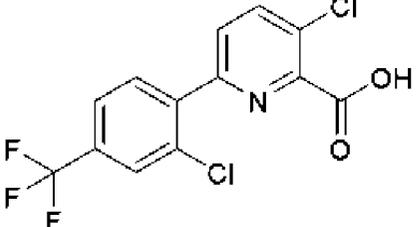
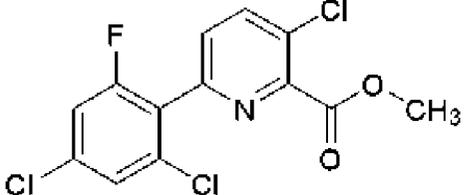
F40		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-4-этинилпиколинат	Пример 6 с применением F41	Белое твердое вещество	0,04 г, 23%
F41		Метил-4-бром-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 22 с применением бромида меди(II) в качестве источника брома	Белое твердое вещество	1 г, 42%
F42		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-5-фтор-4-метоксипиколинат	Пример 17 с применением F43	Белое твердое вещество	0,06 г, 33%

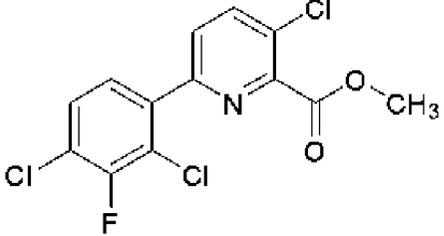
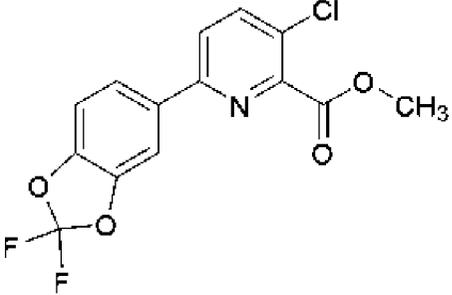
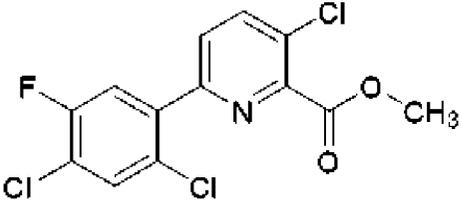
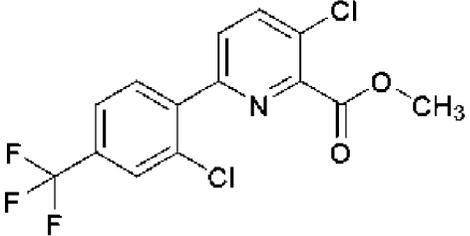
F43		Метил-3,4-дихлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-5-фторпиколинат	Пример 22 с применением С6	Белое твердое вещество	0,25 г, 80%
F44		Бензил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 25 с применением F61	Белое твердое вещество	237 мг, 91%
F45		Проп-2-ин-1-ил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 26 с применением F61	Белое твердое вещество	220 мг, 96%
F46		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-5-фтор-4-метилфенил)пиколинат	Пример 32 с нагреванием при 90°C в течение 4 ч.	Белое твердое вещество	70 мг

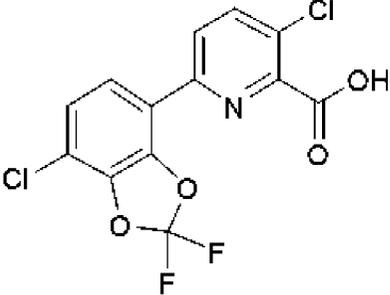
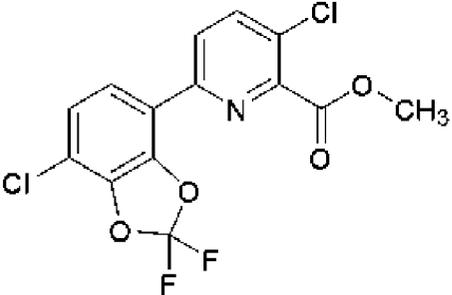
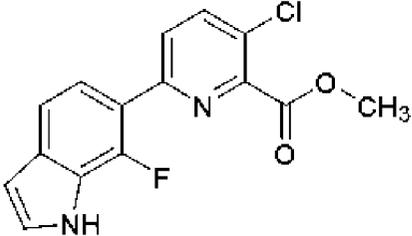
F47		Метил-3-хлор-6-(2,4-дихлор-5-метоксифенил)пиколинат	Пример 32 с нагреванием при 90°C в течение 4 ч.	Белое твердое вещество	70 мг
F48		Метил-3-хлор-6-(2,4-дихлор-3-метилфенил)пиколинат	Пример 32 с нагреванием при 90°C в течение 4 ч.	Белое твердое вещество	150 мг, 33%
F49		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4,5-диметилфенил)пиколинат	Пример 32 с нагреванием при 90°C в течение 4 ч.	Белое твердое вещество	30 мг
F50		Метил-3-хлор-6-(2,5-дихлор-4-цианофенил)пиколинат	Пример 32 с нагреванием при 90°C в течение 4 ч.	Белое твердое вещество	20 мг

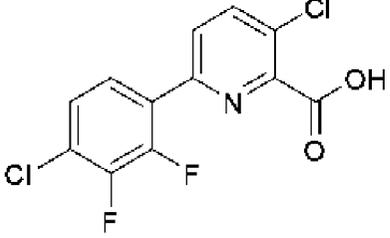
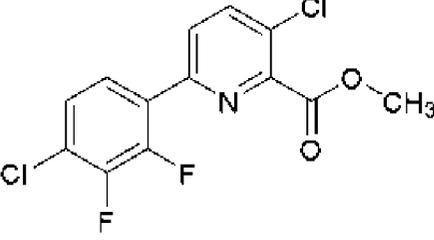
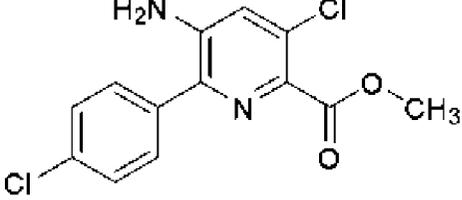
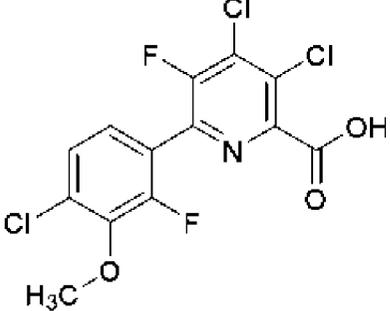
F51		Метил-5-хлор-6-(2,4-дихлор-3-метилфенил)пиколинат	Пример 32 с нагреванием при 90°C в течение 4 ч.	Белое твердое вещество	80 мг
F52		Метил-6-(2,4-дихлорфенил)-3-метилпиколинат	Пример 32 с нагреванием при 90°C в течение 4 ч.	Белое твердое вещество	207 мг
F53		Метил-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-3-метилпиколинат	Пример 32 с нагреванием при 90°C в течение 4 ч.	Белое твердое вещество	185 мг
F54		Пиридин-2-илметил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 33	Белое твердое вещество	65 мг, 49%

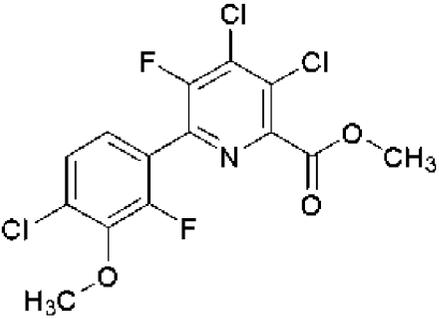
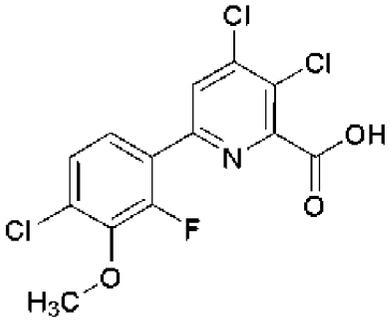
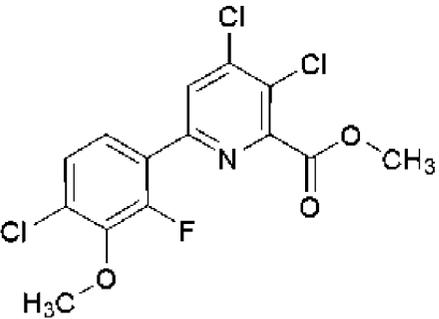
F55		Метил-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 32 с нагреванием при 90°С в течение 4 ч.	Белое твердое вещество	150 мг, 33%
F56		Метил-4-хлор-6-(2,4-дихлорфенил)пиколинат	Пример 32 с нагреванием при 90°С в течение 4 ч.	Белое твердое вещество	95 мг
F57		Метил-4-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 32 с нагреванием при 90°С в течение 4 ч.	Белое твердое вещество	150 мг, 35%
F58		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметокси)фенил)пиколинат	Пример 32 с нагреванием при 90°С в течение 4 ч.	Белое твердое вещество	235 мг

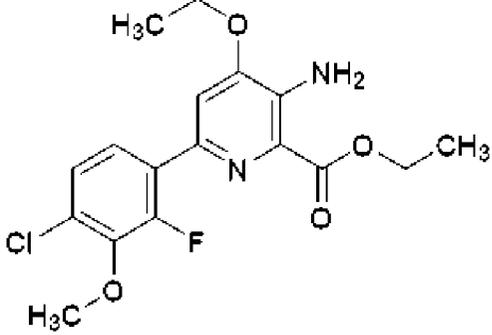
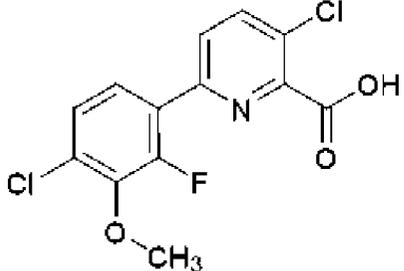
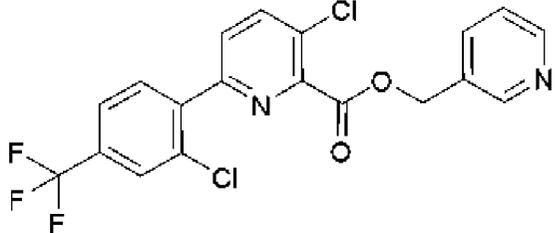
F59		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-цианофенил)пиколинат	Пример 15 с применением F27	Грязно-белое твердое вещество	70 мг, 40%
F60		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-метилфенил)пиколинат	Пример 32 с нагреванием при 90°C в течение 4 ч.	Белое твердое вещество	240 мг
F61		3-Хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)пиколиновая кислота	Пример 27 с применением F66	Белое твердое вещество	1,13 г, 96%
F62		Метил-3-хлор-6-(2,4-дихлор-6-фторфенил)пиколинат	Пример 32	Белое твердое вещество	142 мг, 44%

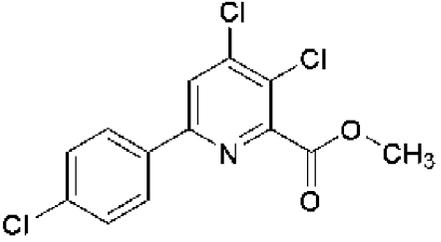
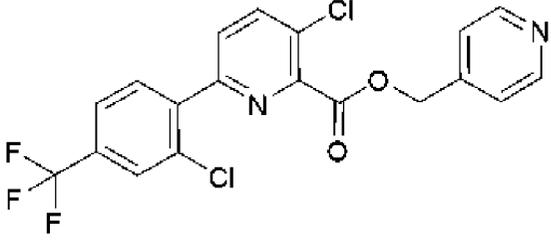
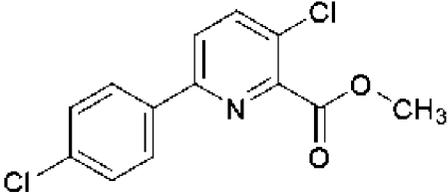
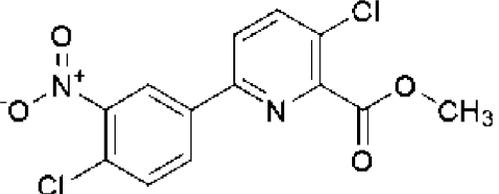
F63		Метил-3-хлор-6-(2,4-дихлор-3-фторфенил)пиколинат	Пример 32	Белое твердое вещество	55 мг, 34%
F64		Метил-3-хлор-6-(2,2-дифторбензо[<i>d</i>][1,3]диоксол-5-ил)пиколинат	Пример 32	Бесцветное масло	70 мг, 43%
F65		Метил-3-хлор-6-(2,4-дихлор-5-фторфенил)пиколинат	Пример 32	Белое твердое вещество	55 мг, 34%
F66		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 32	Белое твердое вещество	1,97 г, 58%

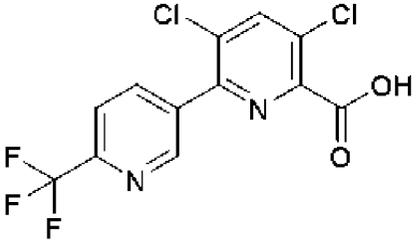
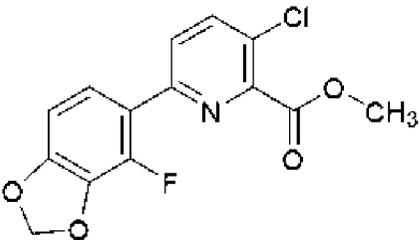
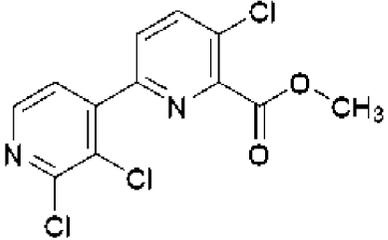
F67		3-Хлор-6-(7-хлор-2,2-дифторбензо[<i>d</i>][1,3]диоксол-4-ил)пиколиновая кислота	Пример 27 с применением только MeOH с 8 эквивалентами NaOH	Матово-белая/грязно-белая остаточная твердая пленка	0,099 г, 55%
F68		Метил-3-хлор-6-(7-хлор-2,2-дифторбензо[<i>d</i>][1,3]диоксол-4-ил)пиколинат	Пример 32 в смеси 5:1 CH ₃ CN-вода с нагреванием в микроволновом реакторе при 120°C в течение 40 мин.	Светло-желтое полутвердое вещество	216 мг, 30%
F69		Метил-3-хлор-6-(7-фтор-1 <i>H</i> -индол-6-ил)пиколинат	Пример 32 в смеси 1:1 CH ₃ CN-вода с нагреванием в микроволновом реакторе при 110°C в течение 20 мин.	Грязно-белое твердое вещество	180 мг, 29%

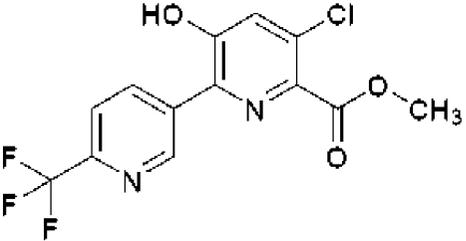
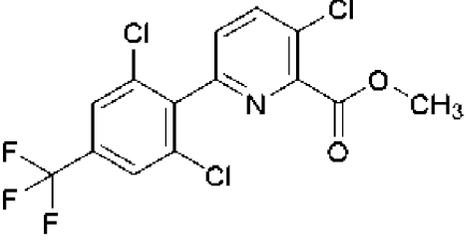
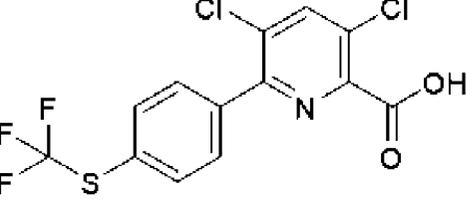
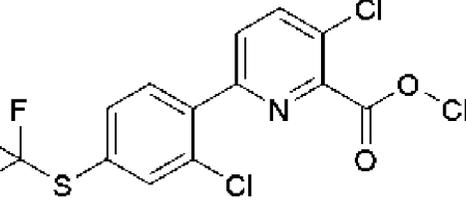
F70		3-Хлор-6-(4-хлор-2,3-дифторфенил)пиколиновая кислота	Пример 27	Белое твердое вещество	0,088 г, 60%
F71		Метил-3-хлор-6-(4-хлор-2,3-дифторфенил)пиколинат	Пример 32 в смеси 1:1 CH ₃ CN-вода с нагреванием в микроволновом реакторе при 110°C в течение 20 мин.	Белое твердое вещество	333 мг, 72%
F72		Метил-5-амино-3-хлор-6-(4-хлорфенил)пиколинат	Пример 31 с применением С8	Белое твердое вещество	0,080 г, 22%
F73		3,4-Дихлор-6-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифенил)-5-фторпиколиновая кислота	Пример 22 с нагреванием при 65°C, время реакции 10 мин.	Порошок кремового цвета	92 мг, 44%

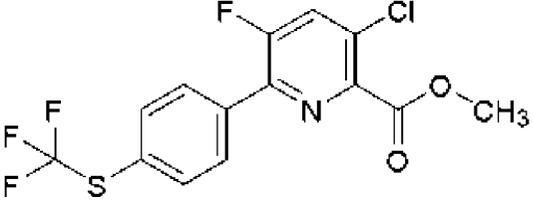
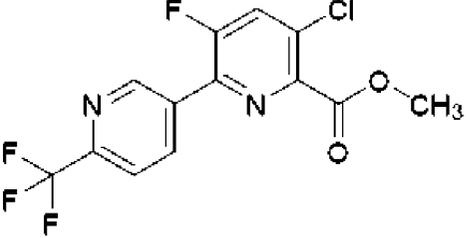
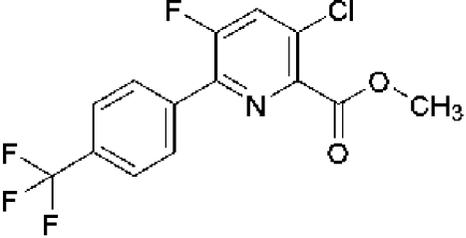
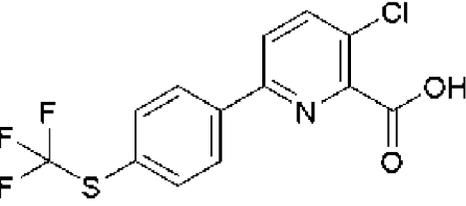
F74	 <p>Chemical structure of Methyl 3,4-dichloro-6-(4-chloro-2-fluoro-3-methoxyphenyl)-5-fluoropyridine-2-carboxylate. The pyridine ring is substituted with a chlorine atom at position 3, a chlorine atom at position 4, a fluorine atom at position 5, and a methyl ester group at position 2. The pyridine ring is attached at position 6 to a phenyl ring substituted with a chlorine atom at position 4, a fluorine atom at position 2, and a methoxy group at position 3.</p>	Метил-3,4-дихлор-6-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифенил)-5-фторпиколинат	Пример 22 с нагреванием при 65°C, время реакции 10 мин.	Белый порошок	180 мг, 57%
F75	 <p>Chemical structure of 3,4-Dichloro-6-(4-chloro-2-fluoro-3-methoxyphenyl)picolinic acid. The pyridine ring is substituted with a chlorine atom at position 3, a chlorine atom at position 4, and a carboxylic acid group at position 2. The pyridine ring is attached at position 6 to a phenyl ring substituted with a chlorine atom at position 4, a fluorine atom at position 2, and a methoxy group at position 3.</p>	3,4-Дихлор-6-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифенил)пиколиновая кислота	Пример 21	Желтовато-коричневый порошок	170 мг, 81%
F76	 <p>Chemical structure of Methyl 3,4-dichloro-6-(4-chloro-2-fluoro-3-methoxyphenyl)picolinat. The pyridine ring is substituted with a chlorine atom at position 3, a chlorine atom at position 4, and a methyl ester group at position 2. The pyridine ring is attached at position 6 to a phenyl ring substituted with a chlorine atom at position 4, a fluorine atom at position 2, and a methoxy group at position 3.</p>	Метил-3,4-дихлор-6-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифенил)пиколинат	Пример 21	Белый порошок	140 мг, 67%

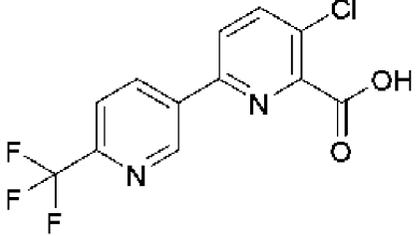
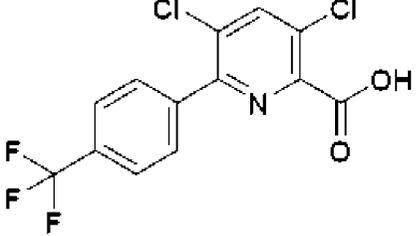
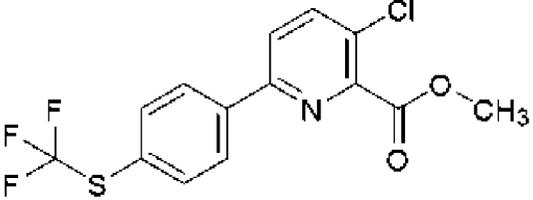
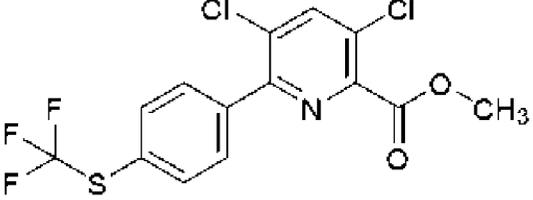
F77		Этил-3-амино-6-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифенил)-4-этоксипиколинат	Пример 36	Грязно-белое твердое вещество	56 мг, 35%
F78		3-Хлор-6-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифенил)пиколиновая кислота	Пример 28	Белое твердое вещество	200 мг, 76%
F79		Пиридин-3-илметил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 33	Белое твердое вещество	24 мг, 24%

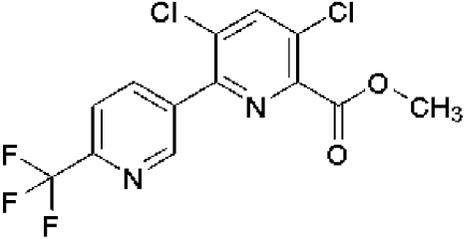
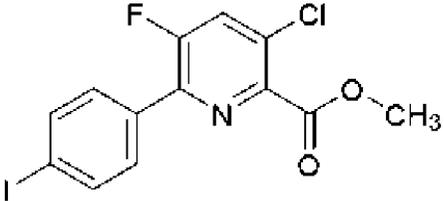
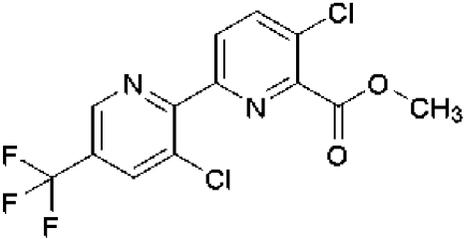
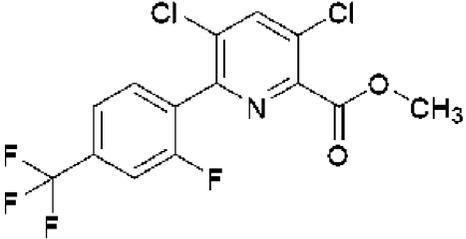
F80		Метил-3,4-дихлор-6-(4-хлорфенил)пиколинат	Пример 51	Белое твердое вещество	820 мг, 63%
F81		Пиридин-4-илметил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 33	Белое твердое вещество	118 мг, 78%
F82		Метил-3-хлор-6-(4-хлорфенил)пиколинат	Пример 34	Желтое масло	1,9 г, 23%
F83		Метил-3-хлор-6-(4-хлор-3-нитрофенил)пиколинат	Пример 19 с применением <i>tert</i> -бутилнитрита и DMF в качестве растворителя, как описано в <i>J. Org. Chem.</i> 1977 , <i>42</i> , 3494	Грязно-белый порошок	0,077 г, 81%

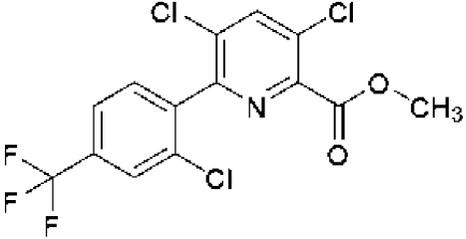
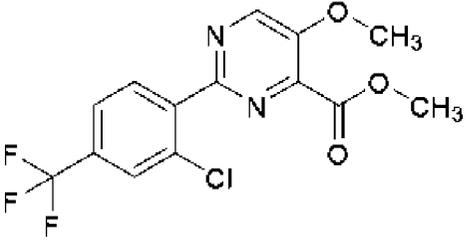
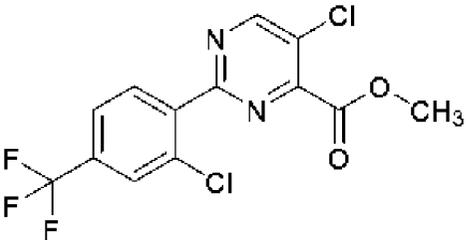
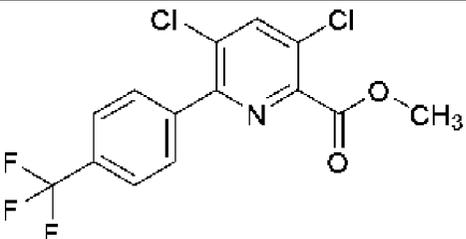
F84		3,5-Дихлор-6'- (трифторметил)-[2,3'- бипиридин]-6- карбоновая кислота	Пример 29	Белое твердое вещество	0,093 г, 81%
F85		Метил-3-хлор-6-(4- фторбензо[<i>d</i>][1,3]диокс- ол-5-ил)пиколинат	Пример 19 с применением <i>трет</i> - бутилнитрита и DMF в качестве растворителя, как описано в <i>J. Org.</i> <i>Chem.</i> 1977, 42, 3494	Светло-желтый порошок	0,088 г, 92%
F86		Метил-2',3',5-трихлор- [2,4'-бипиридин]-6- карбоксилат	Пример 51	Белое твердое вещество	62 мг, 18%

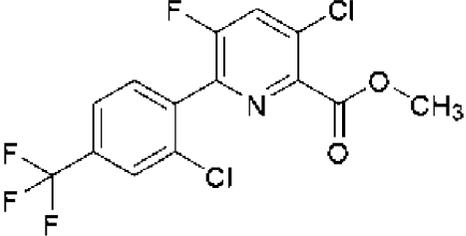
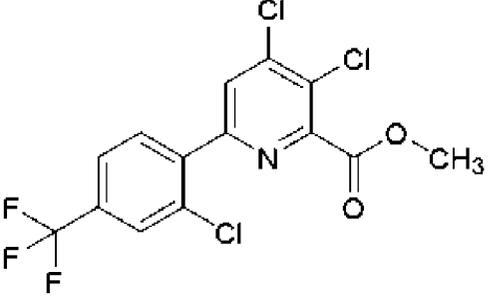
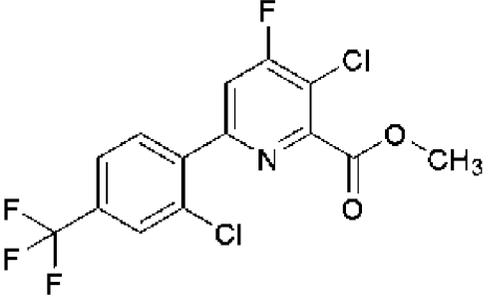
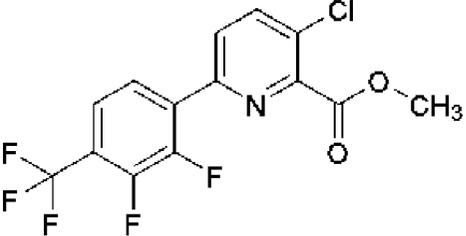
F87		Метил-5-хлор-3-гидрокси-6'-(трифторметил)-[2,3'-бипиридин]-6-карбоксилат	Пример 30 с применением F92	Белое твердое вещество	0,052 г, 90%
F88		Метил-3-хлор-6-(2,6-дихлор-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 32	Светло-желтое масло	24 мг, 10%
F89		3,5-Дихлор-6-(4-(трифторметил)тиофенил)пиколиновая кислота	Пример 29	Белое твердое вещество	0,129 г, 82%
F90		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)тиофенил)пиколинат	Пример 32	Бесцветное масло	133 мг, 57%

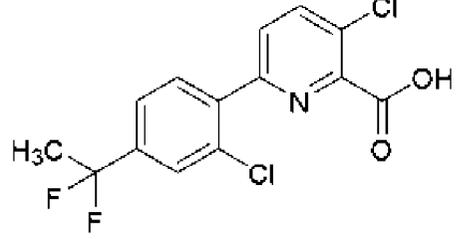
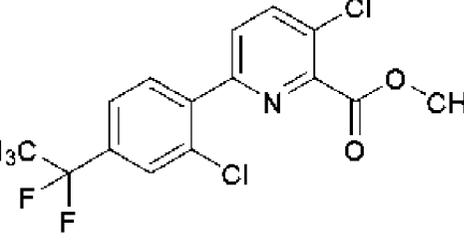
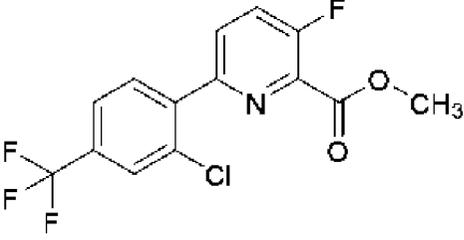
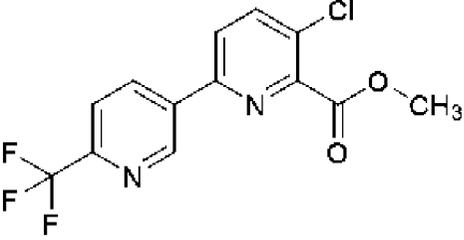
F91		Метил-3-хлор-5-фтор-6-(4-(трифторметил)тио)фенилпиколинат	Пример 32	Белое твердое вещество	200 мг, 66%
F92		Метил-5-хлор-3-фтор-6'-(трифторметил)-[2,3'-бипиридин]-6-карбоксилат	Пример 32	Белое твердое вещество	144 мг, 41%
F93		Метил-3-хлор-5-фтор-6-(4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 32	Бесцветное масло	277 мг, 70%
F94		3-Хлор-6-(4-(трифторметил)тио)фенилпиколиновая кислота	Пример 29	Белое твердое вещество	0,286 г, 96%

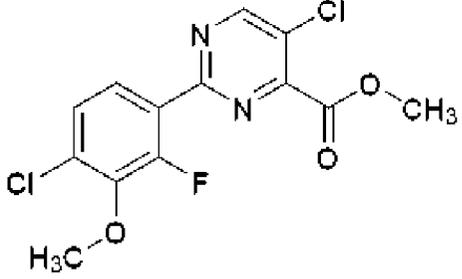
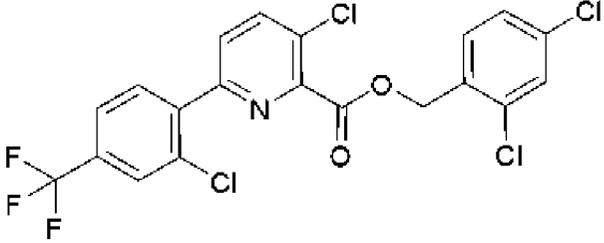
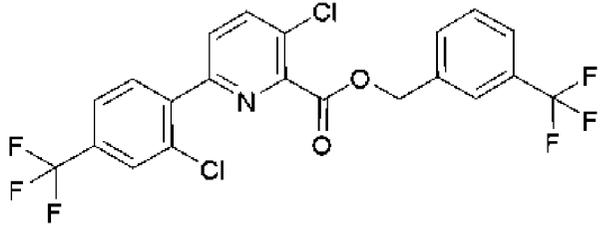
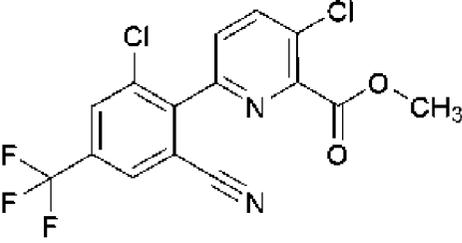
F95		5-Хлор-6'- (трифторметил)-[2,3'- бипиридин]-6- карбоновая кислота	Пример 29	Белое твердое вещество	0,154 г, 47%
F96		3,5-Дихлор-6-(4- (трифторметил)фенил)п иколиновая кислота	Пример 29	Белое твердое вещество	0,115 г, 92%
F97		Метил-3-хлор-6-(4- (трифторметил)тио)фе нил)пиколинат	Пример 32	Бесцветное масло	76 мг, 45%
F98		Метил-3,5-дихлор-6-(4- (трифторметил)тио)фе нил)пиколинат	Пример 32	Бесцветное масло	312 мг, 66%

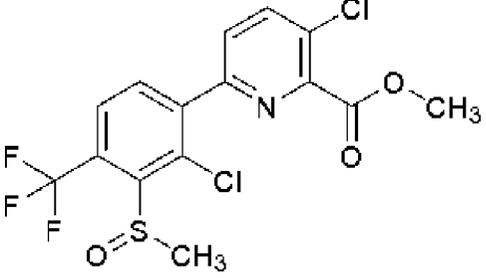
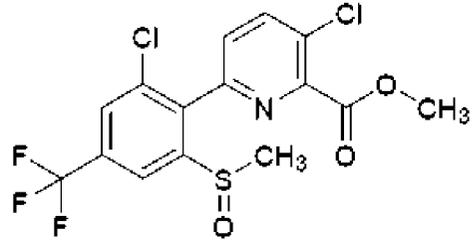
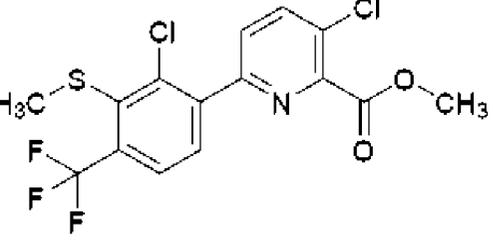
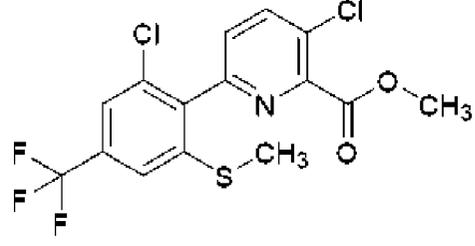
F99		Метил-3,5-дихлор-6'- (трифторметил)-[2,3'- бипиридин]-6- карбоксилат	Пример 32	Белое твердое вещество	297 мг, 68%
F100		Метил-3-хлор-5-фтор- 6-(4- йодфенил)пиколинат	Пример 19	Белое твердое вещество	200 мг, 65%
F101		Метил-3',5-дихлор-5'- (трифторметил)-[2,2'- бипиридин]-6- карбоксилат	Пример 41 с применением C16	Желтое масло	0,069 г, 66%
F102		Метил-3,5-дихлор-6-(2- фтор-4- (трифторметил)фенил)п иколинат	Пример 32	Белое твердое вещество	240 мг, 48%

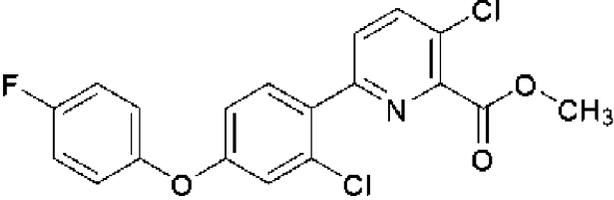
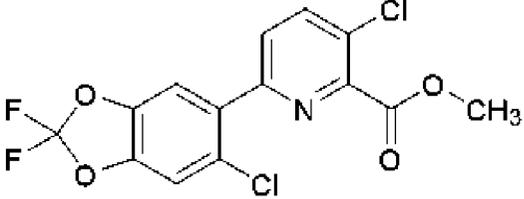
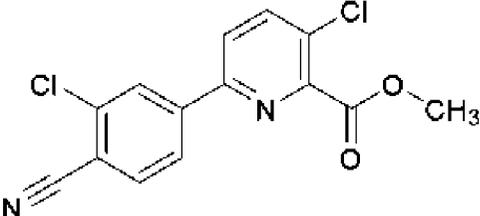
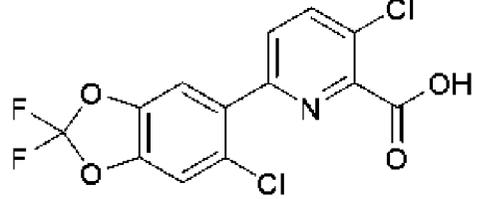
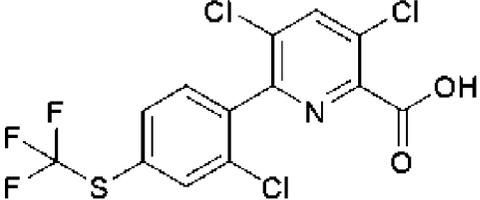
F103		Метил-3,5-дихлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 32	Белое твердое вещество	290 мг, 57%
F104		Метил-2-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-5-метоксипиримидин-4-карбоксилат	Пример 32	Прозрачная смола	40 мг, 15%
F105		Метил-5-хлор-2-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)пиримидин-4-карбоксилат	Пример 32	Прозрачная смола	70 мг, 40%
F106		Метил-3,5-дихлор-6-(4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 32	Белое твердое вещество	155 мг, 33%

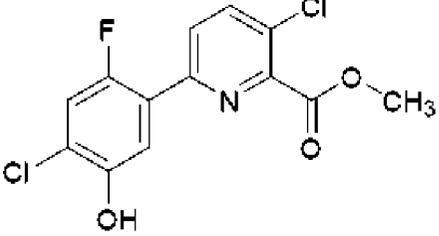
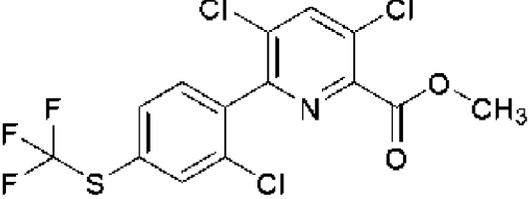
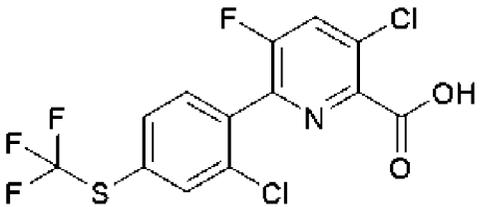
F107		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-5-фторпиколинат	Пример 32	Белое твердое вещество	144 мг, 72%
F108		Метил-3,4-дихлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 32	Белое твердое вещество	110 мг, 44%
F109		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-4-фторпиколинат	Пример 40 с применением F108	Белое твердое вещество	24 мг, 12%
F110		Метил-3-хлор-6-(2,3-дифтор-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 32	Белое твердое вещество	264 мг, 52%

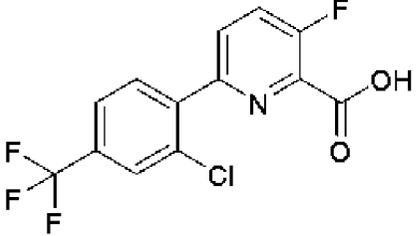
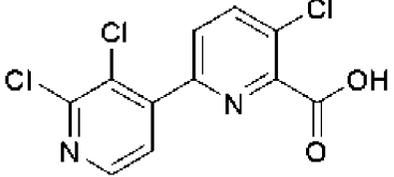
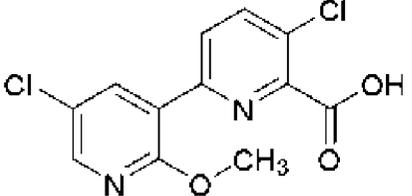
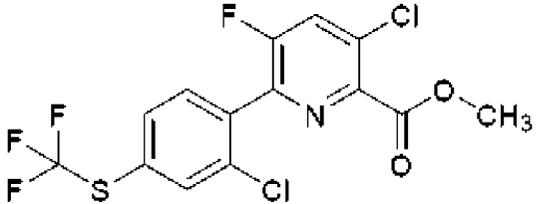
F111		3-Хлор-6-(2-хлор-4-(1,1-дифторэтил)фенил)пиколоиновая кислота	Пример 27	Желтое масло	65 мг, 65%
F112		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(1,1-дифторэтил)фенил)пиколинат	Пример 32	Коричневое масло	138 мг, 33%
F113		Метил-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-3-фторпиколинат	Пример 52	Белое твердое вещество	174 мг, 31%
F114		Метил-5-хлор-6'-(трифторметил)-[2,3'-бипиридин]-6-карбоксилат	Пример 32	Белое твердое вещество	94 мг, 61%

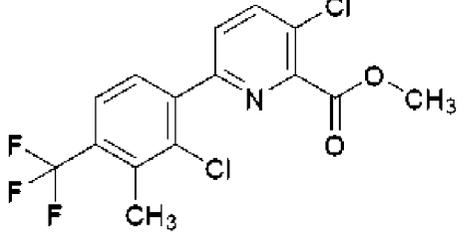
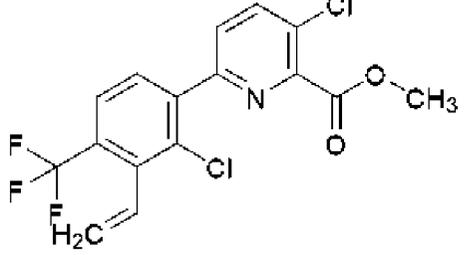
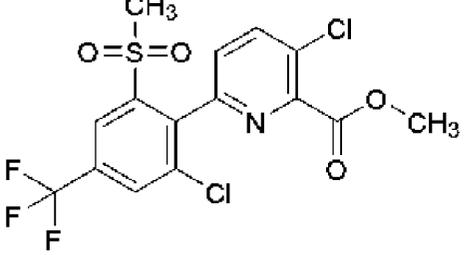
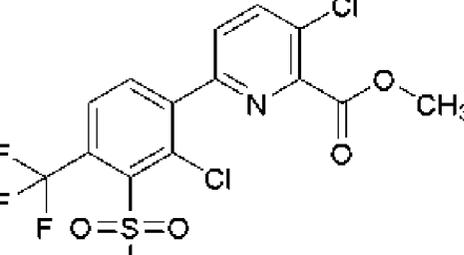
F115		Метил-5-хлор-2-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифенил)пиридин-4-карбоксилат	Пример 37	Белое твердое вещество	0,100 г, 60%
F116		2,4-Дихлорбензил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 33	Прозрачное масло	32 мг, 27%
F117		3-(Трифторметил)бензил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 33	Белое твердое вещество	87 мг, 57%
F118		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-6-циано-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 32 с нагреванием при 90°C в течение 5 ч.	Бесцветная жидкость	31%

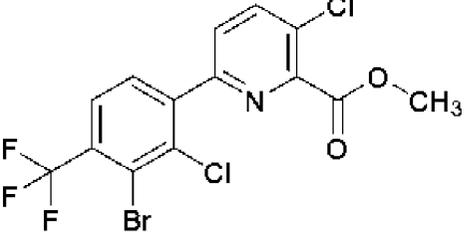
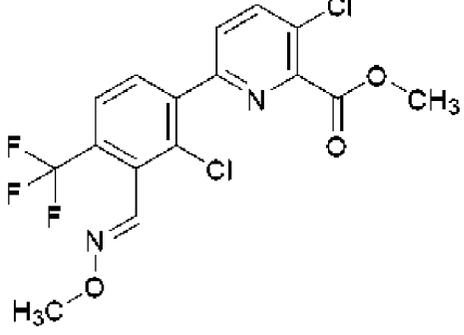
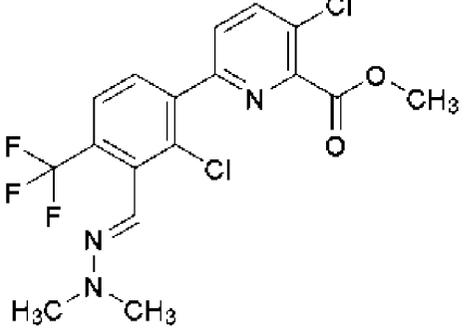
F119		<p>Метил-3-хлор-6-(2-хлор-3-(метилсульфинил)-4-(трифторметил)фенил)пиколинат</p>	Пример 60	Бесцветная жидкость	33 мг, 16%
F120		<p>Метил-6-хлор-6-(2-хлор-3-(метилсульфинил)-4-(трифторметил)фенил)пиколинат</p>	Пример 60	Коричневое твердое вещество	70 мг, 34%
F121		<p>Метил-3-хлор-6-(2-хлор-3-(метилтио)-4-(трифторметил)фенил)пиколинат</p>	Пример 61	Бесцветная жидкость	50 мг, 9%
F122		<p>Метил-6-хлор-6-(2-хлор-3-(метилтио)-4-(трифторметил)фенил)пиколинат</p>	Пример 61	Белое твердое вещество	200 мг, 36%

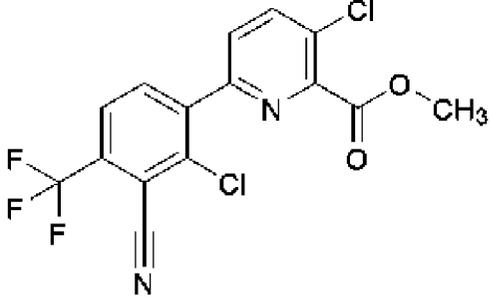
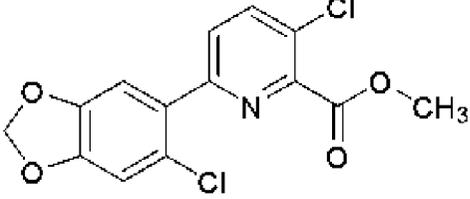
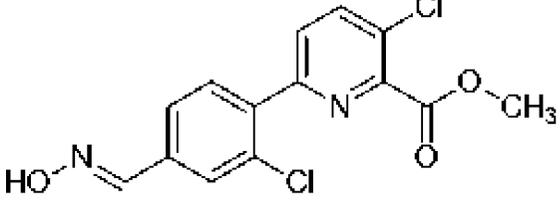
F123		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(4-фторфенокси)фенил)пиколинат	Пример 32	Бесцветное масло	66 мг, 28%
F124		Метил-3-хлор-6-(6-хлор-2,2-дифторбензо[<i>d</i>][1,3]диоксол-5-ил)пиколинат	Пример 51	Белое твердое вещество	148 мг, 42%
F125		Метил-3-хлор-6-(3-хлор-4-цианофенил)пиколинат	Пример 32	Белое твердое вещество	46 мг, 31%
F126		3-Хлор-6-(6-хлор-2,2-дифторбензо[<i>d</i>][1,3]диоксол-5-ил)пиколиновая кислота	Пример 27	Белое твердое вещество	86 мг, 90%
F127		3,5-Дихлор-6-(2-хлор-4-((трифторметил)тио)фенил)пиколиновая кислота	Пример 27	Прозрачное клейкое твердое вещество	49 мг, 91%

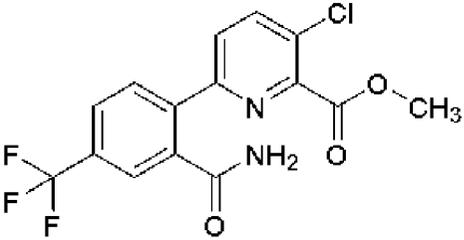
F128		Метил-3-хлор-6-(4-хлор-2-фтор-5-гидроксифенил)пиколинат	Пример 51	Белое твердое вещество	161 мг, 38%
F129		Метил-5,5'-дихлор-2'-метокси-[2,3'-бипиридин]-6-карбоксилат	Пример 51	Белое твердое вещество	191 мг, 56%
F130		Метил-3,5-дихлор-6-(2-хлор-4-((трифторметил)тио)фенил)пиколинат	Пример 32	Прозрачное вязкое масло	85 мг, 49%
F131		3-Хлор-6-(2-хлор-4-((трифторметил)тио)фенил)-5-фторпиколиновая кислота	Пример 27	Прозрачное вязкое масло	82 мг, 85%

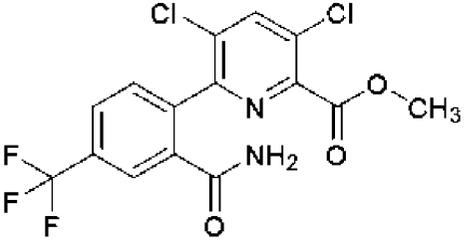
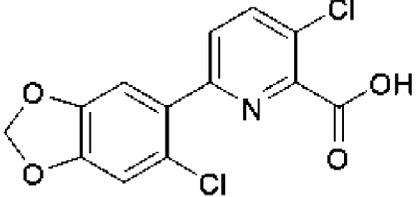
F132		6-(2-Хлор-4-(трифторметил)фенил)-3-фторпиколиновая кислота	Пример 27	Белое твердое вещество	87 мг, 83%
F133		2',3',5-Трихлор-[2,4'-бипиридин]-6-карбоновая кислота	Пример 27	Белое твердое вещество	35 мг, 56%
F134		5,5'-Дихлор-2'-метокси-[2,3'-бипиридин]-6-карбоновая кислота	Пример 27	Белое твердое вещество	90 мг, 70%
F135		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-((трифторметил)тио)фенил)-5-фторпиколинат	Пример 32	Белое твердое вещество	273 мг, 76%

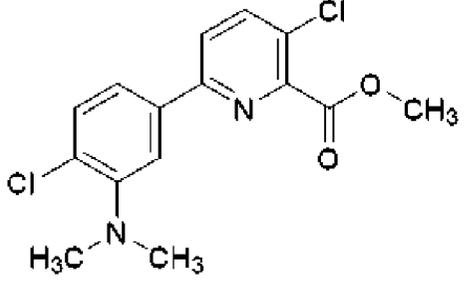
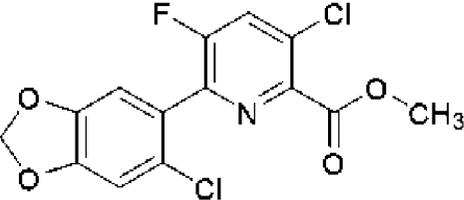
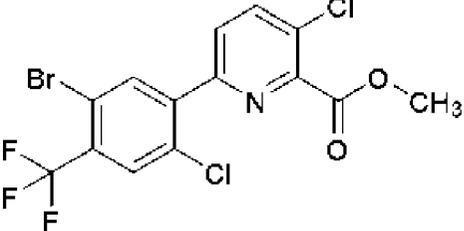
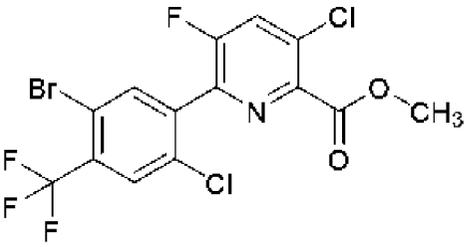
F136		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-3-метил-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 57	Белое твердое вещество	80 мг, 31%
F137		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)-3-винилфенил)пиколинат	ЖКУ	Белое твердое вещество	25 мг, 19%
F138		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-6-(метилсульфонил)-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 59	Белое твердое вещество	15 мг, 6%
F139		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-3-(метилсульфонил)-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 59	Белое твердое вещество	40 мг, 15%

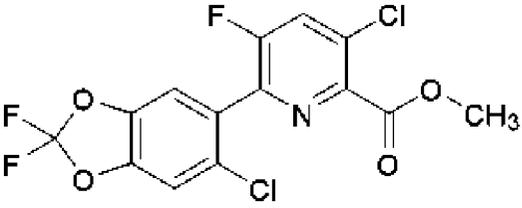
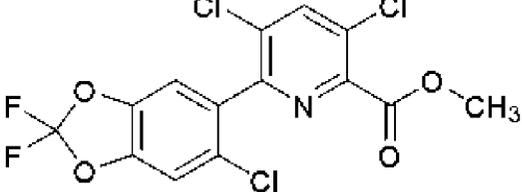
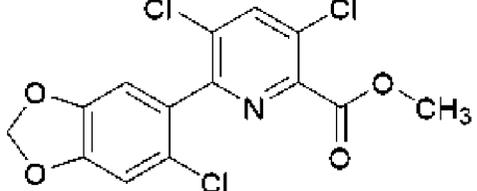
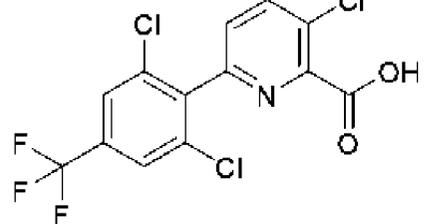
F140		Метил-6-(3-бром-2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-3-хлорпиколинат	Пример 32 с нагреванием при 90°C в течение 5 ч.	Белое твердое вещество	22%
F141		Метил-(<i>E</i>)-3-хлор-6-(2-хлор-3-((метоксиимино)метил)-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 32 с нагреванием при 90°C в течение 5 ч.	Белое твердое вещество	16%
F142		Метил-(<i>E</i>)-3-хлор-6-(2-хлор-3-((2,2-диметилгидразоно)метил)-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 32 с нагреванием при 90°C в течение 5 ч.	Белое твердое вещество	38%

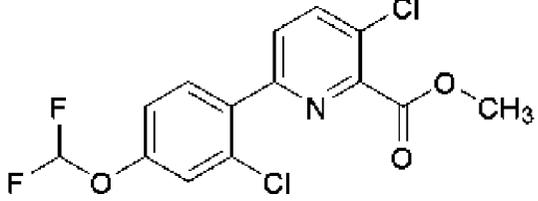
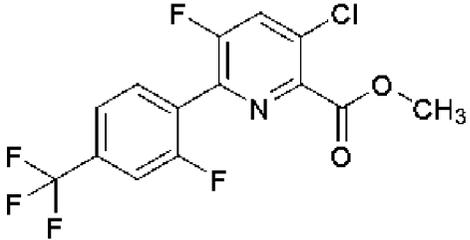
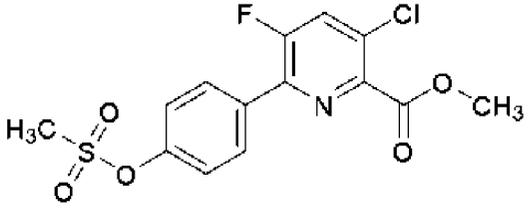
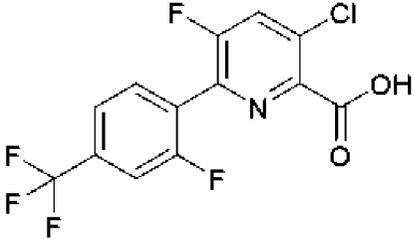
F143		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-3-циано-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 62	Грязно-белое твердое вещество	40 мг, 30%
F144		Метил-3-хлор-6-(6-хлорбензо[<i>d</i>][1,3]диоксол-5-ил)пиколинат	Пример 51	Белое твердое вещество	181 мг, 51%
F145		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-((гидроксиимино)метил)фенил)пиколинат	Пример 35 с применением F22	Белое твердое вещество	24 мг, 56%

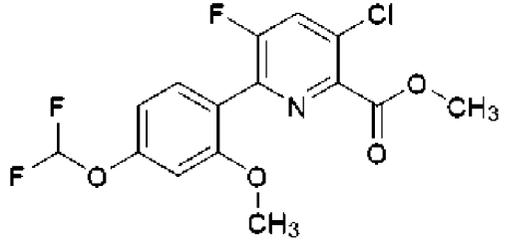
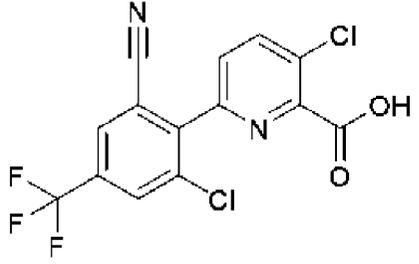
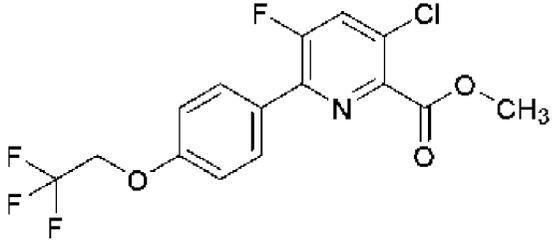
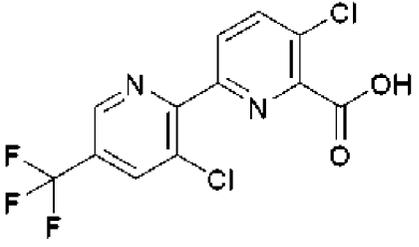
F146	 <p>The chemical structure shows a central boron atom bonded to a nitrogen atom of a pyridine ring, a carbonyl group (C=O), and a nitrogen atom of a carbamate group (-NH-C(=O)-O-CH₃). The pyridine ring has a chlorine atom at the 3-position. The carbonyl group is attached to a benzene ring at the 2-position, which also has a trifluoromethyl group (-CF₃) at the 4-position.</p>	Метил-6-(2-карбамоил-4-(трифторметил)фенил)-3-хлорпиколинат	Пример 32 с применением (2-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)-5-(трифторметил)бензонитрила (нитрил гидролизуется до первичного амида при условиях реакции)	Грязно-белое твердое вещество	263 мг, 60%
------	--	---	---	-------------------------------	-------------

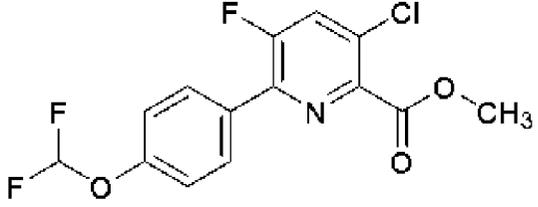
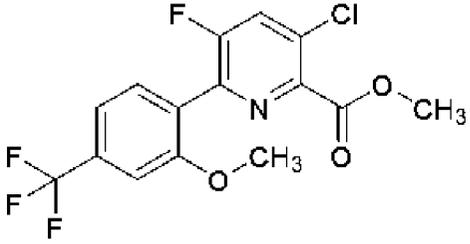
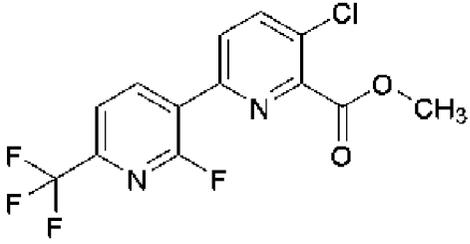
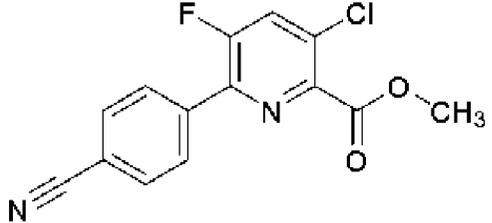
F147		<p>Метил-6-(2-карбамоил-4-(трифторметил)фенил)-3,5-дихлорпиколинат</p>	<p>Пример 32 с применением (2-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)-5-(трифторметил)бензонитрила (нитрил гидролизуется до первичного амида при условиях реакции)</p>	<p>Грязно-белое твердое вещество</p>	<p>220 мг, 54%</p>
F148		<p>3-Хлор-6-(6-хлорбензо[<i>d</i>][1,3]диоксол-5-ил)пиколиновая кислота</p>	<p>Пример 27</p>	<p>Белое твердое вещество</p>	<p>40 мг, 78%</p>

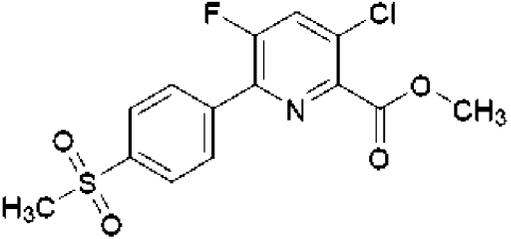
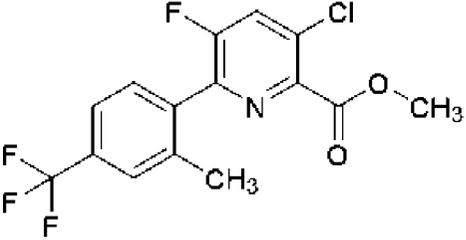
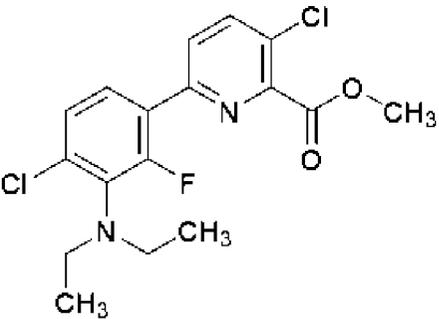
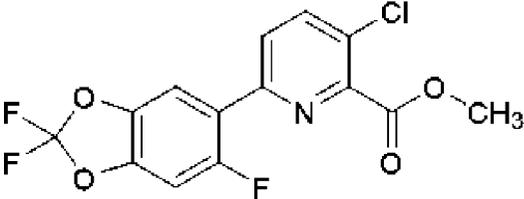
F149		<p>Метил-3-хлор-6-(4-хлор-3-(диметиламино)фенил)пиколинат</p>	<p>Пример 19 с применением <i>tert</i>-бутилнитрита и DMF в качестве растворителя, как описано в <i>J. Org. Chem.</i> 1977, <i>42</i>, 3494</p>	Желтое масло	11 мг, 15%
F150		<p>Метил-3-хлор-6-(6-хлорбензо[<i>d</i>][1,3]диоксол-5-ил)-5-фторпиколинат</p>	Пример 51	Белое твердое вещество	115 мг, 31%
F151		<p>Метил-6-(5-бром-2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-3-хлорпиколинат</p>	Пример 51	Белое твердое вещество	53 мг, 29%
F152		<p>Метил-6-(5-бром-2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-3-хлор-5-фторпиколинат</p>	Пример 51	Белое твердое вещество	67 мг, 36%

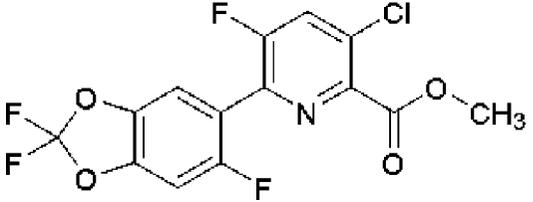
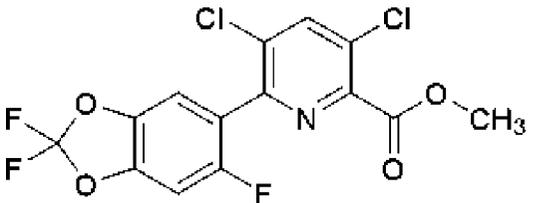
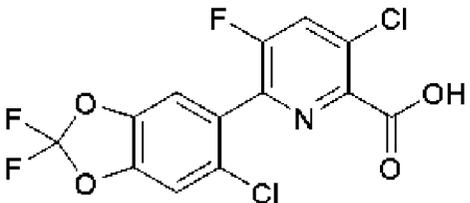
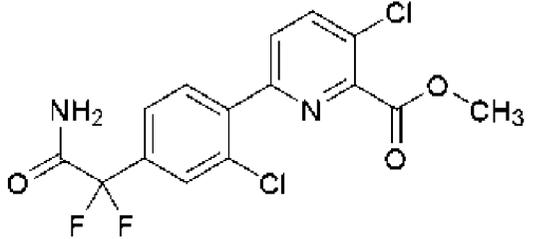
F153		Метил-3-хлор-6-(6-хлор-2,2-дифторбензо[<i>d</i>][1,3]диоксол-5-ил)-5-фторпиколинат	Пример 51	Белое твердое вещество	58 мг, 29%
F154		Метил-3,5-дихлор-6-(6-хлор-2,2-дифторбензо[<i>d</i>][1,3]диоксол-5-ил)пиколинат	Пример 51	Оранжевое твердое вещество	377 мг, 45%
F155		Метил-3,5-дихлор-6-(6-хлорбензо[<i>d</i>][1,3]диоксол-5-ил)пиколинат	Пример 51	Желтое масло	126 мг, 35%
F156		3-Хлор-6-(2,6-дихлор-4-(трифторметил)фенил)пиколиновая кислота	Пример 28	Желтовато-коричневое твердое вещество	29 мг, 100%

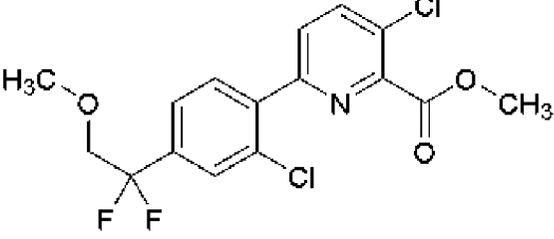
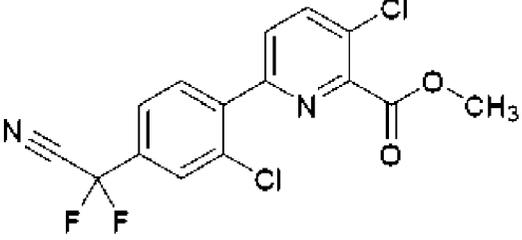
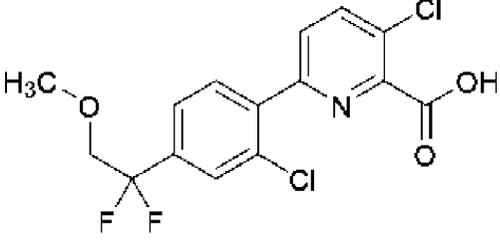
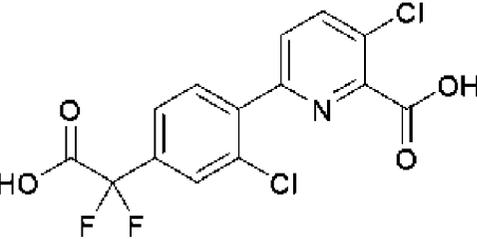
F157		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(диформетокси)фенил)пиколинат	Пример 68 с применением С93	Грязно-белое твердое вещество	125 мг, 24%
F158		Метил-3-хлор-5-фтор-6-(2-фтор-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 63	Белое твердое вещество	353 мг, 71%
F159		Метил-3-хлор-5-фтор-6-(4-((метилсульфонил)окси)фенил)пиколинат	Пример 63	Светло-желтое твердое вещество	248 мг, 50%
F160		3-Хлор-5-фтор-6-(2-фтор-4-(трифторметил)фенил)пиколиновая кислота	Пример 50	Белое твердое вещество	197 мг, 77%

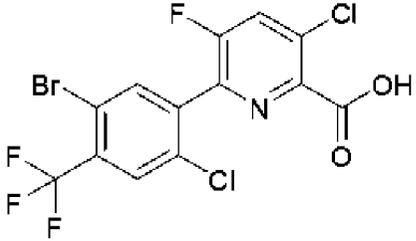
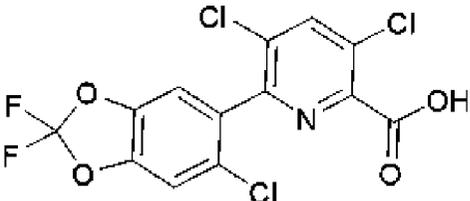
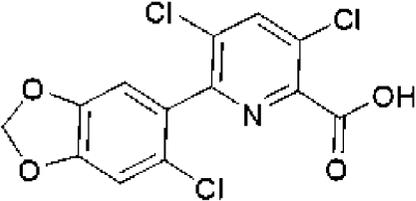
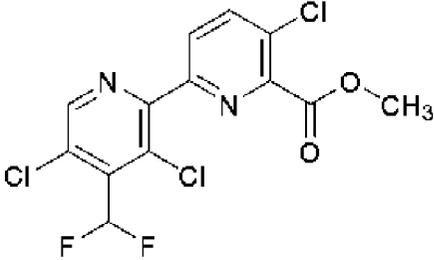
F161		Метил-3-хлор-6-(4-(дифторметокси)-2-метоксифенил)-5-фторпиколинат	Пример 68 с применением С94	Желтое твердое вещество	163 мг, 25%
F162		3-Хлор-6-(2-хлор-6-циано-4-(трифторметил)фенил)пиколиновая кислота	Пример 27	Белое твердое вещество	160 мг, 84%
F163		Метил-3-хлор-5-фтор-6-(4-(2,2,2-трифторэтоксифенил)пиколинат	Пример 63	Белое твердое вещество	261 мг, 52%
F164		3',5-Дихлор-5'-(трифторметил)-[2,2'-бипиридин]-6-карбоновая кислота	Пример 27	Оранжевое масло	110 мг, 97%

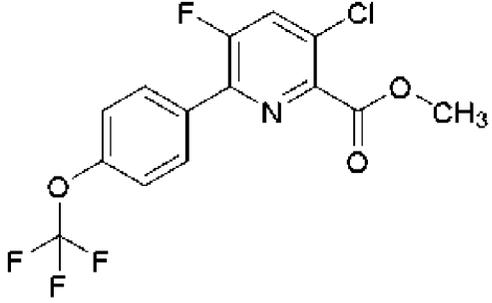
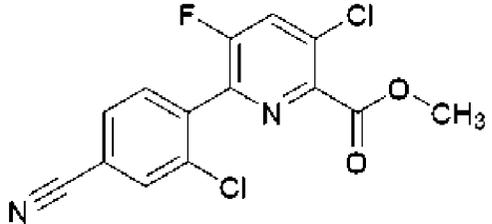
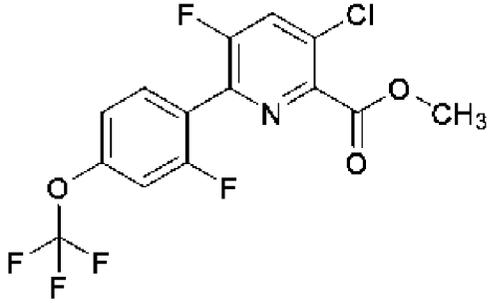
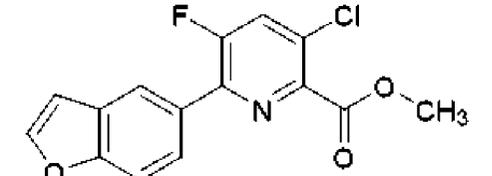
F165		Метил-3-хлор-6-(4-(дифторметокси)фенил)-5-фторпиколинат	Пример 63	Белое твердое вещество	225 мг, 49%
F166		Метил-3-хлор-5-фтор-6-(2-метокси-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 63	Белое твердое вещество	479 мг, 30%
F167		Метил-5-хлор-2'-фтор-6'-(трифторметил)-[2,3'-бипиридин]-6-карбоксилат	Пример 63	Белое твердое вещество	77 мг, 29%
F168		Метил-3-хлор-6-(4-цианофенил)-5-фторпиколинат	Пример 63	Белое твердое вещество	196 мг, 49%

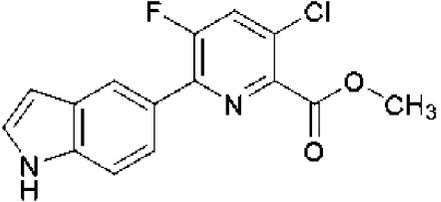
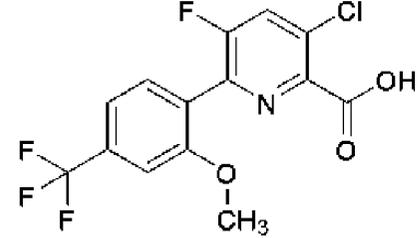
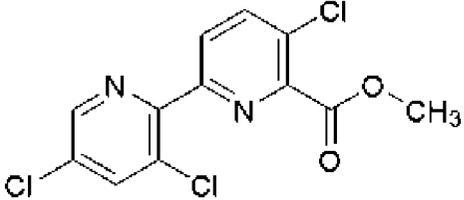
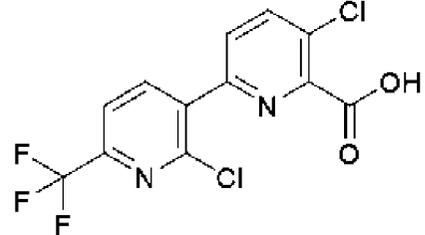
F169		Метил-3-хлор-5-фтор-6-(4-(метилсульфонил)фенил)пиколинат	Пример 63	Грязно-белое твердое вещество	193 мг, 38%
F170		Метил-3-хлор-5-фтор-6-(2-метил-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 63	Белое твердое вещество	223 мг, 47%
F171		Метил-4-амино-3-хлор-6-(4-хлор-3-(диэтиламино)-2-фторфенил)пиколинат	Пример 19 с применением <i>tert</i> -бутилнитрита и DMF в качестве растворителя, как описано в <i>J. Org. Chem.</i> 1977 , <i>42</i> , 3494	Бесцветное масло	16 мг, 22%
F172		Метил-3-хлор-6-(2,2,6-трифторбензо[<i>d</i>][1,3]диоксол-5-ил)пиколинат	Пример 51	Белое твердое вещество	293 мг, 51%

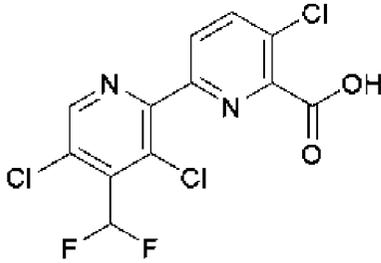
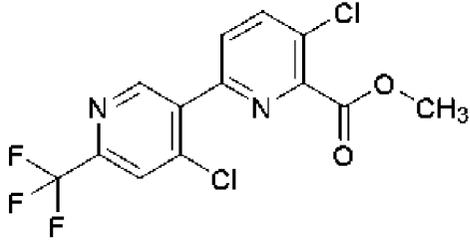
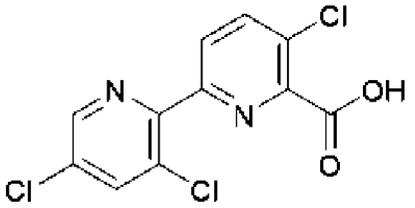
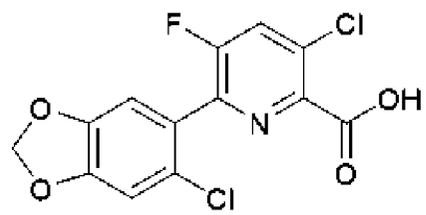
F173		Метил-3-хлор-5-фтор-6-(2,2,6-трифторбензо[<i>d</i>][1,3]диоксол-5-ил)пиколинат	Пример 51	Белое твердое вещество	231 мг, 38%
F174		Метил-3,5-дихлор-6-(2,2,6-трифторбензо[<i>d</i>][1,3]диоксол-5-ил)пиколинат	Пример 51	Белое твердое вещество	341 мг, 54%
F175		3-Хлор-6-(6-хлор-2,2-дифторбензо[<i>d</i>][1,3]диоксол-5-ил)-5-фторпиколиновая кислота	Пример 27	Желтое масло	27 мг, 92%
F176		Метил-6-(4-(2-амино-1,1-дифтор-2-оксоэтил)-2-хлорфенил)-3-хлорпиколинат	Пример 65	Белое твердое вещество	0,1 г, 25%

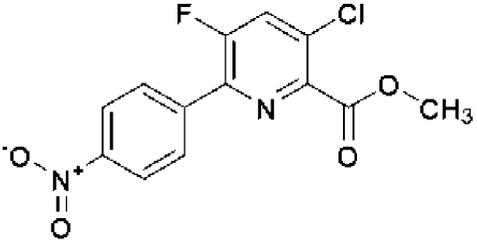
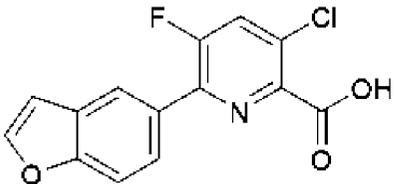
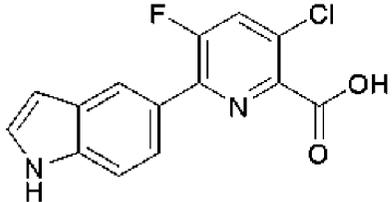
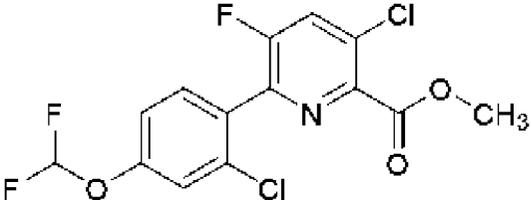
F177		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(1,1-дифтор-2-метоксиэтил)фенил)пиколонат	Пример 65	Бледно-желтая жидкость	0,15 г, 30%
F178		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(цианодиформетил)фенил)пиколинат	Пример 65	Грязно-белое твердое вещество	0,6 г, 20%
F179		3-Хлор-6-(2-хлор-4-(1,1-дифтор-2-метоксиэтил)фенил)пикололиновая кислота	Пример 47	Коричневая жидкость	0,04 г, 70%
F180		6-(4-(Карбоксидиформетил)-2-хлорфенил)-3-хлорпиколиновая кислота	Пример 47	Белое твердое вещество	0,025 г, 20%

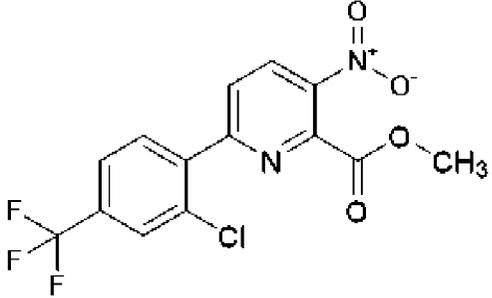
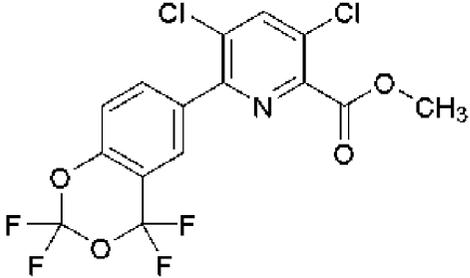
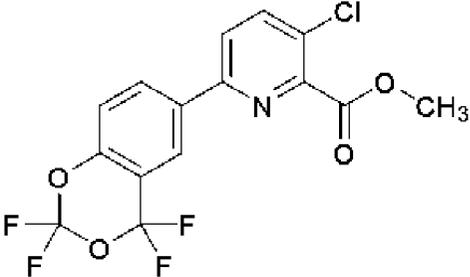
F181		6-(5-Бром-2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-3-хлор-5-фторпиколиновая кислота	Пример 27	Белое твердое вещество	31 мг, 52%
F182		3,5-Дихлор-6-(6-хлор-2,2-дифторбензо[<i>d</i>][1,3]диоксол-5-ил)пиколиновая кислота	Пример 27	Прозрачное масло	48 мг, 98%
F183		3,5-Дихлор-6-(6-хлорбензо[<i>d</i>][1,3]диоксол-5-ил)пиколиновая кислота	Пример 27	Желтое твердое вещество	84 мг, 68%
F184		Метил-3',5,5'-трихлор-4'-(дифторметил)-[2,2'-бипиридин]-6-карбоксилат	Пример 19 с применением <i>tert</i> -бутилнитрита и DMF в качестве растворителя, как описано в <i>J. Org. Chem.</i> 1977 , 42, 3494	Бесцветное масло	82 мг, 92%

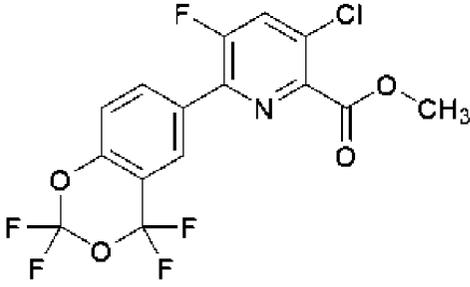
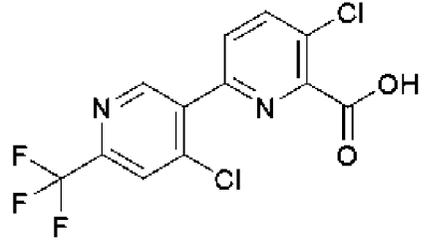
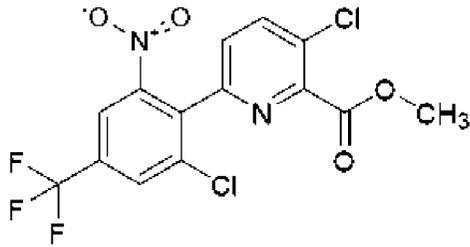
F185		Метил-3-хлор-5-фтор-6-(4-(трифторметокси)фенил)пиколинат	Пример 63	Легкоплавкое стекловидное твердое вещество	125 мг, 26%
F186		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-цианофенил)-5-фторпиколинат	Пример 63	Белое твердое вещество	57 мг, 9,3%
F187		Метил-3-хлор-5-фтор-6-(2-фтор-4-(трифторметокси)фенил)пиколинат	Пример 63	Белое твердое вещество	162 мг, 24%
F188		Метил-6-(бензофуран-5-ил)-3-хлор-5-фторпиколинат	Пример 63	Белое твердое вещество	380 мг, 68%

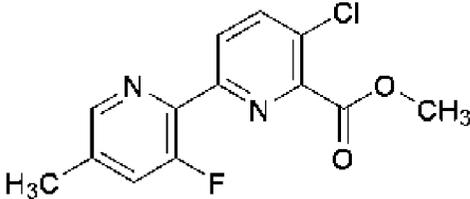
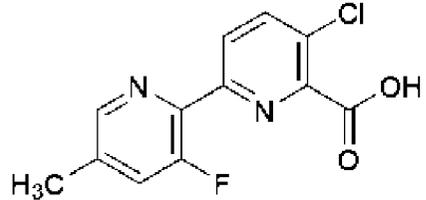
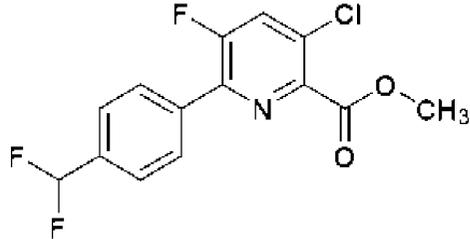
F189		Метил-3-хлор-5-фтор-6-(1 <i>H</i> -индол-5-ил)пиколинат	Пример 63	Белое твердое вещество	250 мг, 45%
F190		3-Хлор-5-фтор-6-(2-метокси-4-(трифторметил)фенил)пиколиновая кислота	Пример 50	Белое твердое вещество	150 мг, 83%
F191		Метил-3',5,5'-трихлор-[2,2'-бипиридин]-6-карбоксилат	Пример 19 с применением <i>tert</i> -бутилнитрита и DMF в качестве растворителя, как описано в <i>J. Org. Chem.</i> 1977 , 42, 3494	Оранжевое масло	94 мг, 100%
F192		2',5-Дихлор-6'-(трифторметил)-[2,3'-бипиридин]-6-карбоновая кислота	Пример 28	Желтовато-коричневое твердое вещество	59 мг, 79%

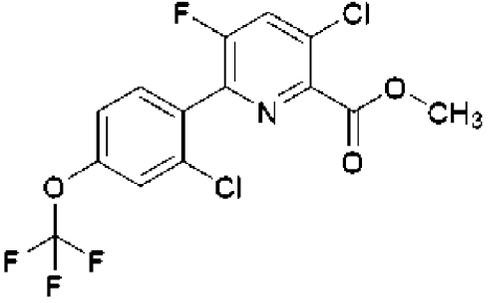
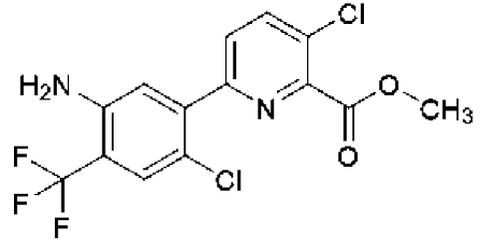
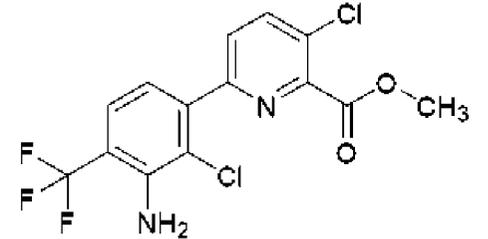
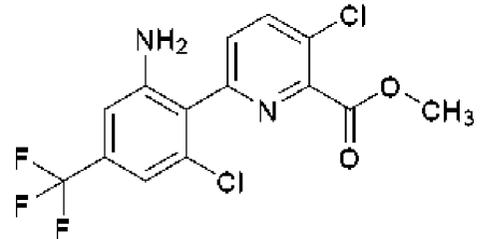
F193		3',5,5'-Трихлор-4'-(дифторметил)-[2,2'-бипиридин]-6-карбоновая кислота	Пример 27	Оранжевое масло	30 мг, 74%
F194		Метил-4',5-дихлор-6'-(трифторметил)-[2,3'-бипиридин]-6-карбоксилат	Пример 19 с применением <i>tert</i> -бутилнитрита и DMF в качестве растворителя, как описано в <i>J. Org. Chem.</i> 1977, 42, 3494	Грязно-белое твердое вещество	138 мг, 91%
F195		3',5,5'-Трихлор-[2,2'-бипиридин]-6-карбоновая кислота	Пример 27	Желтое масло	44 мг, 96%
F196		3-Хлор-6-(6-хлорбензо[<i>d</i>][1,3]диоксол-5-ил)-5-фторпиколиновая кислота	Пример 27	Белое твердое вещество	48 мг, 98%

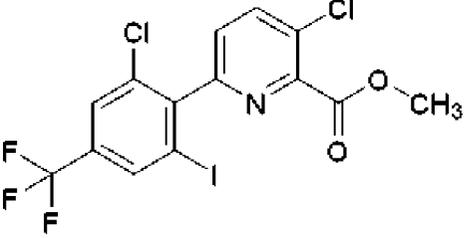
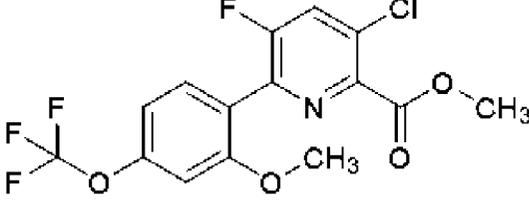
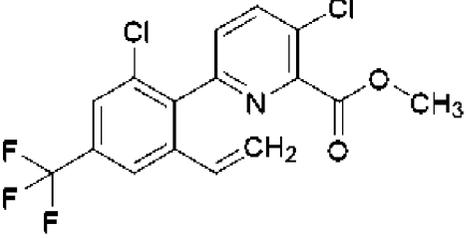
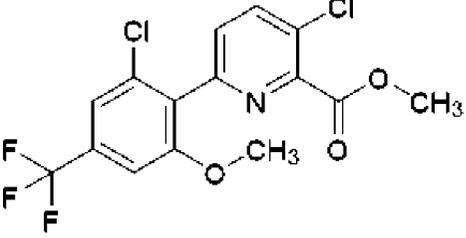
F197		Метил-3-хлор-5-фтор-6-(4-нитрофенил)пиколинат	Пример 63	Белое твердое вещество	290 мг, 50%
F198		6-(Бензофуран-5-ил)-3-хлор-5-фторпиколиновая кислота	Пример 50	Белое твердое вещество	130 мг, 67%
F199		3-Хлор-5-фтор-6-(1H-индол-5-ил)пиколиновая кислота	Пример 50	Грязно-белое твердое вещество	113 мг, 77%
F200		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(дифторметокси)фенил)-5-фторпиколинат	Пример 68 с применением С93	Желтое твердое вещество	250 мг, 33%

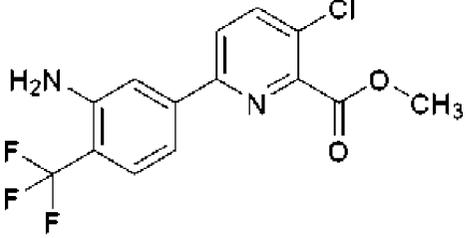
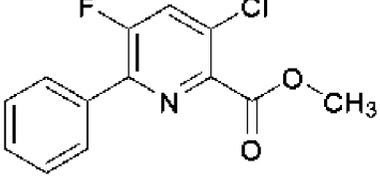
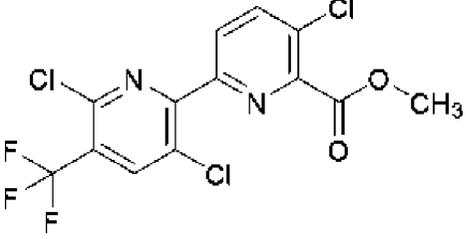
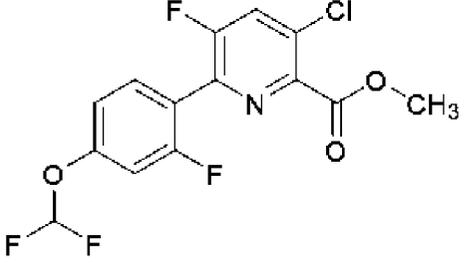
F201		Метил-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-3-нитропиколинат	Пример 51	Белое твердое вещество	239 мг, 75%
F202		Метил-3,5-дихлор-6-(2,2,4,4-тетрафтор-4H-бензо[<i>d</i>][1,3]диоксин-6-ил)пиколинат	Пример 51	Белое твердое вещество	61 мг, 25%
F203		Метил-3-хлор-6-(2,2,4,4-тетрафтор-4H-бензо[<i>d</i>][1,3]диоксин-6-ил)пиколинат	Пример 51	Белое твердое вещество	198 мг, 56%

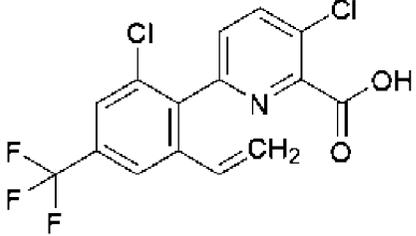
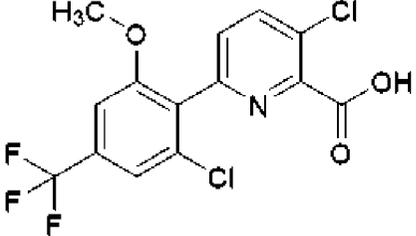
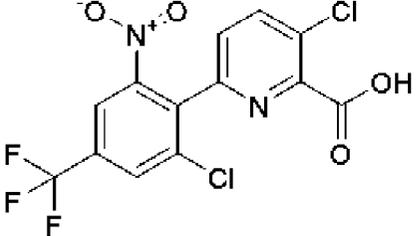
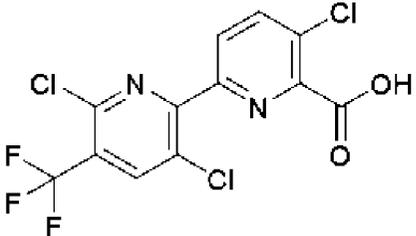
F204		<p>Метил-3-хлор-5-фтор-6-(2,2,4,4-тетрафтор-4H-бензо[<i>d</i>][1,3]диоксин-6-ил)пиколинат</p>	Пример 51	Коричневое масло	199 мг, 55%
F205		<p>4',5-Дихлор-6'-(трифторметил)-[2,3'-бипиридин]-6-карбоновая кислота</p>	Пример 28	Белое твердое вещество	65 мг, 88%
F206		<p>Метил-3-хлор-6-(2-хлор-6-нитро-4-(трифторметил)фенил)пиколинат</p>	Пример 41	Желтое масло	334 мг, 20%

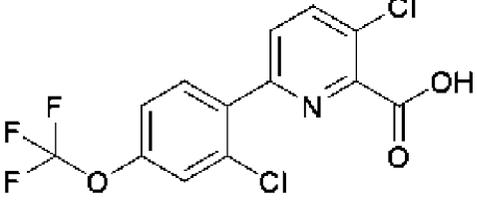
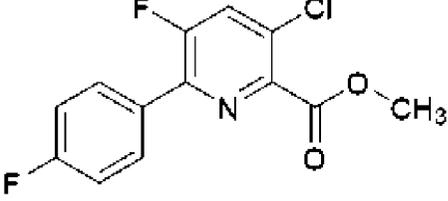
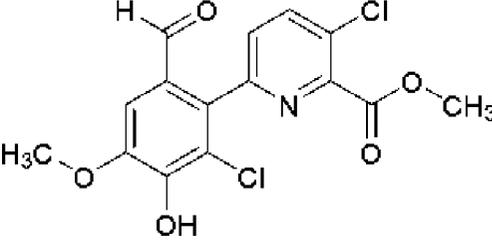
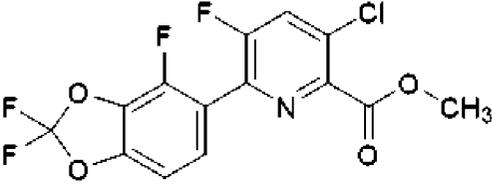
F207		Метил-5-хлор-3'-фтор-5'-метил-[2,2'-бипиридин]-6-карбоксилат	Пример 19 с применением <i>tert</i> -бутилнитрита и DMF в качестве растворителя, как описано в <i>J. Org. Chem.</i> 1977 , <i>42</i> , 3494	Бесцветное масло	25 мг, 68%
F208		5-Хлор-3'-фтор-5'-метил-[2,2'-бипиридин]-6-карбоновая кислота	Пример 28	Светло-оранжевое твердое вещество	19 мг, 80%
F209		Метил-3-хлор-6-(4-(дифторметил)фенил)-5-фторпиколинат	Пример 63	Белое твердое вещество	208 мг, 48%

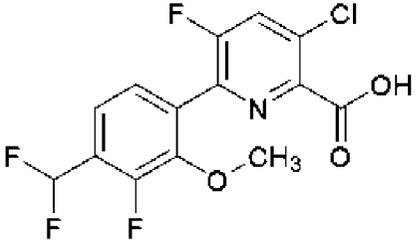
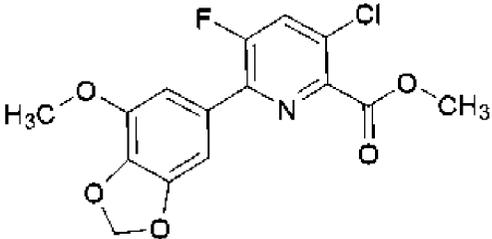
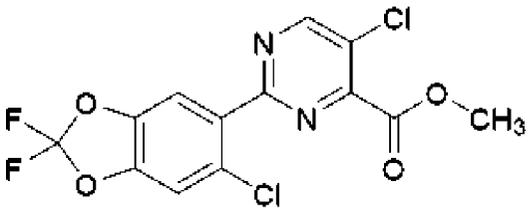
F210		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметокси)фенил)-5-фторпиколинат	Пример 63	Белое твердое вещество	158 мг, 23%
F211		Метил-6-(5-амино-2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-3-хлорпиколинат	Пример 54	Бежевое твердое вещество	102 мг, 28%
F212		Метил-6-(3-амино-2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-3-хлорпиколинат	Пример 54	Белое твердое вещество	49 мг, 13%
F213		Метил-6-(2-амино-6-хлор-4-(трифторметил)фенил)-3-хлорпиколинат	Пример 55	Белое твердое вещество	108 мг, 38%

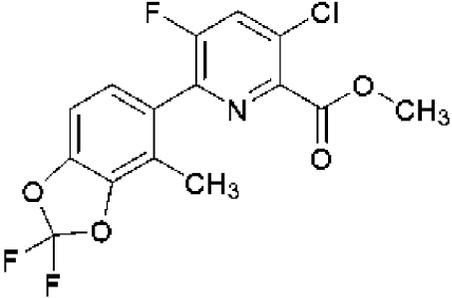
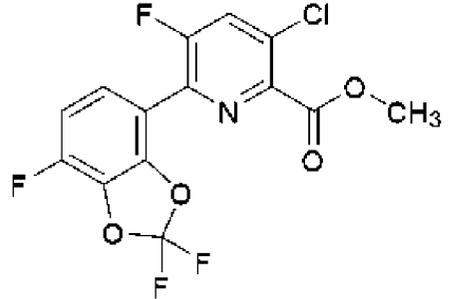
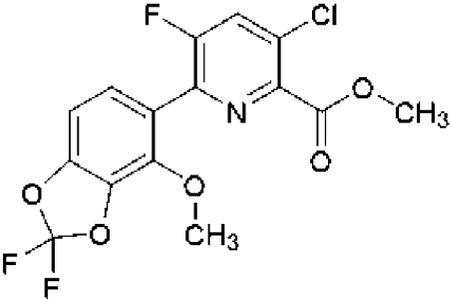
F214		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-6-йод-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 66	Желтое твердое вещество	92 мг, 74%
F215		Метил-3-хлор-5-фтор-6-(2-метокси-4-(трифторметокси)фенил)пиколинат	Пример 63	Белое твердое вещество	397 мг, 57%
F216		Метил-6-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)-3-винилфенил)пиколинат	Пример 56	Белое твердое вещество	46 мг, 55%
F217		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-6-метокси-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 41	Белое твердое вещество	35 мг, 13%

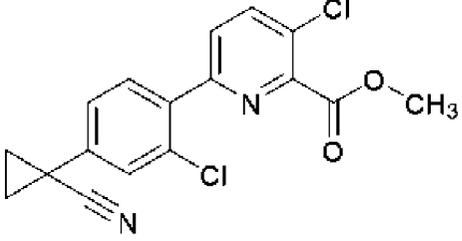
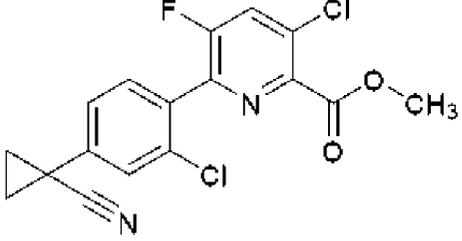
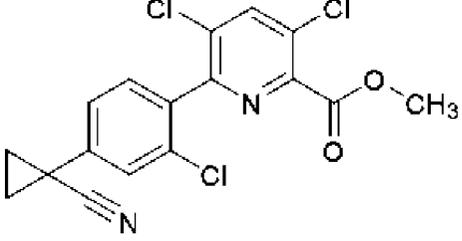
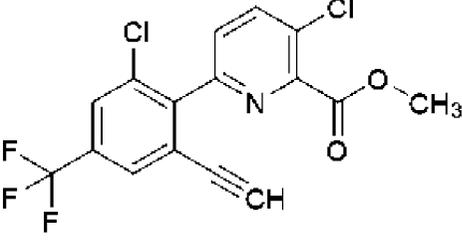
F218		Метил-6-(3-амино-4-(трифторметил)фенил)-3-хлорпиколинат	Пример 32	Вязкое прозрачное масло	1,13 г, 70%
F219		Метил-3-хлор-5-фтор-6-фенилпиколинат	Пример 63	Прозрачное масло	208 мг, 57%
F220		Метил-3',5,6'-трихлор-5'-(трифторметил)-[2,2'-бипиридин]-6-карбоксилат	Пример 19 с применением <i>tert</i> -бутилнитрита и DMF в качестве растворителя, как описано в <i>J. Org. Chem.</i> 1977, 42, 3494	Бесцветное масло	29 мг, 100%
F221		Метил-3-хлор-6-(4-(дифторметокси)-2-фторфенил)-5-фторпиколинат	Пример 63	Белое твердое вещество	91 мг, 14%

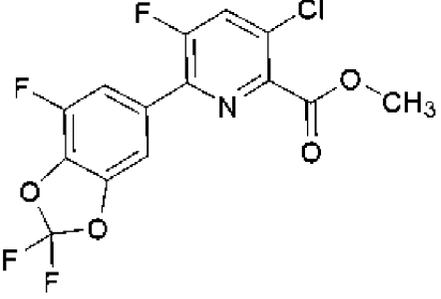
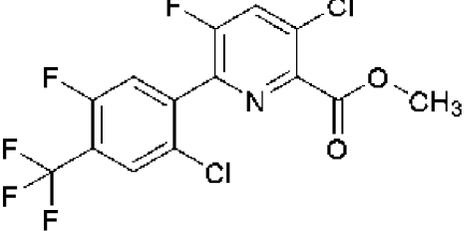
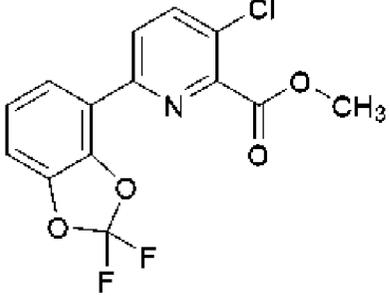
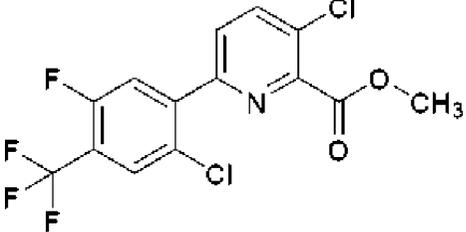
F222		3-Хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)-6-винилфенил)пиколиновая кислота	Пример 27	Желтое масло	36 мг, 100%
F223		3-Хлор-6-(2-хлор-6-метокси-4-(трифторметил)фенил)пиколиновая кислота	Пример 27	Желтое масло	33 мг, 99%
F224		3-Хлор-6-(2-хлор-6-нитро-4-(трифторметил)фенил)пиколиновая кислота	Пример 27	Белое твердое вещество	39 мг, 100%
F225		3',5,6'-Трихлор-5'-(трифторметил)-[2,2'-бипиридин]-6-карбоновая кислота	Пример 27	Желтая пена	23 мг, 80%

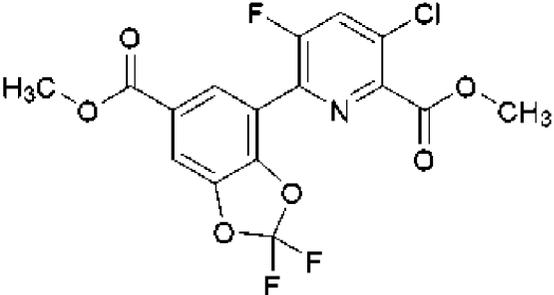
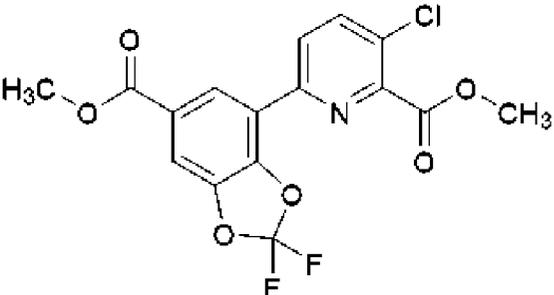
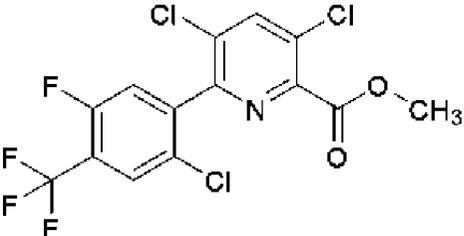
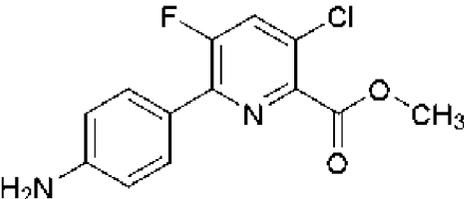
F226		3-Хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметокси)фенил)пиколиновая кислота	Пример 50	Белое твердое вещество	104 мг, 71%
F227		Метил-3-хлор-5-фтор-6-(4-фторфенил)пиколинат	Пример 63	Прозрачное масло	226 мг, 58%
F228		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-6-формил-3-гидрокси-4-метоксифенил)пиколинат	Пример 41	Коричневое твердое вещество	39 мг, 14%
F229		Метил-3-хлор-5-фтор-6-(2,2,4-трифторбензо[<i>d</i>][1,3]диоксол-5-ил)пиколинат	Пример 51	Коричневое твердое вещество	345 мг, 64%

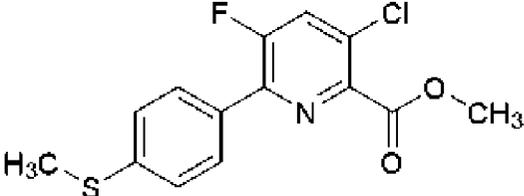
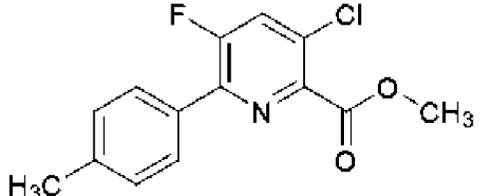
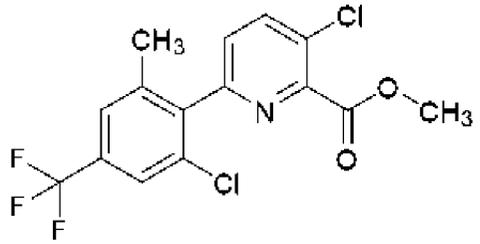
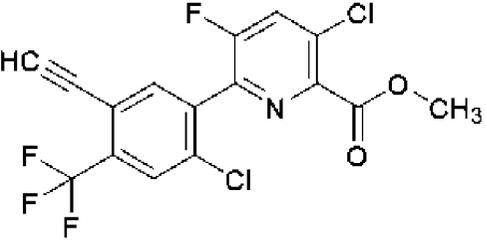
F230		3-Хлор-6-(4-(дифторметил)-3-фтор-2-метоксифенил)-5-фторпиколиновая кислота	Пример 50	Белое твердое вещество	100 мг, 77%
F231		Метил-3-хлор-5-фтор-6-(7-метоксibenзо[<i>d</i>][1,3]диоксол-5-ил)пиколинат	Пример 19 с применением исходных материалов, описанных в US 20140274701, и <i>трет</i> -бутилнитрита и DMF в качестве растворителя, как описано в <i>J. Org. Chem.</i> 1977 , <i>42</i> , 3494	Коричневое твердое вещество	85 мг, 97%
F232		Метил-5-хлор-2-(6-хлор-2,2-дифторбензо[<i>d</i>][1,3]диоксол-5-ил)пиримидин-4-карбоксилат	Пример 51	Желтое твердое вещество	155 мг, 46%

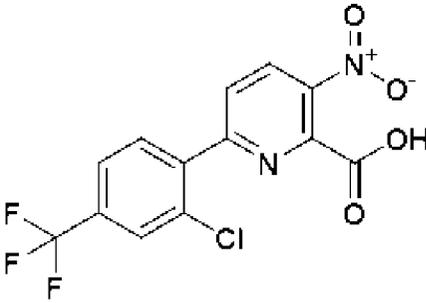
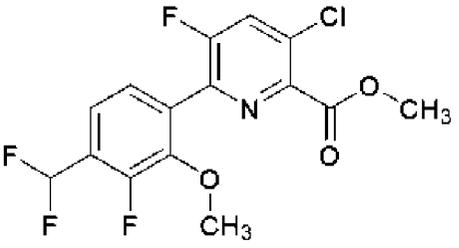
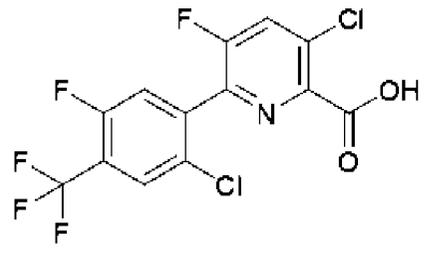
F233		Метил-3-хлор-6-(2,2-дифтор-4-метилбензо[<i>d</i>][1,3]диоксол-5-ил)-5-фторпиколинат	Пример 51	Белое твердое вещество	51 мг, 58%
F234		Метил-3-хлор-5-фтор-6-(2,2,7-трифторбензо[<i>d</i>][1,3]диоксол-4-ил)пиколинат	Пример 51	Белое твердое вещество	235 мг, 65%
F235		Метил-3-хлор-6-(2,2-дифтор-4-метоксибензо[<i>d</i>][1,3]диоксол-5-ил)-5-фторпиколинат	Пример 41	Белое твердое вещество	148 мг, 51%

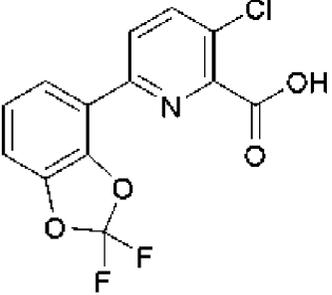
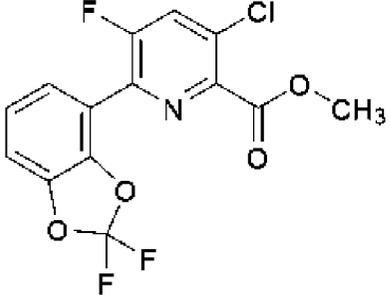
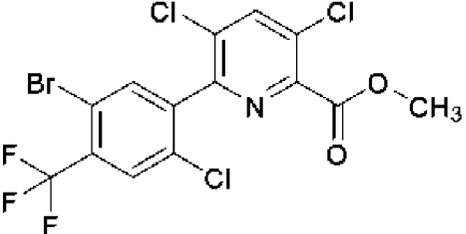
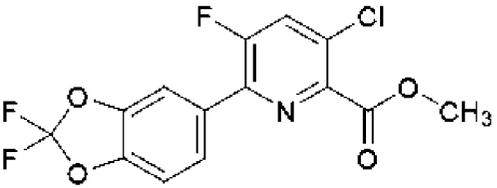
F236		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(1-цианоциклопропил)фенил)пиколинат	Пример 51	Желтое масло	212 мг, 93%
F237		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(1-цианоциклопропил)фенил)-5-фторпиколинат	Пример 51	Белое твердое вещество	218 мг, 91%
F238		Метил-3,5-дихлор-6-(2-хлор-4-(1-цианоциклопропил)фенил)пиколинат	Пример 51	Желтое масло	221 мг, 88%
F239		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-6-этинил-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 67	Коричневое масло	35 мг, 50%

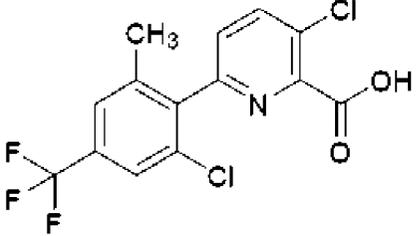
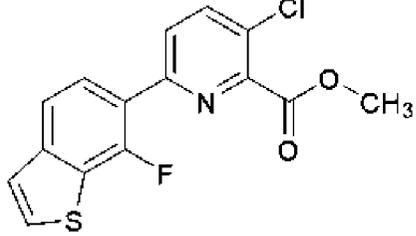
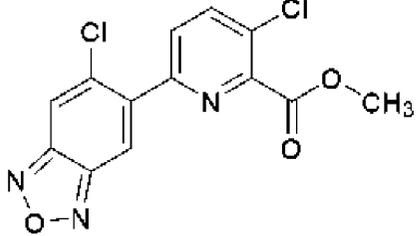
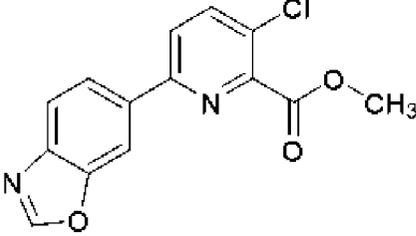
F240		Метил-3-хлор-5-фтор-6-(2,2,7-трифторбензо[<i>d</i>][1,3]диоксол-5-ил)пиколинат	Пример 51	Белое твердое вещество	125 мг, 24%
F241		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-5-фтор-4-(трифторметил)фенил)-5-фторпиколинат	Пример 51	Белое твердое вещество	84 мг, 21%
F242		Метил-3-хлор-6-(2,2-дифторбензо[<i>d</i>][1,3]диоксол-4-ил)пиколинат	Пример 51	Белое твердое вещество	202 мг, 89%
F243		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-5-фтор-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 51	Коричневое твердое вещество	34 мг, 9%

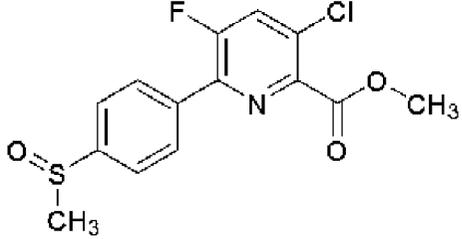
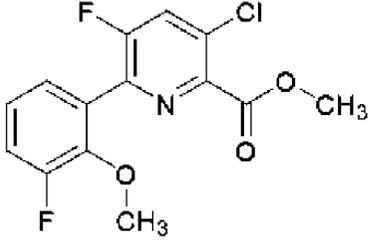
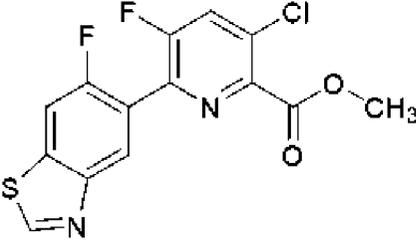
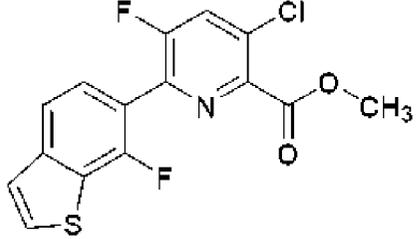
F244		Метил-3-хлор-6-(2,2-дифтор-6-(метоксикарбонил)бензо[<i>d</i>][1,3]диоксол-4-ил)-5-фторпиколинат	Пример 51	Белое твердое вещество	67 мг, 26%
F245		Метил-3-хлор-6-(2,2-дифтор-6-(метоксикарбонил)бензо[<i>d</i>][1,3]диоксол-4-ил)пиколинат	Пример 51	Белое твердое вещество	234 мг, 88%
F246		Метил-3,5-дихлор-6-(2-хлор-5-фтор-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 51	Коричневое твердое вещество	69 мг, 17%
F247		Метил-6-(4-аминофенил)-3-хлор-5-фторпиколинат	Пример 63	Желтое твердое вещество	376 мг, 49%

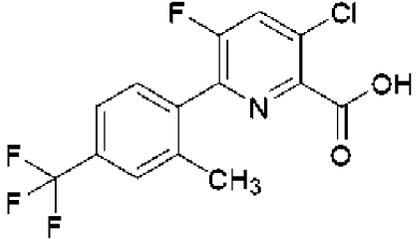
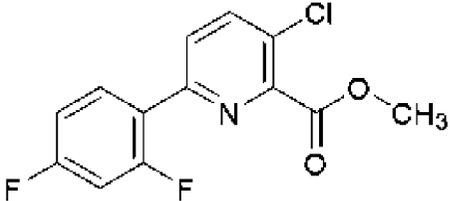
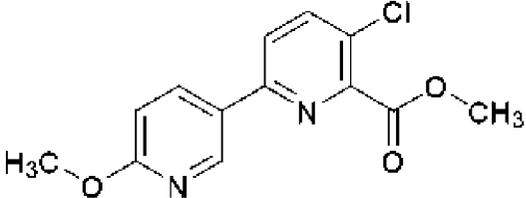
F248		Метил-3-хлор-5-фтор-6-(4-(метилтио)фенил)пиколонат	Пример 63	Белое твердое вещество	297 мг, 69%
F249		Метил-3-хлор-5-фтор-6-(<i>n</i> -толил)пиколинат	Пример 63	Белое твердое вещество	226 мг, 58%
F250		Метил-6-хлор-6-(2-хлор-3-метил-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 41	Желтое масло	195 мг, 27%
F251		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-5-этинил-4-(трифторметил)фенил)-5-ил)пиколинат	Пример 6	Коричневое масло	57 мг, 16%

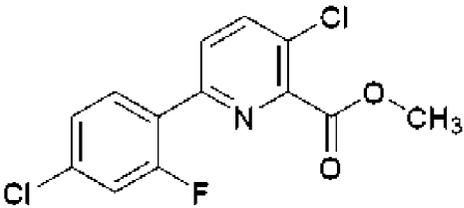
F252		6-(2-Хлор-4-(трифторметил)фенил)-3-нитропиколиновая кислота	Пример 27	Белое твердое вещество	50 мг, 22%
F253		Метил-3-хлор-6-(4-(дифторметил)-3-фтор-2-метоксифенил)-5-фторпиколинат	Пример 64 с применением F357	Белое твердое вещество	271 мг, 93%
F254		3-Хлор-6-(2-хлор-5-фтор-4-(трифторметил)фенил)-5-фторпиколиновая кислота	Пример 27	Белое твердое вещество	48 мг, 59%

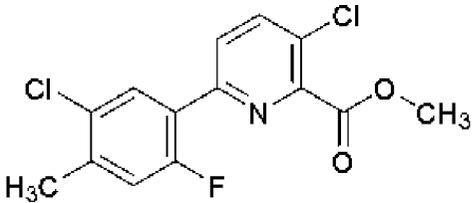
F255		3-Хлор-6-(2,2-дифторбензо[<i>d</i>][1,3]диоксол-4-ил)пиколиновая кислота	Пример 27	Белое твердое вещество	127 мг, 66%
F256		Метил-3-хлор-6-(2,2-дифторбензо[<i>d</i>][1,3]диоксол-4-ил)-5-фторпиколинат	Пример 51	Белое твердое вещество	137 мг, 62%
F257		Метил-6-(5-бром-2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-3,5-дихлорпиколинат	Пример 51	Белое твердое вещество	69 мг, 25%
F258		Метил-3-хлор-6-(2,2-дифторбензо[<i>d</i>][1,3]диоксол-5-ил)-5-фторпиколинат	Пример 51	Белое твердое вещество	95 мг, 43%

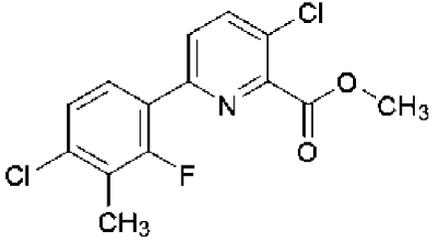
F259		3-Хлор-6-(2-хлор-6-метил-4-(трифторметил)фенил)пиколиновая кислота	Пример 27	Прозрачное масло	125 мг, 93%
F260		Метил-3-хлор-6-(7-фторбензо[<i>b</i>]тиофен-6-ил)пиколинат	Пример 51	Белое твердое вещество	95 мг, 71%
F261		Метил-3-хлор-6-(6-хлорбензо[<i>c</i>][1,2,5]оксадиазол-5-ил)пиколинат	Пример 41 с применением исходных материалов, описанных в US 20140274702	Белое твердое вещество	27 мг, 15%
F262		Метил-6-(бензо[<i>d</i>]оксазол-6-ил)-3-хлорпиколинат	Пример 51	Белое твердое вещество	29 мг, 24%

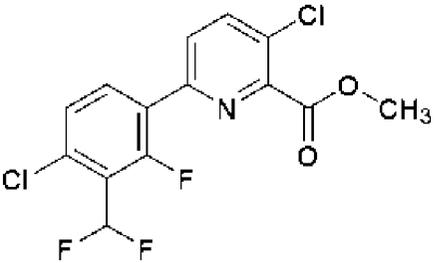
F263		Метил-3-хлор-5-фтор-6-(4-(метилсульфинил)фенил)пиколинат	Пример 63	Вязкое желтое масло	251 мг, 55%
F264		Метил-3-хлор-5-фтор-6-(3-фтор-2-метоксифенил)пиколинат	Пример 63	Белое твердое вещество	295 мг, 49%
F265		Метил-3-хлор-5-фтор-6-(6-фторбензо[<i>d</i>]тиазол-5-ил)пиколинат	Пример 51	Белое твердое вещество	79 мг, 33%
F266		Метил-3-хлор-5-фтор-6-(7-фторбензо[<i>b</i>]тиофен-6-ил)пиколинат	Пример 51	Белое твердое вещество	35 мг, 19%

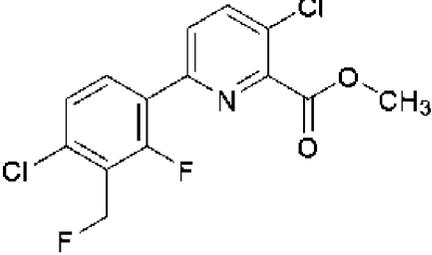
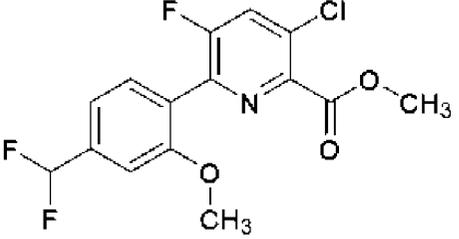
F267		3-Хлор-5-фтор-6-(2-метил-4-(трифторметил)фенил)пиколиновая кислота	Пример 50	Грязно-белое твердое вещество	78 мг, 34%
F268		Метил-3-хлор-6-(2,4-дифторфенил)пиколонат	Пример 19 с применением исходных материалов, описанных в WO 2003011853, и трет-бутилнитрита и DMF в качестве растворителя, как описано в <i>J. Org. Chem.</i> 1977, 42, 3494	Белое твердое вещество	34 мг, 46%
F269		Метил-5-хлор-6'-метокси-[2,3'-бипиридин]-6-карбоксилат	Пример 41	Белое твердое вещество	41 мг, 55%

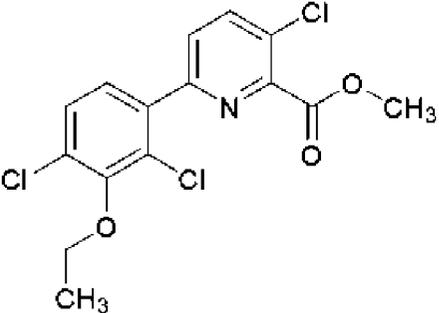
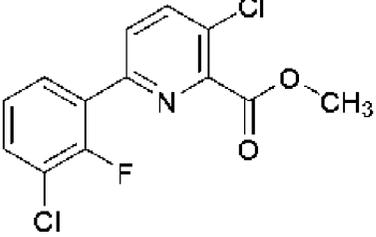
F270		Метил-3-хлор-6-(4-хлор-2-фторфенил)пиколинат	Пример 19 с применением исходных материалов, описанных в WO 2003011853, и <i>трет</i> -бутилнитрита и DMF в качестве растворителя, как описано в <i>J. Org. Chem.</i> 1977 , <i>42</i> , 3494	Белое твердое вещество	42 мг, 56%
------	---	--	--	------------------------	------------

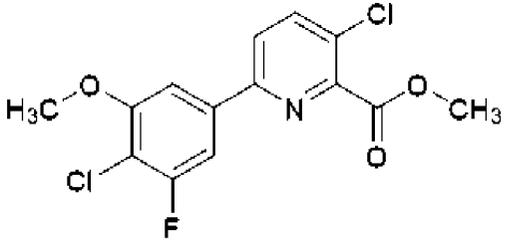
F271	 <p>The chemical structure shows a central pyridine ring. At the 3-position of the pyridine ring, there is a chlorine atom (Cl). At the 6-position, there is a phenyl ring. This phenyl ring is substituted with a chlorine atom (Cl) at the 5-position, a fluorine atom (F) at the 2-position, and a methyl group (H₃C) at the 4-position. At the 4-position of the pyridine ring, there is a methyl ester group (-COOCH₃).</p>	Метил-3-хлор-6-(5-хлор-2-фтор-4-метилфенил)пиколинат	Пример 19 с применением исходных материалов, описанных в WO 2003011853, и <i>трет</i> -бутилнитрита и DMF в качестве растворителя, как описано в <i>J. Org. Chem.</i> 1977 , <i>42</i> , 3494	Белое твердое вещество	38 мг, 51%
------	---	--	--	------------------------	------------

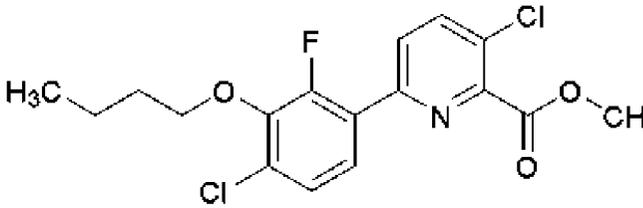
F272	 <chem>COC(=O)c1cc(Cl)nc1-c2cc(Cl)c(F)c(C)c2</chem>	Метил-3-хлор-6-(4-хлор-2-фтор-3-метилфенил)пиколинат	Пример 19 с применением исходных материалов, описанных в WO 2007082098, и <i>трет</i> -бутилнитрита и DMF в качестве растворителя, как описано в <i>J. Org. Chem.</i> 1977 , <i>42</i> , 3494	Белое твердое вещество	41 мг, 54%
------	--	--	--	------------------------	------------

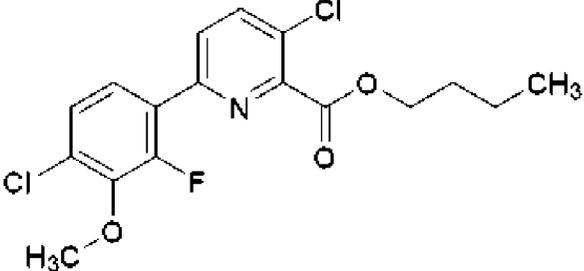
F273		Метил-3-хлор-6-(4-хлор-3-(дифторметил)-2-фторфенил)пиколинат	Пример 19 с применением исходных материалов, описанных в WO 2007082098, и <i>трет</i> -бутилнитрита и DMF в качестве растворителя, как описано в <i>J. Org. Chem.</i> 1977 , <i>42</i> , 3494	Белое твердое вещество	44 мг, 58%
------	---	--	--	------------------------	------------

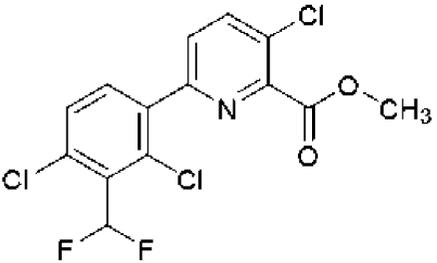
F274		Метил-3-хлор-6-(4-хлор-2-фтор-3-(фторметил)фенил)пиколонат	Пример 19 с применением исходных материалов, описанных в US 7314849, и <i>tert</i> -бутилнитрита и DMF в качестве растворителя, как описано в <i>J. Org. Chem.</i> 1977 , <i>42</i> , 3494	Белое твердое вещество	42 мг, 55%
F275		Метил-3-хлор-6-(4-(дифторметил)-2-метоксифенил)-5-фторпиколонат	Пример 64	Белое твердое вещество	179 мг, 54%

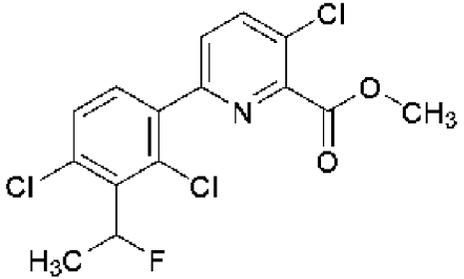
F276	 <p>The structure shows a picolinic acid derivative with a methyl ester group at the 3-position and a 2,4-dichloro-3-ethoxyphenyl group at the 6-position. The pyridine ring has a chlorine atom at the 4-position.</p>	<p>Метил-3-хлор-6-(2,4-дихлор-3-этоксифенил)пиколина т</p>	<p>Пример 19 с применением исходных материалов, описанных в WO 2007082098, и <i>трет</i>-бутилнитрита и DMF в качестве растворителя, как описано в <i>J. Org. Chem.</i> 1977, <i>42</i>, 3494</p>	<p>Белое твердое вещество</p>	<p>37 мг, 49%</p>
F277	 <p>The structure shows a picolinic acid derivative with a methyl ester group at the 3-position and a 3-chloro-2-fluorophenyl group at the 6-position. The pyridine ring has a chlorine atom at the 4-position.</p>	<p>Метил-3-хлор-6-(3-хлор-2-фторфенил)пиколинат</p>	<p>Пример 41</p>	<p>Белое твердое вещество</p>	<p>39 мг, 52%</p>

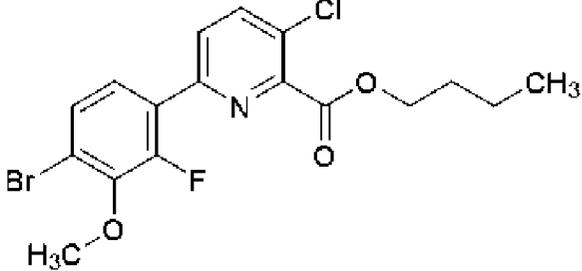
F278	 <chem>COC(=O)c1cc(Cl)ccc1-c1ccc(F)c(Cl)c1OC</chem>	Метил-3-хлор-6-(4-хлор-3-фтор-5-метоксифенил)пиколинат	Пример 19 с применением исходных материалов, описанных в WO 2012080187, и <i>трет</i> -бутилнитрита и DMF в качестве растворителя, как описано в <i>J. Org. Chem.</i> 1977 , <i>42</i> , 3494	Белое твердое вещество	36 мг, 47%
------	---	--	--	------------------------	------------

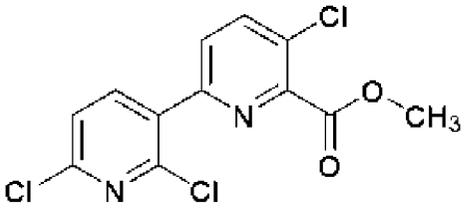
F279	 <chem>CCCCOC1=CC=C(C=C1C2=CC=CC=C2)C3=CC=CC=N3C(=O)OC</chem>	Метил-6-(3-бутокси-4-хлор-2-фторфенил)-3-хлорпиколинат	Пример 19 с применением исходных материалов, описанных в WO 2007082098, и <i>трет</i> -бутилнитрита и DMF в качестве растворителя, как описано в <i>J. Org. Chem.</i> 1977 , <i>42</i> , 3494	Белое твердое вещество	29 мг, 38%
------	--	--	--	------------------------	------------

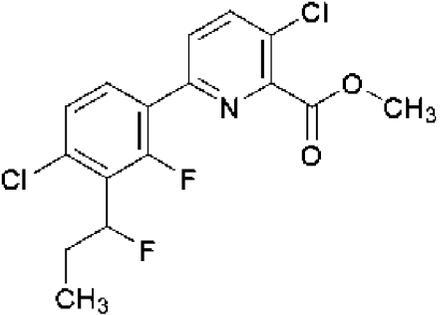
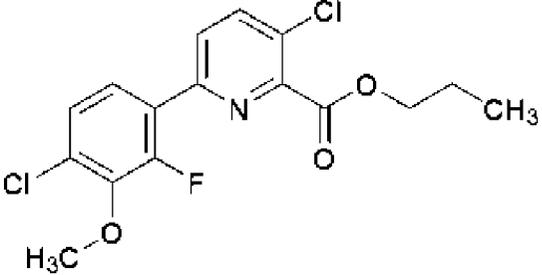
F280	 <chem>CCCCOC(=O)c1cc(Cl)nc(c1)c2cc(Cl)c(OC)c(F)c2</chem>	Бутил-3-хлор-6-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифенил)пиколинат	Пример 19 с применением исходных материалов, описанных в WO 2009029518, и <i>трет</i> -бутилнитрита и DMF в качестве растворителя, как описано в <i>J. Org. Chem.</i> 1977 , <i>42</i> , 3494	Белое твердое вещество	44 мг, 58%
------	---	--	--	------------------------	------------

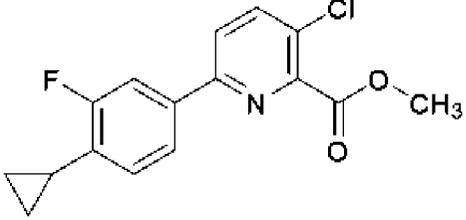
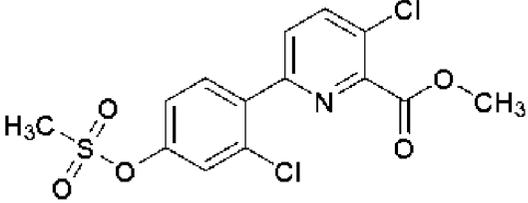
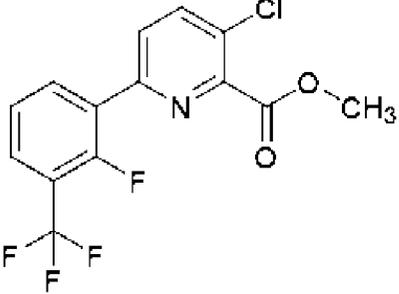
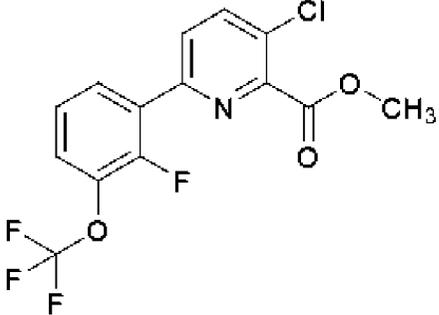
F281		Метил-3-хлор-6-(2,4-дихлор-3-(дифторметил)фенил)пиколинат	Пример 19 с применением исходных материалов, описанных в WO 2007082098, и <i>трет</i> -бутилнитрита и DMF в качестве растворителя, как описано в <i>J. Org. Chem.</i> 1977 , <i>42</i> , 3494	Белое твердое вещество	27 мг, 35%
------	---	---	--	------------------------	------------

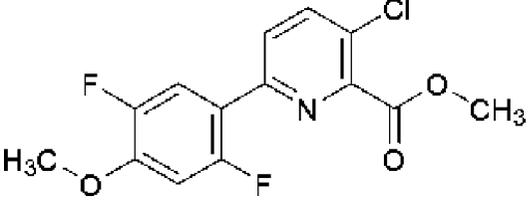
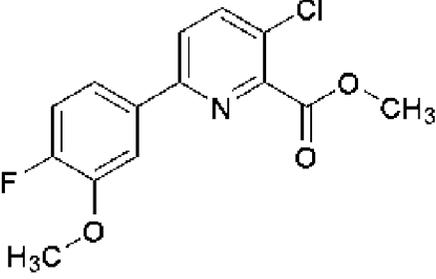
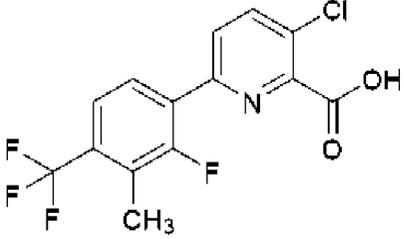
F282	 <chem>COC(=O)c1cc(Cl)nc1C2=CC=C(C=C2)C(F)C</chem>	Метил-3-хлор-6-(2,4-дихлор-3-(1-фторэтил)фенил)пиколонат	Пример 19 с применением исходных материалов, описанных в WO 2007082098, и <i>трет</i> -бутилнитрита и DMF в качестве растворителя, как описано в <i>J. Org. Chem.</i> 1977 , <i>42</i> , 3494	Белое твердое вещество	40 мг, 53%
------	---	--	--	------------------------	------------

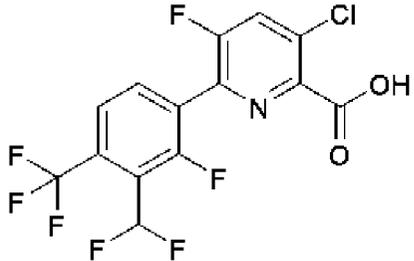
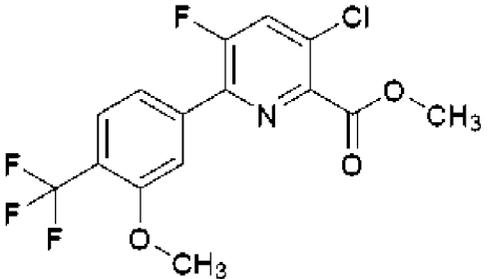
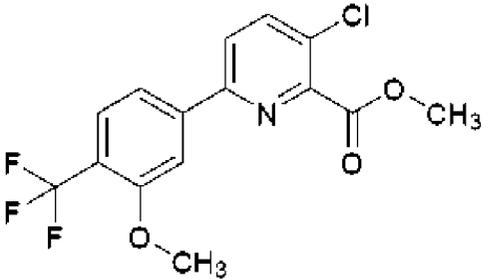
F283	 <chem>CCCCOC(=O)c1cc(Cl)nc(c1)c2cc(F)c(OC)c(Br)c2</chem>	Бутил-6-(4-бром-2-фтор-3-метоксифенил)-3-хлорпиколинат	Пример 19 с применением исходных материалов, описанных в WO 2007082098, и <i>трет</i> -бутилнитрита и DMF в качестве растворителя, как описано в <i>J. Org. Chem.</i> 1977 , <i>42</i> , 3494	Белое твердое вещество	38 мг, 49%
------	--	--	--	------------------------	------------

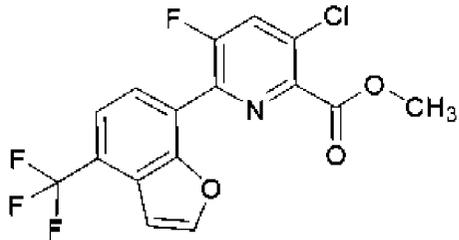
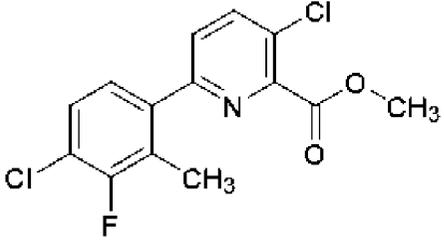
F284		Метил-2',5,6'-трихлор- [2,3'-бипиридин]-6- карбоксилат	Пример 19 с применением исходных материалов, описанных в US 20140274703, и <i>трет</i> -бутилнитрита и DMF в качестве растворителя, как описано в <i>J. Org. Chem.</i> 1977 , <i>42</i> , 3494	Белое твердое вещество	28 мг, 37%
------	---	--	--	---------------------------	------------

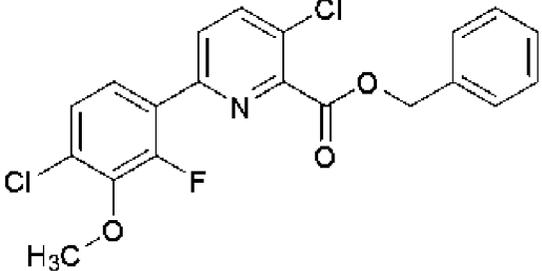
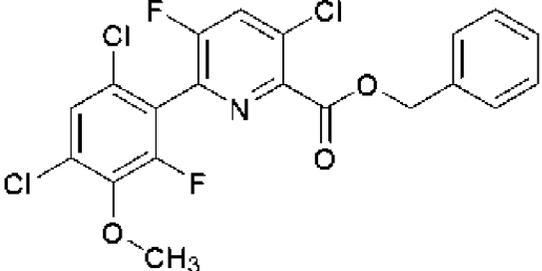
F285		Метил-3-хлор-6-(4-хлор-2-фтор-3-(1-фторпропил)фенил)пиколонат	Пример 19 с применением исходных материалов, описанных в WO 2007082098, и <i>трет</i> -бутилнитрита и DMF в качестве растворителя, как описано в <i>J. Org. Chem.</i> 1977, 42, 3494	Белое твердое вещество	42 мг, 55%
F286		Пропил-3-хлор-6-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифенил)пиколинат	Пример 19 с применением <i>трет</i> -бутилнитрита и DMF в качестве растворителя, как описано в <i>J. Org. Chem.</i> 1977, 42, 3494	Белое твердое вещество	42 мг, 55%

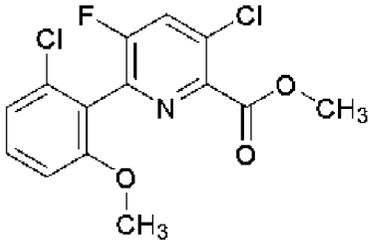
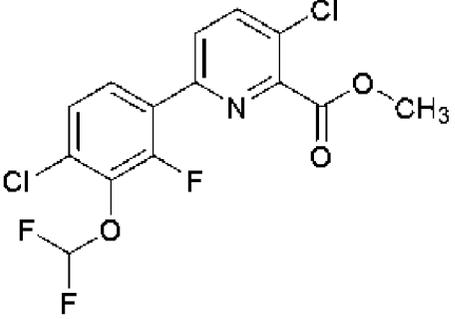
F287		Метил-3-хлор-6-(4-циклопропил-3-фторфенил)пиколинат	Пример 41	Белое твердое вещество	39 мг, 52%
F288		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-((метилсульфонил)окси)фенил)пиколинат	Пример 70	Белое твердое вещество	293 мг, 90%
F289		Метил-3-хлор-6-(2-фтор-3-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 41	Белое твердое вещество	40 мг, 53%
F290		Метил-3-хлор-6-(2-фтор-3-(трифторметокси)фенил)пиколинат	Пример 41	Белое твердое вещество	43 мг, 56%

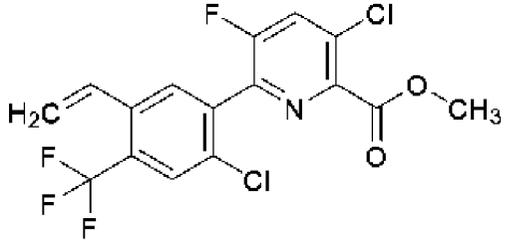
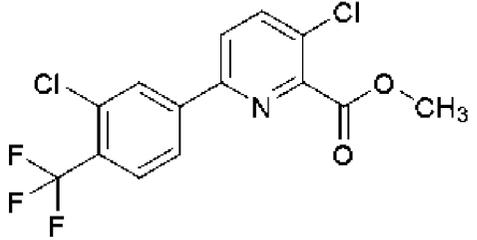
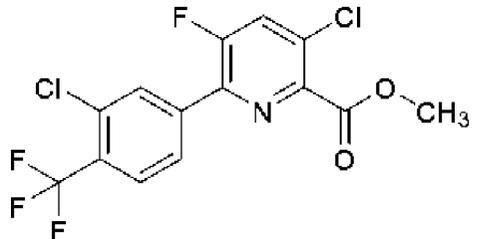
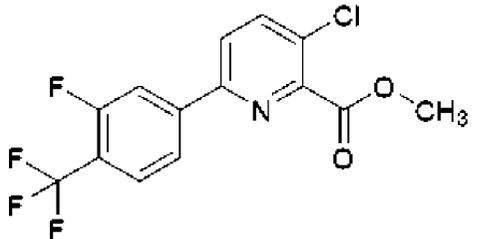
F291		Метил-3-хлор-6-(2,5-дифтор-4-метоксифенил)пиколинат	Пример 41	Белое твердое вещество	37 мг, 49%
F292		Метил-3-хлор-6-(4-фтор-3-метоксифенил)пиколинат	Пример 41	Белое твердое вещество	34 мг, 45%
F293		3-Хлор-6-(2-фтор-3-метил-4-(трифторметил)фенил)пиколиновая кислота	Пример 19 с применением <i>tert</i> -бутилнитрита и DMF после гидролиза промежуточного соединения метилового сложного эфира C22 (пример 27)	Белое твердое вещество	28 мг, 37%

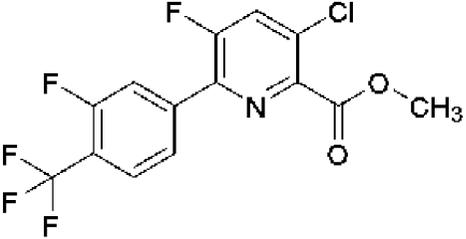
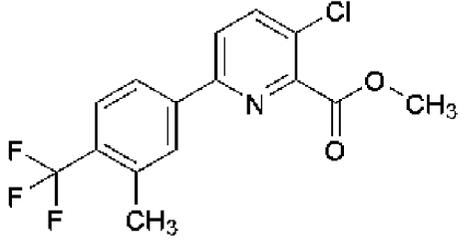
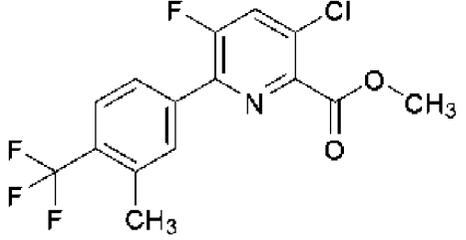
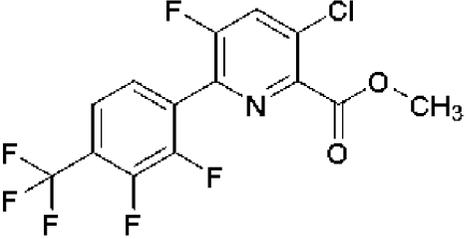
F294		<p>3-Хлор-6-(3-(дифторметил)-2-фтор-4-(трифторметил)фенил)-5-фторпиколиновая кислота</p>	<p>Пример 19 с применением соединения C25, <i>трет</i>-бутилнитрита и DMF в качестве растворителя, как описано в <i>J. Org. Chem.</i> 1977, <i>42</i>, 3494</p>	<p>Белое твердое вещество</p>	<p>12 мг, 16%</p>
F295		<p>Метил-3-хлор-5-фтор-6-(3-метокси-4-(трифторметил)фенил)пиколинат</p>	<p>Пример 41</p>	<p>Белое твердое вещество</p>	<p>40 мг, 53%</p>
F296		<p>Метил-3-хлор-6-(3-метокси-4-(трифторметил)фенил)пиколинат</p>	<p>Пример 41</p>	<p>Белое твердое вещество</p>	<p>42 мг, 55%</p>

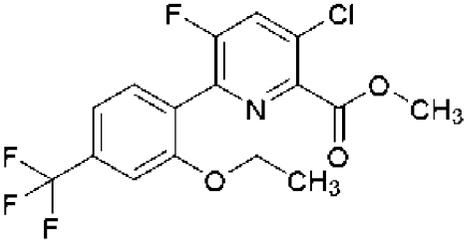
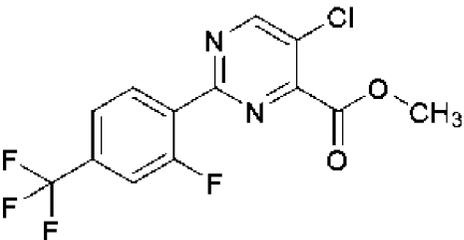
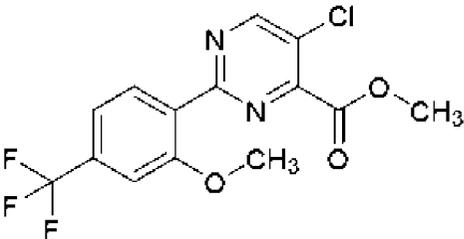
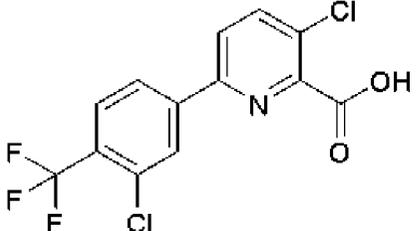
F297		<p>Метил-3-хлор-5-фтор-6-(4-(трифторметил)бензофуран-7-ил)пиколинат</p>	<p>Пример 19 с применением соединения C23, <i>трет</i>-бутилнитрита и DMF в качестве растворителя, как описано в <i>J. Org. Chem.</i> 1977, <i>42</i>, 349</p>	<p>Белое твердое вещество</p>	<p>17 мг, 22%</p>
F298		<p>Метил-3-хлор-6-(4-хлор-3-фтор-2-метилфенил)пиколинат</p>	<p>Пример 19 с применением исходных материалов, описанных в US 20140274703, и <i>трет</i>-бутилнитрита и DMF в качестве растворителя, как описано в <i>J. Org. Chem.</i> 1977, <i>42</i>, 3494</p>	<p>Белое твердое вещество</p>	<p>46 мг, 62%</p>

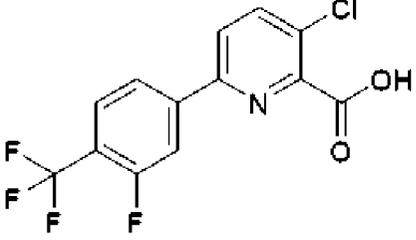
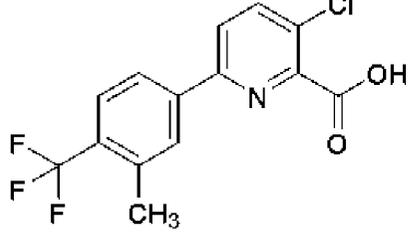
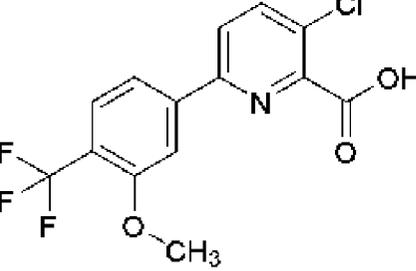
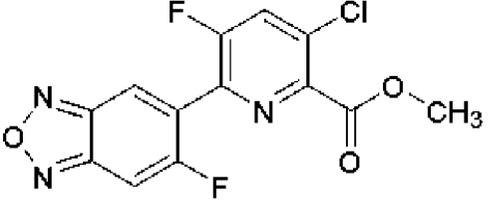
F299		<p>Бензил-3-хлор-6-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифенил)пиколинат</p>	<p>Пример 19 с применением исходных материалов, описанных в US 20120190551, и <i>трет</i>-бутилнитрита и DMF в качестве растворителя, как описано в <i>J. Org. Chem.</i> 1977, <i>42</i>, 3494</p>	<p>Белое твердое вещество</p>	<p>44 мг, 57%</p>
F300		<p>Бензил-3-хлор-6-(4,6-дихлор-2-фтор-3-метоксифенил)-5-фторпиколинат</p>	<p>Пример 19 с применением <i>трет</i>-бутилнитрита и DMF в качестве растворителя, как описано в <i>J. Org. Chem.</i> 1977, <i>42</i>, 3494</p>	<p>Белое твердое вещество</p>	

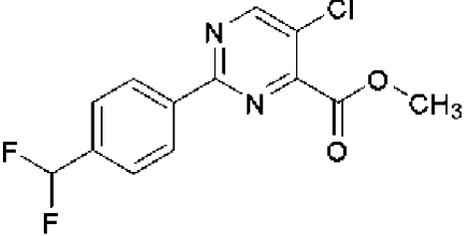
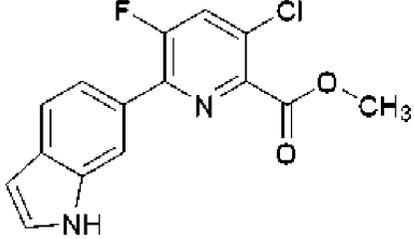
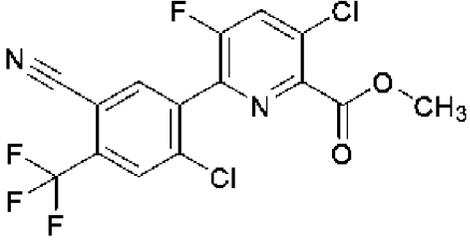
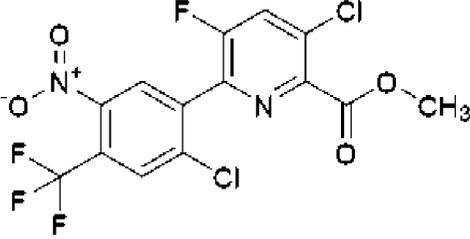
F301		<p>Метил-3-хлор-6-(2-хлор-6-метоксифенил)-5-фторпиколинат</p>	<p>Пример 19 с применением соединения C24, <i>трет</i>-бутилнитрита и DMF в качестве растворителя, как описано в <i>J. Org. Chem.</i> 1977, <i>42</i>, 3494</p>	<p>Белое твердое вещество</p>	<p>20 мг, 27%</p>
F302		<p>Метил-3-хлор-6-(4-хлор-3-(дифторметокси)-2-фторфенил)пиколинат</p>	<p>Пример 19 с применением исходных материалов, описанных в WO 2007082098, и <i>трет</i>-бутилнитрита и DMF в качестве растворителя, как описано в <i>J. Org. Chem.</i> 1977, <i>42</i>, 3494</p>	<p>Белое твердое вещество</p>	<p>1,9 мг, 2,6%</p>

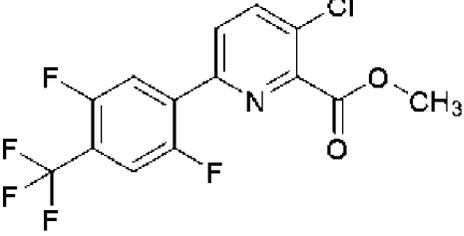
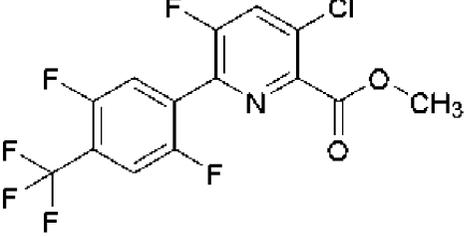
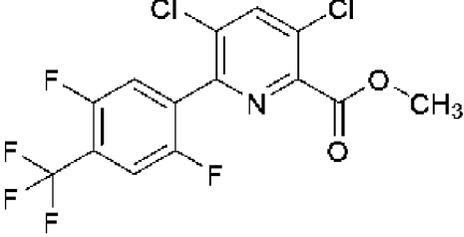
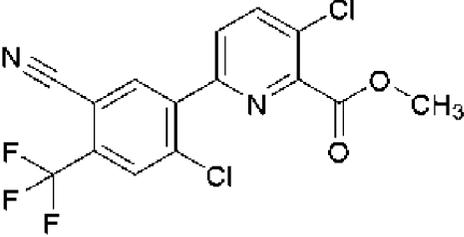
F303		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)-5-винилфенил)-5-фторпиколинат	Пример 41	Белое твердое вещество	35 мг, 7,9%
F304		Метил-3-хлор-6-(3-хлор-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 32	Белое твердое вещество	267 мг, 76%
F305		Метил-3-хлор-6-(3-хлор-4-(трифторметил)фенил)-5-фторпиколинат	Пример 32	Белое твердое вещество	233 мг, 63%
F306		Метил-3-хлор-6-(3-фтор-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 32	Вязкое прозрачное масло	304 мг, 91%

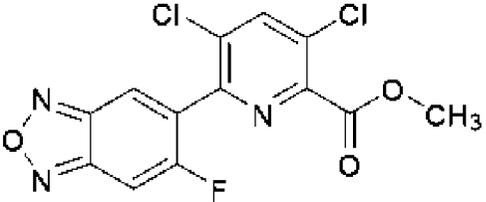
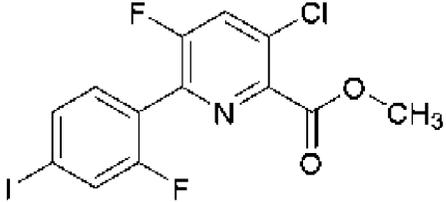
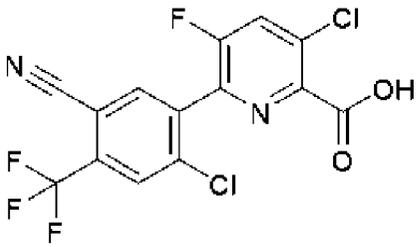
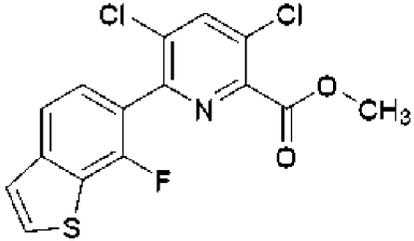
F307		Метил-3-хлор-5-фтор-6-(3-фтор-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 32	Белое твердое вещество	242 мг, 69%
F308		Метил-3-хлор-6-(3-метил-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 32	Белое твердое вещество	188 мг, 57%
F309		Метил-3-хлор-5-фтор-6-(3-метил-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 32	Вязкое прозрачное масло	225 мг, 65%
F310		Метил-3-хлор-6-(2,3-дифтор-4-(трифторметил)фенил)-5-фторпиколинат	Пример 63	Белое твердое вещество	275 мг, 40%

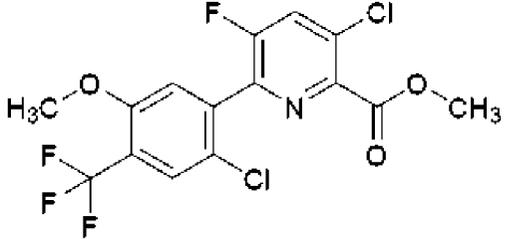
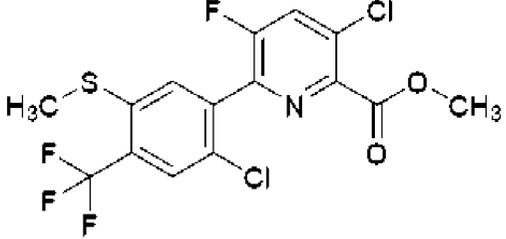
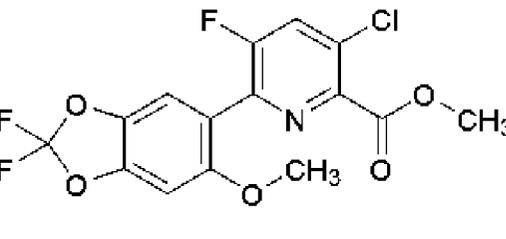
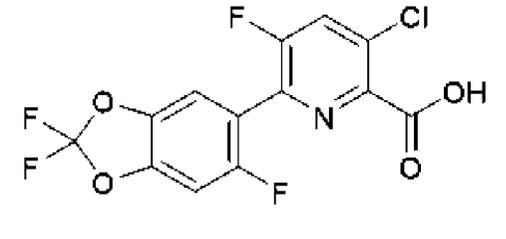
F311		Метил-3-хлор-6-(2-этокси-4-(трифторметил)фенил)-5-фторпиколинат	Пример 63	Белое твердое вещество	435 мг, 62%
F312		Метил-5-хлор-2-(2-фтор-4-(трифторметил)фенил)пиримидин-4-карбоксилат	Пример 63	Оранжевое масло	130 мг, 20%
F313		Метил-5-хлор-2-(2-метокси-4-(трифторметил)фенил)пиримидин-4-карбоксилат	Пример 53	Белое твердое вещество	255 мг, 37%
F314		3-Хлор-6-(3-хлор-4-(трифторметил)фенил)пиколиновая кислота	Пример 27	Белое твердое вещество	90 мг, 94%

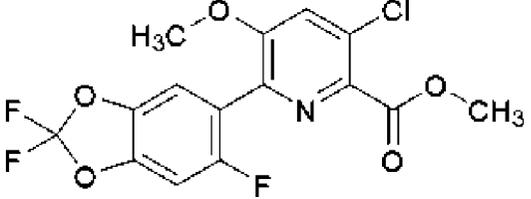
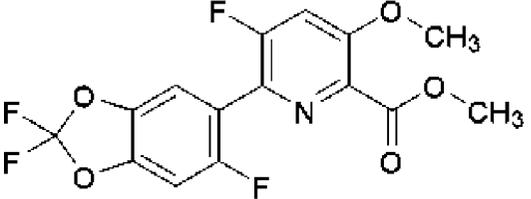
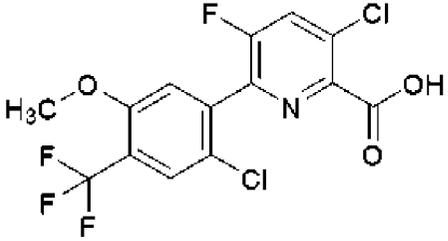
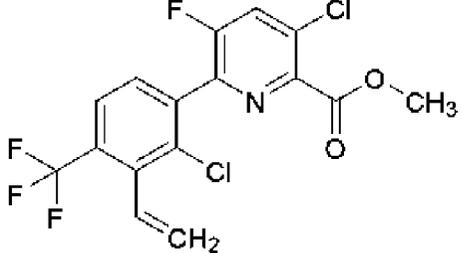
F315		3-Хлор-6-(3-фтор-4-(трифторметил)фенил)пиколиновая кислота	Пример 27	Белое твердое вещество	95 мг, 99%
F316		3-Хлор-6-(3-метил-4-(трифторметил)фенил)пиколиновая кислота	Пример 27	Белое твердое вещество	93 мг, 97%
F317		3-Хлор-6-(3-метокси-4-(трифторметил)фенил)пиколиновая кислота	Пример 27	Белое твердое вещество	90 мг, 94%
F318		Метил-3-хлор-5-фтор-6-(6-фторбензо[с][1,2,5]оксадиазол-5-ил)пиколинат	Пример 41	Белое твердое вещество	164 мг, 46%

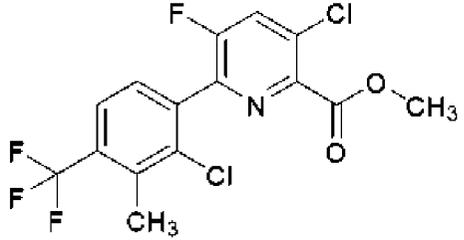
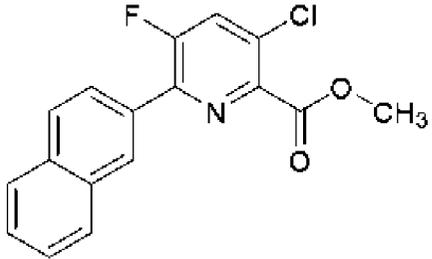
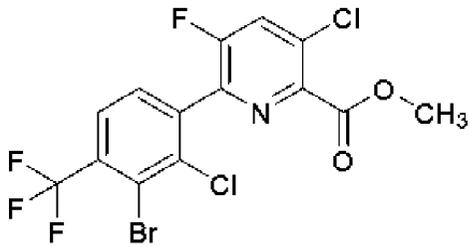
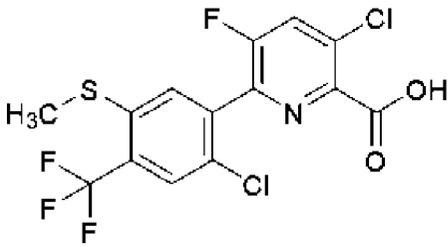
F319		Метил-5-хлор-2-(4-(дифторметил)фенил)пиримидин-4-карбоксилат	Пример 53	Белое твердое вещество	211 мг, 36%
F320		Метил-3-хлор-5-фтор-6-(1 <i>H</i> -индол-6-ил)пиколинат	Пример 63	Грязно-белое твердое вещество	33 мг, 7,6%
F321		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-5-циано-4-(трифторметил)фенил)-5-фторпиколинат	Пример 41	Белое твердое вещество	72 мг, 40%
F322		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-5-нитро-4-(трифторметил)фенил)-5-фторпиколинат	Пример 51	Белое твердое вещество	36 мг, 6,1%

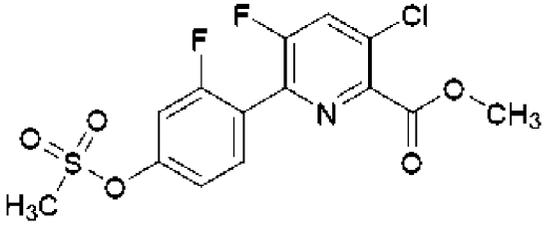
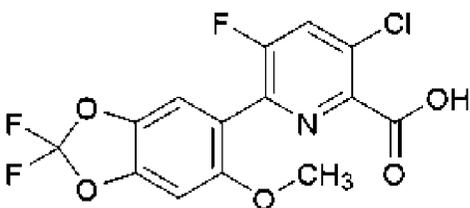
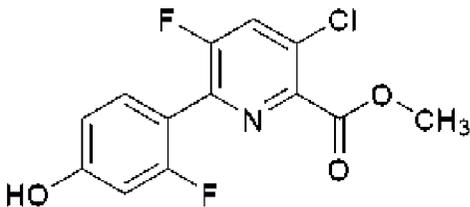
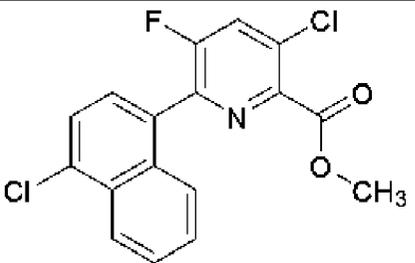
F323		Метил-3-хлор-6-(2,5-дифтор-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 51	Масло янтарного цвета	57 мг, 28%
F324		Метил-3-хлор-6-(2,5-дифтор-4-(трифторметил)фенил)-5-фторпиколинат	Пример 51	Твердое вещество янтарного цвета	101 мг, 43%
F325		Метил-3,5-дихлор-6-(2,5-дифтор-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 51	Белое твердое вещество	62 мг, 26%
F326		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-5-циано-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 41	Белое твердое вещество	53 мг, 39%

F327		Метил-3,5-дихлор-6-(6-фторбензо[с][1,2,5]оксадиазол-5-ил)пиколинат	Пример 41	Белое твердое вещество	25 мг, 7,3%
F328		Метил-3-хлор-5-фтор-6-(2-фтор-4-йодфенил)пиколинат	Пример 71	Белое твердое вещество	320 мг, 46%
F329		3-Хлор-6-(2-хлор-5-циано-4-(трифторметил)фенил)-5-фторпиколиновая кислота	Пример 27	Белое твердое вещество	38 мг, 94%
F330		Метил-3,5-дихлор-6-(7-фторбензо[б]тиофен-6-ил)пиколинат	Пример 51	Белое твердое вещество	46 мг, 31%

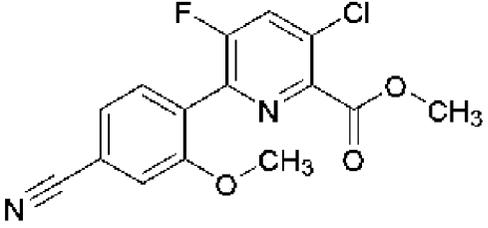
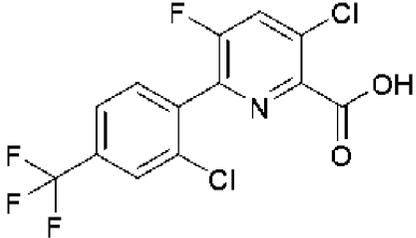
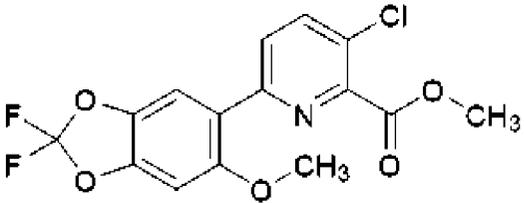
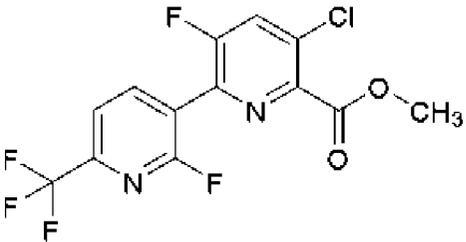
F331		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-5-метокси-4-(трифторметил)фенил)-5-фторпиколинат	Пример 41	Белое твердое вещество	46 мг, 29%
F332		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-5-(метилтио)-4-(трифторметил)фенил)-5-фторпиколинат	Пример 41	Белое твердое вещество	25 мг, 22%
F333		Метил-3-хлор-6-(2,2-дифтор-6-метоксибензо[<i>d</i>][1,3]диоксол-5-ил)-5-фторпиколинат	Пример 41	Белое твердое вещество	20 мг, 37%
F334		3-Хлор-5-фтор-6-(2,2,6-трифторбензо[<i>d</i>][1,3]диоксол-5-ил)пиколиновая кислота	Пример 27	Белое твердое вещество	66 мг, 69%

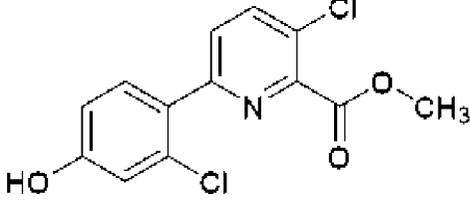
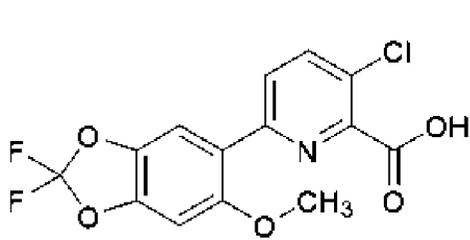
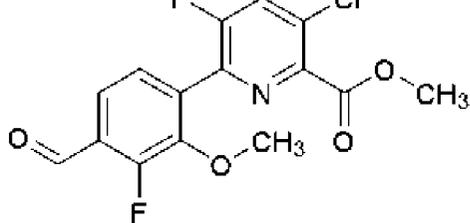
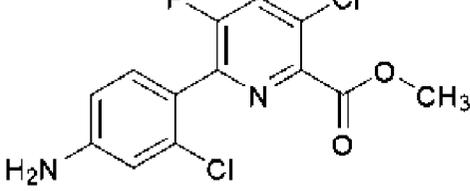
F335		Метил-3-хлор-5-метокси-6-(2,2,6-трифторбензо[<i>d</i>][1,3]диоксол-5-ил)пиколинат	Пример 17	Белое твердое вещество	59 мг, 44%
F336		Метил-5-фтор-3-метокси-6-(2,2,6-трифторбензо[<i>d</i>][1,3]диоксол-5-ил)пиколинат	Пример 17	Белое твердое вещество	9 мг, 7%
F337		3-Хлор-6-(2-хлор-5-метокси-4-(трифторметил)фенил)-5-фторпиколиновая кислота	Пример 27	Белое твердое вещество	13 мг, 80%
F338		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)-3-винилфенил)-5-фторпиколинат	Пример 58	Белое твердое вещество	55 мг, 25%

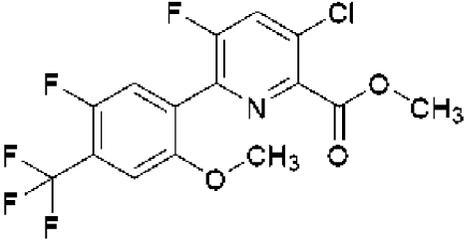
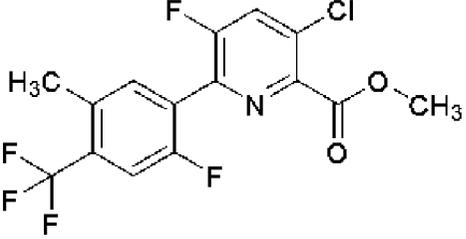
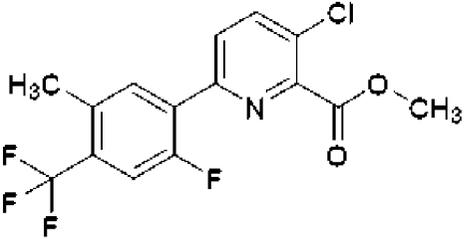
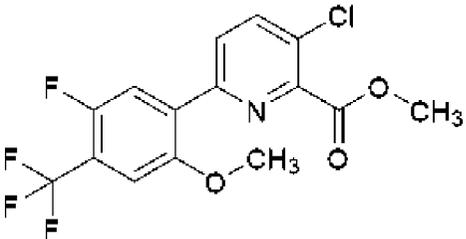
F339		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-3-метил-4-(трифторметил)фенил)-5-фторпиколинат	Пример 57	Вязкое прозрачное масло	46 мг, 22%
F340		Метил-3-хлор-5-фтор-6-(нафталин-2-ил)пиколинат	Пример 63	Белое твердое вещество	292 мг, 67%
F341		Метил-6-(3-бром-2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-3-хлор-5-фторпиколинат	Пример 32	Белое твердое вещество	722 мг, 72%
F342		3-Хлор-6-(2-хлор-5-(метилтио)-4-(трифторметил)фенил)-5-фторпиколиновая кислота	Пример 27	Белое твердое вещество	14 мг, 92%

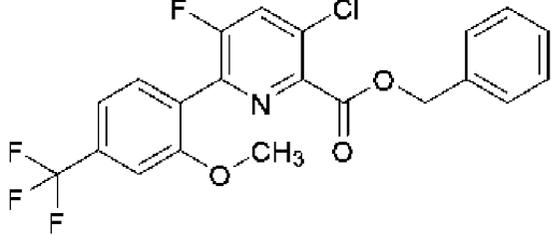
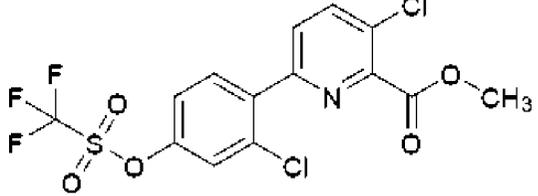
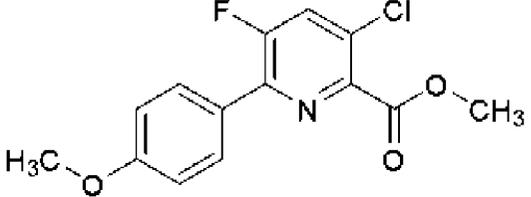
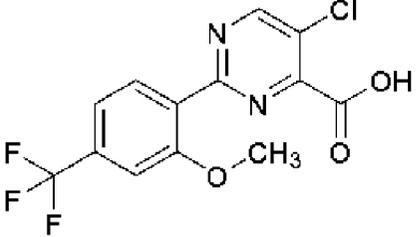
F343		Метил-3-хлор-5-фтор-6-(2-фтор-4-((метилсульфонил)окси)фенил)пиколинат	Пример 70	Белое твердое вещество	144 мг, 74%
F344		3-Хлор-6-(2,2-дифтор-6-метоксибензо[<i>d</i>][1,3]диоксол-5-ил)-5-фторпиколиновая кислота	Пример 27	Белое твердое вещество	11 мг, 99%
F345		Метил-3-хлор-5-фтор-6-(2-фтор-4-гидроксифенил)пиколинат	Пример 63	Грязно-белое твердое вещество	227 мг, 22%
F346		Метил-3-хлор-6-(4-хлорнафталин-1-ил)-5-фторпиколинат	Пример 63	Грязно-белое твердое вещество	128 мг, 27%

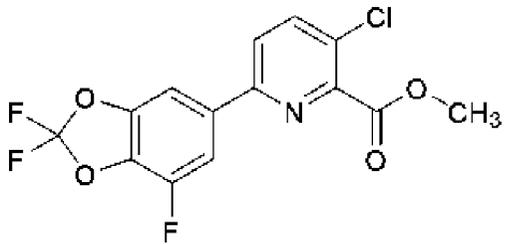
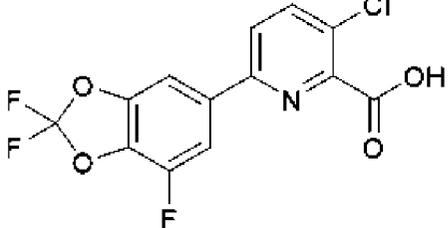
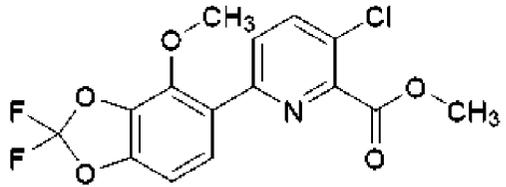
F347		5-Хлор-3-фтор-2'-метокси-6'-(трифторметил)-[2,3'-бипиридин]-6-карбоновая кислота	Пример 49	Белое твердое вещество	80 мг, 77%
F348		Метил-6-(4-амино-2-фторфенил)-3-хлор-5-фторпиколинат	Пример 63	Желтое твердое вещество	555 мг, 43%
F349		6-(5-Бром-2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-3-хлорпиколиновая кислота	Пример 27	Белое твердое вещество	13 мг, 95%
F350		3-Хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)-5-винилфенил)-5-фторпиколиновая кислота	Пример 27	Белое твердое вещество	31 мг, 86%

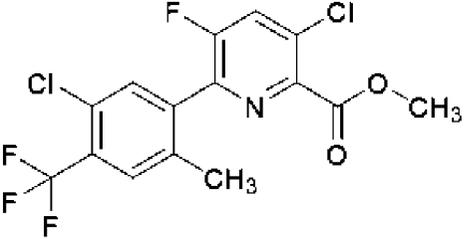
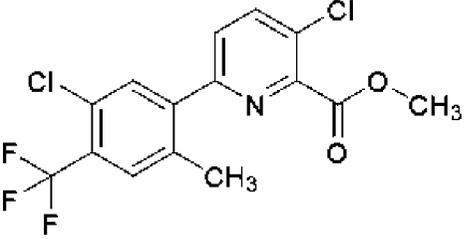
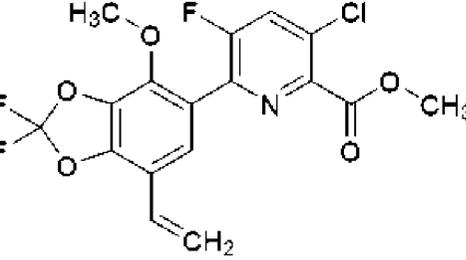
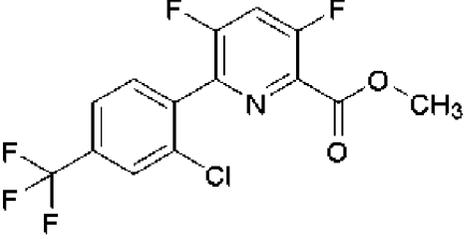
F351		Метил-3-хлор-6-(4-циано-2-метоксифенил)-5-фторпиколинат	Пример 63	Белое твердое вещество	88 мг, 12%
F352		3-Хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-5-фторпиколиновая кислота	Пример 48	Белое твердое вещество	81 мг, 84%
F353		Метил-3-хлор-6-(2,2-дифтор-6-метоксибензо[<i>d</i>][1,3]диоксол-5-ил)пиколинат	Пример 41	Желтое твердое вещество	166 мг, 57%
F354		Метил-5-хлор-2',3'-дифтор-6'-(трифторметил)-[2,3'-бипиридин]-6-карбоксилат	Пример 63	Белое твердое вещество	276 мг, 14%

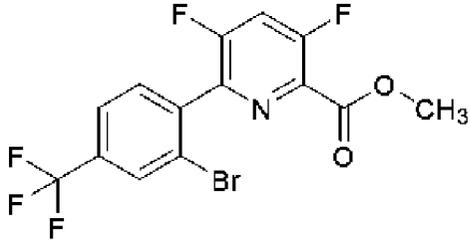
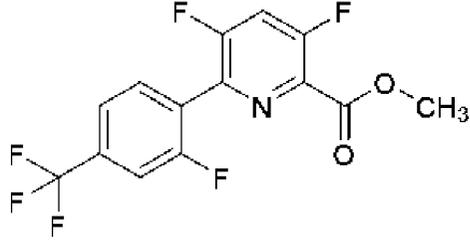
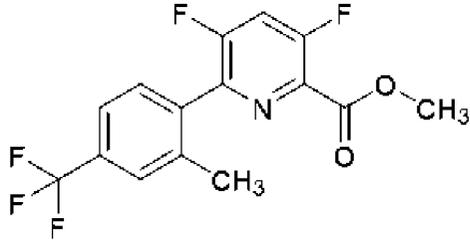
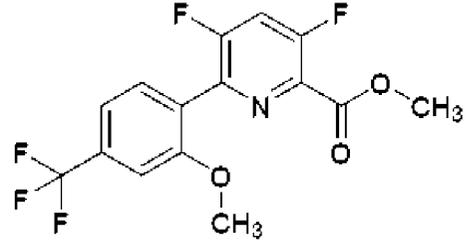
F355		Метил-3-хлор-6-(2-хлор-4-гидроксифенил)пиколинат	Пример 63	Белое твердое вещество	795 мг, 48%
F356		3-Хлор-6-(2,2-дифтор-6-метоксибензо[<i>d</i>][1,3]диоксол-5-ил)пиколиновая кислота	Пример 27	Белое твердое вещество	54 мг, 86%
F357		Метил-3-хлор-5-фтор-6-(3-фтор-4-формил-2-метоксифенил)пиколинат	Пример 63	Белое твердое вещество	314 мг, 23%
F358		Метил-6-(4-амино-2-хлорфенил)-3-хлор-5-фторпиколинат	Пример 63	Грязно-белое твердое вещество	234 мг, 18%

F359		Метил-3-хлор-5-фтор-6-(5-фтор-2-метокси-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 51	Белое твердое вещество	118 мг, 50%
F360		Метил-3-хлор-5-фтор-6-(2-фтор-5-метил-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 51	Коричневая жидкость	118 мг, 33%
361		Метил-3-хлор-6-(2-фтор-5-метил-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 51	Коричневое масло	90 мг, 26%
F362		Метил-3-хлор-6-(5-фтор-2-метокси-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 51	Белое твердое вещество	62 мг, 52%

F363		Бензил-3-хлор-5-фтор- 6-(2-метокси-4- (трифторметил)фенил)п иколинат	Пример 25	Белое твердое вещество	215 мг, 70%
F364		Метил-3-хлор-6-(2- хлор-4- (((трифторметил)сульф онил)окси)фенил)пикол инат	Пример 69	Грязно-белое твердое вещество	243 мг, 47%
F365		Метил-3-хлор-5-фтор- 6-(4- метоксифенил)пиколин ат	Пример 63	Грязно-белое твердое вещество	152 мг, 35%
F366		5-Хлор-2-(2-метокси-4- (трифторметил)фенил)п иримидин-4- карбоновая кислота	Пример 50	Белое твердое вещество	123 мг, 75%

F367		Метил-3-хлор-6-(2,2,7-трифторбензо[<i>d</i>][1,3]диоксол-5-ил)пиколинат	Пример 19 с применением исходных материалов, описанных в US 20140274701	Белое твердое вещество	64 мг, 68%
F368		3-Хлор-6-(2,2,7-трифторбензо[<i>d</i>][1,3]диоксол-5-ил)пиколиновая кислота	Пример 27	Белое твердое вещество	31 мг, 44%
F369		Метил-3-хлор-6-(2,2-дифтор-4-метоксибензо[<i>d</i>][1,3]диоксол-5-ил)пиколинат	Пример 19 с применением исходных материалов, описанных в US 20140274701	Белое твердое вещество	125 мг, 66%

F370		Метил-2-хлор-6-(5-хлор-3-метил-4-(трифторметил)фенил)-5-фторпиколинат	Пример 51	Белое твердое вещество	41 мг, 69%
F371		Метил-2-хлор-6-(5-хлор-3-метил-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 51	Белое твердое вещество	31 мг, 72%
F372		Метил-3-хлор-6-(2,2-дифтор-4-метокси-7-винилбензо[<i>d</i>][1,3]диоксол-5-ил)-5-фторпиколинат	Пример 41	Белое твердое вещество	20 мг, 41%
F373		Метил-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)-3,5-дифторпиколинат	Пример 32	Белое твердое вещество	179 мг, 64%

F374		Метил-6-(2-бром-4-(трифторметил)фенил)-3,5-дифторпиколинат	Пример 32	Белое твердое вещество	166 мг, 53%
F375		Метил-3,5-дифтор-6-(2-фтор-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 32	Белое твердое вещество	130 мг, 49%
F376		Метил-3,5-дифтор-6-(2-метил-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 32	Белое твердое вещество	94 мг, 72%
F377		Метил-3,5-дифтор-6-(2-метокси-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 32	Белое твердое вещество	245 мг, 89%

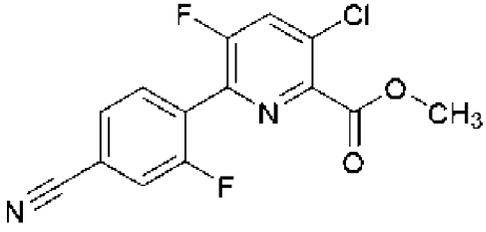
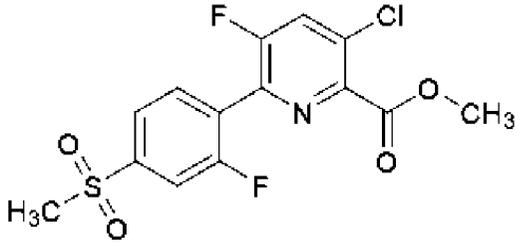
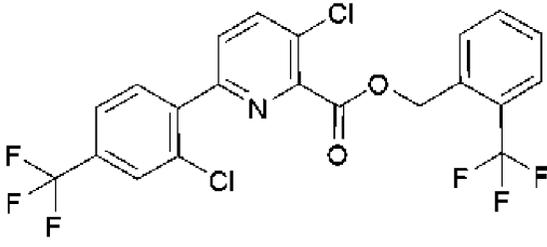
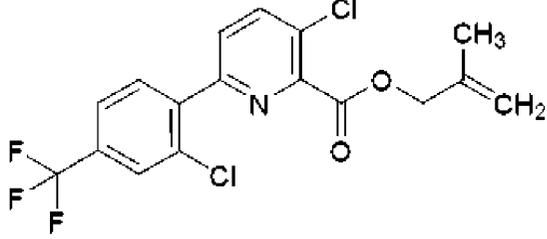
F378		Метил-3-хлор-6-(4-циано-2-фторфенил)-5-фторпиколинат	Пример 63	Белое твердое вещество	131 мг, 22%
F379		Метил-3-хлор-5-фтор-6-(2-фтор-4-(метилсульфонил)фенил)пиколинат	Пример 63	Грязно-белое твердое вещество	83 мг, 12%
F380		2-(Трифторметил)бензил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 33	Прозрачное масло	87 мг, 56%
F381		2-Метилаллил-3-хлор-6-(2-хлор-4-(трифторметил)фенил)пиколинат	Пример 33	Белое твердое вещество	35 мг, 26%

Таблица 2. Аналитические данные для соединений F

№	т. пл. (°C)	Масс-спектрометрия	ЯМР
F1		ESIMS <i>масса/заряд</i> 326 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,86 (d, J=8,5 Гц, 1H), 7,76 (d, J=8,4 Гц, 1H), 7,62 (d, J=8,0 Гц, 1H), 7,50 (d, J=1,7 Гц, 1H), 7,36 (dd, J=1,7, 8,1 Гц, 1H), 4,94 (q, J=6,5 Гц, 1H), 4,01 (s, 3H), 1,51 (d, J=6,4 Гц 3H)
F2	70-72	ESIMS <i>масса/заряд</i> 346 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 7,83 (d, J=8,8 Гц, 1H), 7,78 (d, J=8,1 Гц, 1H), 7,72 (d, J=1,8 Гц, 1H), 7,63-7,57 (m, 1H), 7,45 (d, J=8,8 Гц, 1H), 3,99 (s, 6H)
F3	101-103	ESIMS <i>масса/заряд</i> 375 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,23 (s, 1H), 7,82 (d, J=1,2 Гц, 1H), 7,69 (d, J=7,7 Гц, 1H), 7,61 (d, J=8,0 Гц, 1H), 4,03 (s, 3H)
F4	74-76	ESIMS <i>масса/заряд</i> 374 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 8,03 (s, 1H), 7,75 (d, J=1,5 Гц, 1H), 7,65-7,60 (m, 1H), 7,55 (d, J=8,1 Гц, 1H), 4,00 (s, 3H), 3,28 (s, 1H)
F5	91-93	ESIMS <i>масса/заряд</i> 364 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 7,78-7,72 (m, 2H), 7,64 (d, J=7,9 Гц, 1H), 7,47 (d, J=8,0 Гц, 1H), 3,97 (s, 3H), 2,21 (s, 3H)
F6	78-80	ESIMS <i>масса/заряд</i> 476 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 8,40 (d, J=0,7 Гц, 1H), 7,76 (s, 1H), 7,68-7,61 (m, 1H), 7,45 (d, J=7,8 Гц, 1H), 3,98 (s, 3H)
F7	148-150	ESIMS <i>масса/заряд</i> 396 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 7,75 (d, J=1,6 Гц, 1H), 7,65-7,59 (m, 2H), 7,47 (d, J=7,9 Гц, 1H), 3,97 (s, 3H), 2,47 (s, 3H)
F8	97-99	ESIMS <i>масса/заряд</i> 351 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,23 (d, J=7,8 Гц, 1H), 7,94 (q, J=8,4 Гц, 2H), 7,76 (d, J=7,8 Гц, 1H), 4,03 (s, 3H)

F9	81-83	ESIMS <i>масса/заряд</i> 384 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 8,18 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 7,97 (d, <i>J</i> =8,2 Гц, 1H), 7,85-7,74 (m, 2H), 7,66 (dd, <i>J</i> =1,4, 8,1 Гц, 1H), 4,03 (s, 3H)
F10	158-160	ESIMS <i>масса/заряд</i> 340 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 8,36 (dd, <i>J</i> =1,2, 8,2 Гц, 1H), 8,18 (dd, <i>J</i> =1,3, 8,2 Гц, 1H), 8,15-8,10 (m, 2H), 8,02 (dd, <i>J</i> =1,8, 8,4 Гц, 1H), 4,12 (s, 3H)
F11	153-155	ESIMS <i>масса/заряд</i> 375 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,33 (s, 1H), 7,87 (d, <i>J</i> =8,1 Гц, 1H), 7,83 (s, 1H), 7,73 (d, <i>J</i> =7,9 Гц, 1H), 4,12 (s, 3H)
F12	112-114	ESIMS <i>масса/заряд</i> 334 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 8,21 (t, <i>J</i> =7,9 Гц, 1H), 7,97-7,82 (m, 2H), 7,50 (dd, <i>J</i> =9,4, 28,3 Гц, 2H), 4,04 (s, 3H)
F13	150-152	ESIMS <i>масса/заряд</i> 358 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 7,86 (dd, <i>J</i> =0,8, 8,4 Гц, 1H), 7,76 (dd, <i>J</i> =0,1, 8,4 Гц, 1H), 7,61 (d, <i>J</i> =7,9 Гц, 1H), 7,34 (d, <i>J</i> =1,7 Гц, 1H), 7,25-7,14 (m, 1H), 4,01 (s, 3H), 2,77 (td, <i>J</i> =8,0, 12,2 Гц, 1H), 2,26-1,74 (m, 1H), 1,74-1,59 (m, 1H)
F14	80-82	ESIMS <i>масса/заряд</i> 328 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,87 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,77 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 7,65 (d, <i>J</i> =7,9 Гц, 1H), 7,47 (s, 1H), 7,33 (d, <i>J</i> =7,8 Гц, 1H), 5,64 (dq, <i>J</i> =6,4, 47,4 Гц, 1H), 4,01 (s, 3H), 1,64 (dd, <i>J</i> =6,4, 23,9 Гц, 3H)
F15	89-91	ESIMS <i>масса/заряд</i> 322 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 7,83 (d, <i>J</i> =8,8 Гц, 1H), 7,78-7,71 (m, 1H), 7,52 (d, <i>J</i> =8,2 Гц, 1H), 7,15 (t, <i>J</i> =1,9 Гц, 1H), 7,05 (dd, <i>J</i> =1,8, 8,0 Гц, 1H), 4,00 (s, 3H), 1,91 (m, 1H), 1,09-0,89 (m, 2H), 0,75-0,72 (m, 2H)
F16	83-85	ESIMS <i>масса/заряд</i> 340 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,07 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,95-7,86 (m, 3H), 7,74-7,66 (m, 1H), 4,02 (s, 3H), 3,25 (s, 1H)
F17	95-97	ESIMS <i>масса/заряд</i> 384 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 8,03 (d, <i>J</i> =1,7 Гц, 1H), 7,91 (dd, <i>J</i> =3,0, 8,2 Гц, 2H), 7,69 (d, <i>J</i> =8,0 Гц, 1H), 7,53 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 4,01 (s, 3H)

F18	168-170	ESIMS <i>масса/заряд</i> 306 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 7,87 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,78 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,65-7,58 (m, 2H), 7,48 (dd, <i>J</i> =1,6, 7,9 Гц, 1H), 4,01 (s, 3H), 3,19 (s, 1H)
F19	150-152	ESIMS <i>масса/заряд</i> 332 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 7,90 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,82-7,68 (m, 2H), 7,64 (m, 1H), 7,51 (dq, <i>J</i> =1,1, 7,8 Гц, 1H), 6,67 (t, <i>J</i> =56,0 Гц, 1H), 4,02 (s, 3H)
F20	118-120	ESIMS <i>масса/заряд</i> 352 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 7,86-7,75 (m, 2H), 7,68 (d, <i>J</i> =1,6 Гц, 1H), 7,60 (d, <i>J</i> =8,05 Гц, 1H), 7,48 (dd, <i>J</i> =1,6, 8,1 Гц, 1H), 7,10 (s, 1H), 4,01 (s, 3H), 3,03 (s, 6H)
F21	109-111	ESIMS <i>масса/заряд</i> 339 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 8,57 (d, <i>J</i> =1,5 Гц, 1H), 8,00 (dd, <i>J</i> =1,6, 8,2 Гц, 1H), 7,85 (m, 2H), 7,71 (d, <i>J</i> =8,1 Гц, 1H), 7,40 (s, 1H), 4,01 (s, 3H), 3,92 (s, 3H)
F22	130-132	ESIMS <i>масса/заряд</i> 310 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 10,03 (s, 1H), 7,99 (d, <i>J</i> =1,4 Гц, 1H), 7,94-7,88 (m, 1H), 7,87 (d, <i>J</i> =1,4 Гц, 1H), 7,82 (dd, <i>J</i> =4,4, 8,1 Гц, 2H), 4,02 (s, 3H)
F23	105-107	ESIMS <i>масса/заряд</i> 308 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,86 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,78 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,62 (d, <i>J</i> =7,9 Гц, 1H), 7,50 (d, <i>J</i> =1,7 Гц, 1H), 7,40 (dd, <i>J</i> =1,6, 7,9 Гц, 1H), 6,69 (dd, <i>J</i> =10,9, 17,6 Гц, 1H), 5,83 (d, <i>J</i> =17,5 Гц, 1H), 5,38 (d, <i>J</i> =10,8 Гц, 1H), 4,01 (s, 3H)
F24	98-100	ESIMS <i>масса/заряд</i> 341 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,09-8,04 (m, 2H), 8,00 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,95 (m, 2H), 4,04 (s, 3H)
F25	135-137	ESIMS <i>масса/заряд</i> 376 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 7,92-7,79 (m, 2H), 7,72 (d, <i>J</i> =8,05 Гц, 1H), 7,65 (d, <i>J</i> =1,7 Гц, 1H), 7,60-7,51 (m, 3H), 7,20-7,10 (m, 2H), 4,02 (s, 3H)
F26	147-149	ESIMS <i>масса/заряд</i> 324 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 8,05 (d, <i>J</i> =1,8 Гц, 1H), 7,96-7,86 (m, 2H), 7,78 (dd, <i>J</i> =8,2, 13,3 Гц, 2H), 4,02 (s, 3H), 2,64 (s, 3H)
F27	140-142	ESIMS <i>масса/заряд</i> 362 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,87 (d, <i>J</i> =8,28 Гц, 1H), 7,76 (d, <i>J</i> =8,58 Гц, 1H), 7,65 (d, <i>J</i> =1,96 Гц, 1H), 7,55-7,49 (m, 2H), 4,01 (s, 3H)

F28	125-127	ESIMS <i>масса/заряд</i> 346 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 7,98 (s, 1H), 7,95 (s, 1H), 7,82 (d, J=8,5 Гц, 1H), 7,37-7,31 (m, 1H), 7,20 (s, 1H), 4,01 (s, 3H), 3,92 (s, 3H)
F29	80-82	ESIMS <i>масса/заряд</i> 330 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,90 (d, J=8,5 Гц, 1H), 7,54 (s, 1H), 7,53-7,47 (m, 3H), 4,01 (s, 3H), 2,42 (s, 3H)
F30	70-72	ESIMS <i>масса/заряд</i> 396 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,94 (s, 1H), 7,91 (d, J=8,4 Гц, 1H), 7,74 (d, J=8,4 Гц, 1H), 7,72-7,65 (m, 2H), 4,02 (s, 3H)
F31	101-103	ESIMS <i>масса/заряд</i> 340 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,04 (d, J=8,3 Гц, 1H), 7,84 (d, J=8,2 Гц, 1H), 7,80 (d, J=8,2 Гц, 1H), 7,75 (d, J=1,5 Гц, 1H), 7,64 (dd, J=1,6, 8,3 Гц, 1H), 4,02 (s, 3H), 3,59 (s, 1H)
F32	107-109	ESIMS <i>масса/заряд</i> 394 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 8,09 (d, J=8,3 Гц, 1H), 7,80-7,74 (m, 2H), 7,70 (d, J=8,4 Гц, 1H), 7,65-7,61 (m, 1H), 4,02 (s, 3H)
F33	61-63	ESIMS <i>масса/заряд</i> 364 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 7,75-7,72 (m, 2H), 7,67 (s, 1H), 7,62 (d, = 8,1 Гц, 1H), 4,01 (s, 3H), 2,53 (s, 3H)
F34	185-187	ESIMS <i>масса/заряд</i> 369 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 7,76 (s, 1H), 7,64 (d, J=8,1 Гц, 1H), 7,56 (d, J=7,9 Гц, 1H), 7,45 (s, 1H), 3,96 (s, 3H)
F35	93-95	ESIMS <i>масса/заряд</i> 312 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 7,83 (d, J=8,50 Гц, 1H), 7,76 (d, J=8,49 Гц, 1H), 7,60 (d, J=8,63 Гц, 1H), 7,00 (d, J=2,52 Гц, 1H), 6,91 (dd, J=2,55, 8,63 Гц, 1H), 4,01 (s, 3H), 3,84 (s, 3H)
F36		ESIMS <i>масса/заряд</i> 354 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 7,88-7,82 (m, 1H), 7,77 (dd, J=0,78, 8,41 Гц, 1H), 7,55 (dd, J=0,80, 8,54 Гц, 1H), 7,11 (dd, J=0,78, 2,22 Гц, 1H), 7,00 (m, 1H), 4,02 (s, 3H). 1,39 (s, 9H)
F37	112-114	ESIMS <i>масса/заряд</i> 300 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 7,87 (d, J=8,4 Гц, 1H), 7,74 (d, J=8,4 Гц, 1H), 7,64 (dd, J=6,1, 8,5 Гц, 1H), 7,25-7,18 (m, 1H), 7,11 (t, J=8,4 Гц, 1H), 4,01 (s, 3H)

F38	110-112	ESIMS <i>масса/заряд</i> 350 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 7,97-7,84 (m, 2H), 7,78 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,61 (d, <i>J</i> =1,4 Гц, 2H), 4,03 (s, 3H)
F39	76-78	ESIMS <i>масса/заряд</i> 380 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,80-7,73 (m, 2H), 7,65-7,59 (m, 1H), 7,33 (s, 1H), 4,03 (s, 3H), 4,00 (s, 3H)
F40	110-112	ESIMS <i>масса/заряд</i> 374 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,91 (s, 1H), 7,78-7,74 (m, 2H), 7,63 (dd, <i>J</i> =1,5, 8,1 Гц, 1H), 4,02 (s, 3H), 3,71 (s, 1H)
F41	113-115	ESIMS <i>масса/заряд</i> 430 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 8,09 (s, 1H), 7,77 (d, <i>J</i> =7,0 Гц, 2H), 7,67-7,59 (m, 1H), 4,02 (s, 3H)
F42	65-67	ESIMS <i>масса/заряд</i> 399 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,77 (d, <i>J</i> =1,5 Гц, 1H), 7,64 (dd, <i>J</i> =1,6, 7,9 Гц, 1H), 7,55 (d, <i>J</i> =7,9 Гц, 1H), 3,99 (s, 3H), 3,69 (s, 3H)
F43	86-88	ESIMS <i>масса/заряд</i> 402 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 7,78 (s, 1H), 7,69-7,64 (m, 1H), 7,61 (d, <i>J</i> =8,0 Гц, 1H), 4,01 (s, 3H)
F44	56-57	ESIMS <i>масса/заряд</i> 426 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,29 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 8,07-8,03 (m, 1H), 7,97 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,91-7,85 (m, 1H), 7,83 (d, <i>J</i> =8,1 Гц, 1H), 7,51-7,46 (m, 2H), 7,44-7,32 (m, 3H), 5,45 (s, 2H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -61,32
F45	76-77	ESIMS <i>масса/заряд</i> 374 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,31 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 8,09-8,05 (m, 1H), 7,99 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,91-7,86 (m, 1H), 7,83 (d, <i>J</i> =8,1 Гц, 1H), 5,06 (d, <i>J</i> =2,5 Гц, 2H), 3,69 (t, <i>J</i> =2,4 Гц, 1H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -61,32
F46	125-127	ESIMS <i>масса/заряд</i> 314 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 7,87 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,79 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,43-7,27 (m, 2H), 4,02 (s, 3H), 2,30 (s, 3H)

F47	172-174	ESIMS <i>масса/заряд</i> 348 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 7,88 (d, J=8,4 Гц, 1H), 7,79 (d, J=8,5 Гц, 1H), 7,49 (s, 1H), 7,20 (s, 1H), 4,02 (s, 3H), 3,94 (s, 3H)
F48	110-112	ESIMS <i>масса/заряд</i> 330 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 7,87 (d, J=8,4 Гц, 1H), 7,67 (d, J=8,4 Гц, 1H), 7,40 (d, J=8,4 Гц, 1H), 7,34 (d, J=8,4 Гц, 1H), 4,01 (s, 3H), 2,54 (s, 3H)
F49	88-90	ESIMS <i>масса/заряд</i> 310 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 7,83 (d, J=8,4 Гц, 1H), 7,76 (d, J=8,4 Гц, 1H), 7,41 (s, 1H), 7,23 (s, 1H), 4,00 (d, J=3,4 Гц, 3H), 2,27 (s, 6H)
F50	160-162	ESIMS <i>масса/заряд</i> 341 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 7,94 (d, J=8,5 Гц, 1H), 7,85 (s, 1H), 7,82 (d, J=8,4 Гц, 1H), 7,79 (s, 1H), 4,04 (s, 3H)
F51	129-131	ESIMS <i>масса/заряд</i> 331 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,86 (d, J=8,3 Гц, 1H), 7,75 (d, J=8,3 Гц, 1H), 7,52 (s, 1H), 7,48 (s, 1H), 4,02 (s, 3H), 2,39 (s, 3H)
F52	129-131	ESIMS <i>масса/заряд</i> 296 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,69 (d, J=1,9 Гц, 2H), 7,59 (d, J=8,3 Гц, 1H), 7,48 (d, J=1,9 Гц, 1H), 7,35 (dd, J=2,1, 8,2 Гц, 1H), 3,98 (s, 3H), 2,62 (s, 3H)
F53	105-107	ESIMS <i>масса/заряд</i> 330 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,77 (d, J=7,9 Гц, 1H), 7,73 (t, J=1,2 Гц, 3H), 7,62 (dd, J=1,6, 8,2 Гц, 1H), 3,98 (s, 3H), 2,64 (s, 3H)
F54		ESIMS <i>масса/заряд</i> 427,1 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 8,64-8,60 (m, 1H), 7,92 (d, J=8,4 Гц, 1H), 7,83-7,79 (m, 2H), 7,76 (d, J=1,7 Гц, 1H), 7,73 (td, J=7,7, 1,8 Гц, 1H), 7,64 (ddd, J=8,1, 1,8, 0,8 Гц, 1H), 7,53 (dt, J=7,8, 1,0 Гц, 1H), 7,28-7,23 (m, 1H), 5,58 (s, 2H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -62,91
F55	85-88	ESIMS <i>масса/заряд</i> 316 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,19 (dd, J=1,2, 7,8 Гц, 1H), 8,01-7,93 (m, 1H), 7,85 (dd, J=1,2, 7,8 Гц, 1H), 7,82-7,73 (m, 2H), 7,64 (dd, J=1,6, 8,0 Гц, 1H), 4,02 (s, 3H)

F56	125-127	ESIMS <i>масса/заряд</i> 316 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 8,14 (d, <i>J</i> =1,8 Гц, 1H), 7,83 (d, <i>J</i> =1,8 Гц, 1H), 7,59 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 7,50 (d, <i>J</i> =2,0 Гц, 1H), 7,37 (dd, <i>J</i> =2,0, 8,3 Гц, 1H), 4,02 (s, 3H)
F57	133-135	ESIMS <i>масса/заряд</i> 350 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 8,19 (d, <i>J</i> =1,9 Гц, 1H), 7,85 (d, <i>J</i> =1,8 Гц, 1H), 7,81-7,73 (m, 2H), 7,64 (dt, <i>J</i> =1,3, 6,9 Гц, 1H), 4,02 (s, 3H)
F58	90-92	ESIMS <i>масса/заряд</i> 366 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 7,89 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,76 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,69 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,37 (dd, <i>J</i> =1,0, 2,2 Гц, 1H), 7,29-7,23 (m, 1H), 4,02 (s, 3H)
F59	140-142	ESIMS <i>масса/заряд</i> 307 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 7,92 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,83-7,73 (m, 3H), 7,69-7,63 (m, 1H), 4,02 (s, 3H)
F60	100-102	ESIMS <i>масса/заряд</i> 296 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,84 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 7,75 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,53 (d, <i>J</i> =7,8 Гц, 1H), 7,29 (d, <i>J</i> =1,5 Гц, 1H), 7,17 (dd, <i>J</i> =1,5, 7,9 Гц, 1H), 4,00 (s, 3H), 2,38 (s, 3H)
F61	101-103	ESIMS <i>масса/заряд</i> 336 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 14,00 (s, 1H), 8,24 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 8,08-8,03 (m, 1H), 7,91 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,89-7,82 (m, 2H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -61,31
F62	106-108	ESIMS <i>масса/заряд</i> 334 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 7,92 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 7,47 (dd, <i>J</i> =0,8, 8,2 Гц, 1H), 7,34 (t, <i>J</i> =1,7 Гц, 1H), 7,15 (dd, <i>J</i> =1,9, 8,8 Гц, 1H), 4,01 (s, 3H)
F63	165-167	ESIMS <i>масса/заряд</i> 334 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,90 (d, <i>J</i> =8,0 Гц, 1H), 7,75 (d, <i>J</i> =8,0, 1H), 7,42 (m, 2H), 4,05 (s, 3H)
F64		ESIMS <i>масса/заряд</i> 328 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,83 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,77 (d, <i>J</i> =1,7 Гц, 1H), 7,70 (dd, <i>J</i> =2,0, 8,4 Гц, 2H), 7,13 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 4,02 (s, 3H)
F65	185-187	ESIMS <i>масса/заряд</i> 334 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,89 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,80 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,58-7,47 (m, 2H), 4,03 (s, 3H)

F66	113-114	ESIMS <i>масса/заряд</i> 350 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,29 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 8,06 (d, <i>J</i> =1,7 Гц, 1H), 7,97 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,88 (ddd, <i>J</i> =8,1, 1,8, 0,7 Гц, 1H), 7,83 (dd, <i>J</i> =8,1, 0,8 Гц, 1H), 3,93 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -61,32
F67		ESIMS <i>масса/заряд</i> 348 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 14,11 (s, 1H), 8,24 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 8,02 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,95 (d, <i>J</i> =8,9 Гц, 1H), 7,51 (d, <i>J</i> =8,9 Гц, 1H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -47,95
F68		ESIMS <i>масса/заряд</i> 363 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,99 (m, 2H), 7,89 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,21 (d, <i>J</i> =8,9 Гц, 1H), 4,04 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -49,01
F69	95-98	ESIMS <i>масса/заряд</i> 305 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 8,47 (s, 1H), 7,92 (dd, <i>J</i> =8,6, 1,7 Гц, 1H), 7,83 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,75 (dd, <i>J</i> =8,3, 7,0 Гц, 1H), 7,49 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 7,31 (t, <i>J</i> =2,8 Гц, 1H), 6,61 (td, <i>J</i> =3,4, 2,1 Гц, 1H), 4,03 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -139,06
F70	155-157	ESIMS <i>масса/заряд</i> 303 ([M-H] ⁻)	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,23 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,96 (dd, <i>J</i> =8,5, 2,0 Гц, 1H), 7,79 (td, <i>J</i> =8,2, 7,6, 2,1 Гц, 1H), 7,60 (ddd, <i>J</i> =8,7, 6,8, 1,9 Гц, 1H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -138,52, -138,57, -138,98, -139,04
F71	150-152	ESIMS <i>масса/заряд</i> 319 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,88 (m, 2H), 7,83 (m, 1H), 7,30 (m, 1H), 4,03 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -137,83, -137,88, -138,60, -138,65

F72	197-200	ESIMS <i>масса/заряд</i> 296 ([M-H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,67-7,55 (m, 2H), 7,54-7,38 (m, 2H), 7,11 (s, 1H), 4,22 (s, 3H), 3,94 (s, 2H)
F73	162-163	ESIMS <i>масса/заряд</i> 368 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7,52 (br d, <i>J</i> =8 Гц, 1H), 7,38 (br t, <i>J</i> =8 Гц, 1H), 3,93 (s, 3H)
F74	130-133	ESIMS <i>масса/заряд</i> 382 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 7,31 (dd, <i>J</i> =8, 1 Гц, 1H), 7,25 (dd, <i>J</i> =8, 6 Гц, 1H), 4,01 (s, 3H), 4,00 (d, <i>J</i> =1,5 Гц, 3H)
F75	141-144	ESIMS <i>масса/заряд</i> 350 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,22 (d, <i>J</i> =1 Гц, 1H), 7,64 (dd, <i>J</i> =9, 8 Гц, 1H), 7,50 (dd, <i>J</i> =9, 2 Гц, 1H), 3,95 (d, <i>J</i> =1 Гц, 3H)
F76	97-99	ESIMS <i>масса/заряд</i> 364 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 8,01 (d, <i>J</i> =1 Гц, 1H), 7,71 (dd, <i>J</i> =9, 8 Гц, 1H), 7,27 (dd, <i>J</i> =9, 2 Гц, 1H), 4,03 (s, 3H), 4,00 (d, <i>J</i> =1 Гц, 3H)
F77	85-86	ESIMS <i>масса/заряд</i> 369 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 7,70 (dd, <i>J</i> =8,6, 7,9 Гц, 1H), 7,28-7,21 (m, 2H), 6,09 (s, 2H), 4,46 (q, <i>J</i> =7,1 Гц, 2H), 4,23 (q, <i>J</i> =7,0 Гц, 2H), 3,98 (d, <i>J</i> =1,0 Гц, 3H), 1,54 (t, <i>J</i> =7,0 Гц, 3H), 1,48 (t, <i>J</i> =7,1 Гц, 3H)
F78		ESIMS <i>масса/заряд</i> 316 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 14,02 (s, 1H), 8,20 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,94 (dd, <i>J</i> =8,5, 2,1 Гц, 1H), 7,65 (t, <i>J</i> =8,2 Гц, 1H), 7,48 (dd, <i>J</i> =8,6, 1,7 Гц, 1H), 4,15-3,81 (m, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -131,57
F79		EIMS <i>масса/заряд</i> 426,1	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,75 (d, <i>J</i> =2,1 Гц, 1H), 8,66-8,56 (m, 1H), 7,90 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,85-7,74 (m, 4H), 7,63 (dd, <i>J</i> =8,2, 1,7 Гц, 1H), 7,33 (dd, <i>J</i> =7,9, 4,8 Гц, 1H), 5,48 (s, 2H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -62,95
F80	115-116	ESIMS <i>масса/заряд</i> 316 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,57 (s, 1H), 8,20-8,00 (m, 2H), 7,65-7,49 (m, 2H), 3,97 (s, 3H)

F81		EIMS <i>масса/заряд</i> 426,1	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,66-8,60 (m, 2H), 7,94 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,86-7,75 (m, 3H), 7,69-7,62 (m, 1H), 7,41-7,36 (m, 2H), 5,47 (s, 2H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -62,93
F82	60-63	ESIMS <i>масса/заряд</i> 282 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,21 (s, 2H), 8,15-8,09 (m, 2H), 7,62-7,56 (m, 2H), 3,95 (s, 3H)
F83	149-156	ESIMS <i>масса/заряд</i> 327 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 8,54 (d, <i>J</i> =2,1 Гц, 1H), 8,18 (dd, <i>J</i> =8,5, 2,2 Гц, 1H), 7,93 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,82 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,66 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 4,05 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (126 МГц, CDCl ₃) δ 164,79, 151,46, 148,43, 148,37, 139,64, 137,08, 132,42, 131,01, 130,30, 128,26, 123,88, 122,52, 53,16
F84		ESIMS <i>масса/заряд</i> 337 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 9,83 (s, 1H), 9,12 (s, 1H), 8,28 (d, <i>J</i> =7,8 Гц, 1H), 8,13 (s, 1H), 7,84 (d, <i>J</i> =7,2 Гц, 1H); ¹³ C ЯМР (101 МГц, CDCl ₃) δ 161,2, 153,0, 142,4, 142,0, 139,3, 133,2, 132,5, 132,2, 126,3, 125,6, 125,1, 122,4
F85		ESIMS <i>масса/заряд</i> 310 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,82 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,77 (dd, <i>J</i> =8,5, 1,9 Гц, 1H), 7,56 (dd, <i>J</i> =8,3, 7,2 Гц, 1H), 6,76 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 6,10 (s, 2H), 4,02 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (126 МГц, CDCl ₃) δ 165,09, 151,30 (d, <i>J</i> =5,1 Гц), 151,07 (d, <i>J</i> =2,3 Гц), 147,66, 145,06 (d, <i>J</i> =250,7 Гц), 138,84, 134,94 (d, <i>J</i> =13,9 Гц), 128,78, 126,18 (d, <i>J</i> =10,1 Гц), 124,29 (d, <i>J</i> =1,6 Гц), 120,92 (d, <i>J</i> =8,6 Гц), 105,24 (d, <i>J</i> =3,4 Гц), 102,87, 53,00; ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -142,39 (dd, <i>J</i> =7,2, 2,1 Гц)
F86		EIMS <i>масса/заряд</i> 316,1	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 8,40 (d, <i>J</i> =4,9 Гц, 1H), 7,95 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,80 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,51 (d, <i>J</i> =4,9 Гц, 1H), 4,03 (s, 3H)

F87		ESIMS <i>масса/заряд</i> 333 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 13,58 (s, 1H), 9,23 (d, <i>J</i> =2,0 Гц, 1H), 8,54 (dd, <i>J</i> =8,3, 2,1 Гц, 1H), 8,03 (d, <i>J</i> =8,2 Гц, 1H), 7,94 (s, 1H), 4,00 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (101 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 165,6, 155,8, 150,6, 146,6, 146,3, 140,8, 140,3, 138,9, 135,2, 131,1, 122,7, 120,8, 57,6
F88		ESIMS <i>масса/заряд</i> 384 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,97 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 7,68 (s, 2H), 7,42 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 4,01 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (126 МГц, CDCl ₃) δ 164,46, 151,98, 147,92, 139,90, 139,36, 135,70, 132,98 (q, <i>J</i> =34,2 Гц), 130,95, 127,61, 125,36 (q, <i>J</i> =3,7 Гц), 122,38 (q, <i>J</i> =273,3 Гц), 53,28; ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -63,17
F89		ESIMS <i>масса/заряд</i> 368 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 14,12 (s, 1H), 8,54 (s, 1H), 7,91-7,81 (m, 4H); ¹³ C ЯМР (101 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 165,5, 152,8, 148,0, 140,4, 139,5, 136,2, 131,6, 131,3, 128,5, 128,4, 124,9
F90		ESIMS <i>масса/заряд</i> 383 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,90 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,83-7,76 (m, 2H), 7,71 (d, <i>J</i> =8,0 Гц, 1H), 7,66 (dd, <i>J</i> =8,1, 1,7 Гц, 1H), 4,02 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (101 МГц, CDCl ₃) δ 164,7, 153,3, 147,9, 139,5, 138,5, 137,2, 134,6, 132,9, 132,6, 130,7, 130,3, 127,6, 127,4, 126,7, 53,1
F91		ESIMS <i>масса/заряд</i> 366 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,04 (dd, <i>J</i> =8,4, 1,6 Гц, 2H), 7,77 (d, <i>J</i> =8,2 Гц, 2H), 7,68 (d, <i>J</i> =9,9 Гц, 1H), 4,02 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (101 МГц, CDCl ₃) δ 164,0, 158,6, 155,9, 143,7 (d, <i>J</i> =5,0 Гц), 142,8 (d, <i>J</i> =11,0 Гц), 136,2, 135,8 (d, <i>J</i> =5,9 Гц), 130,8 (d, <i>J</i> =4,7 Гц), 129,74 (d, <i>J</i> =6,2 Гц), 127,9, 126,9, 126,8, 126,5, 53,1

F92		ESIMS <i>масса/заряд</i> 335 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 9,33 (s, 1H), 8,51 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 7,82 (d, <i>J</i> =8,2 Гц, 1H), 7,75 (d, <i>J</i> =9,8 Гц, 1H), 4,03 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (101 МГц, CDCl ₃) δ 163,8, 158,8, 156,1, 149,8 (d, <i>J</i> =8,9 Гц), 144,3 (d, <i>J</i> =5,1 Гц), 139,9 (d, <i>J</i> =11,9 Гц), 137,5 (d, <i>J</i> =5,4 Гц), 132,0 (dd, <i>J</i> =32,1, 5,5 Гц), 127,3, 127,03, 120,3 (d, <i>J</i> =3,0 Гц), 53,2
F93		ESIMS <i>масса/заряд</i> 334 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,15-8,07 (m, 2H), 7,75 (d, <i>J</i> =8,2 Гц, 2H), 7,69 (d, <i>J</i> =9,9 Гц, 1H), 4,03 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (101 МГц, CDCl ₃) δ 164,1, 158,6, 155,9, 143,7 (d, <i>J</i> =4,9 Гц), 142,7 (d, <i>J</i> =11,3 Гц), 136,8 (d, <i>J</i> =5,9 Гц), 130,9 (d, <i>J</i> =4,7 Гц), 129,2, 129,2, 127,0, 126,8, 125,6 (q, <i>J</i> =3,8 Гц), 53,1
F94		ESIMS <i>масса/заряд</i> 334 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,04 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 8,02-7,97 (m, 2H), 7,96 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,84-7,79 (m, 2H); ¹³ C ЯМР (101 МГц, CDCl ₃) δ 161,3, 153,1, 142,4, 142,0, 138,3, 136,7, 133,1, 130,9, 127,9, 127,1, 127,1, 125,5
F95		ESIMS <i>масса/заряд</i> 303 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,44 (d, <i>J</i> =2,1 Гц, 1H), 8,74 (dd, <i>J</i> =8,3, 2,2 Гц, 1H), 8,34 (d, <i>J</i> =8,6 Гц, 1H), 8,28 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 8,07 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H) ¹³ C ЯМР (101 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 166,2, 150,9, 150,2, 148,9, 140,3, 136,9, 135,9, 128,7, 124,5, 123,4, 121,4, 120,7
F96		ESIMS <i>масса/заряд</i> 336 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,12 (s, 1H), 7,84 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 2H), 7,79 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 2H); ¹³ C ЯМР (101 МГц, CDCl ₃) δ 152,4, 142,5, 138,6, 134,7, 133,1, 132,2, 131,9, 129,7, 125,5, 125,1, 122,4

F97		ESIMS <i>масса/заряд</i> 348 ($[M+H]^+$)	1H ЯМР (400 МГц, $CDCl_3$) δ 8,04 (d, $J=8,4$ Гц, 2H), 7,88 (d, $J=8,5$ Гц, 1H), 7,80 (d, $J=8,5$ Гц, 1H), 7,76 (d, $J=8,3$ Гц, 2H), 4,04 (s, 3H); ^{13}C ЯМР (101 МГц, $CDCl_3$) δ 165,0, 153,9, 148,1, 139,6, 139,3, 136,6, 131,0, 129,7, 128,0, 126,0, 123,0, 53,0
F98		ESIMS <i>масса/заряд</i> 382 ($[M+H]^+$)	1H ЯМР (400 МГц, $CDCl_3$) δ 7,98 (s, 1H), 7,80 (d, $J=8,4$ Гц, 2H), 7,75 (d, $J=8,2$ Гц, 2H), 4,00 (s, 3H); ^{13}C ЯМР (101 МГц, $CDCl_3$) δ 164,1, 153,0, 145,7, 140,1, 138,6, 135,9, 132,2, 131,0, 130,6, 130,1, 127,9, 126,0, 126,0, 53,2
F99		ESIMS <i>масса/заряд</i> 351 ($[M+H]^+$)	1H ЯМР (400 МГц, $CDCl_3$) δ 9,13-9,09 (m, 1H), 8,27 (dd, $J=8,1, 2,1$ Гц, 1H), 8,03 (s, 1H), 7,84-7,76 (m, 1H), 4,01 (s, 3H); ^{13}C ЯМР (101 МГц, $CDCl_3$) δ 163,8, 150,4, 150,1, 146,2, 140,3, 138,4, 136,1, 134,9, 132,5, 131,0, 120,0 (q, $J=2,5$ Гц), 53,3
F100	80-81	ESIMS <i>масса/заряд</i> 392 ($[M+H]^+$)	1H ЯМР (400 МГц, $CDCl_3$) δ 7,86-7,79 (m, 2H), 7,72 (dd, $J=8,6, 1,6$ Гц, 2H), 7,63 (d, $J=10,0$ Гц, 1H), 4,01 (s, 3H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, $CDCl_3$) δ -116,13
F101		ESIMS <i>масса/заряд</i> 351 ($[M+H]^+$)	1H ЯМР (400 МГц, $CDCl_3$) δ 8,86 (d, $J=1,8$ Гц, 1H), 8,09 (d, $J=1,9$ Гц, 1H), 7,98 (d, $J=8,4$ Гц, 1H), 7,92 (d, $J=8,4$ Гц, 1H), 4,02 (s, 3H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, $CDCl_3$) δ -62,39

F102	58-61	ESIMS <i>масса/заряд</i> 368 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,00 (s, 1H), 7,76-7,59 (m, 3H), 4,01 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -61,49, -61,52, -113,63, -113,66
F103	85-86	ESIMS <i>масса/заряд</i> 384 ([M+Na] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,00 (s, 1H), 7,76 (d, <i>J</i> =1,7 Гц, 1H), 7,65 (ddd, <i>J</i> =8,0, 1,7, 0,8 Гц, 1H), 7,55-7,48 (m, 1H), 3,99 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -62,98
F104		ESIMS <i>масса/заряд</i> 347 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,74 (s, 1H), 7,87 (d, <i>J</i> =8,0 Гц, 1H), 7,76 (d, <i>J</i> =1,7 Гц, 1H), 7,69-7,54 (m, 1H), 4,10 (s, 3H), 4,01 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -62,94
F105		ESIMS <i>масса/заряд</i> 351 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 9,01 (s, 1H), 8,00-7,88 (m, 1H), 7,86-7,74 (m, 1H), 7,74-7,58 (m, 1H), 4,06 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -63,06
F106	133-134	ESIMS <i>масса/заряд</i> 351 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,99 (s, 1H), 7,91-7,83 (m, 2H), 7,80-7,69 (m, 2H), 4,00 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 61,26
F107	141-142	ESIMS <i>масса/заряд</i> 368 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,55 (d, <i>J</i> =9,0 Гц, 1H), 8,12 (d, <i>J</i> =1,7 Гц, 1H), 7,93 (dd, <i>J</i> =8,2, 1,8 Гц, 1H), 7,84 (d, <i>J</i> =8,0 Гц, 1H), 3,92 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -61,40, -114,46
F108	90-91	ESIMS <i>масса/заряд</i> 384 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,94 (s, 1H), 7,82-7,72 (m, 2H), 7,64 (ddd, <i>J</i> =8,0, 1,8, 0,8 Гц, 1H), 4,03 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -63,01

F109	127-128	EIMS <i>масса/заряд</i> 368	^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 7,84-7,78 (m, 1H), 7,78-7,75 (m, 1H), 7,68 (d, $J=8,8$ Гц, 1H), 7,67-7,62 (m, 1H), 4,03 (s, 3H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, CDCl_3) δ -63,02, -100,76
F110	72-73	ESIMS <i>масса/заряд</i> 352 ($[\text{M}+\text{H}]^+$)	^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 7,99-7,88 (m, 3H), 7,53-7,44 (m, 1H), 4,04 (s, 3H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, CDCl_3) δ -61,21, -61,25, -138,28, -138,31, -138,33, -138,35, -138,36, -138,38, -138,40, -138,43, -139,96, -140,01
F111		ESIMS <i>масса/заряд</i> 332 ($[\text{M}+\text{H}]^+$)	^1H ЯМР (400 МГц, $\text{DMSO}-d_6$) δ 14,01 (s, 1H), 8,21 (d, $J=8,5$ Гц, 1H), 7,87 (d, $J=8,5$ Гц, 1H), 7,80 (d, $J=1,6$ Гц, 1H), 7,73 (d, $J=8,1$ Гц, 1H), 7,68 (dd, $J=8,1, 1,7$ Гц, 1H), 2,03 (t, $J=19,0$ Гц, 3H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, $\text{DMSO}-d_6$) δ -85,10
F112		ESIMS <i>масса/заряд</i> 346 ($[\text{M}+\text{H}]^+$)	^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 7,89 (d, $J=8,4$ Гц, 1H), 7,77 (d, $J=8,4$ Гц, 1H), 7,70 (d, $J=8,0$ Гц, 1H), 7,62 (d, $J=1,7$ Гц, 1H), 7,53-7,47 (m, 1H), 4,02 (s, 3H), 1,93 (t, $J=18,1$ Гц, 3H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, CDCl_3) δ -88,63
F113		EIMS <i>масса/заряд</i> 333,1	^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 7,89 (dd, $J=8,7, 3,5$ Гц, 1H), 7,80-7,74 (m, 2H), 7,71-7,60 (m, 2H), 4,02 (s, 3H); ^{19}F ЯМР (376 МГц, CDCl_3) δ -62,94, -118,77

F114	114-116	ESIMS <i>масса/заряд</i> 317 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 9,27 (d, <i>J</i> =2,08 Гц, 1H), 8,55 (dd, <i>J</i> =2,13, 8,23 Гц, 1H), 7,95 (d, <i>J</i> =8,44 Гц, 1H), 7,87 (d, <i>J</i> =8,43 Гц, 1H), 7,80 (d, <i>J</i> =8,33 Гц, 1H), 4,05 (s, 3H)
F115	93-95	ESIMS <i>масса/заряд</i> 332 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 8,97 (s, 1H), 7,80 (dd, <i>J</i> =8,6, 7,5 Гц, 1H), 7,33-7,27 (m, 1H), 4,08 (s, 3H), 4,05 (d, <i>J</i> =1,1 Гц, 3H)
F116		ESIMS <i>масса/заряд</i> 494 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,91 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,84-7,77 (m, 2H), 7,76 (d, <i>J</i> =1,7 Гц, 1H), 7,64 (dd, <i>J</i> =8,2, 1,7 Гц, 1H), 7,52 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 7,44 (d, <i>J</i> =2,1 Гц, 1H), 7,30-7,25 (m, 1H), 5,53 (s, 2H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -62,93
F117		ESIMS <i>масса/заряд</i> 475,2 ([M-F] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,91 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,82 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,81-7,74 (m, 4H), 7,64 (ddd, <i>J</i> =13,8, 11,2, 7,5 Гц, 2H), 7,52 (t, <i>J</i> =7,8 Гц, 1H), 5,51 (s, 2H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -62,68, -62,92
F118		ESIMS <i>масса/заряд</i> 375 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 8,02 (d, <i>J</i> =8,2 Гц, 1H), 7,98 (d, <i>J</i> =1,6 Гц, 1H), 7,95 (d, <i>J</i> =1,8 Гц, 1H), 7,62 (d, <i>J</i> =8,2 Гц, 1H), 4,02 (s, 3H)
F119		ESIMS <i>масса/заряд</i> 412,1 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,95 (d, <i>J</i> =8,6 Гц, 1H), 7,80 (d, <i>J</i> =2,1 Гц, 2H), 7,72 (d, <i>J</i> =8,6 Гц, 1H), 4,02 (s, 3H), 3,12 (s, 3H)
F120		ESIMS <i>масса/заряд</i> 412,1 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,95 (d, <i>J</i> =8,6 Гц, 1H), 7,80 (d, <i>J</i> =2,1 Гц, 2H), 7,72 (d, <i>J</i> =8,6 Гц, 1H), 4,02 (s, 3H), 3,12 (s, 3H)
F121	166-169	ESIMS <i>масса/заряд</i> 395,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 7,92 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 7,77-7,68 (m, 2H), 7,64 (d, <i>J</i> =8,2 Гц, 1H), 4,01 (s, 3H), 2,56-2,25 (s, 3H)

F122	166-169	ESIMS <i>масса/заряд</i> 396,0 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 7,94 (d, <i>J</i> =8,9 Гц, 1H), 7,51 (s, 1H), 7,41 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,36 (d, <i>J</i> =1,4 Гц, 1H), 4,00 (s, 3H), 2,42 (s, 3H)
F123		ESIMS <i>масса/заряд</i> 392 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,85 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,76 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,61 (d, <i>J</i> =8,6 Гц, 1H), 7,11-7,06 (m, 2H), 7,06-7,01 (m, 3H), 6,96 (dd, <i>J</i> =8,6, 2,5 Гц, 1H), 4,01 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (126 МГц, CDCl ₃) δ 164,95, 159,43 (d, <i>J</i> =243,3 Гц), 159,16, 154,13, 151,56 (d, <i>J</i> =2,7 Гц), 147,55, 138,31, 133,10, 132,95, 131,80, 129,42, 127,51, 121,34 (d, <i>J</i> =8,3 Гц), 119,09, 116,71, 116,70 (d, <i>J</i> =23,5 Гц), 53,07; ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -118,29
F124		EIMS <i>масса/заряд</i> 361	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,88 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,77 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,40 (s, 1H), 7,20 (s, 1H), 4,02 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -50,00
F125		ESIMS <i>масса/заряд</i> 307 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 8,21 (d, <i>J</i> =1,7 Гц, 1H), 8,00 (dd, <i>J</i> =8,2, 1,7 Гц, 1H), 7,93 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,82 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,78 (d, <i>J</i> =8,1 Гц, 1H), 4,05 (s, 3H)
F126		ESIMS <i>масса/заряд</i> 348 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 8,05 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,81 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,49 (s, 1H), 7,47 (s, 1H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -48,12
F127		ESIMS <i>масса/заряд</i> 403 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 8,12 (s, 1H), 7,85 (d, <i>J</i> =1,7 Гц, 1H), 7,72 (dd, <i>J</i> =8,0, 1,7 Гц, 1H), 7,44 (d, <i>J</i> =8,0 Гц, 1H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -41,73

F128			¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,86 (dd, <i>J</i> =1,7, 1,0 Гц, 2H), 7,75 (d, <i>J</i> =7,2 Гц, 1H), 7,19 (d, <i>J</i> =10,3 Гц, 1H), 4,03 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (126 МГц, CDCl ₃) δ 164,92, 48,37, 148,35, 147,75, 139,03, 129,67, 126,75, 126,66, 117,42, 117,40, 116,99, 116,77, 53,07; ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -124,83
F129		ESIMS масса/заряд 313,01 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 8,34 (d, <i>J</i> =2,6 Гц, 1H), 8,18-8,13 (m, 2H), 7,83 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 4,03 (d, <i>J</i> =2,3 Гц, 6H); ¹³ C ЯМР (126 МГц, CDCl ₃) δ 165,00, 159,42, 150,53, 147,64, 145,89, 139,17, 138,62, 129,43, 127,00, 125,07, 121,67, 54,14, 53,04
F130		ESIMS масса/заряд 417 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,99 (s, 1H), 7,80 (d, <i>J</i> =1,7 Гц, 1H), 7,67 (dd, <i>J</i> =8,0, 1,7 Гц, 1H), 7,44 (d, <i>J</i> =7,9 Гц, 1H), 3,99 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -41,90
F131		ESIMS масса/заряд 387 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,86 (s, 1H), 7,84 (dd, <i>J</i> =8,1, 1,1 Гц, 1H), 7,72 (dd, <i>J</i> =8,1, 1,7 Гц, 1H), 7,53 (d, <i>J</i> =8,0 Гц, 1H); ¹³ C ЯМР (101 МГц, CDCl ₃) δ 160,38, 159,57, 156,87, 142,11, 141,94, 136,90, 135,16 (d, <i>J</i> =5,7 Гц), 134,29, 134,01 (d, <i>J</i> =4,4 Гц), 132,00 (d, <i>J</i> =1,8 Гц), 128,83, 128,61, 128,43, 127,60
F132		ESIMS масса/заряд 318 ([M-H] ⁻)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,95 (dd, <i>J</i> =8,7, 3,5 Гц, 1H), 7,87-7,82 (m, 2H), 7,80 (d, <i>J</i> =8,1 Гц, 1H), 7,71 (dd, <i>J</i> =8,1, 1,7 Гц, 1H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -60,43, -116,60, -116,60, -116,62, -116,62

F133		ESIMS <i>масса/заряд</i> 303 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 8,42 (d, <i>J</i> =4,9 Гц, 1H), 8,13 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,90 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,61 (d, <i>J</i> =4,9 Гц, 1H)
F134	155,2- 163,3	EIMS <i>масса/заряд</i> 298	¹ H ЯМР (400 МГц, Метанол- <i>d</i> ₄) δ 8,28 (d, <i>J</i> =2,6 Гц, 1H), 8,17-8,05 (m, 2H), 7,90 (d, <i>J</i> =8,6 Гц, 1H), 3,94 (s, 3H)
F135		ESIMS <i>масса/заряд</i> 401 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,80 (d, <i>J</i> =1,7 Гц, 1H), 7,71 (d, <i>J</i> =8,2 Гц, 1H), 7,68 (dd, <i>J</i> =8,0, 1,8 Гц, 1H), 7,54 (d, <i>J</i> =8,0 Гц, 1H), 4,00 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (101 МГц, CDCl ₃) δ 163,82, 158,25, 155,57, 143,63 (d, <i>J</i> =5,0 Гц), 142,83 (d, <i>J</i> =16,1 Гц), 136,68, 135,45 (d, <i>J</i> =4,7 Гц), 134,38, 132,37, 132,25 (d, <i>J</i> =4,8 Гц), 127,75-127,49 (m), 126,51, 126,29, 53,26
F136	94-97	ESIMS <i>масса/заряд</i> 364 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 7,90 (d, <i>J</i> =8,6 Гц, 1H), 7,66 (dd, <i>J</i> =8,6, 7,0 Гц, 2H), 7,48 (d, <i>J</i> =8,2 Гц, 1H), 4,00 (s, 3H), 2,57 (s, 3H)
F137	87-90	ESIMS <i>масса/заряд</i> 376 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 7,90 (d, <i>J</i> =8,7 Гц, 1H), 7,70 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 2H), 7,57 (d, <i>J</i> =8,2 Гц, 1H), 6,84-6,69 (m, 1H), 5,70 (d, <i>J</i> =11,5 Гц, 1H), 5,48 (d, <i>J</i> =17,3 Гц, 1H), 4,01 (s, 3H)
F138	144-147	ESIMS <i>масса/заряд</i> 428 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 8,39 (d, <i>J</i> =1,7 Гц, 1H), 8,04 (d, <i>J</i> =1,8 Гц, 1H), 7,96 (d, <i>J</i> =8,74 Гц, 1H), 7,52 (d, <i>J</i> =9,5 Гц, 1H), 3,98 (s, 3H), 3,31 (s, 3H)
F139	170-173	ESIMS <i>масса/заряд</i> 428 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (600 МГц, CDCl ₃) δ 7,97 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 2H), 7,89 (d, <i>J</i> =7,8 Гц, 1H), 7,70 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 4,02 (s, 3H), 3,37 (s, 3H)
F140	103-107	ESIMS <i>масса/заряд</i> 430 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 7,94 (d, <i>J</i> =8,1 Гц, 1H), 7,70 (dd, <i>J</i> =8,1, 5,7 Гц, 2H), 7,63 (d, <i>J</i> =8,2 Гц, 1H), 4,02 (s, 3H)
F141	104-107	ESIMS <i>масса/заряд</i> 407 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 8,30-8,26 (m, 1H), 7,91 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,74 (d, <i>J</i> =4,2 Гц, 2H), 7,70 (d, <i>J</i> =1,7 Гц, 1H), 4,01 (s, 6H)

F142	78-81	ESIMS <i>масса/заряд</i> 420 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 7,88 (d, <i>J</i> =8,2 Гц, 1H), 7,70 (dd, <i>J</i> =8,6, 1,4 Гц, 2H), 7,56 (d, <i>J</i> =8,2 Гц, 1H), 7,29 (s, 1H), 4,01 (s, 3H), 3,03 (s, 6H)
F143	169-172	ESIMS <i>масса/заряд</i> 375 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 8,30 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 8,12 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 8,08-7,96 (m, 2H), 4,04 (s, 3H)
F144		EIMS <i>масса/заряд</i> 325	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,86 (dd, <i>J</i> =1,7, 1,0 Гц, 2H), 7,75 (d, <i>J</i> =7,2 Гц, 1H), 7,19 (d, <i>J</i> =10,3 Гц, 1H), 4,03 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (126 МГц, CDCl ₃) δ 164,92, 154,93, 149,99, 148,35, 147,75, 139,03, 129,67, 126,75, 126,66, 117,42, 117,40, 116,99, 116,77, 53,07
F145		ESIMS <i>масса/заряд</i> 325 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 8,08 (s, 1H), 7,88 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,79 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,69 (d, <i>J</i> =1,6 Гц, 1H), 7,66 (d, <i>J</i> =8,0 Гц, 1H), 7,53 (dd, <i>J</i> =8,0, 1,6 Гц, 1H), 4,02 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (126 МГц, CDCl ₃) δ 164,83, 154,04, 148,35, 147,56, 138,49, 138,03, 134,41, 132,64, 132,11, 129,98, 128,29, 127,61, 125,73, 53,14
F146		ESIMS <i>масса/заряд</i> 359 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,21 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 8,12 (s, 1H), 7,94 (dd, <i>J</i> =8,2, 2,0 Гц, 1H), 7,88-7,82 (m, 2H), 7,79 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,61 (s, 1H), 3,93 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (101 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 169,39, 165,06, 155,36, 147,70, 140,85, 139,40, 138,40, 131,55, 129,72, 129,40, 128,43, 127,08, 126,78 (d, <i>J</i> =3,7 Гц), 125,05 (d, <i>J</i> =3,9 Гц), 122,91, 53,35
F147		ESIMS <i>масса/заряд</i> 394 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,50 (s, 1H), 8,23 (s, 1H), 8,14-8,08 (m, 1H), 8,02-7,97 (m, 1H), 7,68 (d, <i>J</i> =8,0 Гц, 1H), 7,52 (s, 1H), 3,89 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (101 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 167,68, 164,36, 155,59, 144,90, 140,68, 139,00 (d, <i>J</i> =4,3 Гц), 136,79, 132,89, 131,96, 128,83

F148		ESIMS <i>масса/заряд</i> 309,9 ([M-H] ⁻)	¹ H ЯМР (500 МГц, Метанол- <i>d</i> ₄) δ 8,02 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,79 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,12 (s, 1H), 7,03 (s, 1H), 6,09 (s, 2H); ¹³ C ЯМР (126 МГц, Метанол- <i>d</i> ₄) δ 166,40, 154,54, 149,21, 148,66, 147,31, 138,45, 130,47, 128,10, 127,51, 124,20, 110,32, 109,63, 102,46
F149		ESIMS <i>масса/заряд</i> 325 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,84 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,74 (d, <i>J</i> =8,6 Гц, 1H), 7,72 (d, <i>J</i> =2,1 Гц, 1H), 7,50 (dd, <i>J</i> =8,3, 2,1 Гц, 1H), 7,43 (d, <i>J</i> =8,2 Гц, 1H), 4,04 (s, 3H), 2,89 (s, 6H); ¹³ C ЯМР (101 МГц, CDCl ₃) δ 165,22, 154,69, 150,92, 147,84, 139,05, 136,67, 131,09, 129,88, 128,87, 122,80, 121,52, 118,68, 52,95, 43,69
F150		ESIMS <i>масса/заряд</i> 343,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,65 (d, <i>J</i> =8,1 Гц, 1H), 6,92 (d, <i>J</i> =13,5 Гц, 2H), 6,05 (s, 2H), 4,00 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -112,19
F151		ESIMS <i>масса/заряд</i> 427,8 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 8,01 (s, 1H), 7,93 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,80 (d, <i>J</i> =8,1 Гц, 2H), 4,04 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -63,09
F152		ESIMS <i>масса/заряд</i> 445,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,85-7,83 (m, 1H), 7,81 (d, <i>J</i> =1,7 Гц, 1H), 7,74 (dt, <i>J</i> =8,2, 1,8 Гц, 1H), 4,12-3,86 (m, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -63,21, -112,32
F153		ESIMS <i>масса/заряд</i> 380 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,70 (d, <i>J</i> =8,1 Гц, 1H), 7,23 (s, 1H), 7,20 (s, 1H), 4,00 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -49,69, -112,24, -112,26

F154		ESIMS <i>масса/заряд</i> 395,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,99 (s, 1H), 7,22 (s, 1H), 7,09 (s, 1H), 3,99 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -49,48, -49,81
F155		ESIMS <i>масса/заряд</i> 359,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,95 (s, 1H), 6,93 (s, 1H), 6,80 (s, 1H), 6,05 (s, 2H), 3,99 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (126 МГц, CDCl ₃) δ 164,07, 153,41, 149,18, 146,82, 145,08, 139,22, 134,40, 130,52, 128,63, 125,75, 110,03, 110,01, 102,21, 53,28
F156		ESIMS <i>масса/заряд</i> 368 ([M-H] ⁻)	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,29 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 8,12 (s, 2H), 7,76 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -61,38
F157	86-89	ESIMS <i>масса/заряд</i> 349 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,87 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,76 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,67 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,28 (d, <i>J</i> =2,5 Гц, 1H), 7,16 (dd, <i>J</i> =8,5, 2,4 Гц, 1H), 6,55 (t, <i>J</i> =72,9 Гц, 1H), 4,01 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -81,49, -81,65
F158		ESIMS <i>масса/заряд</i> 352 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,77 (t, <i>J</i> =7,4 Гц, 1H), 7,71 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,59-7,55 (m, 1H), 7,49-7,44 (m, 1H), 4,01 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -63,01, -111,12, -111,14, -111,16, -111,20, -111,22, -111,23, -113,59, -113,61, -113,66, -113,68

F159	128-130	ESIMS <i>масса/заряд</i> 360 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 8,07 (dd, <i>J</i> =8,8, 1,5 Гц, 2H), 7,67 (d, <i>J</i> =9,8 Гц, 1H), 7,45-7,39 (m, 2H), 4,02 (s, 3H), 3,18 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -116,47, -116,49
F160		ESIMS <i>масса/заряд</i> 336 ([M-H] ⁻)	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 14,12 (s, 1H), 8,46 (d, <i>J</i> =9,3 Гц, 1H), 7,93 (d, <i>J</i> =11,3 Гц, 1H), 7,89 (d, <i>J</i> =7,4 Гц, 1H), 7,80 (d, <i>J</i> =7,7 Гц, 1H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, DMSO) δ -61,36, -112,22, -112,30, -116,13, -116,21
F161	105-107	ESIMS <i>масса/заряд</i> 362 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,60 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 7,44 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 6,86-6,80 (m, 1H), 6,74 (d, <i>J</i> =2,2 Гц, 1H), 6,56 (t, <i>J</i> =73,6 Гц, 1H), 3,99 (s, 3H), 3,81 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -80,84, -81,00, -112,41, -112,43
F162		ESIMS <i>масса/заряд</i> 382,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 9,79 (s, 1H), 8,16 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 8,05 (dd, <i>J</i> =1,7, 0,8 Гц, 1H), 8,04-8,01 (m, 1H), 7,83 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -63,27
F163	79-81	ESIMS <i>масса/заряд</i> 364 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 8,06-7,98 (m, 2H), 7,62 (d, <i>J</i> =10,1 Гц, 1H), 7,08-7,02 (m, 2H), 4,42 (q, <i>J</i> =8,1 Гц, 2H), 4,02 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -73,83, -73,85, -73,87, -116,74, -116,76

F164		ESIMS <i>масса/заряд</i> 335 ([M-H] ⁻)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,98 (br s, 1H), 8,87 (s, 1H), 8,19 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 8,14 (s, 1H), 8,07 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -62,42
F165	88-90	ESIMS <i>масса/заряд</i> 332 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 8,02 (dd, <i>J</i> =8,9, 1,5 Гц, 2H), 7,65 (d, <i>J</i> =10,0 Гц, 1H), 7,23 (d, <i>J</i> =8,8 Гц, 2H), 6,58 (t, <i>J</i> =73,5 Гц, 1H), 4,02 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -81,13, -81,28, -116,65, -116,68
F166	108-110	ESIMS <i>масса/заряд</i> 364 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,63 (d, <i>J</i> =8,2 Гц, 1H), 7,56 (dd, <i>J</i> =7,7, 1,0 Гц, 1H), 7,38-7,33 (m, 1H), 7,22-7,18 (m, 1H), 3,99 (s, 3H), 3,87 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -62,84, -62,84, -112,46, -112,48
F167	80-82	ESIMS <i>масса/заряд</i> 335 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 8,82 (t, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 8,04 (dd, <i>J</i> =8,6, 1,5 Гц, 1H), 7,95 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,74 (dd, <i>J</i> =7,8, 1,6 Гц, 1H), 4,05 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -66,59, -66,61, -68,09
F168	107-109	ESIMS <i>масса/заряд</i> 291 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 8,14 (dd, <i>J</i> =8,5, 1,4 Гц, 2H), 7,79 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 2H), 7,71 (d, <i>J</i> =10,0 Гц, 1H), 4,03 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -115,94, -115,96

F169	132-134	ESIMS <i>масса/заряд</i> 344 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 8,22-8,18 (m, 2H), 8,07 (d, <i>J</i> =8,6 Гц, 2H), 7,72 (d, <i>J</i> =9,9 Гц, 1H), 4,03 (s, 3H), 3,09 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -116,04, -116,07
F170	106-108	ESIMS <i>масса/заряд</i> 348 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,70 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 7,56 (d, <i>J</i> =9,4 Гц, 2H), 7,49 (d, <i>J</i> =7,9 Гц, 1H), 4,00 (s, 3H), 2,33 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -62,87, -114,90, -114,91
F171		ESIMS <i>масса/заряд</i> 371 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,85 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,81 (dd, <i>J</i> =8,6, 2,1 Гц, 1H), 7,72 (dd, <i>J</i> =8,5, 7,9 Гц, 1H), 7,30 (dd, <i>J</i> =8,6, 1,5 Гц, 1H), 4,03 (s, 3H), 3,19 (qd, <i>J</i> =7,2, 1,5 Гц, 4H), 1,03 (td, <i>J</i> =7,2, 0,8 Гц, 6H); ¹³ C ЯМР (101 МГц, CDCl ₃) δ 164,97, 160,24 (d, <i>J</i> =254,4 Гц), 150,84, 147,87, 138,75, 137,80 (d, <i>J</i> =6,0 Гц), 135,39 (d, <i>J</i> =15,0 Гц), 129,30, 127,08 (d, <i>J</i> =3,9 Гц), 126,82 (d, <i>J</i> =10,8 Гц), 125,88 (d, <i>J</i> =3,6 Гц), 125,10 (d, <i>J</i> =12,2 Гц), 52,98, 47,43 (d, <i>J</i> =3,9 Гц), 13,45; ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -121,62
F172			¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,86 (dd, <i>J</i> =1,7, 1,0 Гц, 2H), 7,75 (d, <i>J</i> =7,2 Гц, 1H), 7,19 (d, <i>J</i> =10,3 Гц, 1H), 4,03 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -124,83

F173			¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,69 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,33 (d, <i>J</i> =5,5 Гц, 1H), 6,96 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 4,01 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (101 МГц, CDCl ₃) δ 163,86, 158,42, 157,60, 155,72, 155,11, 145,34, 145,20, 143,83, 143,79, 140,49, 140,03, 139,86, 134,59, 132,03, 131,71, 131,66, 126,56, 126,34, 116,96, 116,74, 111,30, 111,27, 99,40, 99,09, 53,20; ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -49,80, -113,48, -115,06, -115,17
F174		ESIMS масса/заряд 379,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,98 (s, 1H), 7,17 (d, <i>J</i> =5,5 Гц, 1H), 6,95 (d, <i>J</i> =8,2 Гц, 1H), 4,00 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -49,72, -114,22
F175		ESIMS масса/заряд 366 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,81 (d, <i>J</i> =8,1 Гц, 1H), 7,29 (s, 1H), 7,19 (s, 1H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -49,59, -110,33
F176	150-154	ESIMS масса/заряд 375 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,44 (br s, 1H), 8,27 (d, <i>J</i> =8,8 Гц, 1H), 8,12 (br s, 1H), 7,94 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,79-7,75 (m, 2H), 7,69-7,67 (m, 1H), 3,93 (s, 3H)
F177		ESIMS масса/заряд 376 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,26 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,94 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,71 (s, 1H), 7,74-7,71 (m, 1H), 7,67-7,64 (m, 1H), 3,99 (t, <i>J</i> =14,0 Гц, 2H), 3,93 (s, 3H), 3,36 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -101,50
F178	64-67	ESIMS масса/заряд 357 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,92 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,85 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,81-7,78 (m, 2H), 7,69-7,67 (m, 1H), 4,01 (s, 3H)

F179		ESIMS <i>масса/заряд</i> 362 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 14,01 (br s, 1H), 8,21 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,88 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,78 (s, 1H), 7,74 (d, <i>J</i> =7,6 Гц, 1H), 7,66 (d, <i>J</i> =8,0 Гц, 1H), 3,99 (t, <i>J</i> =13,6 Гц, 2H), 3,36 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ -101,50
F180	128-132	ESIMS <i>масса/заряд</i> 362 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 13,98 (br s, 1H), 8,22 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,90 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,89-7,75 (m, 2H), 7,69 (dd, <i>J</i> =1,6, 8,4 Гц, 1H)
F181		ESIMS <i>масса/заряд</i> 431 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,88-7,84 (m, 2H), 7,83 (s, 1H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -63,29, -110,30
F182		ESIMS <i>масса/заряд</i> 381,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,10 (s, 1H), 7,28 (s, 1H), 7,10 (s, 1H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -49,55
F183	138-153	ESIMS <i>масса/заряд</i> 343,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,03 (s, 1H), 6,93 (s, 1H), 6,77 (s, 1H), 6,07 (s, 2H)
F184		ESIMS <i>масса/заряд</i> 367 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,68 (s, 1H), 7,98 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,81 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,27 (t, <i>J</i> =52,6 Гц, 1H), 4,02 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (101 МГц, CDCl ₃) δ 164,42, 153,14, 152,80, 148,51, 147,00, 139,32, 137,21 (t, <i>J</i> =23,2 Гц), 131,37, 131,36 (t, <i>J</i> =2,7 Гц), 130,16 (t, <i>J</i> =3,6 Гц), 127,28, 111,10 (t, <i>J</i> =242,9 Гц), 53,15; ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -117,87
F185		ESIMS <i>масса/заряд</i> 350 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 8,04 (dd, <i>J</i> =8,8, 1,5 Гц, 2H), 7,67 (d, <i>J</i> =9,9 Гц, 1H), 7,34 (dd, <i>J</i> =9,1, 1,1 Гц, 2H), 4,02 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -57,70, -116,59, -116,61

F186		ESIMS <i>масса/заряд</i> 326 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,80 (d, <i>J</i> =1,6 Гц, 1H), 7,72 (d, <i>J</i> =8,2 Гц, 1H), 7,69 (dd, <i>J</i> =8,0, 1,5 Гц, 1H), 7,61 (d, <i>J</i> =7,9 Гц, 1H), 4,01 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -112,54, -112,56
F187	90-92	ESIMS <i>масса/заряд</i> 368 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,72-7,63 (m, 2H), 7,18 (ddt, <i>J</i> =8,7, 2,3, 1,0 Гц, 1H), 7,09 (dd, <i>J</i> =10,2, 1,3 Гц, 1H), 4,01 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -57,92, -109,30, -109,32, -109,32, -109,34, -109,38, -109,39, -109,40, -109,42, -113,76, -113,78, -113,84, -113,85
F188	69-70	ESIMS <i>масса/заряд</i> 306 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 8,24 (d, <i>J</i> =1,8 Гц, 1H), 7,96 (dt, <i>J</i> =8,6, 1,7 Гц, 1H), 7,68 (d, <i>J</i> =2,2 Гц, 1H), 7,65 (d, <i>J</i> =10,0 Гц, 1H), 7,60 (d, <i>J</i> =8,6 Гц, 1H), 6,86 (dd, <i>J</i> =2,1, 0,8 Гц, 1H), 4,03 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -116,57, -116,59
F189	163-165	ESIMS <i>масса/заряд</i> 305 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 8,30 (s, 1H), 8,27 (s, 1H) 7,87 (dt, <i>J</i> =8,6, 1,7 Гц, 1H), 7,62 (d, <i>J</i> =10,1 Гц, 1H), 7,48 (dt, <i>J</i> =8,6, 0,8 Гц, 1H), 7,29-7,24 (m, 1H), 6,65 (ddd, <i>J</i> =3,1, 2,0, 0,9 Гц, 1H), 4,02 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -116,50, -116,52

F190	122-123	ESIMS <i>масса/заряд</i> 350 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 13,96 (s, 1H), 8,32 (d, <i>J</i> =9,1 Гц, 1H), 7,62 (d, <i>J</i> =7,7 Гц, 1H), 7,49-7,44 (m, 2H), 3,88 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, DMSO) δ -61,16, -114,86
F191		ESIMS <i>масса/заряд</i> 317 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,57 (d, <i>J</i> =2,1 Гц, 1H), 7,94 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,89-7,86 (m, 2H), 4,01 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (101 МГц, CDCl ₃) δ 164,54, 153,00, 150,94, 146,93, 146,57, 139,09, 138,10, 132,30, 131,06, 127,13, 53,07
F192	132-135	ESIMS <i>масса/заряд</i> 337 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 8,15 (d, <i>J</i> =7,8 Гц, 1H), 8,11 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,99 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,82 (d, <i>J</i> =7,8 Гц, 1H); ¹³ C ЯМР (126 МГц, CDCl ₃) δ 160,93, 150,65, 149,55, 148,85 (q, <i>J</i> =36,6 Гц), 142,53, 141,91, 141,38, 135,64, 134,26, 129,22, 120,38 (q, <i>J</i> =274,6 Гц), 119,72 (q, <i>J</i> =2,7 Гц); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -68,07
F193		ESIMS <i>масса/заряд</i> 353 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, Ацетон- <i>d</i> ₆) δ 11,46 (br s, 1H), 8,83 (s, 1H), 8,26 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 8,03 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,53 (t, <i>J</i> =52,1 Гц, 1H); ¹³ C ЯМР (101 МГц, Ацетон- <i>d</i> ₆) δ 163,78, 153,35, 152,93, 148,59, 146,51, 140,06, 136,97 (t, <i>J</i> =23,1 Гц), 130,87 (t, <i>J</i> =2,6 Гц), 130,43, 129,73 (t, <i>J</i> =3,5 Гц), 127,81, 111,68 (t, <i>J</i> =241,2 Гц); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, Ацетон) δ -118,78

F194	112-116	ESIMS <i>масса/заряд</i> 351 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,94 (s, 1H), 7,97 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,82 (s, 1H), 7,81 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 2H), 4,04 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (101 МГц, CDCl ₃) δ 164,44, 152,38, 150,22, 149,20 (q, <i>J</i> =35,7 Гц), 148,45, 143,49, 139,07, 135,56, 131,16, 127,42, 120,78 (q, <i>J</i> =274,7 Гц), 122,09 (q, <i>J</i> =3,0 Гц) 53,23; ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -68,11
F195		ESIMS <i>масса/заряд</i> 303 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,61 (d, <i>J</i> =2,1 Гц, 1H), 8,22 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 8,07 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,94 (d, <i>J</i> =2,1 Гц, 1H); ¹³ C ЯМР (101 МГц, CDCl ₃) δ 161,29, 151,60, 148,49, 146,74, 141,97, 140,59, 138,86, 134,04, 132,95, 130,84, 128,98
F196		ESIMS <i>масса/заряд</i> 329,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,77 (d, <i>J</i> =8,1 Гц, 1H), 6,99 (s, 1H), 6,88 (s, 1H), 6,09 (s, 2H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -109,95
F197		ESIMS <i>масса/заряд</i> 311 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 8,35 (d, <i>J</i> =8,9 Гц, 2H), 8,21 (dd, <i>J</i> =8,9, 1,3 Гц, 2H), 7,73 (d, <i>J</i> =10,0 Гц, 1H), 4,04 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -115,69, -115,69
F198	157-159	ESIMS <i>масса/заряд</i> 292 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 13,97 (s, 1H), 8,34 (d, <i>J</i> =10,7 Гц, 1H), 8,23 (t, <i>J</i> =1,7 Гц, 1H), 8,10 (d, <i>J</i> =2,2 Гц, 1H), 7,89 (dt, <i>J</i> =8,7, 1,7 Гц, 1H), 7,77 (dt, <i>J</i> =8,7, 0,8 Гц, 1H), 7,11 (dd, <i>J</i> =2,2, 1,0 Гц, 1H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, DMSO) δ -118,00

F199	176-178	ESIMS <i>масса/заряд</i> 291 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 13,88 (s, 1H), 11,34 (s, 1H), 8,25 (d, <i>J</i> =10,9 Гц, 1H), 8,17 (d, <i>J</i> =1,8 Гц, 1H), 7,71 (dt, <i>J</i> =8,6, 1,7 Гц, 1H), 7,57-7,48 (m, 1H), 7,44 (t, <i>J</i> =2,7 Гц, 1H), 6,58 (ddd, <i>J</i> =3,0, 1,9, 0,9 Гц, 1H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, DMSO) δ -118,09
F200	106-109	ESIMS <i>масса/заряд</i> 367 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,68 (d, <i>J</i> =8,1 Гц, 1H), 7,49 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,29 (d, <i>J</i> =2,4 Гц, 1H), 7,17 (dd, <i>J</i> =8,5, 2,4 Гц, 1H), 6,56 (t, <i>J</i> =72,8 Гц, 1H), 4,00 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -81,55, -81,70, -112,64, -112,66
F201		ESIMS <i>масса/заряд</i> 361 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 8,51 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 8,05 (d, <i>J</i> =8,6 Гц, 1H), 7,85 (d, <i>J</i> =8,0 Гц, 1H), 7,81-7,77 (m, 1H), 7,68 (ddd, <i>J</i> =8,2, 1,6, 0,8 Гц, 1H), 4,05 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CD ₃ CN) δ -68,3
F202		EIMS <i>масса/заряд</i> 411	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 8,07 (d, <i>J</i> =2,1 Гц, 1H), 8,02-7,97 (m, 2H), 7,25 (d, <i>J</i> =6,9 Гц, 1H), 4,01 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (126 МГц, CDCl ₃) δ 163,95, 151,60, 145,85, 140,27, 135,34, 133,52, 132,00, 130,30, 127,16, 116,60, 53,26
F203		ESIMS <i>масса/заряд</i> 378 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 8,31-8,20 (m, 2H), 7,89 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,79 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,32-7,18 (m, 1H), 4,05 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (126 МГц, CDCl ₃) δ 164,96, 152,50, 148,21, 139,47, 134,70, 132,60, 129,68, 124,30, 122,40, 117,23, 53,09

F204		ESIMS масса/заряд 395,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 8,31 (d, J=2,0 Гц, 1H), 8,28 (ddd, J=8,7, 2,2, 1,0 Гц, 1H), 7,70 (d, J=10,1 Гц, 1H), 7,34-7,22 (m, 1H), 4,03 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -58,29, -116,64, -116,66
F205	149-153	ESIMS масса/заряд 337 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,91 (s, 1H), 8,13 (d, J=8,4 Гц, 1H), 7,92 (d, J=8,4 Гц, 1H), 7,89 (s, 1H); ¹³ C ЯМР (101 МГц, CDCl ₃) δ 160,94, 151,63, 149,77 (q, J=35,9 Гц), 149,27, 143,79, 142,79, 142,03, 134,53, 134,31, 129,19, 122,47 (q, J=3,3 Гц), 120,62 (q, J=274,8 Гц); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -68,12
F206		ESIMS масса/заряд 394,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,23 (dd, J=1,8, 0,8 Гц, 1H), 8,02 (dd, J=1,7, 0,8 Гц, 1H), 7,99 (d, J=8,4 Гц, 1H), 7,56 (d, J=8,4 Гц, 1H), 3,98 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -63,21
F207		ESIMS масса/заряд 281 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,40 (s, 1H), 8,05 (dd, J=8,5, 1,3 Гц, 1H), 7,92 (d, J=8,5 Гц, 1H), 7,36 (d, J=11,4 Гц, 1H), 4,02 (s, 3H), 2,43 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (101 МГц, CDCl ₃) δ 164,80, 157,97 (d, J=265,7 Гц), 152,17 (d, J=6,6 Гц), 147,38, 146,15 (d, J=4,6 Гц), 140,37 (d, J=8,8 Гц), 139,02, 136,67 (d, J=4,4 Гц), 130,50, 126,36 (d, J=4,3 Гц), 125,23 (d, J=19,4 Гц), 53,01, 18,01; ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -122,78

F208	137-141	ESIMS <i>масса/заряд</i> 265 ([M-H] ⁻)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,42 (s, 1H), 8,35 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 8,03 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,44 (d, <i>J</i> =11,9 Гц, 1H), 2,47 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (101 МГц, CDCl ₃) δ 161,82, 158,30 (d, <i>J</i> =267,2 Гц), 150,82 (d, <i>J</i> =7,1 Гц), 146,04 (d, <i>J</i> =4,7 Гц), 141,65, 141,61, 138,48 (d, <i>J</i> =7,1 Гц), 137,71 (d, <i>J</i> =4,8 Гц), 133,26, 127,58 (d, <i>J</i> =3,6 Гц), 125,89 (d, <i>J</i> =19,7 Гц), 18,10; ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -121,75
F209	41-43	ESIMS <i>масса/заряд</i> 316 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,08 (d, <i>J</i> =8,0 Гц, 2H), 7,80-7,54 (m, 3H), 6,71 (t, <i>J</i> =56,3 Гц, 1H), 4,02 (d, <i>J</i> =1,0 Гц, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -111,56, -116,42
F210	119-121	ESIMS <i>масса/заряд</i> 385 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,70 (d, <i>J</i> =8,2 Гц, 1H), 7,52 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,39 (d, <i>J</i> =2,2 Гц, 1H), 7,30-7,25 (m, 1H), 4,00 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -57,85, -112,68, -112,70
F211		ESIMS <i>масса/заряд</i> 366 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,88 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,78 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,52 (s, 1H), 7,04 (s, 1H), 4,28 (s, 2H), 4,02 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (101 МГц, CDCl ₃) δ 164,81, 153,43, 147,79, 143,46, 140,97, 138,40, 130,14, 128,25 (d, <i>J</i> =5,4 Гц), 127,42, 120,14, 119,99

F212		ESIMS <i>масса/заряд</i> 366 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,89 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,64 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,46 (d, <i>J</i> =8,1 Гц, 1H), 6,95 (dd, <i>J</i> =8,2, 0,9 Гц, 1H), 4,82 (s, 2H), 4,01 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (101 МГц, CDCl ₃) δ 164,76, 154,51, 147,70, 141,51 (d, <i>J</i> =34,0 Гц), 138,55, 130,06, 127,19, 125,61, 124,97 (q, <i>J</i> =5,3 Гц), 122,90, 119,10, 118,80, 114,99, 114,69, 53,08
F213		ESIMS <i>масса/заряд</i> 364,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,95 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,65 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,10 (s, 1H), 6,90 (s, 1H), 4,61 (s, 2H), 4,01 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -63,54
F214		EIMS <i>масса/заряд</i> 475	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,09 (s, 1H), 7,97 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 7,74 (d, <i>J</i> =1,6 Гц, 1H), 7,38 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 4,01 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -63,02
F215	97-99	ESIMS <i>масса/заряд</i> 380 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,61 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 7,47 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 6,95 (dq, <i>J</i> =8,4, 1,2 Гц, 1H), 6,82 (d, <i>J</i> =2,1 Гц, 1H), 3,99 (s, 3H), 3,82 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -57,64, -112,43, -112,45
F216		EIMS <i>масса/заряд</i> 377,1	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,94 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 7,80-7,75 (m, 1H), 7,65 (d, <i>J</i> =1,6 Гц, 1H), 7,39 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 6,34 (dd, <i>J</i> =17,4, 11,0 Гц, 1H), 5,74 (d, <i>J</i> =17,4 Гц, 1H), 5,32 (d, <i>J</i> =11,0 Гц, 1H), 4,00 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -63,11
F217		EIMS <i>масса/заряд</i> 379,1	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,89 (dd, <i>J</i> =8,3, 1,0 Гц, 1H), 7,44-7,33 (m, 2H), 7,08 (s, 1H), 4,00 (d, <i>J</i> =1,1 Гц, 3H), 3,79 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -63,09

F218		ESIMS <i>масса/заряд</i> 331([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,85 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,75 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,51 (d, <i>J</i> =8,2 Гц, 1H), 7,48-7,44 (m, 1H), 7,28 (ddd, <i>J</i> =8,2, 1,8, 0,9 Гц, 1H), 4,31 (s, 2H), 4,03 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (101 МГц, CDCl ₃) δ 165,11, 154,02, 147,87, 145,03 (d, <i>J</i> =1,9 Гц), 141,45, 139,16, 129,59, 127,25 (q, <i>J</i> =5,2 Гц), 123,08, 115,82, 115,67, 52,98
F219		ESIMS <i>масса/заряд</i> 266 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 8,01-7,93 (m, 2H), 7,64 (d, <i>J</i> =9,8 Гц, 1H), 7,53-7,41 (m, 3H), 4,02 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -116,59, -116,62
F220		ESIMS <i>масса/заряд</i> 385 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,15 (s, 1H), 8,03-7,93 (m, 2H), 4,03 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (101 МГц, CDCl ₃) δ 164,36, 154,86, 151,44, 147,01, 146,03 (q, <i>J</i> =1,01 Гц), 139,54 (q, <i>J</i> =4,9 Гц), 139,45, 132,00, 129,57, 127,23, 126,15 (q, <i>J</i> =34,1 Гц), 121,27 (q, <i>J</i> =273,7 Гц), 53,16; ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -63,77
F221	106-108	ESIMS <i>масса/заряд</i> 350 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,68 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,64 (t, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 7,11-7,05 (m, 1H), 6,99 (dd, <i>J</i> =10,6, 2,4 Гц, 1H), 6,57 (t, <i>J</i> =72,8 Гц, 1H), 4,01 (s, 3H)
F222		ESIMS <i>масса/заряд</i> 362 (M+H) ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,07 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 7,84-7,80 (m, 1H), 7,71 (d, <i>J</i> =1,7 Гц, 1H), 7,58 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 6,26 (dd, <i>J</i> =17,4, 11,0 Гц, 1H), 5,78 (d, <i>J</i> =17,3 Гц, 1H), 5,38 (d, <i>J</i> =11,0 Гц, 1H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -63,13
F223		ESIMS <i>масса/заряд</i> 361,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,02 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 7,57 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 7,42 (dd, <i>J</i> =1,5, 0,7 Гц, 1H), 7,19-7,14 (m, 1H), 3,83 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -63,14

F224		ESIMS <i>масса/заряд</i> 378,9 ([M-H] ⁻)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,30-8,27 (m, 1H), 8,15-8,03 (m, 2H), 7,65 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -63,18
F225		ESIMS <i>масса/заряд</i> 369 ([M-H] ⁻)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,32 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 8,22 (s, 1H), 8,13 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H); ¹³ C ЯМР (101 МГц, CDCl ₃) δ 161,09, 152,44, 149,95, 146,36, 142,33, 140,97, 140,27 (q, <i>J</i> =4,9 Гц), 135,17, 129,28, 129,15, 126,66 (q, <i>J</i> =34,4 Гц), 121,12 (q, <i>J</i> =273,7 Гц); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -63,81
F226	86-88	ESIMS <i>масса/заряд</i> 353 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 14,01 (s, 1H), 8,21 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,87 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,79-7,72 (m, 2H), 7,54 (ddt, <i>J</i> =7,4, 2,4, 1,2 Гц, 1H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, DMSO) δ -56,90
F227		ESIMS <i>масса/заряд</i> 284 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 8,01 (ddd, <i>J</i> =9,0, 5,3, 1,6 Гц, 2H), 7,64 (d, <i>J</i> =9,9 Гц, 1H), 7,18 (t, <i>J</i> =8,7 Гц, 2H), 4,02 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -110,33, -110,34, -110,34, -110,35, -110,36, -110,37, -110,37, -110,38, -110,39, -116,69, -116,72
F228		ESIMS <i>масса/заряд</i> 354 ([M-H] ⁻)	¹ H ЯМР (500 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10,64 (s, 1H), 7,36 (s, 1H), 6,69 (d, <i>J</i> =6,9 Гц, 1H), 6,46 (d, <i>J</i> =7,1 Гц, 1H), 5,51 (s, 1H), 3,97 (s, 3H), 3,71 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (126 МГц, CDCl ₃) δ 172,75, 170,15, 155,59, 137,11, 129,48, 128,92, 127,71, 125,00, 119,75, 106,54, 58,22

F229		ESIMS масса/заряд 363,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,70 (d, J=8,4 Гц, 1H), 7,38 (dd, J=8,4, 6,2 Гц, 1H), 7,04 (dd, J=8,4, 0,8 Гц, 1H), 4,01 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (126 МГц, CDCl ₃) δ 163,90, 158,05, 155,90, 146,80, 146,76, 144,60, 143,92, 143,89, 142,56, 139,81, 139,68, 134,66, 133,99, 131,92, 131,76, 131,72, 131,37, 131,26, 129,86, 128,05, 126,51, 126,35, 126,33, 119,04, 119,01, 118,95, 118,91, 105,92, 105,89, 53,22; ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -49,30, -49,31, -49,32, -114,24, -114,25, -114,31, -114,32, -135,01, -135,02, -135,08, -135,09
F230	139-142	ESIMS масса/заряд 350 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, DMSO-d ₆) δ 14,02 (s, 1H), 8,39 (d, J=9,1 Гц, 1H), 7,48 (dd, J=8,0, 6,1 Гц, 1H), 7,42 (d, J=8,4 Гц, 1H), 7,30 (t, J=54,2 Гц, 1H), 3,86 (d, J=1,9 Гц, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, DMSO) δ -113,66, -113,67, -113,77, -113,79, -115,72, -135,26
F231		ESIMS масса/заряд 340 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, DMSO-d ₆) δ 7,20 (d, J=1,4 Гц, 1H), 7,11 (t, J=1,6 Гц, 1H), 6,87 (dd, J=21,9, 1,6 Гц, 1H), 6,11 (s, 2H), 3,94 (s, 3H), 3,89 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, DMSO) δ -116,01
F232			¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 8,97 (s, 1H), 7,56 (s, 1H), 7,24 (s, 1H), 4,05 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (126 МГц, CDCl ₃) δ 163,14, 161,97, 158,76, 154,11, 145,00, 142,74, 131,82, 131,40, 128,61, 127,63, 112,54, 112,10, 53,56; ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -49,91

F233		ESIMS <i>масса/заряд</i> 360 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,68 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,15 (dd, <i>J</i> =8,3, 1,0 Гц, 1H), 7,00 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 3,99 (s, 3H), 2,23 (d, <i>J</i> =1,2 Гц, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -49,61, -114,90, -114,91
F234		ESIMS <i>масса/заряд</i> 363,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,71 (d, <i>J</i> =8,7 Гц, 1H), 7,46 (dd, <i>J</i> =9,1, 4,6 Гц, 1H), 7,06 (t, <i>J</i> =9,1 Гц, 1H), 4,02 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -49,29, -114,07, -114,09, -132,42, -132,43, -132,44
F235		ESIMS <i>масса/заряд</i> 376 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,61 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 7,18 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 6,84 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 4,06 (s, 3H), 3,99 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -49,80, -49,81, -49,82, -113,26, -113,27, -113,28
F236		ESIMS <i>масса/заряд</i> 347 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,87 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,76 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,65 (d, <i>J</i> =8,1 Гц, 1H), 7,41 (d, <i>J</i> =1,9 Гц, 1H), 7,28 (dd, <i>J</i> =8,1, 2,0 Гц, 1H), 4,01 (s, 3H), 1,86-1,77 (m, 2H), 1,50-1,41 (m, 2H); ¹³ C ЯМР (126 МГц, CDCl ₃) δ 206,93, 164,85, 153,78, 147,73, 138,87, 138,40, 136,46, 132,79, 132,30, 129,83, 127,42, 124,40, 121,62, 53,09, 30,94, 18,75, 13,51
F237		ESIMS <i>масса/заряд</i> 364,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,68 (d, <i>J</i> =8,2 Гц, 1H), 7,47 (d, <i>J</i> =8,0 Гц, 1H), 7,40 (d, <i>J</i> =1,9 Гц, 1H), 7,32 (dd, <i>J</i> =8,1, 2,0 Гц, 1H), 3,99 (s, 3H), 1,90-1,71 (m, 2H), 1,56-1,39 (m, 2H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -112,73, -112,75

F238	ESIMS <i>масса/заряд</i> 380,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,97 (s, 1H), 7,41-7,34 (m, 3H), 7,31 (dd, <i>J</i> =8,1, 1,9 Гц, 1H), 3,98 (s, 3H), 1,86-1,77 (m, 3H), 1,53-1,42 (m, 2H); ¹³ C ЯМР (126 МГц, CDCl ₃) δ 164,00, 152,88, 145,33, 139,24, 139,22, 135,15, 134,02, 133,96, 131,20, 126,78, 124,28, 121,59, 53,26, 30,94, 18,78, 13,61
F239	ESIMS <i>масса/заряд</i> 373 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,94 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,85-7,69 (m, 2H), 7,49 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 4,01 (s, 3H), 3,09 (s, 1H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -63,25
F240	ESIMS <i>масса/заряд</i> 363,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,83-7,58 (m, 3H), 4,03 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -49,49, -116,24, -116,26, -134,07
F241	ESIMS <i>масса/заряд</i> 385,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,93-7,62 (m, 2H), 7,38 (d, <i>J</i> =9,7 Гц, 1H), 4,01 (d, <i>J</i> =0,7 Гц, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -61,78, -112,50, -115,55
F242	ESIMS <i>масса/заряд</i> 328 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 8,03-7,98 (m, 2H), 7,90 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,21 (t, <i>J</i> =8,1 Гц, 1H), 7,13 (dd, <i>J</i> =7,9, 1,2 Гц, 1H), 4,04 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -49,62
F243	ESIMS <i>масса/заряд</i> 367,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,93 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,83 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,73 (d, <i>J</i> =6,2 Гц, 1H), 7,58 (d, <i>J</i> =10,2 Гц, 1H), 4,03 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -61,71, -115,61

F244		ESIMS <i>масса/заряд</i> 404 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 8,24 (d, <i>J</i> =1,6 Гц, 1H), 7,84 (d, <i>J</i> =1,7 Гц, 1H), 7,74 (d, <i>J</i> =8,6 Гц, 1H), 4,03 (s, 3H), 3,95 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -49,42, -113,83
F245		ESIMS <i>масса/заряд</i> 386 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 8,72 (d, <i>J</i> =1,6 Гц, 1H), 8,01 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,92 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,79 (d, <i>J</i> =1,6 Гц, 1H), 4,06 (s, 3H), 3,97 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -49,22
F246		ESIMS <i>масса/заряд</i> 401,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 8,01 (s, 1H), 7,73 (d, <i>J</i> =6,2 Гц, 1H), 7,27 (d, <i>J</i> =10,5 Гц, 1H), 4,00 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (126 МГц, CDCl ₃) δ 163,71, 158,98, 156,92, 151,05, 145,56, 141,05, 139,59, 133,64, 131,72, 128,86, 128,43, 119,76, 119,58, 53,38
F247	127-130	ESIMS <i>масса/заряд</i> 281 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,86 (dd, <i>J</i> =8,7, 1,7 Гц, 2H), 7,55 (d, <i>J</i> =10,3 Гц, 1H), 6,77-6,73 (m, 2H), 4,00 (s, 3H), 3,92 (s, 2H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -116,87, -116,89
F248	91-93	ESIMS <i>масса/заряд</i> 312 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,94 (dd, <i>J</i> =8,5, 1,7 Гц, 2H), 7,62 (d, <i>J</i> =10,1 Гц, 1H), 7,33 (d, <i>J</i> =8,6 Гц, 2H), 4,01 (s, 3H), 2,53 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -116,42, -116,44

F249	58-61	ESIMS <i>масса/заряд</i> 280 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,88 (dd, <i>J</i> =8,2, 1,8 Гц, 2H), 7,62 (d, <i>J</i> =10,0 Гц, 1H), 7,29 (d, <i>J</i> =8,0 Гц, 2H), 4,01 (s, 3H), 2,41 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -116,58, -116,60
F250		ESIMS <i>масса/заряд</i> 364 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,95 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 7,59 (dd, <i>J</i> =2,0, 1,0 Гц, 1H), 7,46 (dt, <i>J</i> =1,7, 0,8 Гц, 1H), 7,41 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 4,00 (s, 3H), 2,19 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -63,05
F251		ESIMS <i>масса/заряд</i> 391,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,80 (s, 1H), 7,67 (s, 1H), 7,49 (s, 1H), 3,96 (s, 3H), 3,47-3,44 (m, 1H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -62,70, -110,58
F252		ESIMS <i>масса/заряд</i> 347 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,36 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 8,10 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,87-7,79 (m, 2H), 7,74-7,67 (m, 1H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -63,08
F253	58-68	ESIMS <i>масса/заряд</i> 364 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,67 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 7,43-7,32 (m, 2H), 6,92 (t, <i>J</i> =54,8 Гц, 1H), 4,00 (s, 3H), 3,96 (d, <i>J</i> =2,5 Гц, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -113,42, -113,44, -114,30, -114,31, -114,42, -114,42, -136,20
F254		ESIMS <i>масса/заряд</i> 393,9 ([M+Na] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,86 (d, <i>J</i> =8,1 Гц, 1H), 7,81 (d, <i>J</i> =6,2 Гц, 1H), 7,38 (d, <i>J</i> =9,6 Гц, 1H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -61,83, -110,53, -114,91

F255		ESIMS масса/заряд 312 ([M-H] ⁻)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 11,27 (s, 1H), 8,12 (d, J=8,5 Гц, 1H), 8,05 (d, J=8,5 Гц, 1H), 7,77 (dd, J=8,1, 1,3 Гц, 1H), 7,26-7,17 (m, 2H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -49,49
F256		ESIMS масса/заряд 346 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,71 (d, J=8,7 Гц, 1H), 7,46 (dd, J=7,8, 1,6 Гц, 1H), 7,25-7,14 (m, 2H), 4,02 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ 49,8, 113,7
F257		ESIMS масса/заряд 462 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,01 (s, 1H), 7,80 (s, 1H), 7,73 (s, 1H), 4,00 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -63,17
F258		ESIMS масса/заряд 346 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,89-7,71 (m, 2H), 7,66 (d, J=10,2 Гц, 1H), 7,16 (d, J=8,4 Гц, 1H), 4,02 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -50,00, -116,53
F259			¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 10,27 (s, 1H), 8,09 (d, J=8,3 Гц, 1H), 7,63 (d, J=1,7 Гц, 1H), 7,57 (d, J=8,3 Гц, 1H), 7,51 (d, J=1,9 Гц, 1H), 2,20 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (101 МГц, CDCl ₃) δ 161,92, 153,07, 142,73, 141,83, 139,78, 139,59, 133,86, 133,08, 132,20, 129,68, 125,80, 124,34, 121,73, 20,70; ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -63,06
F260		ESIMS масса/заряд 322 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,06 (dd, J=8,3, 7,2 Гц, 1H), 7,96 (dd, J=8,5, 1,8 Гц, 1H), 7,85 (d, J=8,5 Гц, 1H), 7,69 (d, J=8,4 Гц, 1H), 7,57-7,53 (m, 1H), 7,37 (dd, J=5,3, 4,0 Гц, 1H), 4,04 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -118,25

F261		ESIMS <i>масса/заряд</i> 321,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,11 (d, <i>J</i> =0,8 Гц, 1H), 8,06 (d, <i>J</i> =0,8 Гц, 1H), 7,96 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,70 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 4,04 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (101 МГц, CDCl ₃) δ 164,46, 152,66, 148,65, 147,96, 147,82, 141,54, 138,85, 136,63, 131,14, 127,25, 119,55, 116,77, 53,25
F262		ESIMS <i>масса/заряд</i> 289 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 8,31 (dd, <i>J</i> =1,7, 0,6 Гц, 1H), 8,17 (s, 1H), 8,01 (dd, <i>J</i> =8,4, 1,6 Гц, 1H), 7,91-7,83 (m, 3H), 4,05 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (126 МГц, CDCl ₃) δ 165,16, 154,61, 153,86, 150,68, 147,85, 141,37, 139,29, 135,42, 129,13, 123,76, 123,02, 120,76, 110,00, 53,04
F263		ESIMS <i>масса/заряд</i> 328 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,16 (dd, <i>J</i> =8,5, 1,6 Гц, 2H), 7,80-7,75 (m, 2H), 7,70 (d, <i>J</i> =9,9 Гц, 1H), 4,03 (s, 3H), 2,77 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -116,29
F264		ESIMS <i>масса/заряд</i> 314 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,64 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 7,25-7,18 (m, 2H), 7,15-7,09 (m, 1H), 3,99 (s, 3H), 3,93 (d, <i>J</i> =2,4 Гц, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -113,34, -113,36, -129,54, -129,57
F265		EIMS <i>масса/заряд</i> 341	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 9,02 (s, 1H), 8,38 (d, <i>J</i> =6,2 Гц, 1H), 7,77 (d, <i>J</i> =9,1 Гц, 1H), 7,72 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 4,02 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -113,90, -116,98

F266		EIMS масса/заряд 339,9	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,71 (dd, <i>J</i> =15,6, 8,2 Гц, 2H), 7,63-7,57 (m, 2H), 7,41 (dd, <i>J</i> =5,3, 3,8 Гц, 1H), 4,01 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -113,47, -115,06
F267	102-104	ESIMS масса/заряд 334 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,83 (d, <i>J</i> =8,1 Гц, 1H), 7,65-7,58 (m, 2H), 7,48 (d, <i>J</i> =7,9 Гц, 1H), 2,41-2,27 (m, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -62,94, -111,86, -111,88
F268		ESIMS масса/заряд 284 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (600 МГц, CDCl ₃) δ 8,08 (td, <i>J</i> =8,9, 6,6 Гц, 1H), 7,88-7,78 (m, 2H), 7,01 (dddd, <i>J</i> =8,8, 7,7, 2,5, 1,0 Гц, 1H), 6,91 (ddd, <i>J</i> =11,3, 8,7, 2,5 Гц, 1H), 4,03 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (564 МГц, CDCl ₃) δ -107,52, -112,27
F269		ESIMS масса/заряд 278,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (600 МГц, CDCl ₃) δ 8,74 (dd, <i>J</i> =2,5, 0,7 Гц, 1H), 8,26 (dd, <i>J</i> =8,7, 2,5 Гц, 1H), 7,83 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,72 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 6,84 (dd, <i>J</i> =8,7, 0,7 Гц, 1H), 4,03 (s, 3H), 4,00 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (151 МГц, CDCl ₃) δ 165,18, 165,09, 153,07, 147,87, 145,78, 139,19, 137,47, 128,62, 126,66, 121,98, 111,15, 53,79, 52,98
F270		ESIMS масса/заряд 300 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (600 МГц, CDCl ₃) δ 8,04 (t, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,85 (d, <i>J</i> =1,0 Гц, 2H), 7,30-7,23 (m, 1H), 7,20 (dd, <i>J</i> =11,1, 2,0 Гц, 1H), 4,03 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (564 МГц, CDCl ₃) δ -114,09

F271		ESIMS <i>масса/заряд</i> 314 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (600 МГц, CDCl ₃) δ 8,06 (d, J=7,3 Гц, 1H), 7,88-7,81 (m, 2H), 7,04 (dd, J=11,6, 0,9 Гц, 1H), 4,04 (s, 3H), 2,40 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (151 МГц, CDCl ₃) δ 164,97, 159,53, 157,87, 149,98, 147,85, 139,80, 138,92, 130,81, 130,26, 129,32, 126,60, 123,99, 118,39, 53,04, 20,13
F272		ESIMS <i>масса/заряд</i> 313,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (600 МГц, CDCl ₃) δ 7,87-7,84 (m, 2H), 7,83-7,78 (m, 1H), 7,28 (dd, J=8,5, 1,2 Гц, 1H), 4,02 (s, 3H), 2,38 (d, J=2,6 Гц, 3H); ¹⁹ F ЯМР (564 МГц, CDCl ₃) δ -115,98
F273		ESIMS <i>масса/заряд</i> 350 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (600 МГц, CDCl ₃) δ 8,15 (t, J=8,4 Гц, 1H), 7,89 (d, J=1,1 Гц, 2H), 7,36 (dd, J=8,6, 1,2 Гц, 1H), 7,24-6,98 (m, 1H), 4,03 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (564 МГц, CDCl ₃) δ -114,42, -117,38 (d, J=8,1 Гц)
F274		ESIMS <i>масса/заряд</i> 332 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (600 МГц, CDCl ₃) δ 8,08 (td, J=8,5, 2,4 Гц, 1H), 7,87 (d, J=1,1 Гц, 2H), 7,37 (dt, J=8,5, 1,1 Гц, 1H), 5,68 (d, J=2,4 Гц, 1H), 5,60 (d, J=2,4 Гц, 1H), 4,03 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (564 МГц, CDCl ₃) δ -117,00
F275	104-106	ESIMS <i>масса/заряд</i> 346 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,61 (d, J=8,3 Гц, 1H), 7,53 (dt, J=7,8, 1,0 Гц, 1H), 7,20 (dt, J=7,8, 1,3 Гц, 1H), 7,13 (s, 1H), 6,68 (t, J=56,4 Гц, 1H), 3,99 (s, 3H), 3,86 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -111,19, -111,31, -112,40, -112,42
F276		ESIMS <i>масса/заряд</i> 360 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (600 МГц, CDCl ₃) δ 7,87 (d, J=8,4 Гц, 1H), 7,72 (d, J=8,4 Гц, 1H), 7,40 (d, J=8,4 Гц, 1H), 7,32 (d, J=8,4 Гц, 1H), 4,12 (q, J=7,0 Гц, 2H), 4,01 (s, 3H), 1,49 (t, J=7,0 Гц, 3H); ¹³ C ЯМР (151 МГц, CDCl ₃) δ 164,80, 153,86, 152,13, 147,60, 138,46, 137,44, 130,46, 129,92, 128,69, 128,25, 127,59, 126,87, 69,66, 53,11, 15,49

F277		ESIMS масса/заряд 300 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (600 МГц, CDCl ₃) δ 7,92 (ddd, J=7,9, 6,9, 1,7 Гц, 1H), 7,89-7,84 (m, 2H), 7,47 (ddd, J=7,9, 6,9, 1,7 Гц, 1H), 7,21 (td, J=7,9, 1,1 Гц, 1H), 4,03 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (564 МГц, CDCl ₃) δ -119,05
F278		ESIMS масса/заряд 330 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (600 МГц, CDCl ₃) δ 7,86 (d, J=8,5 Гц, 1H), 7,73 (d, J=8,5 Гц, 1H), 7,43 (t, J=1,6 Гц, 1H), 7,38 (dd, J=9,5, 1,9 Гц, 1H), 4,04 (s, 3H), 4,01 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (564 МГц, CDCl ₃) δ -112,94
F279		ESIMS масса/заряд 372 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (600 МГц, CDCl ₃) δ 7,86 (d, J=8,5 Гц, 1H), 7,83 (dd, J=8,5, 1,8 Гц, 1H), 7,68 (dd, J=8,6, 7,7 Гц, 1H), 7,31-7,24 (m, 1H), 4,12 (t, J=6,5 Гц, 2H), 4,02 (s, 3H), 1,81 (dq, J=7,7, 6,5 Гц, 2H), 1,60-1,51 (m, 2H), 0,99 (t, J=7,4 Гц, 3H); ¹⁹ F ЯМР (564 МГц, CDCl ₃) δ -131,50
F280			¹ H ЯМР (600 МГц, CDCl ₃) δ 7,88-7,80 (m, 2H), 7,73 (dd, J=8,7, 7,7 Гц, 1H), 7,32-7,23 (m, 1H), 4,44 (t, J=6,7 Гц, 2H), 3,99 (d, J=0,9 Гц, 3H), 2,03-1,71 (m, 2H), 1,56-1,41 (m, 2H), 0,99 (t, J=7,4 Гц, 3H); ¹³ C ЯМР (151 МГц, CDCl ₃) δ 164,81, 155,46, 153,77, 150,15, 148,69, 144,83, 138,76, 129,97, 129,09, 126,34, 125,54, 125,51, 66,16, 61,73, 30,57, 19,16, 13,71; ¹⁹ F ЯМР (564 МГц, CDCl ₃) δ -131,96
F281			¹ H ЯМР (600 МГц, CDCl ₃) δ 7,90 (d, J=8,4 Гц, 1H), 7,69 (d, J=8,4 Гц, 1H), 7,61 (dt, J=8,3, 1,1 Гц, 1H), 7,49 (d, J=8,4 Гц, 1H), 7,33 (t, J=52,9 Гц, 1H), 4,01 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (151 МГц, CDCl ₃) δ 164,67, 153,34, 147,89, 138,64, 137,91, 135,83, 134,12, 133,13, 130,34, 129,68, 129,41, 127,67, 113,97, 112,38, 110,78, 53,18; ¹⁹ F ЯМР (564 МГц, CDCl ₃) δ -115,26

F282		ESIMS <i>масса/заряд</i> 361,89 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (600 МГц, CDCl ₃) δ 7,88 (d, J=8,4 Гц, 1H), 7,66 (d, J=8,4 Гц, 1H), 7,49-7,39 (m, 2H), 6,37 (dq, J=46,2, 6,7 Гц, 1H), 4,01 (s, 3H), 1,79 (dd, J=22,2, 6,7 Гц, 3H); ¹⁹ F ЯМР (564 МГц, CDCl ₃) δ -176,82
F283		ESIMS <i>масса/заряд</i> 415,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (600 МГц, CDCl ₃) δ 7,91-7,80 (m, 2H), 7,67 (dd, J=8,6, 7,5 Гц, 1H), 7,43 (dd, J=8,7, 1,7 Гц, 1H), 4,44 (t, J=6,7 Гц, 2H), 3,98 (d, J=1,0 Гц, 3H), 1,87-1,75 (m, 2H), 1,57-1,41 (m, 2H), 0,99 (t, J=7,4 Гц, 3H); ¹⁹ F ЯМР (564 МГц, CDCl ₃) δ -131,36
F284		ESIMS <i>масса/заряд</i> 316,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (600 МГц, CDCl ₃) δ 8,04 (d, J=8,0 Гц, 1H), 7,98-7,85 (m, 2H), 7,42 (d, J=8,0 Гц, 1H), 4,02 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (151 МГц, CDCl ₃) δ 164,62, 151,66, 150,69, 148,10, 147,87, 142,75, 138,83, 132,47, 130,51, 127,27, 123,58, 53,18
F285		ESIMS <i>масса/заряд</i> 359,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (600 МГц, CDCl ₃) δ 7,96 (td, J=8,3, 1,1 Гц, 1H), 7,87 (d, J=1,1 Гц, 2H), 7,31 (dt, J=8,6, 1,2 Гц, 1H), 6,00-5,86 (m, 1H), 4,03 (s, 3H), 2,35-2,19 (m, 1H), 2,10-1,93 (m, 1H), 1,04 (t, J=7,5 Гц, 3H); ¹⁹ F ЯМР (564 МГц, CDCl ₃) δ -116,23, -181,88
F286		ESIMS <i>масса/заряд</i> 357,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (600 МГц, CDCl ₃) δ 7,90-7,80 (m, 2H), 7,73 (dd, J=8,7, 7,7 Гц, 1H), 7,27 (d, J=8,4 Гц, 1H), 4,40 (t, J=6,7 Гц, 2H), 3,99 (d, J=0,9 Гц, 3H), 1,84 (q, J=7,0 Гц, 2H), 1,05 (t, J=7,4 Гц, 3H); ¹⁹ F ЯМР (564 МГц, CDCl ₃) δ -131,99

F287		ESIMS <i>масса/заряд</i> 306 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (600 МГц, CDCl ₃) δ 7,80 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,72-7,66 (m, 2H), 7,64 (dd, <i>J</i> =8,1, 1,8 Гц, 1H), 6,94 (t, <i>J</i> =7,9 Гц, 1H), 4,03 (s, 3H), 2,13 (ddd, <i>J</i> =8,5, 5,2, 3,3 Гц, 1H), 1,07-0,98 (m, 2H), 0,83-0,72 (m, 2H); ¹⁹ F ЯМР (564 МГц, CDCl ₃) δ -119,71
F288	122-124	ESIMS <i>масса/заряд</i> 377 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,89 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,76 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,72 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,46 (d, <i>J</i> =2,4 Гц, 1H), 7,33 (dd, <i>J</i> =8,5, 2,4 Гц, 1H), 4,02 (s, 3H), 3,21 (s, 3H)
F289		ESIMS <i>масса/заряд</i> 334 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (600 МГц, CDCl ₃) δ 8,26 (td, <i>J</i> =7,6, 1,8 Гц, 1H), 7,93-7,88 (m, 2H), 7,72-7,66 (m, 1H), 7,41-7,34 (m, 1H), 4,03 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (564 МГц, CDCl ₃) δ -61,30, 119,39
F290		ESIMS <i>масса/заряд</i> 349,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (600 МГц, CDCl ₃) δ 7,99 (ddd, <i>J</i> =8,3, 6,8, 1,7 Гц, 1H), 7,92-7,85 (m, 2H), 7,39 (ddt, <i>J</i> =8,3, 6,9, 1,4 Гц, 1H), 7,28 (td, <i>J</i> =8,1, 1,4 Гц, 1H), 4,03 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (564 МГц, CDCl ₃) δ -58,79, -133,60
F291		ESIMS <i>масса/заряд</i> 313,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (600 МГц, CDCl ₃) δ 7,89 (dd, <i>J</i> =12,1, 7,4 Гц, 1H), 7,86 (dd, <i>J</i> =8,6, 1,2 Гц, 1H), 7,81 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 6,75 (dd, <i>J</i> =12,4, 6,9 Гц, 1H), 4,03 (s, 3H), 3,92 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (564 МГц, CDCl ₃) δ -118,08, -139,68
F292		ESIMS <i>масса/заряд</i> 296 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (600 МГц, CDCl ₃) δ 7,82 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,72 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,68 (dd, <i>J</i> =8,2, 2,2 Гц, 1H), 7,45 (ddd, <i>J</i> =8,4, 4,2, 2,2 Гц, 1H), 7,15 (dd, <i>J</i> =10,8, 8,4 Гц, 1H), 4,03 (s, 3H), 3,98 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (564 МГц, CDCl ₃) δ -133,28

F293		ESIMS <i>масса/заряд</i> 331,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (600 МГц, CDCl ₃) δ 8,69 (t, <i>J</i> =1,6 Гц, 1H), 7,86 (t, <i>J</i> =7,9 Гц, 1H), 7,77 (t, <i>J</i> =1,3 Гц, 1H), 7,53 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 2,46 (dd, <i>J</i> =3,0, 1,6 Гц, 3H); ¹⁹ F ЯМР (564 МГц, CDCl ₃) δ -61,19, -118,37
F294		ESIMS <i>масса/заряд</i> 387,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (600 МГц, CDCl ₃) δ 7,87 (dd, <i>J</i> =9,5, 7,4 Гц, 2H), 7,75 (d, <i>J</i> =8,2 Гц, 1H), 7,07 (t, <i>J</i> =52,1 Гц, 1H); ¹³ C ЯМР (151 МГц, CDCl ₃) δ 160,75, 160,07, 159,28, 158,34, 157,46, 139,43, 139,40, 138,34, 138,23, 135,64, 135,60, 133,90, 128,96, 128,81, 126,23, 123,32, 122,32, 122,28, 122,24, 122,21, 121,50, 116,37, 111,53, 109,93, 108,34
F295		ESIMS <i>масса/заряд</i> 363,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (600 МГц, CDCl ₃) δ 7,69 (d, <i>J</i> =9,9 Гц, 1H), 7,66 (d, <i>J</i> =8,1 Гц, 1H), 7,63 (s, 1H), 7,62-7,59 (m, 1H), 4,03 (s, 3H), 3,99 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (564 МГц, CDCl ₃) δ -62,64, -115,92
F296		ESIMS <i>масса/заряд</i> 345,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (600 МГц, CDCl ₃) δ 7,87 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,80 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,70 (d, <i>J</i> =1,5 Гц, 1H), 7,64 (d, <i>J</i> =8,1 Гц, 1H), 7,54-7,50 (m, 1H), 4,04 (s, 3H), 4,00 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (564 МГц, CDCl ₃) δ -62,48
F297		ESIMS <i>масса/заряд</i> 373,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (600 МГц, CDCl ₃) δ 7,78 (d, <i>J</i> =2,2 Гц, 1H), 7,76 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,71 (d, <i>J</i> =7,9 Гц, 1H), 7,67 (d, <i>J</i> =7,7 Гц, 1H), 7,09-7,01 (m, 1H), 4,02 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (564 МГц, CDCl ₃) δ -61,54, -113,00

F298		ESIMS <i>масса/заряд</i> 313,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (600 МГц, CDCl ₃) δ 7,88 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,45 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,35-7,29 (m, 1H), 7,16 (dd, <i>J</i> =8,3, 1,4 Гц, 1H), 4,01 (s, 3H), 2,31 (d, <i>J</i> =2,7 Гц, 3H); ¹⁹ F ЯМР (564 МГц, CDCl ₃) δ -116,39
F299		ESIMS <i>масса/заряд</i> 405,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (600 МГц, CDCl ₃) δ 7,84 (t, <i>J</i> =1,1 Гц, 2H), 7,73 (dd, <i>J</i> =8,7, 7,7 Гц, 1H), 7,53-7,47 (m, 2H), 7,43-7,37 (m, 2H), 7,37-7,32 (m, 1H), 7,27 (d, <i>J</i> =1,7 Гц, 1H), 5,47 (s, 2H), 3,99 (d, <i>J</i> =0,9 Гц, 3H); ¹⁹ F ЯМР (564 МГц, CDCl ₃) δ -131,97
F300		ESIMS <i>масса/заряд</i> 457,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (600 МГц, CDCl ₃) δ 7,70 (d, <i>J</i> =7,9 Гц, 1H), 7,49-7,45 (m, 2H), 7,41-7,32 (m, 4H), 5,45 (d, <i>J</i> =1,9 Гц, 2H), 3,97 (d, <i>J</i> =1,3 Гц, 3H); ¹⁹ F ЯМР (564 МГц, CDCl ₃) δ -113,89, -125,20
F301		ESIMS <i>масса/заряд</i> 329,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (600 МГц, CDCl ₃) δ 7,64 (d, <i>J</i> =7,8 Гц, 1H), 7,34 (t, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 7,10 (dd, <i>J</i> =8,2, 0,9 Гц, 1H), 6,89 (dd, <i>J</i> =8,5, 0,9 Гц, 1H), 3,98 (s, 3H), 3,74 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (564 МГц, CDCl ₃) δ -114,28
F302		ESIMS <i>масса/заряд</i> 365,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (600 МГц, CDCl ₃) δ 7,94 (dd, <i>J</i> =8,7, 7,7 Гц, 1H), 7,89 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,86 (dd, <i>J</i> =8,5, 1,8 Гц, 1H), 7,37 (dd, <i>J</i> =8,7, 1,7 Гц, 1H), 6,80-6,42 (m, 1H), 4,03 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (564 МГц, CDCl ₃) δ -81,69, -128,66

F303		EIMS <i>масса/заряд</i> 393,9	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,80-7,69 (m, 3H), 7,05 (ddq, <i>J</i> =17,7, 11,0, 2,4 Гц, 1H), 5,78 (d, <i>J</i> =17,2 Гц, 1H), 5,50 (dd, <i>J</i> =11,0, 0,7 Гц, 1H), 4,01 (d, <i>J</i> =2,9 Гц, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -60,17, -112,77
F304		ESIMS <i>масса/заряд</i> 350 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,20-8,16 (m, 1H), 7,97 (ddd, <i>J</i> =8,3, 1,8, 0,9 Гц, 1H), 7,91 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,80 (dd, <i>J</i> =9,2, 8,2 Гц, 2H), 4,05 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (101 МГц, CDCl ₃) δ 164,87, 152,24, 148,37, 141,78, 139,49, 133,18 (d, <i>J</i> =2,1 Гц), 130,33, 129,87, 128,08 (q, <i>J</i> =5,2 Гц), 124,96, 123,03, 53,08
F305		ESIMS <i>масса/заряд</i> 367 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,18 (s, 1H), 8,00 (ddd, <i>J</i> =8,2, 1,7, 0,8 Гц, 1H), 7,80 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 7,71 (d, <i>J</i> =10,0 Гц, 1H), 4,03 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (101 МГц, CDCl ₃) δ 163,93, 158,74, 156,03, 144,00 (d, <i>J</i> =4,9 Гц), 141,09 (d, <i>J</i> =10,9 Гц), 138,10 (d, <i>J</i> =5,8 Гц), 132,92, 131,57, 131,50, 127,83 (q, <i>J</i> =5,2 Гц), 127,25, 127,04-126,47 (m), 124,04, 121,32, 53,20
F306		ESIMS <i>масса/заряд</i> 334 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,94-7,83 (m, 3H), 7,81 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,71 (t, <i>J</i> =7,7 Гц, 1H), 4,05 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (101 МГц, CDCl ₃) δ 164,86, 161,51, 158,96, 152,30 (d, <i>J</i> =2,4 Гц), 148,30, 143,11 (d, <i>J</i> =7,7 Гц), 139,50, 130,37, 128,38-127,24 (m), 122,27 (d, <i>J</i> =3,6 Гц), 115,49 (d, <i>J</i> =22,5 Гц), 53,07
F307		ESIMS <i>масса/заряд</i> 352 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,94-7,87 (m, 2H), 7,75-7,69 (m, 2H), 4,03 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (101 МГц, CDCl ₃) δ 163,90, 161,12, 158,71, 156,01, 143,90 (d, <i>J</i> =4,6 Гц), 141,03, 131,57 (d, <i>J</i> =4,6 Гц), 127,48 (d, <i>J</i> =5,3 Гц), 127,16 (d, <i>J</i> =23,8 Гц), 124,32 (dd, <i>J</i> =7,4, 3,7 Гц), 117,24 (dd, <i>J</i> =23,0, 6,2 Гц), 53,17

F308		ESIMS <i>масса/заряд</i> 330 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,96-7,92 (m, 1H), 7,90-7,83 (m, 2H), 7,80 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,70 (d, <i>J</i> =8,2 Гц, 1H), 4,05 (s, 3H), 2,57 (d, <i>J</i> =1,8 Гц, 3H); ¹³ C ЯМР (101 МГц, CDCl ₃) δ 165,10, 153,97, 148,10, 140,25, 139,24, 137,50 (d, <i>J</i> =1,9 Гц), 130,44, 129,62, 126,44 (q, <i>J</i> =5,6 Гц), 124,28, 123,12, 53,01, 19,47 (d, <i>J</i> =2,3 Гц)
F309		ESIMS <i>масса/заряд</i> 348 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,90 (s, 1H), 7,87 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 7,72 (d, <i>J</i> =8,2 Гц, 1H), 7,68 (d, <i>J</i> =9,9 Гц, 1H), 4,03 (s, 3H), 2,57 (d, <i>J</i> =1,9 Гц, 3H); ¹³ C ЯМР (101 МГц, CDCl ₃) δ 164,13, 158,64, 155,95, 143,71 (d, <i>J</i> =4,9 Гц), 142,95 (d, <i>J</i> =11,2 Гц), 137,26, 136,57 (d, <i>J</i> =5,3 Гц), 132,08 (d, <i>J</i> =5,2 Гц), 130,72 (d, <i>J</i> =4,5 Гц), 130,18 (d, <i>J</i> =30,2 Гц), 126,92, 126,68, 126,16 (t, <i>J</i> =6,2 Гц), 125,68, 53,09, 19,46 (d, <i>J</i> =2,2 Гц)
F310	100-102	ESIMS <i>масса/заряд</i> 370 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,74 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,52 (d, <i>J</i> =3,7 Гц, 2H), 4,02 (s, 3H)
F311	92-95	ESIMS <i>масса/заряд</i> 378 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,63 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,57 (d, <i>J</i> =7,8 Гц, 1H), 7,36-7,29 (m, 1H), 7,17 (d, <i>J</i> =1,4 Гц, 1H), 4,12 (q, <i>J</i> =7,0 Гц, 2H), 3,99 (s, 3H), 1,34 (t, <i>J</i> =7,0 Гц, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -62,84, -111,95, -111,97
F312		ESIMS <i>масса/заряд</i> 335 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 8,99 (s, 1H), 8,24 (t, <i>J</i> =7,8 Гц, 2H), 7,51 (dd, <i>J</i> =27,7, 9,4 Гц, 3H), 4,07 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -63,11, -110,89, -110,91, -110,92, -110,93

F313	104-106	ESIMS <i>масса/заряд</i> 347 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 8,96 (s, 1H), 7,83 (dd, <i>J</i> =8,0, 1,0 Гц, 1H), 7,33 (ddd, <i>J</i> =7,9, 1,6, 0,8 Гц, 1H), 7,26-7,22 (m, 1H), 4,04 (s, 3H), 3,92 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -62,92
F314		ESIMS <i>масса/заряд</i> 337 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,08 (d, <i>J</i> =8,7 Гц, 2H), 8,00-7,90 (m, 2H), 7,86 (d, <i>J</i> =8,1 Гц, 1H); ¹³ C ЯМР (101 МГц, CDCl ₃) δ 151,65, 142,52, 140,65, 133,77, 130,04, 129,78, 128,44 (t, <i>J</i> =5,2 Гц), 125,57, 125,01, 123,92, 121,21
F315		ESIMS <i>масса/заряд</i> 320 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,08 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,96 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,87-7,74 (m, 3H); ¹³ C ЯМР (101 МГц, CDCl ₃) δ 161,56, 161,30, 151,70 (d, <i>J</i> =2,5 Гц), 142,52, 142,44, 141,89 (d, <i>J</i> =8,2 Гц), 133,75, 128,19 (dd, <i>J</i> =4,6, 1,9 Гц), 125,50, 122,41 (d, <i>J</i> =3,7 Гц), 115,44 (d, <i>J</i> =22,6 Гц)
F316		ESIMS <i>масса/заряд</i> 316 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,04 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,96 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,88-7,80 (m, 2H), 7,77 (d, <i>J</i> =8,2 Гц, 1H), 2,61 (q, <i>J</i> =1,8 Гц, 3H); ¹³ C ЯМР (101 МГц, CDCl ₃) δ 161,17, 153,16, 142,37, 141,86, 139,02, 137,95 (d, <i>J</i> =1,8 Гц), 133,12, 130,83, 130,53, 130,30, 126,81 (q, <i>J</i> =5,6 Гц), 125,70, 125,56, 124,31, 122,84, 19,55 (d, <i>J</i> =2,2 Гц)
F317		ESIMS <i>масса/заряд</i> 332 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,05 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,95 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,76-7,69 (m, 1H), 7,56-7,49 (m, 2H), 4,03 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (101 МГц, CDCl ₃) δ 161,11, 158,24, 153,24, 142,38, 141,97, 141,01, 133,27, 129,25-127,40 (m), 125,82, 118,63, 110,36, 56,21

F318		ESIMS <i>масса/заряд</i> 324 ([M-H] ⁻)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,21 (s, 1H), 7,78 (d, <i>J</i> =8,1 Гц, 1H), 7,58 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 4,04 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -106,09, -113,71
F319	96-98	ESIMS <i>масса/заряд</i> 299 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 8,91 (s, 1H), 8,53 (dt, <i>J</i> =8,9, 0,9 Гц, 2H), 7,75-7,59 (m, 2H), 6,72 (t, <i>J</i> =56,3 Гц, 1H), 4,07 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -111,66, -111,78
F320	127-131	ESIMS <i>масса/заряд</i> 305 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 8,34 (s, 1H), 8,10 (p, <i>J</i> =1,0 Гц, 1H), 7,79 (dt, <i>J</i> =8,4, 1,7 Гц, 1H), 7,75-7,70 (m, 1H), 7,62 (d, <i>J</i> =10,2 Гц, 1H), 7,32 (dd, <i>J</i> =3,2, 2,4 Гц, 1H), 6,62-6,57 (m, 1H), 4,02 (s, 3H)
F321		EIMS <i>масса/заряд</i> 392	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,99 (s, 1H), 7,94 (s, 1H), 7,77 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 4,02 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -62,28, -112,23
F322		EIMS <i>масса/заряд</i> 413	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,12 (s, 1H), 7,97 (s, 1H), 7,78 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 4,02 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -60,16, -112,18
F323		ESIMS <i>масса/заряд</i> 352 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 8,05-7,98 (m, 1H), 7,96 (dd, <i>J</i> =8,5, 1,5 Гц, 1H), 7,92 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,44 (dd, <i>J</i> =10,4, 5,6 Гц, 1H), 4,05 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -61,79, -109,32 - -119,29 (m), -119,92 (dd, <i>J</i> =11,1, 6,7 Гц)

F324		EIMS <i>масса/заряд</i> 369,9	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,73 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,55-7,50 (m, 1H), 7,45 (dd, <i>J</i> =8,9, 5,5 Гц, 1H), 4,02 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -61,91, -113,26 (d, <i>J</i> =37,3 Гц), -116,64 (dd, <i>J</i> =9,0, 5,5 Гц), -117,53 - -119,51 (m)
F325		ESIMS <i>масса/заряд</i> 385,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 8,01 (s, 1H), 7,44 (dd, <i>J</i> =8,7, 5,5 Гц, 1H), 7,36 (dd, <i>J</i> =9,5, 5,3 Гц, 1H), 4,01 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -61,88, -115,74 (d, <i>J</i> =5,4 Гц), -117,53 - -119,29 (m)
F326		EIMS <i>масса/заряд</i> 374	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,20 (s, 1H), 7,97 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,92 (s, 1H), 7,86 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 4,05 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -62,22
F327		EIMS <i>масса/заряд</i> 341	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,07-8,02 (m, 2H), 7,56 (dd, <i>J</i> =8,4, 0,7 Гц, 1H), 4,02 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -104,96
F328	180-182	ESIMS <i>масса/заряд</i> 410 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,70-7,61 (m, 2H), 7,57 (dd, <i>J</i> =9,3, 1,6 Гц, 1H), 7,34 (t, <i>J</i> =7,8 Гц, 1H), 4,00 (s, 3H)
F329		ESIMS <i>масса/заряд</i> 378,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,02-7,97 (m, 2H), 7,89 (d, <i>J</i> =8,1 Гц, 1H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -62,32, -110,52

F330		ESIMS <i>масса/заряд</i> 356 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,99 (s, 1H), 7,71 (d, <i>J</i> =8,1 Гц, 1H), 7,58 (d, <i>J</i> =5,3 Гц, 1H), 7,47-7,40 (m, 2H), 3,99 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (126 МГц, CDCl ₃) δ 164,15, 155,81, 153,81, 151,02, 145,45, 144,09, 139,33, 134,40, 130,34, 129,03, 127,29, 124,10, 119,46, 118,71, 53,21; ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -114,30
F331		EIMS <i>масса/заряд</i> 397,1	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,72 (d, <i>J</i> =8,2 Гц, 1H), 7,68 (s, 1H), 7,08 (s, 1H), 4,01 (s, 3H), 3,93 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -62,99, -112,56
F332		EIMS <i>масса/заряд</i> 413	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,74 (s, 1H), 7,72 (d, <i>J</i> =8,2 Гц, 1H), 7,39 (s, 1H), 4,01 (s, 3H), 2,52 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -62,43, -112,62
F333		EIMS <i>масса/заряд</i> 375,1	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,61 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,19 (s, 1H), 6,79 (s, 1H), 3,99 (s, 3H), 3,80 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -50,02, -112,07
F334		EIMS <i>масса/заряд</i> 347,9	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,82 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 7,30 (d, <i>J</i> =5,5 Гц, 1H), 7,03 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -49,61, -110,96, -111,05, -115,04, -115,13

F335		EIMS <i>масса/заряд</i> 375,1	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,36 (s, 1H), 7,20 (d, <i>J</i> =5,5 Гц, 1H), 6,90 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 3,97 (s, 3H), 3,91 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -49,80, -114,66
F336		EIMS <i>масса/заряд</i> 359,1	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,31 (d, <i>J</i> =5,6 Гц, 1H), 7,20 (d, <i>J</i> =10,6 Гц, 1H), 6,93 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 3,98 (s, 3H), 3,97 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -49,85, -112,13, -116,17
F337		EIMS <i>масса/заряд</i> 382,9	¹ H ЯМР (400 МГц, Метанол- <i>d</i> ₄) δ 8,00 (d, <i>J</i> =8,7 Гц, 1H), 7,65 (s, 1H), 7,29 (s, 1H), 3,86 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, Метанол- <i>d</i> ₄) δ -64,29, -115,94
F338		ESIMS <i>масса/заряд</i> 395 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,71 (dd, <i>J</i> =8,2, 5,4 Гц, 2H), 7,47 (dt, <i>J</i> =8,1, 0,8 Гц, 1H), 6,76 (ddd, <i>J</i> =17,9, 11,8, 1,8 Гц, 1H), 5,72 (dd, <i>J</i> =11,7, 1,2 Гц, 1H), 5,52 (dq, <i>J</i> =17,7, 0,9 Гц, 1H), 4,00 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -58,46, -112,89
F339		ESIMS <i>масса/заряд</i> 383 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,70 (d, <i>J</i> =8,1 Гц, 1H), 7,67 (d, <i>J</i> =8,2 Гц, 1H), 7,39 (d, <i>J</i> =8,1 Гц, 1H), 3,99 (s, 3H), 2,58 (d, <i>J</i> =1,6 Гц, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -61,22, -113,05

F340	72-74	ESIMS <i>масса/заряд</i> 316 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 8,51-8,48 (m, 1H), 8,12 (dt, <i>J</i> =8,6, 1,7 Гц, 1H), 7,97-7,93 (m, 2H), 7,89-7,86 (m, 1H), 7,68 (d, <i>J</i> =10,0 Гц, 1H), 7,60-7,49 (m, 2H), 4,04 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -116,05, -116,07
F341		ESIMS <i>масса/заряд</i> 448 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,73 (dd, <i>J</i> =8,1, 3,3 Гц, 1H), 7,53 (d, <i>J</i> =8,1, 1 Гц, 1H), 4,00 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (101 МГц, CDCl ₃) δ 163,69, 158,07, 155,39, 142,97, 142,81, 136,90, 132,64, 132,59, 129,95, 126,64, 126,42, 125,88, 125,83, 123,65, 122,30, 120,93, 53,26
F342		ESIMS <i>масса/заряд</i> 397,9 ([M-H] ⁻)	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 8,10 (d, <i>J</i> =8,7 Гц, 1H), 7,82 (s, 1H), 7,62 (s, 1H), 2,57 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -59,84, -112,04
F343	124-126	ESIMS <i>масса/заряд</i> 378 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,70 (dd, <i>J</i> =8,3, 2,1 Гц, 2H), 7,28-7,24 (m, 3H), 7,19 (dd, <i>J</i> =9,9, 2,4 Гц, 1H), 4,01 (s, 3H), 3,21 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -108,83, -108,85, -108,87, -108,91, -108,92, -108,94, -113,57, -113,59, -113,65, -113,66
F344		EIMS <i>масса/заряд</i> 361	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 7,93 (d, <i>J</i> =8,8 Гц, 1H), 7,30 (s, 1H), 7,16 (s, 1H), 3,83 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, CDCl ₃) δ -48,27, -110,91
F345	175-177	ESIMS <i>масса/заряд</i> 298 ([M-H] ⁻)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,64 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,48 (t, <i>J</i> =8,2 Гц, 1H), 6,74 (dd, <i>J</i> =8,4, 2,5 Гц, 1H), 6,66 (dd, <i>J</i> =11,1, 2,4 Гц, 1H), 5,36 (d, <i>J</i> =1,1 Гц, 1H), 4,00 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -111,32, -111,33, -111,34, -111,36, -111,39, -111,41, -111,42, -111,44, -113,71, -113,73, -113,79, -113,81

F346	114-116	ESIMS <i>масса/заряд</i> 351 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 8,41-8,35 (m, 1H), 7,75 (d, <i>J</i> =8,2 Гц, 1H), 7,73-7,66 (m, 2H), 7,65 (ddd, <i>J</i> =8,4, 6,9, 1,2 Гц, 1H), 7,59-7,49 (m, 2H), 3,99 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -113,46, -113,48
F347	145-147	ESIMS <i>масса/заряд</i> 351 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 14,05 (s, 1H), 8,40 (d, <i>J</i> =9,1 Гц, 1H), 8,15 (d, <i>J</i> =7,5 Гц, 1H), 7,69 (d, <i>J</i> =7,5 Гц, 1H), 3,94 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, DMSO) δ -66,96, -114,64
F348	143-146	ESIMS <i>масса/заряд</i> 299 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,28 (d, <i>J</i> =9,3 Гц, 1H), 7,25 (t, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 6,52 (dd, <i>J</i> =8,4, 2,1 Гц, 1H), 6,41 (dd, <i>J</i> =13,2, 2,1 Гц, 1H), 5,92 (s, 2H), 3,91 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, DMSO) δ -114,37, -114,38, -114,39, -114,41, -114,45, -114,46, -114,47, -114,49, -114,77, -114,79, -114,85, -114,87
F349		ESIMS <i>масса/заряд</i> 411,8 ([M-H] ⁻)	¹ H ЯМР (400 МГц, Метанол- <i>d</i> ₄) δ 8,03-7,99 (m, 2H), 7,85 (s, 1H), 7,81 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, Метанол- <i>d</i> ₄) δ -64,32
F350		ESIMS <i>масса/заряд</i> 377,9 ([M-H] ⁻)	¹ H ЯМР (400 МГц, Метанол- <i>d</i> ₄) δ 8,00 (d, <i>J</i> =8,7 Гц, 1H), 7,84 (s, 1H), 7,76 (s, 1H), 7,03-6,89 (m, 1H), 5,83 (d, <i>J</i> =17,1 Гц, 1H), 5,43 (dd, <i>J</i> =11,1, 0,7 Гц, 1H); ¹⁹ F ЯМР (376 МГц, Метанол- <i>d</i> ₄) δ -61,41, -116,08
F351		ESIMS <i>масса/заряд</i> 321 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,64 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 7,56 (d, <i>J</i> =7,7 Гц, 1H), 7,39 (dd, <i>J</i> =7,7, 1,4 Гц, 1H), 7,22 (d, <i>J</i> =1,4 Гц, 1H), 3,99 (s, 3H), 3,86 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -112,17, -112,18

F352		ESIMS <i>масса/заряд</i> 354 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 7,87-7,79 (m, 2H), 7,72-7,66 (m, 1H), 7,62 (d, <i>J</i> =8,1 Гц, 1H); ¹³ C ЯМР (126 МГц, CDCl ₃) δ 161,10, 159,14, 156,98, 141,98 (d, <i>J</i> =17,3 Гц), 139,18, 135,13 (d, <i>J</i> =15,7 Гц), 135,02, 134,01 (d, <i>J</i> =58,3 Гц), 133,51, 131,95, 128,61 (d, <i>J</i> =22,0 Гц), 127,25 (d, <i>J</i> =3,7 Гц), 124,07 (q, <i>J</i> =3,8 Гц), 123,98, 121,81; ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -63,08, -110,82
F353		EIMS <i>масса/заряд</i> 358	¹ H ЯМР (500 МГц, Метанол- <i>d</i> ₄) δ 8,06 (d, <i>J</i> =8,6 Гц, 1H), 7,95 (d, <i>J</i> =8,6 Гц, 1H), 7,66 (s, 1H), 7,16 (s, 1H), 3,99 (s, 3H), 3,90 (s, 3H) ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, Метанол- <i>d</i> ₄) δ -52,44
F354	84-86	ESIMS <i>масса/заряд</i> 353 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 8,31 (ddd, <i>J</i> =8,4, 7,6, 0,8 Гц, 1H), 7,80-7,73 (m, 2H), 4,02 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -64,76, -64,78, -64,83, -64,85, -68,17, -113,08, -113,10, -113,16, -113,18
355	182-184	ESIMS <i>масса/заряд</i> 299 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,83 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,74 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,51 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 6,94 (d, <i>J</i> =2,5 Гц, 1H), 6,82 (dd, <i>J</i> =8,5, 2,5 Гц, 1H), 5,48 (s, 1H), 4,02 (s, 3H)
F356		EIMS <i>масса/заряд</i> 342	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 8,05 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,93 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,46 (s, 1H), 6,86 (s, 1H), 3,89 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -50,09
F357	136-138	ESIMS <i>масса/заряд</i> 342 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 10,40 (d, <i>J</i> =0,8 Гц, 1H), 7,68 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,65 (dd, <i>J</i> =8,1, 6,0 Гц, 1H), 7,37 (dt, <i>J</i> =8,2, 1,2 Гц, 1H), 4,00 (s, 3H), 4,00 (d, <i>J</i> =0,9 Гц, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -113,12, -113,14, -138,97

F358)		ESIMS <i>масса/заряд</i> 316 (M+H) ⁺	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,61 (d, J=8,2 Гц, 1H), 7,26 (d, 1H), 6,77 (d, J=2,3 Гц, 1H), 6,65 (dd, J=8,3, 2,3 Гц, 1H), 3,99 (s, 3H), 3,91 (s, 2H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -112,16, -112,18
F359		ESIMS <i>масса/заряд</i> 382 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (600 МГц, CDCl ₃) δ 7,65 (d, J=8,3 Гц, 1H), 7,35 (dd, J=9,9, 0,8 Гц, 1H), 7,15 (d, J=5,4 Гц, 1H), 4,00 (s, 3H), 3,85 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (564 МГц, CDCl ₃) δ -61,50, -112,15, -124,52
F360		ESIMS <i>масса/заряд</i> 366 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (600 МГц, CDCl ₃) δ 7,70 (d, J=8,3 Гц, 1H), 7,54 (d, J=6,7 Гц, 1H), 7,44 (d, J=10,0 Гц, 1H), 4,02 (s, 3H), 2,52 (dq, J=2,3, 1,1 Гц, 3H); ¹⁹ F ЯМР (564 МГц, CDCl ₃) δ -62,46, -113,52, -116,41
F361		ESIMS <i>масса/заряд</i> 348 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (600 МГц, CDCl ₃) δ 7,97 (d, J=7,5 Гц, 1H), 7,92-7,85 (m, 2H), 7,43 (d, J=11,3 Гц, 1H), 4,04 (s, 3H), 2,70-2,36 (m, 3H); ¹⁹ F ЯМР (564 МГц, CDCl ₃) δ -62,36, -119,79
F362		ESIMS <i>масса/заряд</i> 364 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (600 МГц, CDCl ₃) δ 7,65 (d, J=8,3 Гц, 1H), 7,35 (dd, J=9,9, 0,8 Гц, 1H), 7,15 (d, J=5,4 Гц, 1H), 4,00 (s, 3H), 3,85 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (564 МГц, CDCl ₃) δ -61,38, -124,40

F363	76-78	ESIMS <i>масса/заряд</i> 440 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,60 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 7,57 (dd, <i>J</i> =8,0, 0,9 Гц, 1H), 7,49-7,43 (m, 2H), 7,42-7,31 (m, 4H), 7,19 (t, <i>J</i> =1,0 Гц, 1H), 5,44 (s, 2H), 3,86 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -62,82, -112,57, -112,59
F364	43-45	ESIMS <i>масса/заряд</i> 431 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,91 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,76 (dd, <i>J</i> =8,5, 5,6 Гц, 2H), 7,44 (d, <i>J</i> =2,5 Гц, 1H), 7,32 (dd, <i>J</i> =8,6, 2,5 Гц, 1H), 4,02 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -72,55
F365		ESIMS <i>масса/заряд</i> 296 ([M-H] ⁻)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 8,01-7,94 (m, 2H), 7,60 (d, <i>J</i> =10,1 Гц, 1H), 7,03-6,97 (m, 2H), 4,01 (s, 3H), 3,87 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -116,77, -116,79
F366	126-128	ESIMS <i>масса/заряд</i> 333 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 14,59 (s, 1H), 9,21 (s, 1H), 7,79 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,48 (d, <i>J</i> =1,7 Гц, 1H), 7,45 (dd, <i>J</i> =8,2, 1,7 Гц, 1H), 3,87 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, DMSO) δ -61,19
F367		ESIMS <i>масса/заряд</i> 346 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,87 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,70 (d, <i>J</i> =8,5 Гц, 1H), 7,65-7,55 (m, 2H), 4,04 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -49,52, -134,11
F368		ESIMS <i>масса/заряд</i> 331,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 8,03 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,85 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,57-7,46 (m, 2H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -49,32, -133,12 (d, <i>J</i> =10,4 Гц)

F369		ESIMS <i>масса/заряд</i> 358 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,87-7,75 (m, 2H), 7,59 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 6,84 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 4,06 (s, 3H), 4,01 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -49,82
F370		ESIMS <i>масса/заряд</i> 381,9 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,72 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,63 (s, 1H), 7,53 (s, 1H), 4,01 (s, 3H), 2,50-2,22 (m, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -62,72, -114,72
F371		ESIMS <i>масса/заряд</i> 364 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,92 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,61 (s, 1H), 7,56 (s, 1H), 7,49 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 4,02 (s, 3H), 2,39 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -62,56
F372		EIMS <i>масса/заряд</i> 401,1	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,62 (d, <i>J</i> =8,3 Гц, 1H), 7,19 (s, 1H), 6,62 (dd, <i>J</i> =17,8, 11,3 Гц, 1H), 5,88 (dd, <i>J</i> =17,7, 0,7 Гц, 1H), 5,45 (dd, <i>J</i> =11,2, 0,8 Гц, 1H), 4,05 (s, 3H), 4,00 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -49,38, -113,26
F373		ESIMS <i>масса/заряд</i> 352 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 7,77 (dt, <i>J</i> =1,5, 0,8 Гц, 1H), 7,71-7,57 (m, 2H), 7,48 (dd, <i>J</i> =9,1, 8,1 Гц, 1H), 4,02 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (126 МГц, CDCl ₃) δ 162,29 (d, <i>J</i> =6,5 Гц), 160,77 (d, <i>J</i> =6,2 Гц), 159,41 (d, <i>J</i> =6,3 Гц), 158,56 (d, <i>J</i> =6,3 Гц), 157,25 (d, <i>J</i> =6,2 Гц), 141,93-139,65 (m), 136,62, 134,40, 133,15-133,05 (m), 133,01, 132,33, 126,84 (q, <i>J</i> =3,9 Гц), 124,14, 123,97 (q, <i>J</i> =3,7 Гц), 121,97, 113,93 (t, <i>J</i> =22,7 Гц), 53,16

F374		ESIMS <i>масса/заряд</i> 397 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 7,95 (dt, <i>J</i> =1,9, 0,6 Гц, 1H), 7,71 (ddd, <i>J</i> =8,0, 1,8, 0,7 Гц, 1H), 7,57 (d, <i>J</i> =8,0 Гц, 1H), 7,48 (dd, <i>J</i> =9,1, 8,1 Гц, 1H), 4,02 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (126 МГц, CDCl ₃) δ 162,28 (d, <i>J</i> =6,5 Гц), 160,76 (d, <i>J</i> =5,9 Гц), 159,14 (d, <i>J</i> =6,4 Гц), 158,54 (d, <i>J</i> =6,1 Гц), 156,95, 142,51, 138,65, 133,12 (d, <i>J</i> =33,3 Гц), 132,15, 129,96 (d, <i>J</i> =4,0 Гц), 124,54 (d, <i>J</i> =3,6 Гц), 123,98, 123,50, 121,81, 113,97 (t, <i>J</i> =22,7 Гц), 53,17
F375		ESIMS <i>масса/заряд</i> 336 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 7,78 (ddd, <i>J</i> =7,9, 6,9, 1,0 Гц, 1H), 7,58 (dt, <i>J</i> =8,1, 1,1 Гц, 1H), 7,53-7,43 (m, 2H), 4,02 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (126 МГц, CDCl ₃) δ 162,32 (d, <i>J</i> =6,7 Гц), 160,85, 160,68 (d, <i>J</i> =6,1 Гц), 159,67 (d, <i>J</i> =6,3 Гц), 158,83, 158,46 (d, <i>J</i> =6,3 Гц), 157,49 (d, <i>J</i> =6,0 Гц), 138,10 (dd, <i>J</i> =16,3, 4,5 Гц), 133,99 (d, <i>J</i> =8,1 Гц), 133,72 (d, <i>J</i> =8,2 Гц), 133,41 (dd, <i>J</i> =9,1, 4,6 Гц), 132,61 (d, <i>J</i> =3,1 Гц), 125,51 (d, <i>J</i> =15,4 Гц), 124,12 (d, <i>J</i> =2,6 Гц), 121,96, 121,48 (q, <i>J</i> =3,8 Гц), 114,00 (t, <i>J</i> =22,8 Гц), 113,50 (dd, <i>J</i> =25,0, 4,0 Гц), 53,13
F376		ESIMS <i>масса/заряд</i> 332 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 7,56 (ddt, <i>J</i> =7,3, 1,9, 0,7 Гц, 1H), 7,53-7,43 (m, 1H), 4,01 (s, 2H), 2,32 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (126 МГц, CDCl ₃) δ 162,44 (d, <i>J</i> =6,6 Гц), 160,16 (d, <i>J</i> =6,0 Гц), 159,15 (d, <i>J</i> =5,7 Гц), 157,95 (d, <i>J</i> =5,8 Гц), 157,00 (d, <i>J</i> =5,6 Гц), 144,24-142,69 (m), 137,99, 136,69, 133,62-132,71 (m), 131,56 (q, <i>J</i> =32,3 Гц), 130,58 (d, <i>J</i> =2,2 Гц), 127,38 (q, <i>J</i> =3,9 Гц), 125,02, 122,81 (q, <i>J</i> =3,5 Гц), 113,83 (t, <i>J</i> =22,9 Гц), 53,09, 19,72 (d, <i>J</i> =2,8 Гц)

F377		ESIMS <i>масса/заряд</i> 348 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (300 МГц, CDCl ₃) δ 7,55 (dd, <i>J</i> =7,8, 1,0 Гц, 1H), 7,39 (dd, <i>J</i> =9,3, 8,2 Гц, 1H), 7,36-7,32 (m, 1H), 7,21-7,16 (m, 1H), 4,00 (s, 3H), 3,86 (s, 3H); ¹³ C ЯМР (126 МГц, CDCl ₃) δ 162,62 (d, <i>J</i> =7,0 Гц), 160,48 (d, <i>J</i> =6,3 Гц), 159,89 (d, <i>J</i> =5,6 Гц), 158,27 (d, <i>J</i> =6,4 Гц), 157,72 (d, <i>J</i> =5,9 Гц), 157,54, 141,88-140,03 (m), 132,74-132,52 (m), 131,86, 127,00, 124,89, 122,71, 117,78 (q, <i>J</i> =4,0 Гц), 113,38 (t, <i>J</i> =23,1 Гц), 107,93 (q, <i>J</i> =3,9 Гц), 55,97, 53,02
F378	156-159	ESIMS <i>масса/заряд</i> 309 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,78 (dd, <i>J</i> =7,9, 6,8 Гц, 1H), 7,73 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,61 (dd, <i>J</i> =8,0, 1,5 Гц, 1H), 7,50 (dd, <i>J</i> =9,3, 1,5 Гц, 1H), 4,02 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -110,08, -110,10, -110,10, -110,12, -110,16, -110,17, -110,18, -110,19, -113,25, -113,27, -113,33, -113,35
F379	179-181	ESIMS <i>масса/заряд</i> 362 ([M+H] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,88 (d, <i>J</i> =4,9 Гц, 2H), 7,81-7,77 (m, 1H), 7,74 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 4,02 (s, 3H), 3,10 (s, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -109,22, -109,23, -109,24, -109,25, -109,29, -109,30, -109,31, -109,32, -113,31, -113,33, -113,39, -113,41
F380		ESIMS <i>масса/заряд</i> 475,3 ([M-F] ⁺)	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,91 (d, <i>J</i> =8,4 Гц, 1H), 7,84-7,79 (m, 2H), 7,77-7,69 (m, 3H), 7,64 (ddd, <i>J</i> =8,1, 1,7, 0,8 Гц, 1H), 7,58 (t, <i>J</i> =7,6 Гц, 1H), 7,46 (t, <i>J</i> =7,6 Гц, 1H), 5,67 (s, 2H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -59,88, -62,91

F381		HRMS-ESI (масса/заряд) [M+H] ⁺ расщ. для $C_{17}H_{12}Cl_2F_3NO_2$, 390,027; найденное значение 390,0267	¹ H ЯМР (500 МГц, CDCl ₃) δ 7,90 (d, J=8,4 Гц, 1H), 7,80 (d, J=8,3 Гц, 2H), 7,76 (d, J=1,7 Гц, 1H), 7,63 (dd, J=8,1, 1,7 Гц, 1H), 5,17-5,13 (m, 1H), 5,02 (t, J=1,5 Гц, 1H), 4,85 (s, 2H), 1,86 (t, J=1,1 Гц, 3H); ¹⁹ F ЯМР (471 МГц, CDCl ₃) δ -62,93
-------------	--	--	---

Т. пл. = точка плавления

Пример А. Оценка послевсходовой гербицидной активности

Испытание после появления всходов. Семена или орешки необходимых видов исследуемых растений высаживали в смесь для посадки Sun Gro Metro-Mix® 360, которая, как правило, характеризуется значением рН, составляющим от 6,0 до 6,8, и содержанием органического вещества, составляющим приблизительно 30 процентов, в пластиковые горшки с площадью поверхности, составляющей 64 квадратных сантиметра. В некоторых аспектах для обеспечения надлежащего прорастания и здоровых растений применяли обработку фунгицидом и/или другую химическую или физическую обработку. Растения выращивали в течение 7-21 д. в теплице с примерно 15-ч. фотопериодом, который поддерживали при 23-29°C в течение дня и 22-28°C в течение ночи. Регулярно добавляли питательные вещества и воду и при необходимости обеспечивали дополнительное освещение с помощью потолочных металлогалогенных 1000-ваттных ламп. Растения применяли для испытаний, когда они достигали первой или второй стадии настоящего листа.

Отвешенное количество, определенное по наиболее высокой норме внесения, подлежащей испытанию, каждого исследуемого соединения помещали в стеклянный сосуд объемом 25 мл и растворяли в 4 мл смеси 97:3 об./об. ацетона и DMSO с получением концентрированных исходных растворов. Если исследуемое соединение не растворялось легко, смесь нагревали и/или подвергали воздействию ультразвука. Полученные концентрированные исходные растворы разбавляли с помощью 20 мл водной смеси, содержащей ацетон, воду, изопропиловый спирт, DMSO, концентрат масляного вспомогательного средства AgriDex и поверхностно-активное вещество X-77 в соотношении 48,5:39:10:1,5:1,0:0,02 об./об., с получением растворов для опрыскивания, содержащих норму внесения. Требуемые количества соединений основаны на 12 мл объема внесения при норме, составляющей 187 литров на гектар (л/га). Составленные соединения применяли в отношении растительного материала с помощью машины для опрыскивания с нисходящей струей Mandel, оснащенной соплами 8002E, откалиброванными для доставки 187 л/га на площадь применения, составляющую 0,64 квадратного метра, при высоте распыления, составляющей 18 дюймов (43 см) выше среднего полога растений. Контрольные растения опрыскивали таким же образом с помощью холостого растворителя.

Обработанные растения и контрольные растения помещали в теплицу, как описано выше, и поливали путем подпочвенного орошения для предупреждения вымывания исследуемых соединений. Через 14 дней определяли визуально состояние исследуемых растений по сравнению с необработанными и контрольными растениями и оценивали по шкале от 0 до 100 процентов, где 0 соответствует отсутствию поражения, и 100 соответствует полному контролю. В отчете о результатах использовали таблицу А: таблицу преобразования процентного уменьшения роста. Некоторые из исследуемых соединений, используемых норм внесения, исследуемых видов растений и результатов приведены в таблице В на фигуре 3.

Таблица А. Таблица преобразования процентного уменьшения роста.

Оценка	% визуального уменьшения роста
A	95-100
B	85-94
C	75-84
D	60-74
E	45-59
F	30-44
G	0-29

ALOMY: лисохвост мышехвостниковидный (*Alopecurus myosuroides*)

AMARE: амарант запрокинутый (*Amaranthus retroflexus*)

AVEFA: овес пустой (*Avena fatua*)

CHEAL: марь белая (*Chenopodium album*)

CIRAR: бодяк полевой (*Cirsium arvense*)

CYPES: сыть съедобная (*Cyperus esculentus*)

DIGSA: ползучий сорняк (*Digitaria sanguinalis*)

ECHCG: ежовник обыкновенный (*Echinochloa crus-galli*)

IPOHE: ипомея плющевидная (*Ipomoea hederacea*)

KCHSC: кохия (*Bassia scoparia*)

ORYSA: рис (*Oryza sativa*)

SETFA: щетинник Фабера (*Setaria faberi*)

SORVU: сорго алеппское (*Sorghum vulgare*)

STEME: звездчатка средняя (*Stellaria media*)

TRZAS: яровая пшеница (*Triticum aestivum*)

г а. и./га: граммы активного ингредиента на гектар

н./т.: не тестировали

Таблица В. Визуальное уменьшение роста (%) через 14 дней после применения при норме 140 грамм активного ингредиента на гектар (г а. и./га)

Таблица В: часть А							
ID соединения	ALOM	AMAR	AVEF	CHEA	CIRA	CYPE	DIGS
	Y	E	A	L	R	S	A
F1	G	G	G	G	G	E	G
F2	G	D	G	G	G	G	B
F3	G	G	G	C	G	G	D
F4	G	G	G	B	C	G	G
F5	G	G	G	E	G	F	G
F6	G	G	G	G	D	G	G
F7	G	G	G	G	G	G	G

Таблица В: часть А							
ID соединения	ALOM	AMAR	AVEF	CHEA	CIRA	CYPE	DIGS
	Y	E	A	L	R	S	A
F8	G	A	G	A	B	E	D
F9	G	F	G	G	G	G	G
F10	G	F	G	E	F	E	E
F11	G	G	G	G	F	G	G
F12	G	B	G	A	D	D	C
F13	G	C	G	B	B	G	G
F14	G	G	G	B	G	G	G
F15	G	F	G	E	G	F	G
F16	G	F	G	G	F	G	G
F17	G	D	G	D	G	G	E
F18	G	G	G	G	G	G	G
F19	G	A	G	A	A	F	G
F20	G	G	G	G	G	G	G
F21	G	G	G	G	G	G	G
F22	G	G	G	G	G	G	G
F23	G	G	G	G	G	G	G
F24	G	B	G	A	A	G	B
F25	G	G	G	G	G	G	G
F26	G	G	G	G	G	G	G
F27	G	D	G	E	C	G	D
F28	G	D	G	D	C	G	E
F29	G	D	G	D	G	G	E
F30	D	A	E	A	B	G	B
F31	G	E	G	G	G	G	G
F32	G	D	G	D	C	G	D
F33	G	G	G	E	E	G	F
F34	G	G	G	E	G	G	G
F35	G	F	G	G	G	G	G
F36	G	G	G	G	G	G	G
F37	G	B	G	D	G	G	G
F38	G	G	G	G	G	G	G

Таблица В: часть А							
ID соединения	ALOM	AMAR	AVEF	CHEA	CIRA	CYPE	DIGS
	Y	E	A	L	R	S	A
F39	G	G	G	G	G	G	G
F40	G	G	G	G	G	G	G
F41	G	G	G	G	G	G	G
F42	G	F	G	B	D	G	G
F43	G	G	G	G	G	G	G
F44	F	A	E	A	A	G	C
F45	F	A	E	A	A	G	A
F46	G	G	G	D	G	G	G
F47	G	G	G	G	G	G	G
F48	G	D	G	A	G	G	G
F49	G	F	G	E	G	G	G
F50	G	G	G	D	G	G	G
F51	G	E	G	E	G	G	G
F52	G	G	G	G	G	G	G
F53	D	A	C	A	A	G	A
F54	G	G	G	G	G	G	G
F55	G	A	G	D	G	G	G
F56	G	G	G	G	G	G	G
F57	G	G	G	G	G	G	G
F58	F	A	E	D	A	G	B
F59	G	B	G	D	F	G	D
F60	G	D	G	G	G	G	G
F61	D	A	D	A	B	G	A
F62	G	A	G	C	C	G	C
F63	G	A	G	A	B	G	B
F64	G	E	G	D	G	D	B
F65	G	A	G	D	B	G	A
F66	E	A	D	B	A	G	A
F67	G	E	G	G	G	G	G
F68	G	G	G	G	G	н./т.	G
F69	G	G	G	G	G	G	G

Таблица В: часть А							
ID соединения	ALOM	AMAR	AVEF	CHEA	CIRA	CYPE	DIGS
	Y	E	A	L	R	S	A
F70	G	A	G	A	C	C	D
F71	G	A	G	A	C	D	C
F72	G	G	G	G	G	G	G
F73	G	G	G	A	G	G	G
F74	G	G	G	F	G	G	G
F75	G	B	G	A	F	G	G
F76	G	F	G	E	G	F	G
F77	G	н./т.	G	E	G	G	G
F78	G	E	G	C	D	G	G
F79	D	A	C	A	B	G	A
F80	G	D	G	F	G	G	G
F81	D	A	D	C	A	G	A
F82	G	A	G	D	C	C	G
F83	G	G	G	G	G	G	G
F84	G	G	G	E	G	G	F
F85	G	G	G	C	G	G	G
F86	н./т.						
F87	G	G	G	G	G	G	G
F88	D	A	G	A	B	G	B
F89	G	G	G	E	G	G	F
F90	G	C	G	C	B	G	D
F91	G	G	G	G	F	G	G
F92	G	G	G	G	G	G	F
F93	G	G	G	E	F	G	D
F94	G	G	G	G	F	G	G
F95	G	G	G	G	G	G	G
F96	G	F	G	D	F	G	G
F97	G	G	G	G	G	G	G
F98	G	G	G	G	G	G	G
F99	G	G	G	G	G	G	G
F100	G	G	G	G	E	F	G

Таблица В: часть А							
ID соединения	ALOM	AMAR	AVEF	CHEA	CIRA	CYPE	DIGS
	Y	E	A	L	R	S	A
F101	G	A	G	A	B	C	A
F102	G	E	G	D	G	G	G
F103	G	D	G	C	B	G	F
F104	G	G	G	G	G	G	D
F105	G	A	G	B	B	G	B
F106	G	E	G	F	G	G	E
F107	F	A	E	A	A	G	A
F108	G	G	G	G	G	G	G
F109	G	G	G	G	G	G	G
F110	G	B	G	C	B	G	G
F111	D	A	D	A	A	G	B
F112	D	A	A	A	A	E	B
F113	G	A	E	A	B	G	B
F114	G	G	G	G	G	G	G
F115	G	G	G	G	D	G	G
F116	F	A	E	B	B	G	B
F117	E	A	D	A	B	G	A
F118	F	A	D	A	A	E	B
F119	G	G	G	G	G	G	G
F120	G	E	G	F	D	G	G
F121	G	F	G	G	G	G	G
F122	G	A	G	D	D	G	F
F123	G	G	G	G	G	G	G
F124	E	C	F	B	C	G	B
F125	G	G	G	E	G	G	G
F126	G	A	G	B	C	G	B
F127	G	A	G	C	B	G	D
F128	G	G	G	G	G	G	G
F129	G	G	G	G	G	G	G
F130	G	B	G	C	C	G	D
F131	E	A	C	A	A	G	A

Таблица В: часть А							
ID соединения	ALOM	AMAR	AVEF	CHEA	CIRA	CYPE	DIGS
	Y	E	A	L	R	S	A
F132	G	A	G	A	B	G	C
F133	G	G	G	C	G	G	E
F134	G	G	G	G	G	G	G
F135	F	A	D	B	A	G	A
F136	G	A	G	C	G	G	D
F137	G	D	G	C	G	G	F
F138	G	B	G	D	D	G	G
F139	G	G	G	G	G	F	G
F140	G	B	G	B	E	G	B
F141	G	C	G	G	G	G	D
F142	G	D	G	F	G	G	G
F143	G	E	G	F	G	G	C
F144	G	E	G	C	G	G	G
F145	н./т.						
F146	G	G	G	G	G	G	G
F147	G	E	G	F	G	G	G
F148	G	C	G	C	G	н./т.	G
F149	G	C	G	A	D	G	G
F150	G	C	G	C	B	G	G
F151	G	A	G	A	E	G	G
F152	G	A	G	A	E	G	D
F153	D	A	D	B	B	G	B
F154	G	B	G	B	G	G	D
F155	G	D	G	C	G	G	G
F156	E	A	G	B	C	G	B
F157	G	A	E	B	B	G	B
F158	G	A	F	A	B	G	B
F159	G	D	G	E	F	G	D
F160	C	A	B	A	B	D	B
F161 (F393)	G	A	C	B	B	G	E
F162	G	A	F	A	B	G	C

Таблица В: часть А							
ID соединения	ALOM	AMAR	AVEF	CHEA	CIRA	CYPE	DIGS
	Y	E	A	L	R	S	A
F163	G	F	G	E	G	G	G
F164	D	A	D	A	B	G	A
F165	G	B	G	E	D	G	C
F166	G	A	C	B	B	G	C
F167	G	D	G	C	G	G	C
F168	G	F	G	E	G	G	D
F169	G	F	G	F	G	G	F
F170	E	A	F	A	B	D	B
F171	G	G	G	D	G	G	G
F172	F	A	F	B	D	C	B
F173	D	A	C	A	B	C	A
F174	G	B	G	B	G	G	B
F175	D	A	D	A	B	G	A
F176	G	G	G	G	G	G	G
F177	G	G	G	D	E	G	G
F178	G	G	G	G	G	G	G
F179	G	D	G	G	G	G	G
F180	G	G	G	G	G	G	G
F181	F	A	F	A	C	E	A
F182	G	C	G	B	G	F	D
F183	G	D	G	G	F	G	G
F184	G	D	G	D	E	G	D
F185	G	G	G	E	G	G	C
F186	G	C	G	B	C	E	C
F187	G	B	F	C	C	F	B
F188	G	G	G	D	E	G	F
F189	G	G	G	F	F	G	G
F190	G	A	D	A	B	G	B
F191	G	B	G	A	B	E	B
F192	G	B	G	A	C	G	B
F193	G	A	F	B	G	G	B

Таблица В: часть А							
ID соединения	ALOM	AMAR	AVEF	CHEA	CIRA	CYPE	DIGS
	Y	E	A	L	R	S	A
F194	G	G	G	F	C	G	G
F195	G	A	F	A	G	G	D
F196	G	C	G	B	G	G	G
F197	G	G	G	E	G	G	F
F198	G	G	G	G	G	G	G
F199	G	G	G	F	G	G	G
F200	E	A	D	A	A	G	A
F201	G	E	G	G	G	G	G
F202	G	G	G	G	G	G	G
F203	G	G	G	G	G	G	G
F204	G	G	G	G	G	G	G
F205	G	F	G	C	C	G	E
F206	G	E	G	F	F	G	E
F207	н./т.						
F208	G	G	G	B	G	G	G
F209	G	E	G	B	D	G	G
F210	E	A	D	B	B	G	B
F211	G	B	G	A	B	G	F
F212	G	D	G	A	B	G	F
F213	G	E	G	B	G	G	F
F214	E	C	D	A	B	G	A
F215	G	B	D	B	B	G	E
F216	G	F	G	A	D	G	G
F217	н./т.						
F218	G	G	G	D	F	G	G
F219	G	G	G	E	G	G	F
F220	н./т.						
F221	C	A	C	A	A	C	A
F222	G	C	G	C	B	G	C
F223	G	A	D	A	A	E	D
F224	G	B	G	A	E	G	C

Таблица В: часть А							
ID соединения	ALOM	AMAR	AVEF	CHEA	CIRA	CYPE	DIGS
	Y	E	A	L	R	S	A
F225	E	A	A	A	B	E	A
F226	E	D	E	A	B	G	A
F227	G	G	G	C	F	G	F
F228	G	G	G	G	G	G	G
F229	B	A	A	A	A	E	A
F230	G	A	G	A	A	G	G
F231	G	G	G	G	G	G	G
F232	G	D	G	A	B	G	A
F233	C	A	E	A	A	E	A
F234	G	G	G	F	G	G	F
F235	D	A	A	A	A	G	A
F236	G	F	G	B	B	G	C
F237	G	A	E	B	A	E	B
F238	G	E	G	A	D	G	D
F239	G	G	G	F	G	G	G
F240	G	F	G	D	G	G	A
F241	D	A	B	A	A	D	A
F242	G	G	G	D	G	G	G
F243	B	A	C	A	A	B	A
F244	G	G	G	D	G	G	G
F245	G	G	G	B	G	E	G
F246	E	A	G	A	C	D	B
F247	G	G	G	D	G	G	G
F248	G	G	G	G	G	G	D
F249	G	G	G	D	G	G	G
F250	G	G	G	C	D	G	B
F251	G	B	G	A	B	G	C
F252	G	G	G	D	G	G	F
F253	G	A	G	A	A	G	G
F254	B	A	A	A	A	D	A
F255	G	G	G	G	G	G	G

Таблица В: часть А							
ID соединения	ALOM	AMAR	AVEF	CHEA	CIRA	CYPE	DIGS
	Y	E	A	L	R	S	A
F256	G	G	G	G	G	G	G
F257	G	G	G	C	G	G	G
F258	G	D	G	C	G	F	B
F259	G	A	G	C	C	G	D
F260	G	G	G	G	G	G	G
F261	G	G	G	D	F	G	D
F262	G	G	G	F	G	G	G
F263	G	G	G	G	G	G	G
F264	G	G	G	C	F	G	G
F265	G	G	G	C	G	G	G
F266	G	G	G	G	G	G	G
F267	F	A	E	A	B	G	B
F268	G	G	G	D	F	G	G
F269	G	G	G	G	F	G	G
F270	G	E	G	B	C	E	B
F271	G	G	G	D	G	G	G
F272	G	G	G	G	G	G	G
F273	G	G	G	C	F	G	D
F274	G	G	G	G	D	G	G
F275	G	D	G	B	A	G	G
F276	G	G	G	G	G	G	G
F277	G	G	G	G	G	G	G
F278	G	G	G	G	G	G	G
F279	G	G	G	G	G	G	G
F280	G	F	G	B	F	D	G
F281	G	C	G	B	G	G	G
F282	G	E	G	B	D	G	G
F283	G	F	G	B	B	F	G
F284	G	G	G	G	F	G	G
F285	G	G	G	G	F	G	G
F286	G	G	G	C	D	G	G

Таблица В: часть А							
ID соединения	ALOM	AMAR	AVEF	CHEA	CIRA	CYPE	DIGS
	Y	E	A	L	R	S	A
F287	G	G	G	G	G	G	G
F288	G	B	G	B	A	G	C
F289	G	G	G	F	F	G	G
F290	G	G	G	G	G	D	G
F291	G	G	G	E	F	G	G
F292	G	G	G	B	D	D	G
F293	G	G	G	E	F	G	G
F294	C	A	D	B	C	G	B
F295	G	G	G	F	D	C	E
F296	G	G	G	G	D	G	G
F297	G	B	G	B	B	G	C
F298	G	F	G	C	D	G	G
F299	G	D	G	C	C	C	G
F300	G	G	G	C	E	G	G
F301	G	G	G	G	G	G	G
F302	н./т.						
F303	G	G	G	C	G	G	G
F304	G	G	G	G	G	G	F
F305	G	F	G	E	G	E	B
F306	G	F	G	G	G	E	C
F307	G	C	G	C	G	G	B
F308	G	E	G	G	G	G	G
F309	G	E	G	E	G	G	G
F310	E	A	D	A	A	C	A
F311	G	G	G	F	G	G	G
F312	G	B	G	B	B	E	B
F313	G	E	G	F	E	G	C
F314	G	G	G	F	E	G	C
F315	G	D	G	D	D	D	C
F316	G	G	G	F	F	G	G
F317	G	G	G	G	G	G	G

Таблица В: часть А							
ID соединения	ALOM	AMAR	AVEF	CHEA	CIRA	CYPE	DIGS
	Y	E	A	L	R	S	A
F318	G	D	G	D	G	G	B
F319	G	G	G	F	G	G	G
F320	G	G	G	D	F	G	G
F321	G	F	C	A	C	G	B
F322	G	D	G	C	F	G	G
F323	G	C	G	B	E	E	C
F324	F	A	F	B	н./т.	D	A
F325	G	D	G	A	B	G	C
F326	G	G	G	D	E	G	C
F327	G	F	G	F	G	G	G
F328	G	F	G	G	G	G	C
F329	G	D	D	C	B	G	C
F330	G	G	G	G	н./т.	F	G
F331	G	E	G	E	н./т.	G	G
F332	G	G	G	G	н./т.	G	G
F333	G	F	G	G	н./т.	G	D
F334	C	C	D	C	н./т.	D	A
F335	G	G	G	F	н./т.	G	G
F336	G	F	G	F	н./т.	G	D
F337	G	F	G	C	н./т.	G	E
F338	G	A	F	B	н./т.	G	D
F339	G	A	G	A	н./т.	D	G
F340	G	G	G	G	н./т.	G	G
F341	F	A	E	B	н./т.	G	B
F342	G	G	G	D	н./т.	G	G
F343	G	A	F	B	A	F	B
F344	G	G	G	F	н./т.	G	D
F345	G	G	G	G	G	G	G
F346	G	G	G	G	н./т.	G	G
F347	D	A	D	A	B	G	A
F348	G	G	G	G	н./т.	G	G

Таблица В: часть А							
ID соединения	ALOM	AMAR	AVEF	CHEA	CIRA	CYPE	DIGS
	Y	E	A	L	R	S	A
F349	D	D	D	A	н./т.	G	C
F350	G	F	G	D	н./т.	G	F
F351	G	D	G	C	G	G	F
F352	C	A	B	A	A	G	A
F353	G	G	G	E	G	G	G
F354	G	D	F	C	C	G	B
F355	G	G	G	G	C	G	G
F356	G	G	G	D	G	G	G
F357	G	G	G	G	G	G	G
F358	G	G	G	G	G	G	G
F359	F	A	C	A	C	G	F
F360	G	A	G	A	G	G	G
F361	G	E	G	B	G	G	G
F362	G	A	G	B	G	G	E
F363	G	A	B	A	B	G	G
F364	G	D	G	C	D	G	C
F365	G	G	G	G	G	G	G
F366	G	C	G	B	F	G	C
F367	G	G	G	G	G	G	C
F368	G	G	G	G	G	G	C
F369	F	D	F	F	B	G	B
F370	G	B	G	E	C	G	E
F371	G	F	G	F	G	G	E
F372	G	E	G	G	G	G	G
F373	G	A	E	A	A	G	A
F374	E	A	E	A	A	G	B
F375	E	A	D	B	B	G	B
F376	G	A	G	B	D	G	D
F377	G	A	F	B	C	D	D
F378	G	E	G	C	E	G	D
F379	G	D	G	D	G	G	D

Таблица В: часть А							
ID соединения	ALOM	AMAR	AVEF	CHEA	CIRA	CYPE	DIGS
	Y	E	A	L	R	S	A
F380	E	A	D	A	B	G	A
F381	E	B	E	A	B	G	B

Таблица В: часть В								
ID соединения	ECHC	IPOH	KCHS	ORYS	SETF	SORV	STEM	TRZA
	G	E	C	A	A	U	E	S
F1	G	G	G	G	G	G	G	G
F2	D	B	G	G	F	A	G	E
F3	G	D	G	G	G	G	G	G
F4	G	D	G	G	G	F	G	G
F5	G	F	F	G	G	F	н./т.	G
F6	G	E	E	G	G	E	G	G
F7	G	G	G	G	G	G	G	G
F8	F	A	B	G	G	B	G	F
F9	G	E	G	G	G	G	G	G
F10	G	D	G	G	G	F	G	G
F11	G	F	G	G	G	G	н./т.	G
F12	G	A	G	G	G	C	G	G
F13	G	A	D	G	G	D	G	G
F14	G	E	B	G	G	G	G	G
F15	G	A	G	G	G	G	G	G
F16	G	A	G	G	G	C	G	G
F17	G	A	G	G	G	B	G	G
F18	G	G	G	G	G	G	G	G
F19	G	A	B	G	G	F	G	G
F20	G	D	G	G	G	G	G	G
F21	G	G	G	G	G	G	G	G
F22	G	G	G	G	G	G	G	G
F23	G	F	G	G	G	G	G	G
F24	B	A	D	G	E	B	G	G
F25	G	G	G	G	G	F	G	G

Таблица В: часть В								
ID соединения	ЕСНС G	ІРОН E	КСНС C	ОРYS A	SETF A	SORV U	STEM E	TRZA S
F88	C	C	E	G	B	B	G	F
F89	G	G	G	G	G	G	G	G
F90	G	C	F	G	E	D	G	G
F91	G	F	G	G	G	G	G	G
F92	G	F	G	G	G	G	G	G
F93	G	D	G	G	G	G	G	G
F94	G	D	G	G	G	G	G	G
F95	G	E	G	G	G	G	G	G
F96	G	C	G	G	E	D	G	G
F97	G	G	G	G	G	G	G	G
F98	G	G	G	G	G	G	G	G
F99	G	G	G	G	G	G	G	G
F100	G	F	G	G	G	F	G	G
F101	B	A	A	G	C	A	G	D
F102	G	D	G	G	G	D	G	G
F103	G	A	C	G	D	C	G	G
F104	G	D	G	G	G	D	G	G
F105	D	A	D	G	D	C	G	G
F106	G	E	G	G	G	F	G	G
F107	G	A	D	G	E	A	G	E
F108	G	F	G	G	G	G	н./т.	G
F109	G	G	G	G	G	G	н./т.	G
F110	G	A	G	G	G	D	н./т.	G
F111	A	A	A	G	C	B	н./т.	C
F112	C	A	A	G	D	A	н./т.	D
F113	C	A	D	F	C	B	G	G
F114	G	F	G	G	G	G	G	G
F115	G	F	н./т.	G	G	G	G	G
F116	C	B	C	G	D	B	G	D
F117	B	A	A	G	A	A	G	B
F118	B	A	A	D	D	B	G	G

Таблица В: часть В								
ID соединения	ЕСНС G	ІРОН E	КСНС C	ОРЫС A	SETF A	SORV U	STEM E	TRZA S
F119	G	G	G	G	G	G	G	G
F120	G	F	D	G	G	G	G	G
F121	G	G	G	G	G	G	G	G
F122	E	A	C	G	B	C	G	G
F123	G	F	G	G	G	G	G	G
F124	C	A	E	G	F	C	G	D
F125	G	F	G	G	G	G	G	G
F126	D	A	D	G	D	C	G	C
F127	G	E	C	G	C	D	G	G
F128	G	G	G	G	G	G	G	G
F129	G	G	G	G	G	G	G	G
F130	G	F	D	G	D	F	G	G
F131	D	A	A	F	B	B	G	D
F132	D	A	C	G	C	B	G	G
F133	G	E	G	G	G	D	G	G
F134	G	G	G	G	G	G	G	G
F135	E	A	B	G	B	A	G	E
F136	G	A	E	G	G	C	G	G
F137	G	A	G	G	G	D	G	G
F138	G	C	D	G	G	G	G	G
F139	G	G	G	G	G	G	G	G
F140	G	A	G	G	C	B	G	G
F141	G	G	D	G	G	G	G	G
F142	G	D	G	G	G	D	G	G
F143	G	C	G	G	G	D	G	G
F144	G	C	G	G	G	G	G	G
F145	н./т.							
F146	G	F	G	G	G	G	G	G
F147	G	F	G	G	G	G	G	G
F148	G	F	G	G	G	G	G	G
F149	G	F	C	G	G	G	G	G

Таблица В: часть В								
ID соединения	ЕСНС G	ІРОН E	КСНС C	ОРЫС A	SETF A	SORV U	STEM E	TRZA S
F181	D	A	D	G	F	A	G	E
F182	G	A	E	G	D	B	G	G
F183	G	C	G	G	G	G	G	G
F184	B	A	G	F	B	A	G	F
F185	G	C	G	G	F	D	G	G
F186	D	A	C	G	B	B	G	F
F187	E	A	E	G	C	A	G	F
F188	G	F	G	G	G	G	G	G
F189	G	D	G	G	G	G	G	G
F190	A	A	C	F	A	A	G	D
F191	C	A	D	G	B	B	G	G
F192	C	A	D	G	C	B	G	G
F193	B	A	G	G	C	A	G	G
F194	E	A	G	G	G	E	G	G
F195	C	A	D	F	D	B	G	E
F196	G	A	D	G	G	E	G	G
F197	G	D	G	G	G	F	G	G
F198	G	D	G	G	G	G	G	G
F199	G	G	G	G	G	G	G	G
F200	C	A	A	G	B	A	F	C
F201	G	G	G	G	G	G	G	G
F202	G	G	G	G	G	G	G	G
F203	G	F	G	G	G	G	G	G
F204	G	F	G	G	G	G	G	G
F205	E	A	G	G	C	C	G	G
F206	G	A	F	C	C	C	G	G
F207	н./т.							
F208	G	G	G	G	G	G	G	G
F209	G	B	G	G	G	G	G	G
F210	D	A	C	G	B	A	G	E
F211	D	A	C	G	E	D	G	G

Таблица В: часть В								
ID соединения	ЕСНС G	ІРОН E	КСНС C	ОРYS A	SETF A	SORV U	STEM E	TRZA S
F212	C	A	D	G	D	D	G	G
F213	G	A	D	G	F	D	G	G
F214	G	A	C	G	C	B	F	C
F215	B	A	C	G	A	A	F	E
F216	G	A	F	G	D	D	G	E
F217	н./т.							
F218	G	G	G	G	G	G	G	G
F219	G	E	G	G	G	D	G	G
F220	н./т.							
F221	B	A	B	G	B	A	G	C
F222	D	A	E	G	F	C	G	E
F223	C	A	A	F	B	B	D	C
F224	G	A	E	E	E	D	G	G
F225	A	A	A	B	A	A	E	C
F226	D	A	D	G	B	B	G	E
F227	G	D	G	G	G	D	G	G
F228	G	G	G	G	G	G	G	G
F229	B	A	A	G	B	A	E	B
F230	D	A	A	G	F	D	G	G
F231	G	G	G	G	G	G	G	G
F232	C	A	E	G	C	B	E	E
F233	E	A	B	G	B	B	E	D
F234	G	D	G	G	G	G	G	G
F235	A	A	A	E	A	A	B	A
F236	G	A	C	G	C	C	E	G
F237	F	A	B	G	C	B	F	E
F238	G	C	G	G	E	D	G	G
F239	G	C	G	G	G	D	G	G
F240	G	A	G	G	G	C	G	G
F241	D	A	A	G	A	A	G	C
F242	G	G	G	G	G	C	G	G

Таблица В: часть В								
ID соединения	ЕСНС G	ІРОН E	КСНС C	ОРYS A	SETF A	SORV U	STEM E	TRZA S
F243	A	A	C	G	A	A	G	B
F244	G	G	G	G	G	G	G	G
F245	G	B	G	G	G	C	G	G
F246	G	A	C	G	C	A	G	G
F247	G	G	G	G	G	G	G	G
F248	G	F	G	G	G	G	G	G
F249	G	G	G	G	G	G	G	G
F250	G	A	G	G	E	B	G	E
F251	G	A	D	G	B	B	G	G
F252	G	F	G	G	G	E	G	G
F253	D	A	A	G	G	E	G	G
F254	A	A	B	C	A	A	A	A
F255	G	G	G	G	G	G	G	G
F256	G	G	G	G	G	G	G	G
F257	G	B	G	G	G	G	G	G
F258	G	A	G	G	G	C	G	G
F259	E	A	D	G	C	B	G	E
F260	G	G	G	G	G	G	G	G
F261	G	C	G	G	G	G	G	G
F262	G	F	G	G	G	G	G	G
F263	G	G	G	G	G	G	G	G
F264	G	A	G	G	G	G	G	G
F265	G	G	G	G	G	G	G	G
F266	G	G	G	G	G	G	G	G
F267	C	A	D	G	B	A	G	D
F268	G	G	G	G	G	D	G	G
F269	G	G	F	G	G	G	G	G
F270	G	A	C	G	G	B	F	E
F271	G	G	G	G	G	G	G	G
F272	G	G	G	G	G	G	G	G
F273	G	C	G	G	G	C	G	G

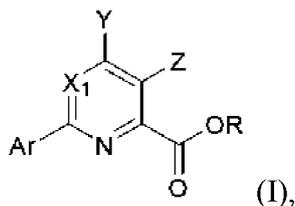
Таблица В: часть В								
ID соединения	ЕСНС G	ІРОН E	КСНС C	ОРЫС A	SETF A	SORV U	STEM E	TRZA S
F274	G	G	G	G	G	G	G	G
F275	G	A	B	G	E	E	G	G
F276	G	G	G	G	G	G	G	G
F277	G	G	G	G	G	G	G	G
F278	G	G	G	G	G	G	G	G
F279	G	G	G	G	G	G	G	G
F280	G	F	D	G	G	G	G	G
F281	G	B	G	G	F	B	G	G
F282	G	E	G	G	G	G	G	G
F283	G	G	C	G	G	G	G	G
F284	G	D	G	G	G	B	G	G
F285	G	G	G	G	G	G	G	G
F286	G	D	D	G	G	G	G	G
F287	G	D	G	G	G	G	G	G
F288	D	A	C	G	D	B	G	F
F289	G	E	G	G	G	G	G	G
F290	G	C	G	G	G	G	G	G
F291	G	G	G	G	G	G	G	G
F292	G	F	E	G	G	G	G	G
F293	G	G	G	G	G	G	G	G
F294	D	A	C	G	B	A	G	D
F295	G	D	G	G	G	G	G	G
F296	G	E	G	G	G	G	G	G
F297	G	A	E	G	D	D	G	G
F298	G	A	G	G	C	C	G	G
F299	G	D	C	G	G	G	D	G
F300	G	D	F	G	G	G	G	G
F301	G	G	G	G	G	G	G	G
F302	н./т.							
F303	G	A	G	G	G	G	G	G
F304	G	A	G	G	G	G	G	G

Таблица В: часть В								
ID соединения	ЕСНС G	ІРОН E	КСНС C	ОРЫС A	SETF A	SORV U	STEM E	TRZA S
F336	G	G	G	G	G	C	G	F
F337	D	A	B	G	B	C	G	F
F338	G	A	E	G	C	B	G	F
F339	G	A	B	G	G	D	G	G
F340	G	G	G	G	G	G	G	G
F341	G	A	D	G	B	A	F	E
F342	G	B	B	G	F	F	G	F
F343	B	A	B	F	B	A	G	D
F344	G	A	E	G	D	C	G	E
F345	G	G	G	G	G	G	G	G
F346	G	F	G	G	G	G	G	G
F347	B	A	B	F	B	B	G	C
F348	G	G	G	G	G	G	G	G
F349	G	A	B	G	C	B	G	B
F350	G	B	B	G	G	G	G	G
F351	F	A	F	G	C	C	G	G
F352	A	A	B	B	A	A	D	A
F353	G	A	G	G	G	E	G	G
F354	C	A	D	G	C	B	G	D
F355	G	G	G	G	G	G	G	G
F356	G	A	G	G	G	F	G	G
F357	G	G	G	G	G	G	G	G
F358	G	G	G	G	G	G	G	G
F359	A	A	B	G	A	B	G	D
F360	G	A	E	G	G	G	G	G
F361	G	C	G	G	G	G	G	G
F362	G	A	F	G	D	B	G	G
F363	A	A	C	F	B	A	F	C
F364	G	B	G	G	D	B	G	G
F365	G	G	G	G	G	G	G	G
F366	C	A	G	G	C	C	G	G

Таблица В: часть В								
ID	ЕСНС	ІРОН	КСНС	ОРYS	SETF	SORV	STEM	TRZA
соединения	G	E	C	A	A	U	E	S
F367	G	A	G	G	G	G	G	G
F368	G	A	G	G	E	C	G	G
F369	E	A	F	G	D	B	G	D
F370	G	A	G	G	D	B	G	G
F371	G	A	G	G	G	C	G	G
F372	G	A	G	G	G	F	G	G
F373	C	A	C	G	C	A	F	F
F374	C	A	C	E	B	A	G	D
F375	B	A	D	G	B	B	G	C
F376	G	A	E	G	D	B	G	G
F377	D	A	D	G	C	B	G	G
F378	G	A	E	G	D	C	G	G
F379	C	A	B	G	C	C	G	D
F380	C	A	C	G	A	A	G	D
F381	B	A	A	G	B	B	G	D

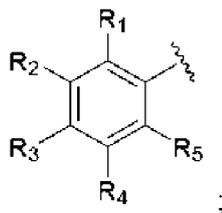
ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Соединение формулы (I):



где

Ar представляет собой



X₁ представляет собой N или CR₆;

R представляет собой водород, замещенный либо незамещенный алкил, замещенный либо незамещенный фенил, замещенный либо незамещенный бензил, замещенный либо незамещенный пиридинилметил, замещенный либо незамещенный алкенил или замещенный либо незамещенный алкинил;

R₁, R₂, R₃, R₄ и R₅ независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, галогена, гидроксигруппы, замещенного либо незамещенного алкила, замещенного либо незамещенного галогеналкила, замещенного либо незамещенного алкенила, замещенного либо незамещенного галогеналкенила, замещенного либо незамещенного алкинила, замещенного либо незамещенного циклоалкила, замещенного либо незамещенного галогенциклоалкила, замещенного либо незамещенного арила, замещенного либо незамещенного арилокси, замещенного либо незамещенного алкокси, замещенного либо незамещенного галогеналкокси, замещенного либо незамещенного алкилсульфанила, замещенного либо незамещенного галогеналкилсульфанила, замещенного либо незамещенного алкилсульфинила, замещенного либо незамещенного галогеналкилсульфинила, замещенного либо незамещенного алкилсульфонил(окси), замещенного либо незамещенного галогеналкилсульфонил(окси), амино, алкиламино, диалкиламино, амидо, формила, 2,2-диметилгидразоно, метоксиимино, гидроксимино, алкилкарбонила, алкоксикарбонила, нитро и циано, или R₁ и R₂, R₂ и R₃, R₃ и R₄ или R₄ и R₅ вместе могут образовывать замещенное либо незамещенное 5- или 6-членное алифатическое или ароматическое кольцо, содержащее 0-3 гетероатома, выбранных из группы, состоящей из O, N и S;

R₆ представляет собой водород, галоген, замещенный либо незамещенный алкил, замещенный либо незамещенный галогеналкил, замещенный либо незамещенный алкинил, замещенный либо незамещенный алкокси, замещенный либо незамещенный

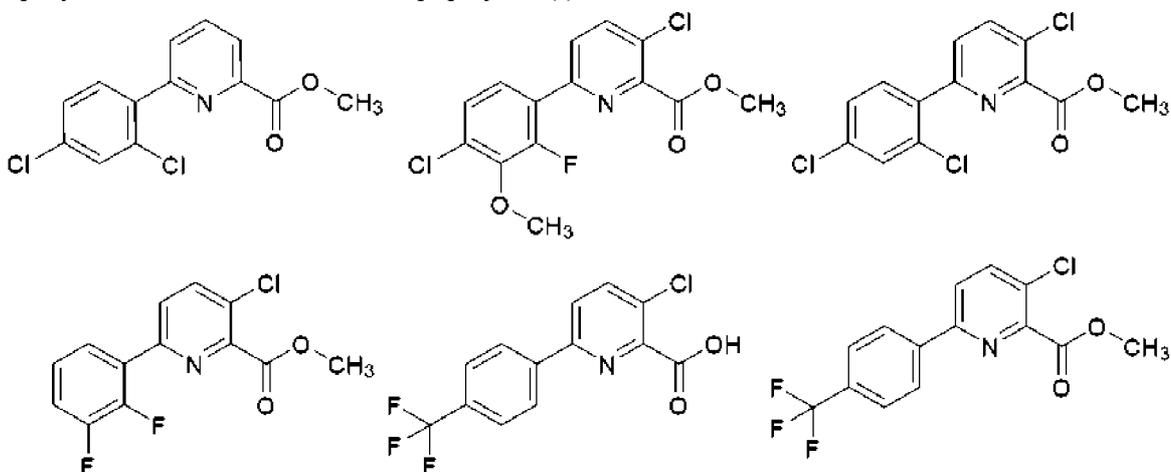
алкилсульфанил, гидрокси, amino, циано или ациламино;

Y выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, замещенного либо незамещенного алкила, замещенного либо незамещенного галогеналкила, замещенного либо незамещенного алкенила, замещенного либо незамещенного галогеналкенила, замещенного либо незамещенного алкинила, замещенного либо незамещенного алкокси, замещенного либо незамещенного галогеналкокси, замещенного либо незамещенного алкилсульфанила, замещенного либо незамещенного алкилсульфинила, замещенного либо незамещенного алкилсульфонила, нитро и циано;

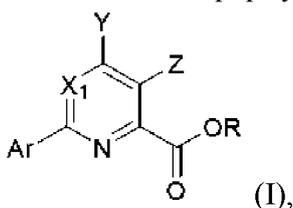
Z выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, алкила, галогеналкила, алкинила, алкокси, галогеналкокси, алкилсульфанила, amino, нитро и циано;

при условии, что если $X_1=N$, то Y не является алкокси;

при условии, что соединение формулы (I) является отличным от

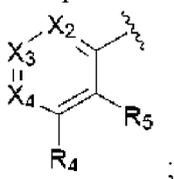


2. Соединение формулы (I):



где

Ag представляет собой



X_1 представляет собой N или CR_6 ;

X_2 представляет собой N или CR_1 ;

X_3 представляет собой N или CR_2 ;

X_4 представляет собой N или CR_3 ;

R представляет собой водород, замещенный либо незамещенный алкил, фенил,

замещенный либо незамещенный бензил, замещенный либо незамещенный пиридинилметил, замещенный либо незамещенный алкенил или замещенный либо незамещенный алкинил;

R_1, R_2, R_3, R_4 и R_5 независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, галогена, гидроксигруппы, замещенного либо незамещенного алкила, замещенного либо незамещенного галогеналкила, замещенного либо незамещенного алкенила, замещенного либо незамещенного галогеналкенила, замещенного либо незамещенного алкинила, замещенного либо незамещенного циклоалкила, замещенного либо незамещенного галогенциклоалкила, замещенного либо незамещенного арила, замещенного либо незамещенного арилокси, замещенного либо незамещенного алкокси, замещенного либо незамещенного галогеналкокси, замещенного либо незамещенного алкилсульфанила, замещенного либо незамещенного галогеналкилсульфанила, замещенного либо незамещенного алкилсульфинила, замещенного либо незамещенного галогеналкилсульфинила, замещенного либо незамещенного алкилсульфонила, замещенного либо незамещенного галогеналкилсульфонила, замещенного либо незамещенного алкилсульфонил(окси), замещенного либо незамещенного галогеналкилсульфонил(окси), амина, алкиламина, диалкиламина, амидо, формила, 2,2-диметилгидразона, метоксиимино, гидроксимино, алкилкарбонила, алкоксикарбонила, нитро и циано, или R_1 и R_2, R_2 и R_3, R_3 и R_4 или R_4 и R_5 вместе могут образовывать замещенное либо незамещенное 5- или 6-членное алифатическое или ароматическое кольцо, содержащее 0-3 гетероатома, выбранных из группы, состоящей из O, N и S;

R_6 представляет собой водород, галоген, замещенный либо незамещенный алкил, замещенный либо незамещенный галогеналкил, замещенный либо незамещенный алкинил, замещенный либо незамещенный алкокси, замещенный либо незамещенный алкилсульфанил, гидроксигруппы, амина, циано или ациламино;

Y выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, замещенного либо незамещенного алкила, замещенного либо незамещенного галогеналкила, замещенного либо незамещенного алкенила, замещенного либо незамещенного галогеналкенила, замещенного либо незамещенного алкинила, замещенного либо незамещенного алкокси, замещенного либо незамещенного галогеналкокси, замещенного либо незамещенного алкилсульфанила, замещенного либо незамещенного алкилсульфинила, замещенного либо незамещенного алкилсульфонила, нитро и циано; и

Z выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, алкила, галогеналкила, алкинила, алкокси, галогеналкокси, алкилсульфанила, амина, нитро и циано;

при условии, что если X_1 представляет собой N, то Y не является алкокси.

3. Соединение по п. 268, где R выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_8 алкила, замещенного C_1 - C_8 алкила, C_2 - C_8 алкенила, C_2 - C_8 алкинила, бензила, замещенного бензила и пиридинилметила.

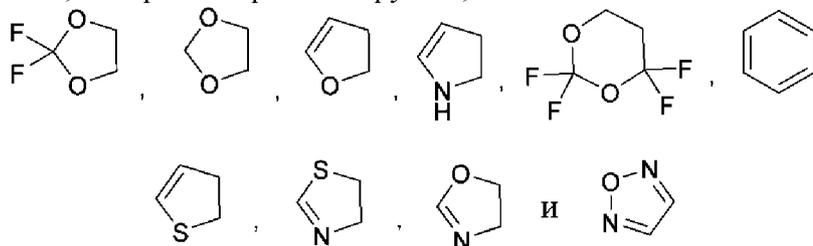
4. Соединение по п. 268, где R_1 или R_5 выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, циано, амина, амидо, нитро, C_1 - C_8 алкила, C_1 - C_8 галогеналкила, C_2 - C_8 алкенила, C_2 -

C_8 алкинила, C_1 - C_8 алкокси, C_1 - C_8 алкилсульфанила, C_1 - C_8 алкилсульфинила, C_1 - C_8 алкилсульфонила, формила.

5. Соединение по п. 268, где R_2 или R_4 выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, нитро, C_1 - C_8 алкила, C_1 - C_8 галогеналкила, C_1 - C_8 алкокси, C_1 - C_8 алкилсульфанила и C_1 - C_8 алкилсульфинила.

6. Соединение по п. 268, где R_3 выбран из группы, состоящей из галогена, замещенного либо незамещенного галогеналкила, замещенного либо незамещенного циклоалкила, замещенного либо незамещенного галогенциклоалкила, замещенного либо незамещенного галогеналкилсульфанила, замещенного либо незамещенного алкилсульфонил(окси) и циано.

7. Соединение по п. 268, где R_1 и R_2 , R_2 и R_3 , R_3 и R_4 или R_4 и R_5 вместе могут образовывать замещенное либо незамещенное 5- или 6-членное алифатическое или ароматическое кольцо, содержащее 0-3 гетероатома, выбранных из группы, состоящей из O, N, или S, которое выбрано из группы, состоящей из



8. Соединение по п. 2, где R выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_8 алкила, замещенного C_1 - C_8 алкила, C_2 - C_8 алкенила, C_2 - C_8 алкинила, бензила, замещенного бензила и пиридинилметила.

9. Соединение по п. 2, где R_1 , R_2 , R_3 , R_4 и R_5 независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, галогена, циано, amino, амидо, нитро, C_1 - C_8 алкила, C_1 - C_8 галогеналкила, C_2 - C_8 алкенила, C_2 - C_8 алкинила, C_1 - C_8 алкокси, C_1 - C_8 алкилсульфанила, C_1 - C_8 алкилсульфинила, C_1 - C_8 алкилсульфонила и формила.

10. Соединение по п. 268, где R_2 или R_4 выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, нитро, C_1 - C_8 алкила, C_1 - C_8 галогеналкила, C_1 - C_8 алкокси, C_1 - C_8 алкилсульфанила и C_1 - C_8 алкилсульфинила.

11. Соединение по п. 268, где R выбран из группы, состоящей из водорода, метила, цианометила, 2-метилаллила, пропаргила, бензила, замещенного бензила и пиридинилметила;

R_1 или R_5 выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, циано, (C_1-C_4) алкила и (C_1-C_4) алкокси;

R_2 или R_4 выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, (C_2-C_4) алкинила и (C_1-C_4) галогеналкила;

R_3 выбран из группы, состоящей из галогена, замещенного (C_3-C_6) циклоалкила, (C_1-C_4) галогеналкилсульфанила, (C_1-C_4) галогеналкила и (C_1-C_4) галогеналкокси, или R_1 и R_2 , R_2 и R_3 , R_3 и R_4 или R_4 и R_5 вместе могут образовывать замещенное либо незамещенное 5- или

6-членное алифатическое или ароматическое кольцо, содержащее 0-3 гетероатома, выбранных из группы, состоящей из O, N и S;

R₆ выбран из группы, состоящей из водорода, галогена и гидроксид;

Y представляет собой H; и

Z представляет собой галоген.

Соединение по п. 2, где R выбран из группы, состоящей из водорода, метила, цианометила, 2-метилаллила, пропаргила, бензила, замещенного бензила и пиридинилметила;

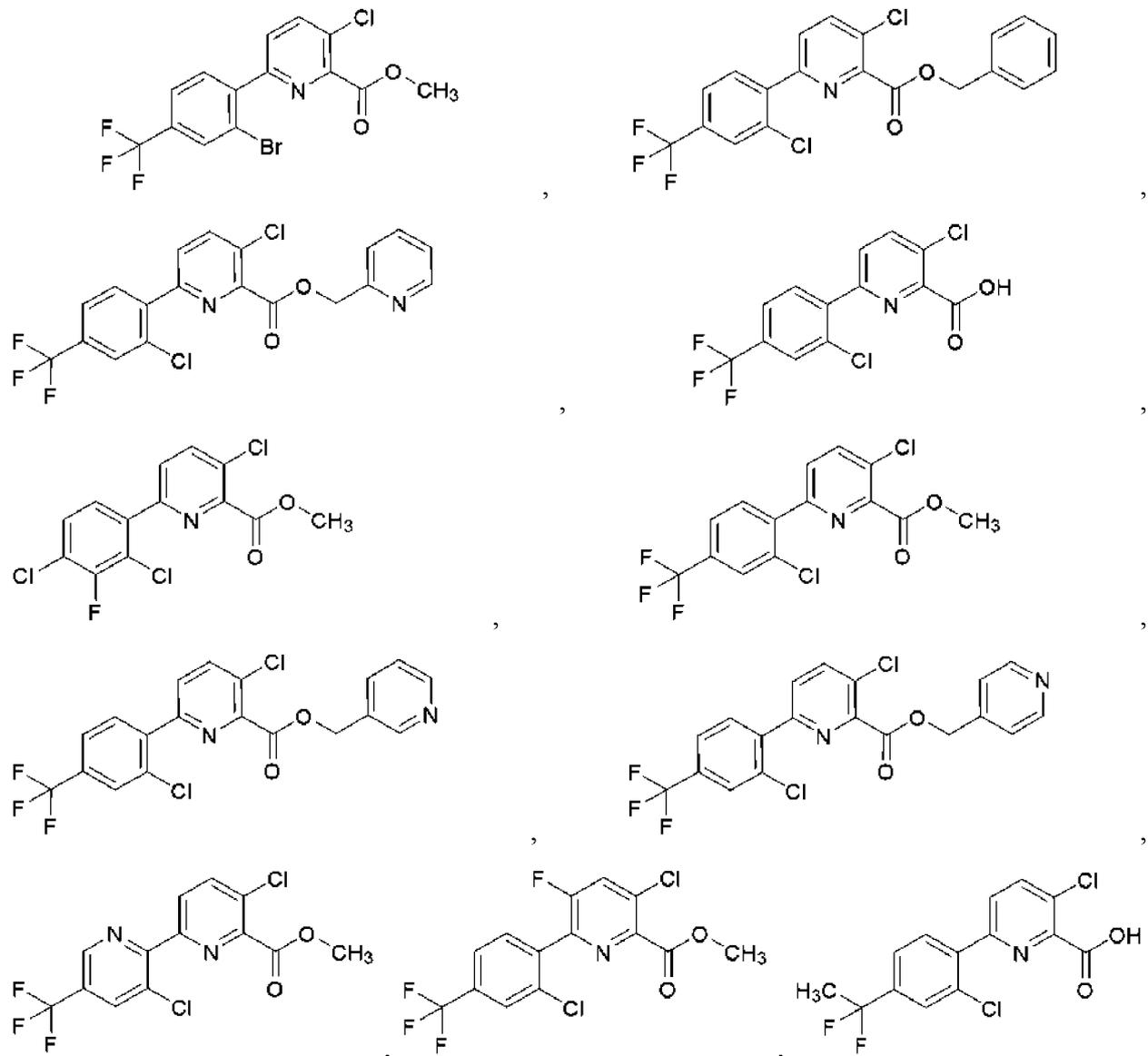
R₁, R₂, R₃, R₄ и R₅ независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, галогена, (C₁-C₄)галогеналкила и (C₁-C₄)алкокси;

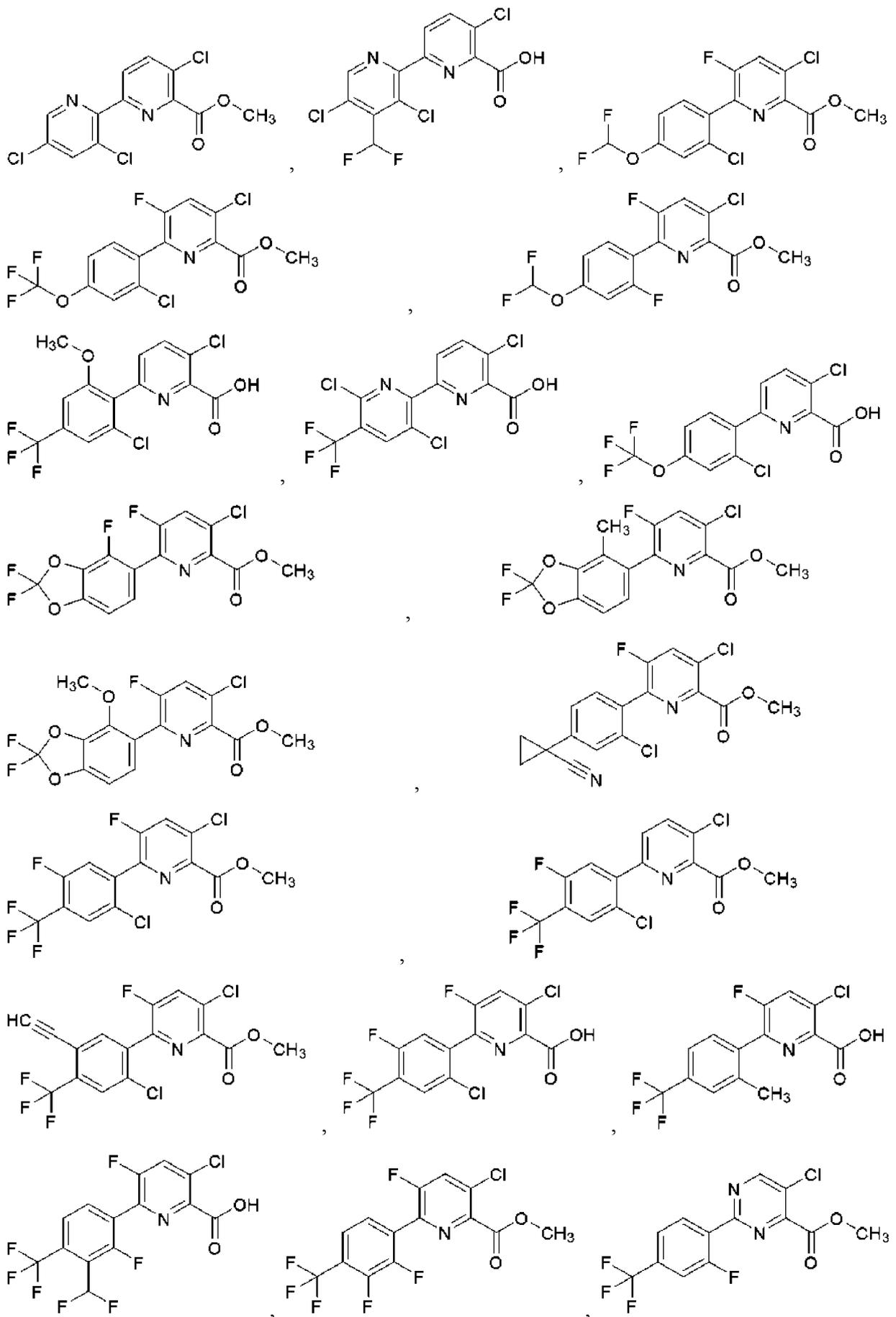
R₆ выбран из группы, состоящей из водорода, галогена и гидроксид;

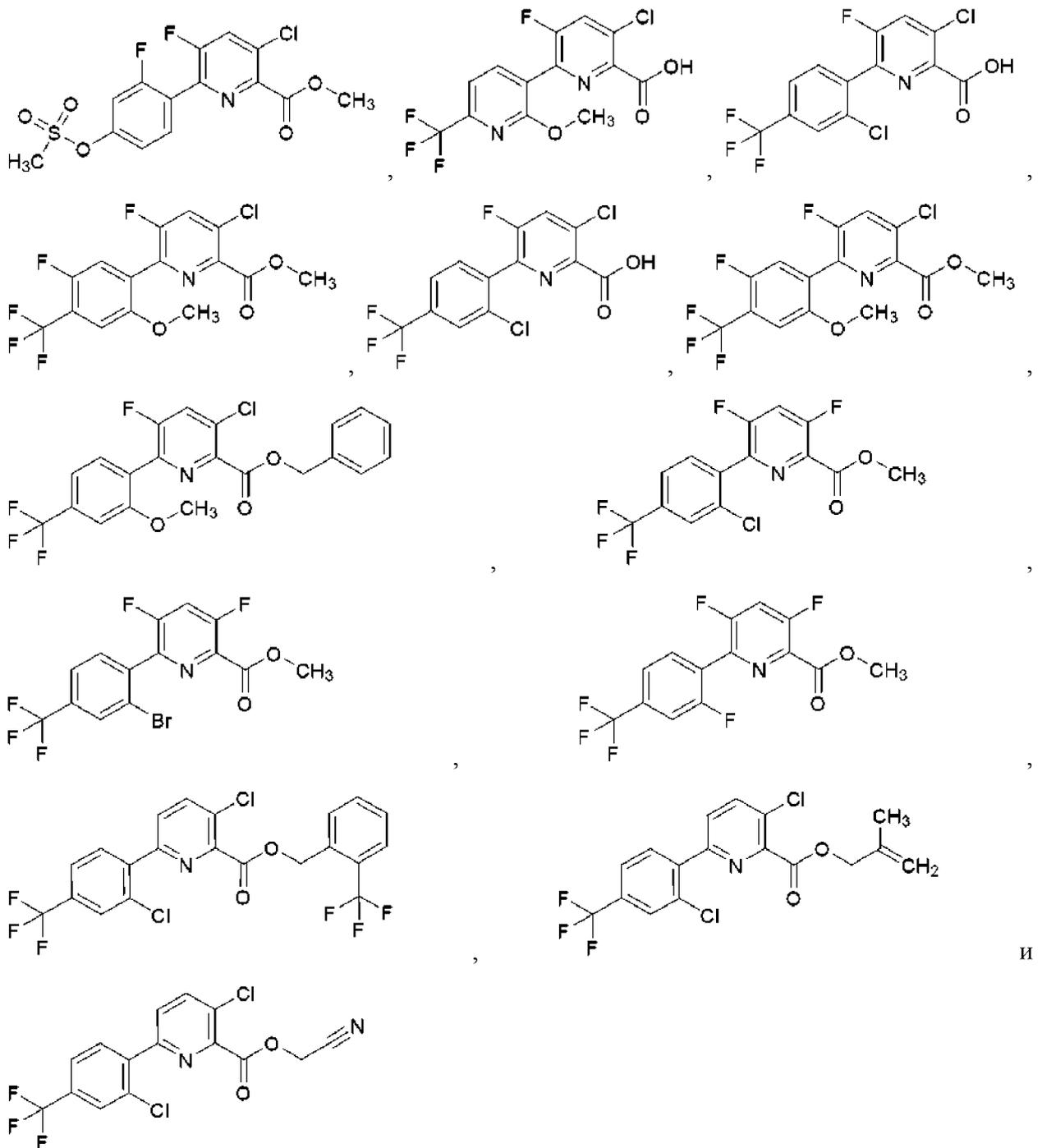
Y представляет собой H; и

Z представляет собой галоген.

12. Соединение по п. 268 или п. 269, выбранное из группы, состоящей из







13. Композиция, содержащая соединение по любому из предыдущих пунктов, дополнительно содержащая приемлемые с точки зрения сельского хозяйства вспомогательное вещество или носитель.

14. Композиция, содержащая соединение по любому из предыдущих пунктов, дополнительно содержащая дополнительное гербицидное соединение.

15. Композиция, содержащая соединение по любому из предыдущих пунктов, дополнительно содержащая антидот.

16. Композиция или гербицидная композиция по любому из пп. 1-15, где R представляет собой H, алкил, замещенный алкил, бензил и алкинил.

17. Композиция или гербицидная композиция по любому из пп. 1-16, где R₁

представляет собой циано, C₁-C₄алкил, C₂-C₄алкинил или замещенный фенил.

18. Композиция или гербицидная композиция по любому из пп. 1-17, где R₁ представляет собой метил, этинил, 4-хлорфенил или 2,4-дихлорфенил.

19. Композиция или гербицидная композиция по любому из пп. 1-8, где R₄ представляет собой циано, трифторметил или фтор.

20. Способ осуществления контроля нежелательной растительности, который предусматривает (а) приведение в контакт нежелательной растительности или области, прилегающей к нежелательной растительности, или (b) предвсходное приведение в контакт почвы или воды с соединением по п. 1 или п. 2 или с гербицидной композицией по п. 3 или п. 4.

21. Способ по п. 20, где гербицидная композиция дополнительно содержит дополнительное гербицидное соединение.

22. Способ по п. 20 или п. 21, где гербицидная композиция дополнительно содержит антидот.

23. Способ по любому из пп. 20-22, где R представляет собой H, алкил, замещенный алкил, бензил и алкинил.

24. Способ по любому из пп. 20-23, где R₁ представляет собой циано, C₁-C₄алкил, C₂-C₄алкинил или замещенный фенил.

25. Способ по любому из пп. 20-24, где R₁ представляет собой Me, этинил, 4-хлорфенил или 2,4-дихлорфенил.

26. Способ по любому из пп. 20-25, где R₄ представляет собой циано, трифторметил или фтор.

27. Способ по любому из пп. 11-17, где соединение или композицию применяют до появления всходов.

28. Способ по любому из пп. 11-17, где соединение или композицию применяют после появления всходов.

По доверенности