

(19)



**Евразийское
патентное
ведомство**

(21) **202391599** (13) **A1**

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОЙ ЗАЯВКЕ

(43) Дата публикации заявки
2023.07.19

(22) Дата подачи заявки
2021.11.26

(51) Int. Cl. *C07D 213/80* (2006.01)
C07D 401/04 (2006.01)
C07D 405/04 (2006.01)
C07D 407/04 (2006.01)
C07D 413/04 (2006.01)
C07D 491/04 (2006.01)
A01N 43/04 (2006.01)

(54) ГЕРБИЦИДНЫЕ ПРОИЗВОДНЫЕ

(31) 2018994.0

(32) 2020.12.02

(33) GB

(86) PCT/EP2021/083128

(87) WO 2022/117445 2022.06.09

(71) Заявитель:

**СИНГЕНТА КРОП ПРОТЕКШН АГ
(CH)**

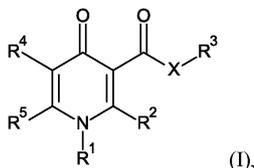
(72) Изобретатель:

**Седен Питер Тимоти, Эмметт Эдвард
Джон, Дейл Сюзанна, Бёрнс Дэвид,
Уолли Луиза, Моррис Джеймс Алан
(GB)**

(74) Представитель:

**Веселицкий М.Б., Кузенкова Н.В.,
Каксис Р.А., Белоусов Ю.В., Куликов
А.В., Кузнецова Е.В., Соколов Р.А.,
Кузнецова Т.В. (RU)**

(57) Соединения формулы (I)



где заместители определены в п.1 формулы изобретения. Настоящее изобретение дополнительно относится к гербицидным композициям, которые содержат соединение формулы (I), и к применению соединений формулы (I) для осуществления контроля сорняков, в частности, в сельскохозяйственных культурах полезных растений.

A1

202391599

202391599

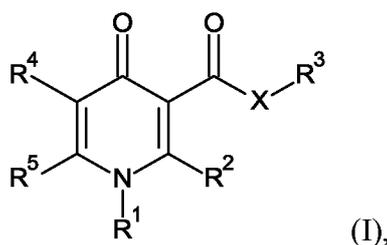
A1

ГЕРБИЦИДНЫЕ ПРОИЗВОДНЫЕ

5 Настоящее изобретение относится к гербицидным производным пиридона, например таким, как активные ингредиенты, которые обладают гербицидной активностью. Настоящее изобретение также относится к агрохимическим композициям, которые содержат по меньшей мере одно из производных пиридона, к способам получения таких соединений и к вариантам применения производных пиридона или композиций на их основе в сельском хозяйстве или садоводстве для борьбы с сорняками, в частности, в сельскохозяйственных культурах полезных растений.

В EP0239391, EP0127313, EP0040082 и GB2182931 описаны производные пиридона в качестве гербицидных средств.

15 В соответствии с настоящим изобретением предусмотрено соединение формулы (I),



где

X представляет собой O, NR⁶ или S;

20 R¹ представляет собой C₁-C₆алкил;

R² представляет собой фенил или гетероарил, где гетероарильный фрагмент представляет собой 5- или 6-членное ароматическое кольцо, которое содержит 1, 2, 3 или 4 гетероатома, по отдельности выбранных из N, O и S, и где каждый фенильный и гетероарильный фрагменты могут быть необязательно замещены 1, 2, 3 или 4 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R⁷;

25 R³ представляет собой водород, C₁-C₆алкил, N,N-ди(C₁-C₃алкил)амино, C₁-C₆галогеналкил, C₃-C₆циклоалкил, C₃-C₆циклоалкилC₁-C₆алкил, C₁-C₆алкоксиC₁-C₆алкил, C₂-C₆алкенил, C₂-C₆алкинил, фенил или фенилC₁-C₃алкил, где фенильные фрагменты могут быть необязательно замещены 1, 2, 3 или 4 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R⁸;

30

R^4 представляет собой C_3 - C_6 циклоалкенил, фенил, фенил C_1 - C_2 алкил, фенил C_1 - C_2 алкенил, гетероциклил, где гетероциклильный фрагмент представляет собой 4-, 5- или 6-членное неароматическое моноциклическое кольцо, содержащее 1, 2 или 3 гетероатома, по отдельности выбранных из N, O и S, или гетероарил, где гетероарильный фрагмент представляет собой 5- или 6-членное ароматическое моноциклическое кольцо, содержащее 1, 2 или 3 гетероатома, по отдельности выбранных из N, O и S, и где каждый фенильный, гетероциклильный и гетероарильный фрагменты могут быть необязательно замещены 1, 2, 3 или 4 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R^9 , или

10 R^4 представляет собой 6–10-членную аннелированную кольцевую систему, необязательно содержащую 1, 2 или 3 гетероатома, по отдельности выбранных из N, O и S, где аннелированная кольцевая система необязательно замещена 1 или 2 группами, представленными R^{12} , и где аннелированная кольцевая система необязательно связана с остальной частью молекулы посредством C_1 - C_2 алкиленового линкера;

15 R^5 представляет собой галоген, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_4 галогеналкил, C_1 - C_4 галогеналкокси или C_1 - C_4 алкокси C_1 - C_4 алкил;

R^6 представляет собой водород, C_1 - C_3 алкил или C_1 - C_6 алкокси;

20 R^7 представляет собой циано, нитро, галоген, C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_6 галогеналкил, C_1 - C_6 галогеналкокси, C_1 - C_6 алкокси C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 алкилсульфанил, C_1 - C_6 алкилсульфинил, C_1 - C_6 алкилсульфонил, C_1 - C_6 алкилсульфонамидо, C_1 - C_6 алкилкарбонил, C_1 - C_6 алкоксикарбонил, C_1 - C_6 алкиламинокарбонил, C_3 - C_6 циклоалкил, C_3 - C_6 циклоалкиламинокарбонил, N,N-ди(C_1 - C_4 алкил)аминокарбонил или фенил, где каждый фенильный фрагмент может быть необязательно замещен 1, 2 или 3 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R^{10} ;

25 R^8 представляет собой галоген, циано, C_1 - C_3 алкил или C_1 - C_3 алкокси;

30 R^9 представляет собой циано, нитро, галоген, оксо, C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_6 галогеналкил, C_1 - C_6 галогеналкокси, C_1 - C_6 алкокси C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 алкокси C_1 - C_6 алкокси, C_2 - C_6 алкенил, C_2 - C_6 алкинил, C_2 - C_6 алкенилокси, C_2 - C_6 алкинилокси, C_1 - C_6 алкилсульфанил, C_1 - C_6 алкилсульфинил, C_1 - C_6 алкилсульфонил, C_1 - C_6 алкилсульфонамидо, C_1 - C_6 алкилкарбонил, C_1 - C_6 алкоксикарбонил, C_1 - C_6 алкиламинокарбонил, C_3 - C_6 циклоалкил, C_3 - C_6 циклоалкил C_1 - C_6 алкокси, N,N-ди(C_1 - C_4 алкил)аминосульфанил, C_3 - C_6 циклоалкиламинокарбонил, N,N-ди(C_1 - C_4 алкил)аминокарбонил, фенокси или бензилокси, где каждый циклоалкильный или

фенильный фрагмент может быть необязательно замещен 1 или 2 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R^{12} ; или

любые две смежные группы R^9 вместе с атомами углерода, к которым они присоединены, могут образовывать 5- или 6-членное гетероциклическое кольцо, содержащее 1 или 2 гетероатома, выбранных из O и N, и где гетероциклическое кольцо может быть необязательно замещено 1, 2, 3 или 4 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R^{11} ;

R^{10} представляет собой галоген, C_1 - C_3 алкил или C_1 - C_3 алкокси;

R^{11} представляет собой галоген, C_1 - C_3 алкил или C_1 - C_3 алкокси;

R^{12} представляет собой циано, галоген, C_1 - C_3 алкил или C_1 - C_3 алкокси; или его соль или N-оксид.

Неожиданно было обнаружено, что новые соединения формулы (I) обладают для практических целей весьма преимущественным уровнем гербицидной активности.

В соответствии со вторым аспектом настоящего изобретения предусмотрена агрохимическая композиция, содержащая гербицидно эффективное количество соединения формулы (I) в соответствии с настоящим изобретением. Такая композиция, предназначенная для применения в сельском хозяйстве, может дополнительно содержать по меньшей мере один дополнительный активный ингредиент и/или агрохимически приемлемый разбавитель или носитель.

В соответствии с третьим аспектом настоящего изобретения предусмотрен способ контроля сорняков в месте произрастания, включающий применение по отношению к месту произрастания достаточного для контроля сорняков количества композиции, содержащей соединение формулы (I).

В соответствии с четвертым аспектом настоящего изобретения представлено применение соединения формулы (I) в качестве гербицида.

Если указано, что заместители являются "необязательно замещенными", это означает, что они могут нести или могут не нести один или несколько идентичных или различных заместителей, например, один, два или три заместителя R^7 . Например, C_1 - C_6 алкил, замещенный 1, 2 или 3 атомами галогена, может включать без ограничения группы $-CH_2Cl$, $-CHCl_2$, $-CCl_3$, $-CH_2F$, $-CHF_2$, $-CF_3$, $-CH_2CF_3$ или $-CF_2CH_3$. В качестве другого примера, C_1 - C_6 алкокси, замещенный 1, 2 или 3 галогенами, может включать без ограничения CH_2ClO- , $CHCl_2O-$, CCl_3O- , CH_2FO- , CHF_2O- , CF_3O- , CF_3CH_2O- или CH_3CF_2O- группы.

Применяемый в данном документе термин "циано" означает группу $-CN$.

Применяемый в данном документе термин "галоген" относится к фтору (фторо), хлору (хлоро), бромю (бромю) или йоду (йодо).

Применяемый в данном документе термин "нитро" означает группу $-\text{NO}_2$.

Применяемый в данном документе термин "ацетил" означает группу $-\text{C}(\text{O})\text{CH}_3$.

5 Применяемое в данном документе обозначение $=\text{O}$ означает оксогруппу, которая, например, находится в карбонильной группе ($-\text{C}(=\text{O})-$).

10 Применяемый в данном документе термин " C_1 - C_6 алкил" относится к углеводородному радикалу с прямой или разветвленной цепью, состоящему исключительно из атомов углерода и водорода, не содержащему ненасыщенных связей, имеющему от одного до шести атомов углерода, и который присоединен к остальной части молекулы одинарной связью. " C_1 - C_4 алкил" и " C_1 - C_3 алкил" следует истолковывать соответствующим образом. Примеры C_1 - C_6 алкила включают без ограничения метил, этил, н-пропил и их изомеры, например, изопропил. « C_1 - C_6 алкиленовая» группа относится к соответствующему определению C_1 - C_6 алкила, за
15 исключением того, что такой радикал присоединен к остальной части молекулы посредством двух одинарных связей. Термин " C_1 - C_2 алкилен" следует истолковывать соответствующим образом. Примеры C_1 - C_6 алкилена включают без ограничения $-\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ и $-(\text{CH}_2)_3-$.

20 Применяемый в данном документе термин " C_1 - C_6 галогеналкил" относится к C_1 - C_6 алкильному радикалу, который в целом определен выше, замещенному одним или несколькими одинаковыми или разными атомами галогена. Термины " C_1 - C_4 галогеналкил" и " C_1 - C_3 галогеналкил" следует истолковывать соответствующим образом. Примеры C_1 - C_6 галогеналкила включают без ограничения трифторметил.

25 Применяемый в данном документе термин " C_1 - C_6 алкокси" относится к радикалу формулы $-\text{OR}_a$, где R_a представляет собой C_1 - C_6 алкильный радикал, который в целом определен выше. Термины " C_1 - C_4 алкокси" и " C_1 - C_3 алкокси" следует истолковывать соответствующим образом. Примеры C_1 - C_6 алкокси включают без ограничения метокси, этокси, 1-метилэтокси- (изопропокси-) и пропокси.

30 Применяемый в данном документе термин " C_1 - C_6 галогеналкокси" относится к радикалу C_1 - C_6 алкокси, который в целом определен выше, замещенному одним или несколькими одинаковыми или разными атомами галогена. Термины " C_1 - C_4 галогеналкокси" и " C_1 - C_3 галогеналкокси" следует истолковывать соответствующим образом. Примеры C_1 - C_6 галогеналкокси включают без ограничения трифторметокси.

Применяемый в данном документе термин "C₂-C₆алкенил" относится к группе, представляющей собой углеводородный радикал с прямой или разветвленной цепью, состоящей исключительно из атомов углерода и водорода, содержащей по меньшей мере одну двойную связь, которая может находиться либо в (*E*)-, либо в (*Z*)- конфигурации, содержащей от двух до шести атомов углерода, которая присоединена к 5 остальной части молекулы посредством одинарной связи. Термин "C₂-C₃алкенил" следует истолковывать соответствующим образом. Примеры C₂-C₆алкенила включают без ограничения этенил (винил), проп-1-енил, проп-2-енил (аллил), бут-1-енил.

Применяемый в данном документе термин "C₂-C₆алкинил" относится к группе, представляющей собой углеводородный радикал с прямой или разветвленной цепью, состоящей исключительно из атомов углерода и водорода, содержащей по меньшей мере одну тройную связь, имеющей от двух до шести атомов углерода, и которая присоединена к остальной части молекулы одинарной связью. Термин "C₂-C₃алкинил" 10 следует истолковывать соответствующим образом. Примеры C₂-C₆алкинила включают без ограничения этинил, проп-1-инил, бут-1-инил.

Применяемый в данном документе термин "C₁-C₆алкоксиC₁-C₆алкил" относится к радикалу формулы R_bOR_a-, где R_b представляет собой C₁-C₆алкильный радикал, который в целом определен выше, и R_a представляет собой C₁-C₆алкиленовый радикал, который в целом определен выше. Термин "C₁-C₄алкоксиC₁-C₄алкил" 20 следует истолковывать соответствующим образом.

Применяемый в данном документе термин "C₁-C₆алкоксиC₁-C₆алкокси" относится к радикалу формулы R_bOR_aO-, где каждый R_a и R_b независимо представляет собой C₁-C₆алкильный радикал, который в целом определен выше. Термины "C₁-C₄алкоксиC₁-C₄алкокси" и "C₁-C₃алкоксиC₁-C₃алкокси" 25 следует истолковывать соответствующим образом.

Применяемый в данном документе термин "C₃-C₆циклоалкил" относится к радикалу, который представляет собой моноциклическую насыщенную кольцевую систему и который содержит 3–6 атомов углерода. Термины "C₃-C₅циклоалкил" и "C₃-C₄циклоалкил" 30 следует истолковывать соответствующим образом. Примеры C₃-C₆циклоалкила включают без ограничения циклопропил, циклобутил, циклопентил и циклогексил.

Применяемый в данном документе термин "C₃-C₆циклоалкенил" относится к радикалу, который представляет собой моноциклическую ненасыщенную кольцевую систему, содержащую по меньшей мере одну двойную связь и которая содержит 3–6

атомов углерода. Термины "С₃-С₅циклоалкенил" и "С₃-С₄циклоалкенил" следует истолковывать соответствующим образом. Примеры С₃-С₆циклоалкенила включают без ограничения циклопропенил, циклобутенил, циклопентенил и циклогексенил.

5 Применяемый в данном документе термин "С₃-С₆циклоалкилС₁-С₆алкил" относится к С₃-С₆циклоалкильному кольцу, присоединенному к остальной части молекулы посредством С₁-С₆алкиленового линкера, определенного выше. Примеры С₃-С₆циклоалкилС₁-С₆алкила включают без ограничения циклопропилметил.

10 Применяемый в данном документе термин "С₃-С₆циклоалкиламинокарбонил" относится к С₃-С₆циклоалкильному кольцу, присоединенному к остальной части молекулы посредством линкера -NHС(O)-. Примеры С₃-С₆циклоалкиламинокарбонила включают без ограничения циклопропилкарбамоил (т. е. циклопропиламинокарбонил).

Применяемый в данном документе термин "бензилокси-" относится к бензиловому кольцу, присоединенному к остальной части молекулы посредством атома кислорода.

15 Применяемый в данном документе термин "фенилС₁-С₃алкил" относится к фенильному кольцу, присоединенному к остальной части молекулы посредством С₁-С₃алкиленового линкера, определенного выше. Термин фенилС₁-С₂алкил следует истолковывать соответствующим образом.

20 Применяемый в данном документе термин "фенилС₁-С₃алкенил" относится к фенильному кольцу, присоединенному к остальной части молекулы посредством С₁-С₃алкенильного фрагмента, определенного выше. Термин фенилС₁-С₂алкенил следует истолковывать соответствующим образом.

25 При использовании в данном документе термин "гетероциклил" означает стабильное 4-, 5- или 6-членное неароматическое моноциклическое кольцо, которое содержит 1, 2 или 3 гетероатома, где гетероатомы по отдельности выбраны из азота, кислорода и серы. Гетероциклильный радикал может быть связан с остальной частью молекулы посредством атома углерода или гетероатома. Примеры гетероциклила включают без ограничения азиридилил, азетидинил, оксетанил, тиетанил, тетрагидрофурил, пирролидинил, пирозолидинил, имидазолидинил, пиперидинил, 30 пиперазинил, морфолинил, диоксоланил, дитиоланил и тиазолидинил.

Применяемый в данном документе термин "гетероарил" означает 5- или 6-членный ароматический моноциклический кольцевой радикал, который содержит 1, 2, 3 или 4 гетероатома, по отдельности выбранные из азота, кислорода и серы. Примеры гетероарила включают без ограничения фуранил, пирролил, тиенил, пирозолил,

имидазолил, тиазолил, изотиазолил, оксазолил, изоксазолил, триазолил, тетразолил, пиразинил, пиридазинил, пиримидил или пиридил.

Применяемый в данном документе термин “С₁-С₆алкилкарбонил” относится к радикалу формулы -C(O)R_a, где R_a представляет собой С₁-С₆алкильный радикал, который в целом определен выше. Примеры С₁-С₆алкилкарбонила включают без ограничения ацетил.

Применяемый в данном документе термин “С₁-С₆алкоксикарбонил” относится к радикалу формулы -C(O)OR_a, где R_a представляет собой С₁-С₆алкильный радикал, который в целом определен выше.

Применяемый в данном документе термин “С₁-С₆алкиламинокарбонил” относится к радикалу формулы -C(O)NHR_a, где R_a представляет собой С₁-С₆алкильный радикал, который в целом определен выше. Примеры С₁-С₆алкиламинокарбонила включают без ограничения этилкарбамоил (т. е. этиламинокарбонил).

Применяемый в данном документе термин “N,N-ди(С₁-С₄алкил)аминокарбонил” относится к радикалу формулы -C(O)N(R_a)(R_b), где каждый R_a и R_b по отдельности представляет собой С₁-С₄алкильный радикал, который в целом определен выше. Термин “N,N-ди(С₁-С₃алкил)аминокарбонил” следует истолковывать соответствующим образом. Примеры N,N-ди(С₁-С₄алкил)аминокарбонил включают без ограничения диметилкарбамоил (т. е. N, N-ди(метил)аминокарбонил).

Применяемый в данном документе термин “N,N-ди(С₁-С₄алкил)аминосульфанил” относится к радикалу формулы -S(O)₂N(R_a)(R_b), где каждый R_a и R_b по отдельности представляет собой С₁-С₄алкильный радикал, который в целом определен выше. Термин “N,N-ди(С₁-С₃алкил)аминосульфанил” следует истолковывать соответствующим образом. Примеры N,N-ди(С₁-С₄алкил)аминосульфанил включают без ограничения диэтилсульфамоил (т. е. N,N-ди(метил)аминосульфанил).

Применяемый в данном документе термин “N,N-ди(С₁-С₄алкил)амино” относится к радикалу формулы -N(R_a)(R_b), где каждый R_a и R_b по отдельности представляет собой С₁-С₄алкильный радикал, который в целом определен выше. Термин “N,N-ди(С₁-С₃алкил)амино” следует истолковывать соответствующим образом.

Применяемый в данном документе термин “С₁-С₆алкилсульфанил” относится к радикалу формулы -SR_a, где R_a представляет собой С₁-С₆алкильный радикал, который в целом определен выше. Термины “С₁-С₄алкилсульфанил” и “С₁-С₃алкилсульфанил” следует истолковывать соответствующим образом. Примеры С₁-С₆алкилсульфанила включают без ограничения метилсульфанил.

Применяемый в данном документе термин “С₁-С₆алкилсульфинил” относится к радикалу формулы -S(O)R_a, где R_a представляет собой С₁-С₆алкильный радикал, который в целом определен выше. Термины “С₁-С₄алкилсульфинил” и “С₁-С₃алкилсульфинил” следует истолковывать соответствующим образом. Примеры С₁-С₆алкилсульфинила включают без ограничения метилсульфинил.

Применяемый в данном документе термин “С₁-С₆алкилсульфонил” относится к радикалу формулы -S(O)₂R_a, где R_a представляет собой С₁-С₆алкильный радикал, который в целом определен выше. Термины “С₁-С₄алкилсульфонил” и “С₁-С₃алкилсульфонил” следует истолковывать соответствующим образом. Примеры С₁-С₆алкилсульфонила включают без ограничения метилсульфонил.

Применяемый в данном документе термин “С₁-С₆алкилсульфонамидо” относится к радикалу формулы -NHS(O)₂R_a, где R_a представляет собой С₁-С₆алкильный радикал, который в целом определен выше.

Наличие одного или нескольких возможных стереогенных элементов в соединении формулы (I) означает, что соединения могут встречаться в формах оптических изомеров, т. е. энантиомерных или диастереоизомерных формах. Также могут встречаться атропоизомеры в результате ограниченного вращения вокруг одинарной связи. Предполагается, что формула (I) включает все такие возможные изомерные формы и их смеси. Настоящее изобретение включает все такие возможные изомерные формы соединения формулы (I) и их смеси. Аналогично предполагается, что формула (I) включает все возможные таутомеры. Настоящее изобретение включает все возможные таутомерные формы соединения формулы (I).

В каждом случае соединения формулы (I) в соответствии с настоящим изобретением находятся в свободной форме, в окисленной форме в виде N-оксида или в форме соли, например, в форме агрономически применимой соли. Предпочтительными являются соли, которые соединения формулы (I) могут образовывать с аминами, включая первичные, вторичные и третичные амины (например, аммиак, диметиламин и триметиламин), основаниями щелочных металлов и щелочноземельных металлов, основаниями переходных металлов или четвертичного аммония. В особенно предпочтительном наборе вариантов осуществления соединения формулы (I) могут образовывать соли хлорида или 2,2,2-трифторацетата.

N-оксиды представляют собой окисленные формы третичных аминов или окисленные формы азотсодержащих гетероароматических соединений. Они описаны,

например, в книге “Heterocyclic N-oxides”, A. Albinì и S. Pietra, CRC Press, Boca Raton (1991).

В следующем перечне представлены определения, в том числе предпочтительные определения, для заместителей X , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , R^{11} и R^{12} со ссылкой на соединения формулы (I). Применительно к любому из этих заместителей любое из определений, приведенных ниже, можно комбинировать с любым определением любого другого заместителя, приведенным ниже или в других частях данного документа.

X представляет собой O , NR^6 или S . В одной группе вариантов осуществления X представляет собой O или NR^6 . В одной группе вариантов осуществления X представляет собой O . В другой группе вариантов осуществления X представляет собой NR^6 . В дополнительной группе вариантов осуществления X представляет собой S .

R^1 представляет собой C_1 - C_6 алкил. Предпочтительно R^1 представляет собой C_1 - C_4 алкил. Более предпочтительно R^1 представляет собой C_1 - C_3 алкил. Еще более предпочтительно R^1 представляет собой метил, этил, *n*-пропил или изопропил. Еще более предпочтительно R^1 представляет собой метил или этил. Наиболее предпочтительно R^1 представляет собой этил.

R^2 представляет собой фенил или гетероарил, где гетероарильный фрагмент представляет собой 5- или 6-членное ароматическое кольцо, которое содержит 1, 2, 3 или 4 гетероатома, по отдельности выбранных из N , O и S , и где каждый фенильный и гетероарильный фрагменты могут быть необязательно замещены 1, 2, 3 или 4 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R^7 .

Предпочтительно R^2 представляет собой фенил или гетероарил, где гетероарильный фрагмент представляет собой 5- или 6-членное ароматическое кольцо, которое содержит 1, 2 или 3 гетероатома, по отдельности выбранных из N , O и S , и где каждый фенильный и гетероарильный фрагменты могут быть необязательно замещены 1, 2 или 3 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R^7 .

Более предпочтительно R^2 представляет собой фенил или гетероарил, где гетероарильный фрагмент представляет собой 5- или 6-членное ароматическое кольцо, которое содержит 1 или 2 гетероатома, по отдельности выбранных из N и O , и где каждый фенильный и гетероарильный фрагменты могут быть необязательно замещены 1, 2 или 3 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R^7 .

Еще более предпочтительно R^2 представляет собой фенил или гетероарил, где гетероарильный фрагмент представляет собой 5- или 6-членное ароматическое кольцо, которое содержит 1 или 2 гетероатома, по отдельности выбранных из N и O, и где каждый фенильный и гетероарильный фрагменты могут быть необязательно замещены 1 или 2 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R^7 . Еще более предпочтительно R^2 представляет собой фенил или пиридил, где каждый фенильный и пиридинильный фрагменты могут быть необязательно замещены 1 или 2 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R^7 .

В одной группе вариантов осуществления R^2 представляет собой 4-хлорфенил, 3,4-дихлорфенил, 3,4-дифторфенил, 4-бром-2-фторфенил, 4-бром-3-фторфенил, 3-хлор-4-фторфенил, 4-хлор-3-фторфенил, 3-хлор-4-нитрофенил, 4-хлор-3-нитрофенил, 3-хлор-4-(2,4-дифторфенил)фенил, 2-хлор-4-пиридил, 5-хлор-2-пиридил, 5,6-дихлор-2-пиридил или 5,6-дихлор-3-пиридил. В дополнительной группе вариантов осуществления R^2 представляет собой 4-хлорфенил, 3,4-дихлорфенил, 3,4-дифторфенил, 4-бром-2-фторфенил, 4-бром-3-фторфенил, 3-хлор-4-фторфенил, 3-хлор-4-(2,4-дифторфенил)фенил, 2-хлор-4-пиридил, 5-хлор-2-пиридил, 5,6-дихлор-2-пиридил или 5,6-дихлор-3-пиридил.

В другой группе вариантов осуществления R^2 представляет собой фенил, необязательно замещенный 1 или 2 группами, предпочтительно 2 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R^7 . В дополнительной группе вариантов осуществления R^2 представляет собой 3,4-дихлорфенил.

R^3 представляет собой водород, C_1 - C_6 алкил, N,N-ди(C_1 - C_3 алкил)амино, C_1 - C_6 галогеналкил, C_3 - C_6 циклоалкил, C_3 - C_6 циклоалкил C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 алкокси C_1 - C_6 алкил, C_2 - C_6 алкенил, C_2 - C_6 алкинил, фенил или фенил C_1 - C_3 алкил, где фенильные фрагменты могут быть необязательно замещены 1, 2, 3 или 4 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R^8 .

Предпочтительно R^3 представляет собой водород, C_1 - C_6 алкил, N,N-ди(C_1 - C_3 алкил)амино, C_1 - C_3 галогеналкил, C_3 - C_6 циклоалкил, C_3 - C_6 циклоалкил C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_4 алкокси C_1 - C_2 алкил, C_2 - C_3 алкенил, C_2 - C_3 алкинил, фенил или фенил C_1 - C_2 алкил, где фенильные фрагменты могут быть необязательно замещены 1, 2 или 3 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R^8 .

Более предпочтительно R^3 представляет собой водород, C_1 - C_6 алкил или N,N-ди(C_1 - C_3 алкил)амино, C_1 - C_3 галогеналкил, C_3 - C_6 циклоалкил, C_3 - C_6 циклоалкил C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_4 алкокси C_1 - C_2 алкил, C_2 - C_3 алкенил, C_2 - C_3 алкинил, фенил или фенил C_1 -

С₂алкил, где фенильные фрагменты могут быть необязательно замещены 1, 2 или 3 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R⁸.

В одной группе вариантов осуществления, R³ представляет собой водород, С₁-С₆алкил, N,N-ди(С₁-С₃алкил)амино, С₁-С₆галогеналкил, С₃-С₆циклоалкил, С₃-С₆циклоалкилС₁-С₆алкил, С₁-С₆алкоксиС₁-С₆алкил, С₂-С₆алкенил, С₂-С₆алкинил или фенилС₁-С₃алкил, где фенильные фрагменты могут быть необязательно замещены 1, 2, 3 или 4 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R⁸.

Предпочтительно R³ представляет собой водород, С₁-С₆алкил, N,N-ди(С₁-С₃алкил)амино, С₁-С₃галогеналкил, С₃-С₆циклоалкил, С₃-С₆циклоалкилС₁-С₃алкил, С₁-С₄алкоксиС₁-С₂алкил, С₂-С₃алкенил, С₂-С₃алкинил или фенилС₁-С₂алкил, где фенильные фрагменты могут быть необязательно замещены 1, 2 или 3 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R⁸.

Более предпочтительно R³ представляет собой водород, С₁-С₆алкил или N,N-ди(С₁-С₃алкил)амино, С₁-С₃галогеналкил, С₃-С₆циклоалкил, С₃-С₆циклоалкилС₁-С₃алкил, С₁-С₄алкоксиС₁-С₂алкил, С₂-С₃алкенил, С₂-С₃алкинил или фенилС₁-С₂алкил, где фенильные фрагменты могут быть необязательно замещены 1, 2 или 3 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R⁸.

В другой группе вариантов осуществления R³ представляет собой водород, С₁-С₄алкил или N,N-ди(С₁-С₃алкил)амино. Предпочтительно R³ представляет собой водород, С₁-С₄алкил или N,N-ди(метил)амино, более предпочтительно водород, С₁-С₃алкил или N,N-ди(метил)амино. Еще более предпочтительно R³ представляет собой водород, метил, этил или N,N-ди(метил)амино. Еще более предпочтительно R³ представляет собой водород, метил или N,N-ди(метил)амино. Еще более предпочтительно R³ представляет собой водород.

R⁴ представляет собой С₃-С₆циклоалкенил, фенил, фенилС₁-С₂алкил, фенилС₁-С₂алкенил, гетероциклил, где гетероциклильный фрагмент представляет собой 4-, 5- или 6-членное неароматическое моноциклическое кольцо, содержащее 1, 2 или 3 гетероатома, по отдельности выбранных из N, O и S, или гетероарил, где гетероарильный фрагмент представляет собой 5- или 6-членное ароматическое моноциклическое кольцо, содержащее 1, 2 или 3 гетероатома, по отдельности выбранных из N, O и S, и где каждый фенильный, гетероциклильный и гетероарильный фрагменты могут быть необязательно замещены 1, 2, 3 или 4 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R⁹, или

R^4 представляет собой 6–10-членную аннелированную кольцевую систему, необязательно содержащую 1, 2 или 3 гетероатома, по отдельности выбранных из N, O и S, где аннелированная кольцевая система необязательно замещена 1 или 2 группами, представленными R^{12} , и где аннелированная кольцевая система необязательно связана с
5 остальной частью молекулы посредством C_1 - C_2 алкиленового линкера.

Предпочтительно R^4 представляет собой C_3 - C_6 циклоалкенил, фенил, фенил C_1 - C_2 алкил, фенил C_1 - C_2 алкенил, гетероциклил, где гетероциклильный фрагмент представляет собой 5- или 6-членное неароматическое моноциклическое кольцо, содержащее 1 или 2 гетероатома, по отдельности выбранных из N, O и S, или
10 гетероарил, где гетероарильный фрагмент представляет собой 5- или 6-членное ароматическое моноциклическое кольцо, содержащее 1, 2 или 3 гетероатома, по отдельности выбранных из N, O и S, и где каждый фенильный, гетероциклильный и гетероарильный фрагменты могут быть необязательно замещены 1, 2 или 3 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R^9 ; или

R^4 представляет собой 8–10-членную аннелированную кольцевую систему, необязательно содержащую 1 или 2 гетероатома, по отдельности выбранных из N, O и S, где аннелированная кольцевая система необязательно замещена 1 или 2 группами, представленными R^{12} , и где аннелированная кольцевая система необязательно связана с
15 остальной частью молекулы посредством C_1 - C_2 алкиленового линкера.

Более предпочтительно R^4 представляет собой C_4 - C_6 циклоалкенил, фенил, фенил C_1 - C_2 алкенил, гетероциклил, где гетероциклильный фрагмент представляют собой 6-членное неароматическое моноциклическое кольцо, содержащее единственный атом азота, или гетероарил, где гетероарильный фрагмент представляет собой 5- или 6-членное ароматическое моноциклическое кольцо, содержащее 1 или 2 гетероатома, по
20 отдельности выбранных из N, O и S, и где каждый фенильный и гетероарильный фрагменты могут быть необязательно замещены 1, 2 или 3 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R^9 ; и где каждый гетероциклильный фрагмент может быть необязательно замещен 1 или 2 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R^9 , или R^4
25 представляет собой 10-членную аннелированную кольцевую систему, необязательно содержащую один гетероатом, выбранный из N и O, и где аннелированная кольцевая система необязательно связана с остальной частью молекулы посредством C_1 - C_2 алкиленового линкера.
30

Еще более предпочтительно R^4 представляет собой циклопентенил, фенил, стирил, пиридил, пиразинил, пиридазинил, пиримидинил, тиенил, оксазол, фурил или имидазолил, где каждый фенильный фрагмент может быть необязательно замещен 1, 2 или 3 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R^9 , и где каждый пиридинильный фрагмент может быть необязательно замещен либо у атома углерода, либо у атома азота 1 или 2 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R^9 , и где каждый пиримидинильный, тиенильный и имидазолильный фрагмент может быть необязательно замещен одной группой R^9 , или R^4 представляет собой 2-оксо-4-пиридинильную группу, необязательно замещенную одной группой R^9 , или R^4 представляет собой хинолильную группу.

В одной группе вариантов осуществления R^4 представляет собой C_3 - C_6 циклоалкенил, фенил, фенил C_1 - C_2 алкил, фенил C_1 - C_2 алкенил, гетероцикл, где гетероциклильный фрагмент представляет собой 4-, 5- или 6-членное неароматическое моноциклическое кольцо, содержащее 1, 2 или 3 гетероатома, по отдельности выбранных из N, O и S, или гетероарил, где гетероарильный фрагмент представляет собой 5- или 6-членное ароматическое моноциклическое кольцо, содержащее 1, 2 или 3 гетероатома, по отдельности выбранных из N, O и S, и где каждый фенильный, гетероциклильный и гетероарильный фрагменты могут быть необязательно замещены 1, 2, 3 или 4 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R^9 .

Предпочтительно R^4 представляет собой C_4 - C_6 циклоалкенил, фенил, фенил C_1 - C_2 алкенил, гетероцикл, где гетероциклильный фрагмент представляет собой 5- или 6-членное неароматическое моноциклическое кольцо, содержащее 1 или 2 гетероатома, по отдельности выбранных из N, O и S, или гетероарил, где гетероарильный фрагмент представляет собой 5- или 6-членное ароматическое моноциклическое кольцо, содержащее 1 или 2 гетероатома, по отдельности выбранных из N, O и S, и где каждый фенильный, гетероциклильный и гетероарильный фрагменты могут быть необязательно замещены 1, 2 или 3 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R^9 .

Более предпочтительно R^4 представляет собой циклопентенил, фенил, стирил, гетероцикл, где гетероциклильный фрагмент представляет собой 6-членное неароматическое моноциклическое кольцо, содержащее 1 или 2 атома азота, или гетероарил, где гетероарильный фрагмент представляет собой 5- или 6-членное

ароматическое моноциклическое кольцо, содержащее 1 или 2 гетероатома, по отдельности выбранных из N, O и S, и где каждый фенильный, гетероциклический и гетероарильный фрагменты могут быть необязательно замещены 1, 2, или 3 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R⁹.

5 Еще более предпочтительно R⁴ представляет собой циклопентенил, фенил, стирил, гетероциклил, где гетероциклический фрагмент представляет собой 6-членное неароматическое моноциклическое кольцо, содержащее единственный атом азота, или гетероарил, где гетероарильный фрагмент представляет собой 5- или 6-членное ароматическое моноциклическое кольцо, содержащее 1 или 2 гетероатома, по
10 отдельности выбранных из N, O и S, и где каждый фенильный, гетероциклический и гетероарильный фрагменты могут быть необязательно замещены 1 или 2 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R⁹.

 Еще более предпочтительно R⁴ представляет собой фенил или гетероарил, где гетероарильный фрагмент представляет собой 5- или 6-членное ароматическое кольцо,
15 которое содержит 1 или 2 гетероатома, по отдельности выбранных из N, O и S, и где каждый фенильный, гетероциклический и гетероарильный фрагменты могут быть необязательно замещены 1 или 2 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R⁹.

 В предпочтительной группе вариантов осуществления R⁴ представляет собой
20 циклопентен-1-ил, фенил, (E)-стирил, 3-цианофенил, 4-цианофенил, 4-нитрофенил, 3-ацетилфенил, 4-ацетилфенил, 2-метилфенил (о-толил), 3-метилфенил (м-толил), 4-метилфенил (п-толил), 4-этилфенил, 4-трет-бутилфенил, 2,5-диметилфенил, 3,5-диметилфенил, 2-хлорфенил, 3-хлорфенил, 4-хлорфенил, 2-фторфенил, 3-фторфенил, 4-фторфенил, 3-(дифторметил)фенил, 3-(трифторметил)фенил, 4-(дифторметил)фенил, 4-
25 (трифторметил)фенил, 4-метоксифенил, 3-этоксифенил, 4-этоксифенил, 4-(метоксиметил)фенил, 3-(трифторметокси)фенил, 4-(трифторметокси)фенил, 2,4-дифторфенил, 3,4-дифторфенил, 3,5-дифторфенил, 2,4-дихлорфенил, 2,5-дихлорфенил, 3,4-дихлорфенил, 3,5-дихлорфенил, 3,4-диметоксифенил, 3,5-диметоксифенил, 4-метокси-3-метилфенил, 2-хлор-5-фторфенил, 4-хлор-2-фторфенил, 4-хлор-3-
30 фторфенил, 3-хлор-5-фторфенил, 5-хлор-2-фторфенил, 4-хлор-3-цианофенил, 3-циано-4-фторфенил, 3-циано-5-фторфенил, 3-циано-5-метилфенил, 4-циано-3-этоксифенил, 4-циано-3-(трифторметил)фенил, 2-фтор-3-метилфенил, 2-фтор-4-метилфенил, 4-фтор-3-метилфенил, 2-фтор-5-метилфенил, 5-фтор-2-метилфенил, 4-хлор-3-этилфенил, 4-хлор-3-(этилкарбамоил)фенил, 2-фтор-3-(трифторметил)фенил, 2-фтор-5-

(трифторметил)фенил, 3-метил-5-(трифторметил)фенил, 2-хлор-5-(трифторметил)фенил, 3-хлор-4-(трифторметил)фенил, 3-хлор-5-(трифторметил)фенил, 3-хлор-4-(трифторметил)фенил, 4-хлор-3-(трифторметил)фенил, 2-хлор-5-(трифторметокси)фенил, 3-(2,2,2-трифторэтокси)фенил, 3-фтор-5-(2,2,2-трифторэтокси)фенил, 4-фтор-3-(2,2,2-трифторэтокси)фенил, 2-фтор-3-метоксифенил, 2-фтор-5-метоксифенил, 3-хлор-4-метоксифенил, 3-фтор-4-метоксифенил, 3-фтор-5-метоксифенил, 4-фтор-2-метоксифенил, 5-фтор-2-метоксифенил, 4-хлор-2-метоксифенил, 4-хлор-3-этоксифенил, 3-этокси-5-фторфенил, 4-метокси-3-(трифторметил)фенил, 3-этокси-5-метилфенил, 4-фтор-2-метилфенил, 4-хлор-2-метилфенил, 4-хлор-2-метилсульфанилфенил, 4-хлор-3-нитрофенил, 3,4-бис(трифторметил)фенил, 3,5-бис(трифторметил)фенил, 4-циано-2-метилфенил, 4-циано-2-метилсульфанилфенил, 4-(диметилкарбамоил)фенил, 4-хлор-3-(циклопропилкарбамоил)фенил, 3-метилсульфанилфенил, 4-метилсульфанилфенил, 4-метилсульфонилфенил, 4-этилсульфонилфенил, 2-фтор-4-метилсульфонил-фенил, 4-(диэтилсульфамоил)фенил, 3-феноксифенил, 4-бензилоксифенил, 3-этокси-4-(трифторметил)фенил, 3-этокси-5-(трифторметил)фенил, 3,4,5-трифторфенил, 4-хлор-3,5-диметилфенил, 3-хлор-4-фтор-5-метоксифенил, 3-хлор-4,5-диметоксифенил, 3-хлор-5-фтор-4-метоксифенил, 4-метокси-3,5-диметилфенил, 2,4-дифтор-3-метилфенил, 2,4-дифтор-3-метоксифенил, 3,5-дифтор-4-метоксифенил, 3,5-дихлор-4-фторфенил, 4-фтор-3,5-диметилфенил, 5-трет-бутоксикарбонил-4-хлор-2-фторфенил, 4-хлор-2-фтор-5-(2-метоксиэтокси)фенил, 4-хлор-2-фтор-5-изопропоксифенил, 4-хлор-5-(циклопропилметокси)-2-фторфенил, 4-хлор-2-фтор-5-метоксикарбонилфенил, 1-(цианоциклопропил)-2-фторфенил, 2,2-дифтор-1,3-бензодиоксол-4-ил, 1-метилпиразол-4-ил, 2,5-диметилпиразол-3-ил, 2-метилпиразол-3-ил, 3-метилимидазол-4-ил, 3-пиридил, пиридин-1-иум-2-ил, пиридин-1-иум-3-ил, пиридин-1-иум-4-ил, 2-фтор-3-пиридил, 6-фтор-3-пиридил, 5-хлор-3-пиридил, 6-хлор-3-пиридил, 2-фтор-4-пиридил, 6-фтор-2-метил-3-пиридил, 6-(трифторметил)-2-пиридил, 6-(трифторметил)-3-пиридил, 2-хлор-6-изопропокси-4-пиридил, 5-хлор-2-фтор-3-пиридил, 6-хлор-5-метил-3-пиридил, 2-метокси-4-пиридил, 5-метокси-3-пиридил, 6-метокси-2-пиридил, 6-метокси-3-пиридил, 5,6-дихлор-3-пиридил, 5,6-дифтор-3-пиридил, 2,6-диметокси-3-пиридил, 5-метилсульфонил-3-пиридил, 4-(метансульфонамидо)фенил, 1-метил-2-оксо-4-пиридил, 2,2-дифтор-[1,3]диоксоло[4,5-b]пиридин-6-ил, пиазин-2-ил, пиридазин-4-ил, пиридазин-1-ий-4-ил, пиримидин-5-ил, 2-хлорпиримидин-5-ил, 2-

(трифторметил)пиримидин-5-ил, 2-тиенил, 3-тиенил, 4-метил-2-тиенил, 4-метил-3-тиенил, 5-хлор-2-тиенил, 5-хлор-3-тиенил, оксазол-2-ил, 3-фурил или 2-хинолил.

В особенно предпочтительной группе вариантов осуществления R⁴ представляет собой циклопентен-1-ил, фенил, 3-цианофенил, 4-цианофенил, 4-нитрофенил, 3-ацетилфенил, 4-ацетилфенил, 2-метилфенил (о-толил), 4-этилфенил, 4-трет-бутилфенил, 2,5-диметилфенил, 2-хлорфенил, 3-хлорфенил, 4-хлорфенил, 2-фторфенил, 4-фторфенил, 3-(дифторметил)фенил, 3-(трифторметил)фенил, 4-(дифторметил)фенил, 4-(трифторметил)фенил, 4-метоксифенил, 4-этоксифенил, 4-(метоксиметил)фенил, 3-(трифторметокси)фенил, 4-(трифторметокси)фенил, 2,4-дифторфенил, 3,4-дифторфенил, 3,5-дифторфенил, 2,4-дихлорфенил, 2,5-дихлорфенил, 3,4-дихлорфенил, 3,5-дихлорфенил, 3,4-диметоксифенил, 3,5-диметоксифенил, 4-метокси-3-метилфенил, 2-хлор-5-фторфенил, 4-хлор-3-фторфенил, 3-хлор-5-фторфенил, 5-хлор-2-фторфенил, 4-хлор-3-цианофенил, 3-циано-4-фторфенил, 3-циано-5-фторфенил, 3-циано-5-метилфенил, 4-циано-3-этоксифенил, 4-циано-3-(трифторметил)фенил, 2-фтор-3-метилфенил, 2-фтор-4-метилфенил, 2-фтор-5-метилфенил, 5-фтор-2-метилфенил, 4-хлор-3-(этилкарбамоил)фенил, 2-фтор-3-(трифторметил)фенил, 2-фтор-5-(трифторметил)фенил, 3-метил-5-(трифторметил)фенил, 2-хлор-5-(трифторметил)фенил, 3-хлор-4-(трифторметил)фенил, 3-хлор-5-(трифторметил)фенил, 3-хлор-4-(трифторметил)фенил, 2-хлор-5-(трифторметокси)фенил, 3-(2,2,2-трифторэтоксифенил, 3-фтор-5-(2,2,2-трифторэтоксифенил, 4-фтор-3-(2,2,2-трифторэтоксифенил, 2-фтор-3-метоксифенил, 2-фтор-5-метоксифенил, 3-хлор-4-метоксифенил, 3-фтор-4-метоксифенил, 4-фтор-2-метоксифенил, 5-фтор-2-метоксифенил, 4-хлор-2-метоксифенил, 4-метокси-3-(трифторметил)фенил, 3-этоксифенил, 4-фтор-2-метилфенил, 4-хлор-2-метилфенил, 4-хлор-2-метилсульфанилфенил, 4-(диметилкарбамоил)фенил, 4-хлор-3-(циклопропилкарбамоил)фенил, 3-метилсульфанилфенил, 4-метилсульфанилфенил, 4-метилсульфонилфенил, 4-этилсульфонилфенил, 2-фтор-4-метилсульфонилфенил, 4-(диэтилсульфамоил)фенил, 3-феноксифенил, 4-бензилоксифенил, 3-этоксифенил, 4-(трифторметил)фенил, 3-этоксифенил, 3,4,5-трифторфенил, 4-хлор-3,5-диметилфенил, 3-хлор-4,5-диметоксифенил, 3-хлор-5-фтор-4-метоксифенил, 4-метокси-3,5-диметилфенил, 2,4-дифтор-3-метоксифенил, 3,5-дифтор-4-метоксифенил, 3,5-дихлор-4-фторфенил, 4-фтор-3,5-диметилфенил, 4-хлор-2-фтор-5-(2-метоксиэтоксифенил, 4-хлор-2-фтор-5-изопропоксифенил, 4-хлор-5-(циклопропилметокси)-2-фторфенил, 2,2-дифтор-1,3-бензодиоксол-4-ил, 1-

метилпиразол-4-ил, 2,5-диметилпиразол-3-ил, 2-метилпиразол-3-ил, 3-метилимидазол-4-ил, 3-пиридил, пиридин-1-иум-2-ил, пиридин-1-иум-3-ил, пиридин-1-иум-4-ил, 2-фтор-3-пиридил, 6-фтор-3-пиридил, 5-хлор-3-пиридил, 6-хлор-3-пиридил, 2-фтор-4-пиридил, 6-(трифторметил)-2-пиридил, 6-(трифторметил)-3-пиридил, 2-хлор-6-изопропокси-4-пиридил, 6-хлор-5-метил-3-пиридил, 2-метокси-4-пиридил, 5-метокси-3-пиридил, 6-метокси-2-пиридил, 6-метокси-3-пиридил, 1-метил-2-оксо-4-пиридил, 2,2-дифтор-[1,3]диоксоло[4,5-b]пиридин-6-ил, пиразин-2-ил, пиридазин-4-ил, пиридазин-1-ий-4-ил, 2-тиенил, 3-тиенил, 4-метил-2-тиенил, 4-метил-3-тиенил, 5-хлор-2-тиенил, 5-хлор-3-тиенил, оксазол-2-ил, 3-фурил или 2-хинолил.

10 R^5 представляет собой галоген, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_4 галогеналкил, C_1 - C_4 галогеналкокси или C_1 - C_4 алкокси C_1 - C_4 алкил. Предпочтительно R^5 представляет собой C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_3 алкокси, C_1 - C_3 галогеналкокси или C_1 - C_3 алкокси C_1 - C_2 алкил. Более предпочтительно R^5 представляет собой C_1 - C_4 алкил или C_1 - C_2 алкокси C_1 - C_2 алкил. Еще более предпочтительно R^5 представляет собой C_1 - C_3 алкил или C_1 - C_2 алкокси C_1 - C_2 алкил. В одной группе вариантов осуществления R^5 представляет собой метил или метоксиметил.

20 В одной группе вариантов осуществления R^5 представляет собой C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_3 галогеналкил или C_1 - C_2 алкокси C_1 - C_2 алкил. Предпочтительно R^5 представляет собой C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_2 галогеналкил или C_1 - C_2 алкокси C_1 - C_2 алкил. Более предпочтительно R^5 представляет собой метил, метоксиметил, метоксиэтил, бромметил или дифторметил.

R^6 представляет собой водород, C_1 - C_3 алкил или C_1 - C_6 алкокси. Предпочтительно R^6 представляет собой водород или C_1 - C_3 алкил. Более предпочтительно R^6 представляет собой водород, метил или этил. Еще более предпочтительно R^6 представляет собой водород.

25 R^7 представляет собой циано, нитро, галоген, C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_6 галогеналкил, C_1 - C_6 галогеналкокси, C_1 - C_6 алкокси C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 алкилсульфанил, C_1 - C_6 алкилсульфинил, C_1 - C_6 алкилсульфонил, C_1 - C_6 алкилсульфонамидо, C_1 - C_6 алкилкарбонил, C_1 - C_6 алкоксикарбонил, C_1 - C_6 алкиламинокарбонил, C_3 - C_6 циклоалкил, C_3 - C_6 циклоалкиламинокарбонил, N,N-ди(C_1 - C_4 алкил)аминокарбонил или фенил, где
30 каждый фенильный фрагмент может быть необязательно замещен 1, 2 или 3 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R^{10} . Предпочтительно R^7 представляет собой циано, нитро, галоген, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_4 галогеналкил, C_1 - C_4 галогеналкокси, C_1 - C_3 алкокси C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_4 алкилсульфанил, C_1 - C_4 алкилсульфинил, C_1 - C_4 алкилсульфонил, C_1 -

C_4 алкилсульфонамидо, C_1 - C_4 алкилкарбонил, C_1 - C_4 алкоксикарбонил, C_1 - C_4 алкиламинокарбонил, C_3 - C_6 циклоалкил, C_3 - C_6 циклоалкиламинокарбонил, N,N-ди(C_1 - C_3 алкил)аминокарбонил или фенил, где каждый фенильный фрагмент может быть необязательно замещен 1 или 2 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R^{10} . Более предпочтительно R^7 представляет собой циано, нитро, галоген, C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_3 алкокси, C_1 - C_4 галогеналкил, C_1 - C_4 галогеналкокси, C_1 - C_3 алкокси C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_3 алкилсульфанил, C_1 - C_3 алкилсульфинил, C_1 - C_3 алкилсульфонил, C_1 - C_3 алкилсульфонамидо, C_1 - C_3 алкилкарбонил, C_1 - C_3 алкоксикарбонил, C_1 - C_3 алкиламинокарбонил, C_3 - C_6 циклоалкил, C_3 - C_6 циклоалкиламинокарбонил, N,N-ди(C_1 - C_3 алкил)аминокарбонил или фенил, где каждый фенильный фрагмент может быть необязательно замещен 1 или 2 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R^{10} . Еще более предпочтительно R^7 представляет собой циано, нитро, галоген, C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_3 алкокси, C_1 - C_4 галогеналкил, C_1 - C_4 галогеналкокси, C_1 - C_3 алкокси C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_3 алкилсульфанил, C_1 - C_3 алкилсульфонил, C_1 - C_2 алкилкарбонил, C_1 - C_3 алкоксикарбонил, N,N-ди(C_1 - C_2 алкил)аминокарбонил или фенил, где каждый фенильный фрагмент может быть необязательно замещен 1 или 2 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R^{10} .

В одной группе вариантов осуществления R^7 представляет собой нитро, галоген или фенил, где каждый фенильный фрагмент может быть необязательно замещен 1 или 2 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R^{10} . Предпочтительно R^7 представляет собой галоген или фенил, где каждый фенильный фрагмент может быть необязательно замещен 1 или 2 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R^{10} . Более предпочтительно R^7 представляет собой хлор, фтор, бром или фенил, где каждый фенильный фрагмент может быть необязательно замещен 2 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R^{10} . Еще более предпочтительно R^7 представляет собой хлор, фтор, бром или 2,4-дифторфенил,

R^8 представляет собой галоген, циано, C_1 - C_3 алкил или C_1 - C_3 алкокси. Предпочтительно R^8 представляет собой галоген, циано, метил, этил, метокси или этокси. Более предпочтительно R^8 представляет собой хлор, бром, фтор, метил или метокси.

R^9 представляет собой циано, нитро, галоген, оксо, C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_6 галогеналкил, C_1 - C_6 галогеналкокси, C_1 - C_6 алкокси C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 алкокси C_1 -

С₆алкокси, С₂-С₆алкенил, С₂-С₆алкинил, С₂-С₆алкенилокси, С₂-С₆алкинилокси, С₁-С₆алкилсульфанил, С₁-С₆алкилсульфинил, С₁-С₆алкилсульфонил, С₁-С₆алкилсульфонамидо, С₁-С₆алкилкарбонил, С₁-С₆алкоксикарбонил, С₁-С₆алкиламинокарбонил, С₃-С₆циклоалкил, С₃-С₆циклоалкилС₁-С₆алкокси, N,N-ди(С₁-С₄алкил)аминосульфанил, С₃-С₆циклоалкиламинокарбонил, N,N-ди(С₁-С₄алкил)аминокарбонил, фенокси или бензилокси, где каждый циклоалкильный или фенильный фрагмент может быть необязательно замещен 1 или 2 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R¹²; или

любые две смежные группы R⁹ вместе с атомами углерода, к которым они присоединены, могут образовывать 5- или 6-членное гетероциклическое кольцо, содержащее 1 или 2 гетероатома, выбранных из O и N, и где гетероциклическое кольцо может быть необязательно замещено 1, 2, 3 или 4 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R¹¹.

Предпочтительно R⁹ представляет собой циано, нитро, галоген, оксо, С₁-С₆алкил, С₁-С₆алкокси, С₁-С₆галогеналкил, С₁-С₆галогеналкокси, С₁-С₆алкоксиС₁-С₆алкил, С₁-С₆алкоксиС₁-С₆алкокси, С₁-С₆алкилсульфанил, С₁-С₆алкилсульфонил, С₁-С₆алкилсульфонамидо, С₁-С₆алкилкарбонил, С₁-С₆алкоксикарбонил, С₃-С₆циклоалкил, С₃-С₆циклоалкилС₁-С₆алкокси, N,N-ди(С₁-С₄алкил)аминосульфанил, С₃-С₆циклоалкиламинокарбонил, N,N-ди(С₁-С₄алкил)аминокарбонил, фенокси или бензилокси, где каждый циклоалкильный или фенильный фрагмент может быть необязательно замещен 1 или 2 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R¹²; или

любые две смежные группы R⁹ вместе с атомами углерода, к которым они присоединены, могут образовывать 5- или 6-членное гетероциклическое кольцо, содержащее 1 или 2 гетероатома, выбранных из O и N, и где гетероциклическое кольцо может быть необязательно замещено 1, 2 или 3 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R¹¹.

Более предпочтительно R⁹ представляет собой циано, нитро, галоген, оксо, С₁-С₄алкил, С₁-С₄алкокси, С₁-С₄галогеналкил, С₁-С₄галогеналкокси, С₁-С₄алкоксиС₁-С₄алкил, С₁-С₄алкоксиС₁-С₄алкокси, С₁-С₄алкилсульфанил, С₁-С₄алкилсульфонил, С₁-С₄алкилсульфонамидо, С₁-С₄алкилкарбонил, С₁-С₄алкоксикарбонил, С₃-С₄циклоалкил, С₃-С₄циклоалкилС₁-С₃алкокси, N,N-ди(С₁-С₃алкил)аминосульфанил, С₃-С₄циклоалкиламинокарбонил, N,N-ди(С₁-С₃алкил)аминокарбонил, фенокси или бензилокси, где каждый циклоалкильный или фенильный фрагмент может быть

необязательно замещен 1 или 2 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R^{12} ; или

любые две смежные группы R^9 вместе с атомами углерода, к которым они присоединены, могут образовывать 5- или 6-членное гетероциклическое кольцо, содержащее 1 или 2 гетероатома, выбранных из O и N, и где гетероциклическое кольцо может быть необязательно замещено 1 или 2 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R^{11} .

Еще более предпочтительно R^9 представляет собой циано, нитро, галоген, оксо, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_3 алкокси, C_1 - C_2 галогеналкил, C_1 - C_2 галогеналкокси, C_1 - C_2 алкокси- C_1 - C_2 алкил, C_1 - C_2 алкокси- C_1 - C_2 алкокси, C_1 - C_3 алкилсульфанил, C_1 - C_3 алкилсульфонил, C_1 - C_3 алкилсульфонамидо, C_1 - C_2 алкилкарбонил, C_1 - C_4 алкоксикарбонил, циклопропил, циклопропил- C_1 - C_2 алкокси, N,N-ди(C_1 - C_2 алкил)аминосульфонил, циклопропиламинокарбонил, N,N-ди(C_1 - C_2 алкил)аминокарбонил, фенокси или бензилокси, где каждый циклоалкильный или фенильный фрагмент может быть необязательно замещен одной группой, представленной R^{12} ; или

любые две смежные группы R^9 вместе с атомами углерода, к которым они присоединены, могут образовывать 5-членное гетероциклическое кольцо, содержащее два атома кислорода, и где гетероциклическое кольцо может быть необязательно замещено 1 или 2 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R^{11} .

Еще более предпочтительно R^9 представляет собой циано, нитро, хлор, фтор, оксо, метил, этил, трет-бутил, метокси, этокси, изопропокси, дифторметил, трифторметил, трифторметокси, 2,2,2-трифторэтокси, метоксиметил, метоксиэтокси, метилсульфанил, метилсульфонил, этилсульфонил, метилсульфонамидо, ацетил (метилкарбонил), метоксикарбонил, трет-бутоксикарбонил, циклопропил, необязательно замещенный одной группой, представленной R^{12} , циклопропилметокси, этилкарбамоил (этиламинокарбонил), диметилкарбамоил (N, N-ди(метил)аминокарбонил), циклопропилкарбамоил (циклопропиламинокарбонил), диэтилсульфамоил (N,N-ди(метил)аминосульфонил), фенокси или бензилокси; или любые две смежные группы R^9 вместе с атомами углерода, к которым они присоединены, могут образовывать 5-членное гетероциклическое кольцо, содержащее два атома кислорода, и где гетероциклическое кольцо может быть необязательно замещено 1 или 2 группами фтора.

Еще более предпочтительно R^9 представляет собой циано, нитро, хлор, фтор, оксо, метил, трет-бутил, метокси, этокси, изопропокси, дифторметил, трифторметил,

трифторметокси, 2,2,2-трифторэтоксид, метоксиметил, метоксиэтоксид, метилсульфанил, метилсульфонил, этилсульфонил, ацетил (метилкарбонил), циклопропилметокси, этилкарбамоил (этиламинокарбонил), циклопропилкарбамоил (циклопропиламинокарбонил), диметилкарбамоил (N, N-ди(метил)аминокарбонил), диэтилсульфамоил (N,N-ди(метил)аминосульфанил), феноксид, бензилоксид; или любые две смежные группы R⁹ вместе с атомами углерода, к которым они присоединены, могут образовывать 5-членное гетероциклическое кольцо, содержащее два атома кислорода, и где гетероциклическое кольцо может быть необязательно замещено 1 или 2 группами фтора.

10 В одной группе вариантов осуществления R⁹ представляют собой циано, нитро, галоген, оксо, C₁-C₆алкил, C₁-C₆алкоксид, C₁-C₆галогеналкил, C₁-C₆галогеналкоксид, C₁-C₆алкоксидC₁-C₆алкил, C₁-C₆алкилсульфанил, C₁-C₆алкилсульфинил, C₁-C₆алкилсульфонил, C₁-C₆алкилсульфонамидо, C₁-C₆алкилкарбонил, C₁-C₆алкоксикарбонил, C₁-C₆алкиламинокарбонил, C₃-C₆циклоалкил, C₃-C₆циклоалкиламинокарбонил, N,N-ди(C₁-C₄алкил)аминокарбонил или бензилоксид, или
 15 любые две смежные группы R⁹ вместе с атомами углерода, к которым они присоединены, могут образовывать 5- или 6-членное гетероциклическое кольцо, содержащее 1 или 2 гетероатома, выбранных из O и N, и где гетероциклическое кольцо может быть необязательно замещено 1, 2, 3 или 4 группами, которые могут быть
 20 одинаковыми или разными, представленными R¹¹.

Предпочтительно R⁹ представляет собой циано, нитро, галоген, оксо, C₁-C₆алкил, C₁-C₄алкоксид, C₁-C₄галогеналкил, C₁-C₄галогеналкоксид, C₁-C₄алкоксидC₁-C₄алкил, C₁-C₄алкилсульфанил, C₁-C₄алкилсульфинил, C₁-C₄алкилсульфонил, C₁-C₄алкилсульфонамидо, C₁-C₄алкилкарбонил, C₁-C₄алкоксикарбонил, C₁-C₄алкиламинокарбонил, C₃-C₆циклоалкил, C₃-C₆циклоалкиламинокарбонил, N,N-ди(C₁-C₃алкил)карбонил или бензилоксид; или любые две смежные группы R⁹ вместе с атомами углерода, к которым они присоединены, могут образовывать 5- или 6-членное гетероциклическое кольцо, содержащее 1 или 2 гетероатома, выбранных из O и N, и где гетероциклическое кольцо может быть необязательно замещено 1, 2 или 3 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R¹¹.

30 Более предпочтительно R⁹ представляет собой циано, нитро, галоген, оксо, C₁-C₆алкил, C₁-C₄алкоксид, C₁-C₄галогеналкил, C₁-C₄галогеналкоксид, C₁-C₄алкоксидC₁-C₄алкил, C₁-C₄алкилсульфанил, C₁-C₄алкилсульфинил, C₁-C₄алкилсульфонил, C₁-C₄алкилсульфонамидо, C₁-C₄алкилкарбонил, C₁-C₄алкиламинокарбонил, C₃-

С₆циклоалкил, С₃-С₆циклоалкиламинокарбонил, N,N-ди(С₁-С₃алкил)карбонил или бензилокси; или любые две смежные группы R⁹ вместе с атомами углерода, к которым они присоединены, могут образовывать 5- или 6-членное гетероциклическое кольцо, содержащее 1 или 2 гетероатома, выбранных из О и N, и где гетероциклическое кольцо может быть необязательно замещено 1, 2 или 3 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R¹¹.

Еще более предпочтительно R⁹ представляет собой циано, нитро, галоген, оксо, С₁-С₄алкил, С₁-С₃алкокси, С₁-С₃галогеналкил, С₁-С₃галогеналкокси, С₁-С₃алкоксиС₁-С₂алкил, С₁-С₃алкилсульфанил, С₁-С₃алкилсульфонил, С₁-С₃алкилсульфонамидо, С₁-С₃алкилкарбонил, С₁-С₃алкиламинокарбонил, С₃-С₄циклоалкиламинокарбонил, N,N-ди(С₁-С₂алкил)карбонил или бензилокси; или любые две смежные группы R⁹ вместе с атомами углерода, к которым они присоединены, могут образовывать 5-членное гетероциклическое кольцо, содержащее 1 или 2 гетероатома, выбранных из О и N, и где гетероциклическое кольцо может быть необязательно замещено 1 или 2 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R¹¹.

Еще более предпочтительно R⁹ представляет собой нитро, галоген, С₁-С₃алкил, С₁-С₃алкокси, С₁-С₃галогеналкил, С₁-С₃галогеналкокси, С₁-С₃алкилсульфонил или бензилокси. Еще более предпочтительно R⁹ представляет собой нитро, хлор, фтор, метил, метокси, трифторметил, трифторметокси, метилсульфонил или бензилокси.

R¹⁰ представляет собой галоген, С₁-С₃алкил или С₁-С₃алкокси. Предпочтительно R¹⁰ представляет собой галоген, метил или метокси. Более предпочтительно R¹⁰ представляет собой галоген. Еще более предпочтительно R¹⁰ представляет собой хлор или фтор. Еще более предпочтительно R¹⁰ представляет собой фтор.

R¹¹ представляет собой галоген, С₁-С₃алкил или С₁-С₃алкокси. Предпочтительно R¹¹ представляет собой галоген, метил или метокси. Более предпочтительно R¹¹ представляет собой галоген. Еще более предпочтительно R¹¹ представляет собой хлор или фтор. Еще более предпочтительно R¹¹ представляет собой фтор.

R¹² представляет собой циано, галоген, С₁-С₃алкил или С₁-С₃алкокси. Предпочтительно R¹² представляет собой циано, галоген, метил, этил, метокси, этокси или изопропокси. Более предпочтительно R¹² представляет собой циано или галоген. Еще более предпочтительно R¹² представляет собой циано.

В соединении формулы (I) в соответствии с настоящим изобретением предпочтительно:

X представляет собой О или NR⁶;

- R^1 представляет собой метил или этил;
 R^2 представляет собой 3,4-дихлорфенил;
 R^3 представляет собой водород, C_1 - C_4 алкил или N,N -ди(C_1 - C_3 алкил)амино;
 R^4 представляет собой C_3 - C_6 циклоалкенил, фенил, фенил C_1 - C_2 алкил, фенил C_1 -
 5 C_2 алкенил, гетероциклил, где гетероциклильный фрагмент представляет собой 4-,
 5- или 6-членное неароматическое моноциклическое кольцо, содержащее 1, 2 или
 3 гетероатома, по отдельности выбранных из N, O и S, или гетероарил, где
 гетероарильный фрагмент представляет собой 5- или 6-членное ароматическое
 моноциклическое кольцо, содержащее 1, 2, или 3 гетероатома, по отдельности
 10 выбранных из N, O и S, и где каждый фенильный, гетероциклильный и
 гетероарильный фрагменты могут быть необязательно замещены 1, 2, 3 или 4
 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R^9 ;
 R^5 представляет собой C_1 - C_4 алкил или C_1 - C_2 алкокси C_1 - C_2 алкил;
 R^6 представляет собой водород или C_1 - C_3 алкил;
 15 R^7 представляет собой галоген;
 R^9 представляет собой циано, нитро, галоген, оксо, C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 алкокси, C_1 -
 C_6 галогеналкил, C_1 - C_6 галогеналкокси, C_1 - C_6 алкокси C_1 - C_6 алкил, C_1 -
 C_6 алкилсульфанил, C_1 - C_6 алкилсульфинил, C_1 - C_6 алкилсульфонил, C_1 -
 C_6 алкилсульфонамидо, C_1 - C_6 алкилкарбонил, C_1 - C_6 алкоксикарбонил, C_1 -
 20 C_6 алкиламинокарбонил, C_3 - C_6 циклоалкил, C_3 - C_6 циклоалкиламинокарбонил, N,N -
 ди(C_1 - C_4 алкил)аминокарбонил или бензилокси; или
 любые две смежные группы R^9 вместе с атомами углерода, к которым они
 присоединены, могут образовывать 5- или 6-членное гетероциклильное кольцо,
 содержащее 1 или 2 гетероатома, выбранных из O и N, и где гетероциклильное
 25 кольцо может быть необязательно замещено 1, 2, 3 или 4 группами, которые
 могут быть одинаковыми или разными, представленными R^{11} ; и
 R^{11} представляет собой галоген.
 В другой группе вариантов осуществления
 X представляет собой O или NR^6 ;
 30 R^1 представляет собой метил или этил;
 R^2 представляет собой 3,4-дихлорфенил;
 R^3 представляет собой водород, C_1 - C_4 алкил или N,N -ди(C_1 - C_3 алкил)амино;
 R^4 представляет собой фенил или гетероарил, где гетероарильный фрагмент
 представляет собой 5- или 6-членное ароматическое кольцо, которое содержит 1

или 2 гетероатома, по отдельности выбранных из N, O и S, и где каждый фенильный, гетероциклический и гетероарильный фрагменты могут быть необязательно замещены 1 или 2 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R⁹;

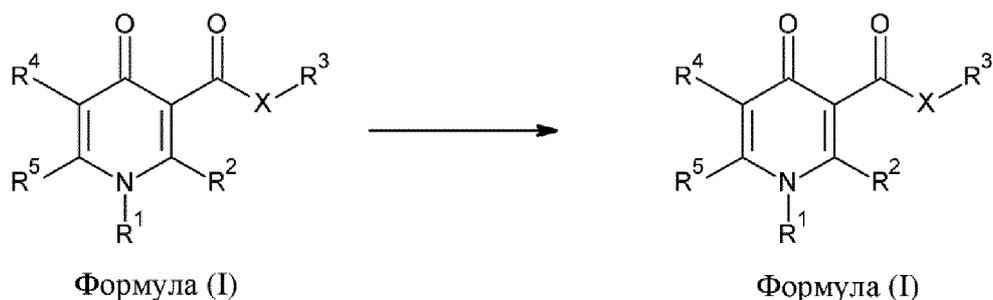
5 R⁶ представляет собой водород;

R⁷ представляет собой галоген и

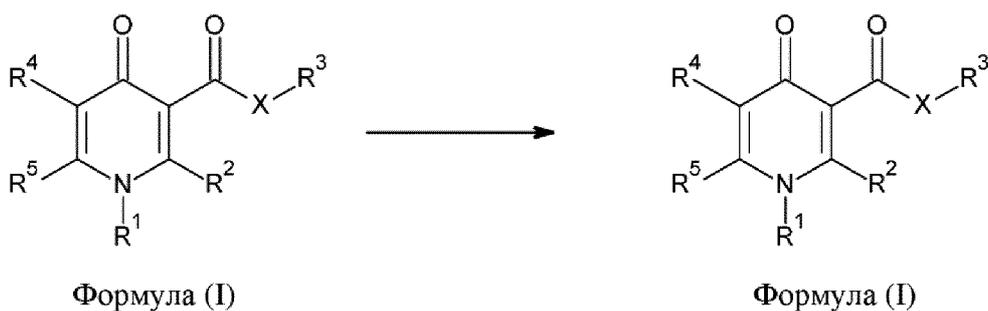
R⁹ представляет собой нитро, галоген, C₁-C₃алкил, C₁-C₃алкокси, C₁-C₃галогеналкил, C₁-C₃галогеналкокси, C₁-C₃алкилсульфонил или бензилокси-

10 Соединения по настоящему изобретению могут получать, как показано на следующих схемах, на которых, если не указано иное, определение каждой переменной определено выше для соединения формулы (I). Общие способы получения соединений формулы (I) описаны ниже. Если в тексте не указано иное, R¹, R², R³, R⁴, R⁵ и X определены выше в данном документе. Исходные материалы, используемые для получения соединений по настоящему изобретению, могут быть приобретены у
15 обычных коммерческих поставщиков или могут быть получены с помощью известных способов. Исходные материалы, а также промежуточные продукты можно очищать перед использованием на следующей стадии с помощью известных из уровня техники методик, таких как хроматография, кристаллизация, перегонка и фильтрация.

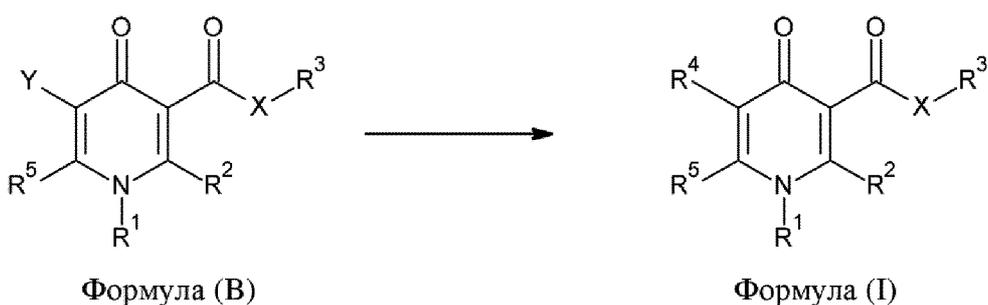
Схема 1.



20 Соединения формулы (I), где X представляет собой NH и R³ представляет собой -N(CH₃)₂, могут быть получены посредством реакции сочетания соединения формулы (I), где X представляет собой O, и R³ представляет собой водород, с 1,1-диметилгидразином и связывающим средством, таким как пропилфосфоновый ангидрид (применяемый в чистом виде или в виде раствора в этилацетате) в подходящем растворителе (таком как дихлорметан или этилацетат) с необязательной
25 добавкой (такой как диметиламинопиридин). Это показано на схеме 1 выше. Соединения формулы (I) могут быть дополнительно получены способами, описанными ниже.

Схема 2.

Соединения формулы (I), где X представляет собой O и R³ представляет собой водород, могут быть получены посредством гидролиза соединения формулы (I), где X представляет собой O, и R³ не представляет собой водород, а любую другую R³ группу, как определено выше, с подходящим основанием (таким как гидроксид натрия или гидроксид лития) или с подходящей кислотой (такой как трифторуксусная кислота, хлористоводородная кислота, муравьиная кислота или серная кислота) в подходящем растворителе (таком как метанол, этанол, дихлорметан, хлороформ, этилацетат или тетрагидрофуран) с необязательным соразтворителем (таким как вода). В тех случаях, когда применяли основание, продукт получали после подкисления подходящей кислотой (такой как хлористоводородная кислота). В случаях, когда R⁴ представлял собой пиридил или пиридазинил, продукт получали в виде эквивалентной соли (такой как соль гидрохлорида). Это показано на схеме 2 выше. Соединения формулы (I) могут быть дополнительно получены способами, описанными ниже.

Схема 3.

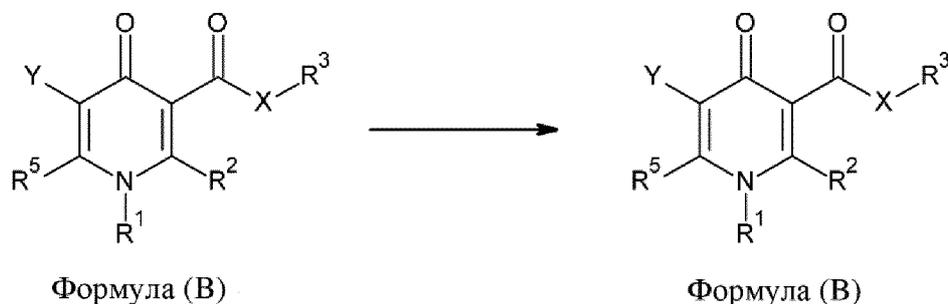
Соединения формулы (I), где R⁴ представляет собой фенил или гетероарил, могут быть дополнительно получены из соединений формулы (B), где Y представляет собой Cl, Br или I, посредством реакции кросс-сочетания Сузуки-Мияуры с применением стандартных литературных условий. Как правило, реакцию проводят путем реакции соединения формулы (B) с R⁴-бороновой кислотой или бороксином в присутствии подходящего катализатора (такого как дихлорбис(трифенилфосфин)палладий(II),

тетракис(трифенилфосфин)палладий, трис(дибензилиденацетон)дипалладий или аддукт дихлор(1,1'-бис(дифенилфосфанил)ферроцен)палладия(II) и дихлорметана) или диацетат палладия, необязательно с лигандом (таким как 2-дициклогексилфосфино-2',6'-диметоксибифенил) в присутствии основания (такого как карбонат калия или цезия или трикалийфосфат) в подходящем органическом растворителе (таком как 1,4-диоксан, толуол или тетрагидрофуран) необязательно в присутствии воды при повышенной температуре. Это показано на схеме 3 выше.

В соединениях формулы (I), где X представляет собой O, R³ представляет собой водород и R⁴ представляет собой пиридинил или пиридазинил, продукт также может быть получен в виде соли (обычно трифторацетатной или гидрохлоридной соли).

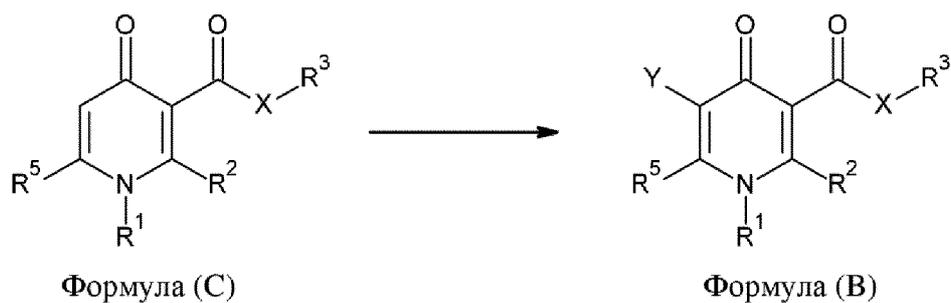
В альтернативном преобразовании соединение формулы (B), где Y представляет собой I, может быть преобразовано в соединение формулы (I), где R⁴ представляет собой C-связанный гетероцикл (такой как оксазол-2-ил), посредством реакции в условиях Стилле с, например, гетероциклическим станнаном в присутствии катализатора (такого как тетракис(трифенилфосфин)палладий(0)) в подходящем растворителе (таком как толуол) при повышенной температуре (например, 120°C).

Схема 4.



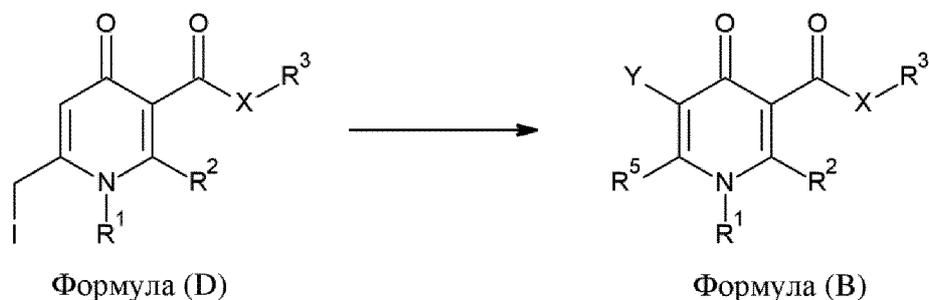
Соединения формулы (B), где X представляет собой O, R³ представляет собой водород и Y представляет собой Br или I, могут быть получены посредством гидролиза соединения формулы (B), где X представляет собой O и R³ не представляет собой водород, а любую другую R³ группу, как определено выше, с подходящим основанием (таким как гидроксид натрия или гидроксид лития) или с подходящей кислотой (такой как трифторуксусная кислота, хлористоводородная кислота, муравьиная кислота или серная кислота) в подходящем растворителе (таком как метанол, этанол, дихлорметан, хлороформ, этилацетат или тетрагидрофуран) с необязательным соразтворителем (таким как вода). Это показано на схеме 4 выше.

Схема 5.



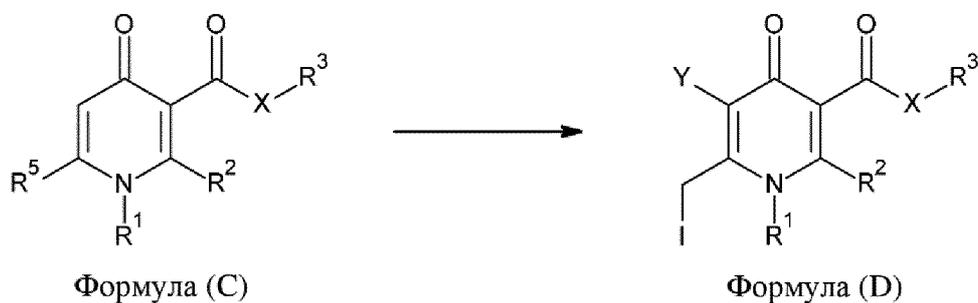
Соединения формулы (В), где Y представляет собой Br или I, могут быть получены посредством обработки соединений формулы (С) подходящим галогенирующим средством (таким как *N*-йодсукцинимид или *N*-бромсукцинимид) в подходящем растворителе (таком как ацетонитрил или трифторуксусная кислота). Это показано на схеме 5 выше.

Схема 6.



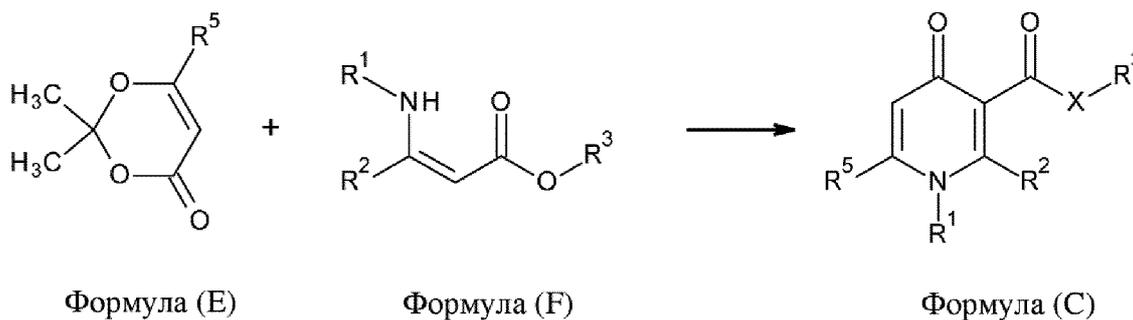
Соединения формулы (В), где Y представляет собой I и R⁵ представляет собой метилалкоксид, могут быть получены посредством реакции соединений формулы (D), где Y представляет собой I, с алкоксидным основанием (таким как метоксид натрия) в присутствии спирта (такого как метанол). Это показано на схеме 6 выше.

Схема 7.



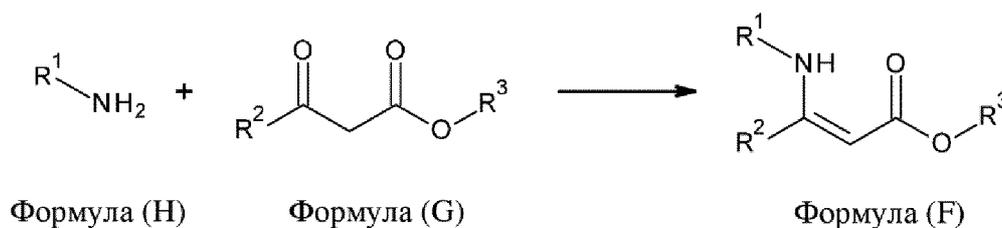
Соединения формулы (D), где Y представляет собой I, могут быть получены посредством обработки соединений формулы (С), где R⁵ представляет собой метил, с подходящим йодирующим средством (таким как *N*-йодсукцинимид) в подходящем растворителе (таком как ацетонитрил) с дополнительной кислотой (такой как трифторуксусная кислота). Это показано на схеме 7 выше.

Схема 8.



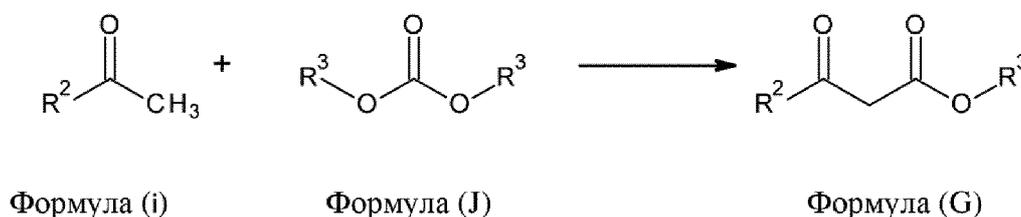
Соединения формулы (С), где Х представляет собой О, могут быть получены посредством осуществления реакции соединения формулы (Е) с соединением формулы (F) без растворителя при повышенной температуре (например, 120°C). Соединения формулы Е являются коммерчески доступными или могут быть получены способами, известными специалистам в данной области техники. Это показано на схеме 8 выше.

Схема 9.



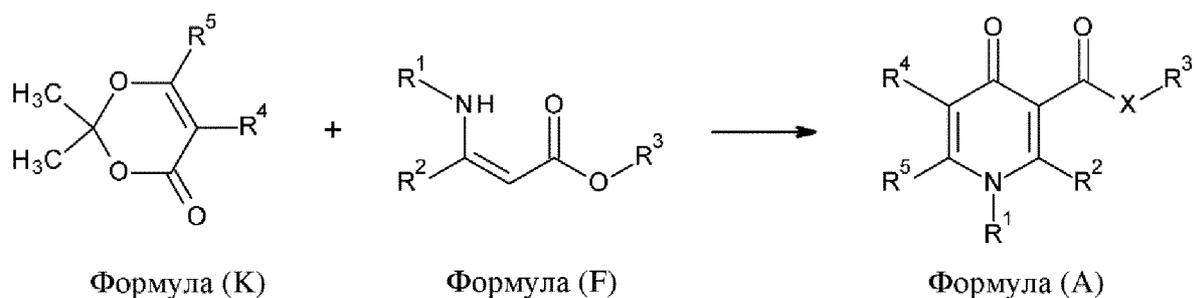
Соединения формулы (F) могут быть получены в результате реакции сложных β-кетозэфиров формулы (G) с солью амина. Соли аминов могут быть получены *in situ* посредством подкисления аминов формулы (H) подходящей кислотой (такой как уксусная кислота). Затем такие соли аминов могут вводить в реакцию с соединениями формулы (G) в подходящем растворителе (таком как толуол) в присутствии кислоты (такой как уксусная кислота) и высушивающего средства (такого как молекулярные сита 4Å). Соединения формулы (G) являются коммерчески доступными или могут быть получены в условиях, описанных ниже. Соединения формулы (H) являются коммерчески доступными или могут быть получены способами, известными специалистам в данной области техники. Это показано на схеме 9 выше.

20 Схема 10.



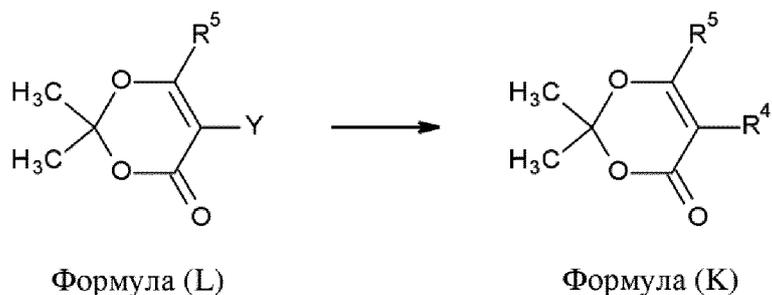
Соединения формулы (G) могут быть получены обработкой кетонов формулы (I) с основанием (таким как гидрид натрия) в присутствии диалкилкарбонатов формулы (J) (таких как диметилкарбонат). Соединения формулы (i) и формулы (J) являются коммерчески доступными или могут быть получены способами, известными 5 специалистам в данной области техники. Это показано на схеме 10 выше.

Схема 11.



Соединения формулы (A), где X представляет собой O и R^3 не представляет собой водород, но любую другую R^3 группу, как определено выше, могут быть получены 10 посредством осуществления реакции соединения формулы (K) с соединением формулы (F), где R^3 не представляет собой водород, но любую другую R^3 группу, без растворителя при повышенной температуре (например, 120°C). Это показано на схеме 11 выше.

Схема 12.

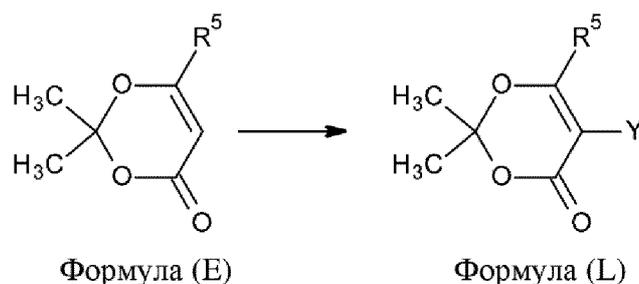


Соединения формулы (K), где R^4 представляет собой фенил, могут быть 15 получены с помощью реакции соединений формулы (L), где Y представляет собой I, в условиях кросс-сочетания Сузуки-Мияуры по аналогии с литературными условиями. Как правило, реакцию проводят путем реакции соединения формулы (K) с R^4 - 20 бороновой кислотой или бороксином в присутствии подходящего катализатора (такого как дихлорбис(трифенилфосфин)палладий(II), тетракис(трифенилфосфин)палладий, трис(дибензилиденацетон)дипалладий или аддукт дихлор(1,1'-бис(дифенилфосфанил)ферроцен)палладия(II) и дихлорметана) или диацетат палладия,

необязательно с лигандом (таким как 2-дициклогексилфосфино-2',6'-диметоксибифенил) в присутствии основания (такого как карбонат калия или цезия или трикалийфосфат) в подходящем органическом растворителе (таком как 1,4-диоксан, толуол или тетрагидрофуран) необязательно в присутствии воды при повышенной

5 температуре. Это показано на схеме 12 выше.

Схема 13.



Соединения формулы (L), где Y представляет собой Br или I, могут быть получены посредством обработки соединений формулы (E) подходящим галогенирующим

10 средством (таким как *N*-йодсукцинимид или *N*-бромсукцинимид) в подходящем растворителе (таком как ацетонитрил, уксусная кислота или трифторуксусная кислота). Соединения формулы (E) являются коммерчески доступными или могут быть получены способами, известными специалистам в данной области техники. Это

показано на схеме 13 выше.

15 В настоящем изобретении, кроме того, дополнительно предусмотрен способ контроля сорняков в месте произрастания, включающий применение по отношению к месту произрастания достаточного для контроля сорняков количества композиции, содержащей соединение формулы (I). Более того, в настоящем изобретении может быть

20 дополнительно представлен способ избирательного контроля сорняков в месте произрастания полезных (культурных) растений и сорняков, при этом способ включает применение по отношению к месту произрастания достаточного для контроля сорняков количества композиции согласно настоящему изобретению. «Контроль» означает

уничтожение, снижение или замедление роста или предупреждение или снижение прорастания. Следует отметить, что соединения по настоящему изобретению

25 демонстрируют значительно улучшенную селективность по сравнению с известными структурно аналогичными соединениями. Обычно растениями, подлежащими контролю, являются нежелательные растения (сорняки). "Место произрастания" означает территорию, на которой растения произрастают или будут произрастать. Применение могут осуществлять в отношении места произрастания до появления

всходов и/или после появления всходов культурного растения. Некоторые культурные растения могут обладать природной выносливостью к гербицидным эффектам соединений формулы (I).

5 Нормы применения соединений формулы (I) могут варьировать в широких пределах и зависят от характера почвы, способа применения (до или после появления всходов; протравливание семян; внесение в борозду для семян; применение при беспашотной обработке и т. д.), культурного растения, сорняка(-ов), который(-е) подлежит(-ат) контролю, преобладающих климатических условий и других факторов, определяемых способом применения, временем применения и целевой
10 сельскохозяйственной культурой. Соединения формулы I в соответствии с настоящим изобретением обычно применяют при норме от 10 до 2500 г/га, в частности от 25 до 1000 г/га, более конкретно от 25 до 250 г/га.

Применение обычно осуществляют посредством распыления композиции, как правило, с помощью установленного на тракторе опрыскивателя для больших
15 площадей, но также могут применяться и другие способы, такие как опыление (для порошков), капельный полив или орошение.

Термин "полезные растения" следует понимать как также включающий полезные растения, которым придали выносливость к гербицидам, таким как бромоксинил, или классам гербицидов, таким как, например, ингибиторы 4-
20 гидроксифенилпируватдиоксигеназы (HPPD), ингибиторы ALS, например примисульфурон, просульфурон и трифлорисульфурон, ингибиторы 5-енолпирувиллицимат-3-фосфатсинтазы (EPSPS), ингибиторы глутаминсинтазы (GS) или ингибиторы протопорфириногенаоксидазы (PPO), в результате применения традиционных способов селекции или генной инженерии. Примером
25 сельскохозяйственной культуры, которой была придана толерантность к имидазолинонам, например имазамоксу, посредством традиционных способов селекции (мутагенеза), является сурепица Clearfield® (канола). Примеры сельскохозяйственных культур, которым была придана толерантность к гербицидам или классам гербицидов посредством способов генной инженерии, включают
30 устойчивые к глифосату и глюфосинату сорта маиса, коммерчески доступные под торговыми названиями RoundupReady®, Herculex I® и LibertyLink®.

Термин "полезные растения" следует понимать как также включающий полезные растения, которые были трансформированы посредством применения методик с использованием рекомбинантных ДНК таким образом, что они стали способны

синтезировать один или несколько токсинов избирательного действия, таких как известные, например, у токсинообразующих бактерий, в особенности бактерий рода *Bacillus*.

Примерами таких растений являются YieldGard® (сорт маиса, экспрессирующий токсин CryIA(b)); YieldGard Rootworm® (сорт маиса, экспрессирующий токсин CryIIIВ(b1)); YieldGard Plus® (сорт маиса, экспрессирующий токсин CryIA(b) и токсин CryIIIВ(b1)); Starlink® (сорт маиса, экспрессирующий токсин Cry9(c)); Herculex I® (сорт маиса, экспрессирующий токсин CryIF(a2) и фермент фосфинотрицин-N-ацетилтрансферазу (PAT) для обеспечения толерантности к гербициду глюфосинату аммония); NuCOTN 33В® (сорт хлопчатника, экспрессирующий токсин CryIA(c)); Bollgard I® (сорт хлопчатника, экспрессирующий токсин CryIA(c)); Bollgard II® (сорт хлопчатника, экспрессирующий токсин CryIA(c) и токсин CryIIA(b)); VIPCOT® (сорт хлопчатника, экспрессирующий токсин VIP); NewLeaf® (сорт картофеля, экспрессирующий токсин CryIIIА); NatureGard® Agrisure® GT Advantage (GA21 с признаком толерантности к глифосату), Agrisure® CB Advantage (Bt11 с признаком устойчивости к кукурузному мотыльку (CB)), Agrisure® RW (с признаком устойчивости к западному кукурузному жуку) и Protecta®.

Сельскохозяйственные культуры растений или их семенной материал могут быть как устойчивыми к гербицидам, так и в то же время устойчивыми к поеданию насекомыми (трансгенные объекты с "пакетированными" генами). Например, семя может обладать способностью экспрессировать инсектицидный белок Cry3, в то же время будучи выносливым к глифосату.

Также следует понимать, что культурные растения включают те, которые получены с помощью традиционных способов селекции или генной инженерии и обладают так называемыми привнесенными признаками (например, улучшенной стабильностью при хранении, более высокой питательной ценностью и улучшенным вкусом).

Соединения формулы (I) (или содержащие их композиции) могут использовать для контроля нежелательных растений (обобщенно «сорняки»). Сорняки, подлежащие контролю, могут представлять собой как виды однодольных растений, например *Agrostis*, *Alopecurus*, *Avena*, *Brachiaria*, *Bromus*, *Cenchrus*, *Cyperus*, *Digitaria*, *Echinochloa*, *Eleusine*, *Lolium*, *Monochoria*, *Rottboellia*, *Sagittaria*, *Scirpus*, *Setaria* и *Sorghum*, так и виды двудольных растений, например *Abutilon*, *Amaranthus*, *Ambrosia*,

Chenopodium, Chrysanthemum, Conyza, Galium, Ipomoea, Nasturtium, Sida, Sinapis, Solanum, Stellaria, Veronica, Viola и *Xanthium*.

Соединения формулы (I) могут применять в немодифицированной форме или, предпочтительно, вместе со вспомогательными веществами, традиционно применяемыми в области составления для получения гербицидных композиций с применением вспомогательных веществ для составления, таких как носители, растворители и поверхностно-активные вещества (SAA). В настоящем изобретении, следовательно, дополнительно представлена гербицидная композиция, содержащая по меньшей мере одно соединение формулы (I) и приемлемый с точки зрения сельского хозяйства носитель и необязательно вспомогательное вещество. Приемлемый с точки зрения сельского хозяйства носитель представляет собой, например, носитель, который является подходящим для сельскохозяйственного применения. Сельскохозяйственные носители хорошо известны из уровня техники.

Гербицидные композиции, как правило, содержат от 0,1 до 99% по весу, в частности от 0,1 до 95% по весу соединений формулы (I) и от 1 до 99,9% по весу вспомогательного средства для составления, которое предпочтительно включает от 0 до 25% по весу поверхностно-активного вещества.

Композиции могут быть выбраны из ряда типов составов. Таковые включают эмульсионный концентрат (EC), суспензионный концентрат (SC), суспензию (SE), капсульную суспензию (CS), диспергируемую в воде гранулу (WG), эмульгируемую гранулу (EG), эмульсию типа "вода в масле" (EO), эмульсию типа "масло в воде" (EW), микроэмульсию (ME), масляную дисперсию (OD), смешиваемый с маслом текучий состав (OF), смешиваемую с маслом жидкость (OL), растворимый концентрат (SL), суспензию для сверхнизкообъемного применения (SU), жидкость для сверхнизкообъемного применения (UL), технический концентрат (TK), диспергируемый концентрат (DC), растворимый порошок (SP), смачиваемый порошок (WP) и растворимую гранулу (SG). Выбранный тип состава в любом случае будет зависеть от конкретного предусматриваемого назначения, а также физических, химических и биологических свойств соединения формулы (I).

Растворимые порошки (SP) можно получать посредством смешивания соединения формулы (I) с одной или несколькими водорастворимыми неорганическими солями (такими как бикарбонат натрия, карбонат натрия или сульфат магния) или с одним или несколькими водорастворимыми органическими твердыми веществами (такими как полисахарид) и необязательно с одним или несколькими

смачивающими средствами, одним или несколькими диспергирующими средствами или смесью указанных средств для улучшения диспергируемости/растворимости в воде. Затем смесь измельчают до тонкодисперсного порошка. Подобные композиции также могут быть гранулированы с образованием водорастворимых гранул (SG).

5 Смачиваемые порошки (WP) могут получать посредством смешивания соединения формулы (I) с одним или несколькими твердыми разбавителями или носителями, одним или несколькими смачивающими средствами и предпочтительно одним или несколькими диспергирующими средствами, а также необязательно с одним или несколькими суспендирующими средствами для облегчения диспергирования в
10 жидкостях. Затем смесь измельчают до тонкодисперсного порошка. Подобные композиции также могут быть гранулированы с образованием диспергируемых в воде гранул (WG).

Гранулы (GR) могут быть образованы либо посредством гранулирования смеси соединения формулы (I) и одного или нескольких порошкообразных твердых
15 разбавителей или носителей, либо из предварительно образованных пустых гранул посредством абсорбции соединения формулы (I) (или его раствора в подходящем средстве) в пористом гранулированном материале (таком как пемза, аттапульгитовые глины, фуллерова земля, кизельгур, диатомовые земли или измельченные кукурузные початки) или посредством адсорбции соединения формулы (I) (или его раствора в
20 подходящем средстве) на твердом зернистом материале (таком как пески, силикаты, минеральные карбонаты, сульфаты или фосфаты) и высушивания в случае необходимости. Средства, которые обычно применяют для облегчения абсорбции или адсорбции, включают растворители (такие как алифатические и ароматические нефтяные растворители, спирты, эфиры, кетоны и сложные эфиры) и средства,
25 способствующие слипанию (такие как поливинилацетаты, поливиниловые спирты, декстрины, сахара и растительные масла). В гранулы также могут быть включены одна или несколько других добавок (например, эмульгирующее средство, смачивающее средство или диспергирующее средство).

Диспергируемые концентраты (DC) могут быть получены посредством
30 растворения соединения формулы (I) в воде или органическом растворителе, таком как кетон, спирт или гликолевый эфир. Такие растворы могут содержать поверхностно активное средство (например, для улучшения разбавления водой или предотвращения кристаллизации в резервуаре опрыскивателя).

Эмульгируемые концентраты (ЕС) или эмульсии типа "масло в воде" (EW) можно получать посредством растворения соединения формулы (I) в органическом растворителе (необязательно содержащем одно или несколько смачивающих средств, одно или несколько эмульгирующих средств или смесь указанных средств).

5 Подходящие органические растворители для применения в ЕС включают ароматические углеводороды (такие как алкилбензолы или алкилнафталины, примерами которых являются SOLVESSO 100, SOLVESSO 150 и SOLVESSO 200; причем SOLVESSO является зарегистрированной торговой маркой), кетоны (такие как циклогексанон или метилциклогексанон) и спирты (такие как бензиловый спирт, 10 фурфуроловый спирт или бутанол), N-алкилпирролидоны (такие как N-метилпирролидон или N-октилпирролидон), диметилами́ды жирных кислот (такие как диметиламид C₈-C₁₀жирной кислоты) и хлорированные углеводороды. ЕС-продукт может самопроизвольно образовывать эмульсию при добавлении в воду с получением эмульсии, обладающей достаточной стабильностью, что позволяет применять ее 15 посредством распыления с помощью соответствующего оборудования.

Получение EW включает получение соединения формулы (I) либо в виде жидкости (если оно представляет собой не жидкость при комнатной температуре, его можно расплавить при допустимой температуре, как правило, ниже 70°C), либо в виде раствора (путем растворения его в соответствующем растворителе), а затем 20 эмульгирование полученной жидкости или раствора в воде, содержащей одно или несколько SAA, при условиях высокого сдвига с получением эмульсии. Подходящие растворители для применения в EW включают растительные масла, хлорированные углеводороды (такие как хлорбензолы), ароматические растворители (такие как алкилбензолы или алкилнафталины) и другие соответствующие органические 25 растворители, которые характеризуются низкой растворимостью в воде.

Микроэмульсии (ME) могут получать посредством смешивания воды со смесью одного или нескольких растворителей с одним или несколькими SAA с самопроизвольным образованием термодинамически стабильного изотропного жидкого состава. Соединение формулы (I) изначально присутствует либо в воде, либо в смеси 30 растворитель/SAA. Подходящие растворители для применения в ME включают растворители, описанные в данном документе выше для применения в ЕС или в EW. ME может представлять собой систему либо типа "масло в воде", либо типа "вода в масле" (при этом система может быть определена посредством измерений электрической проводимости) и может быть подходящей для смешивания

водорастворимых и маслорастворимых пестицидов в одном и том же составе. ME является подходящей для разбавления в воде, при этом она либо остается в виде микроэмульсии, либо образует обычную эмульсию типа "масло в воде".

5 Суспензионные концентраты (SC) могут содержать водные или неводные суспензии мелкоизмельченных нерастворимых твердых частиц соединения формулы (I). SC могут получать посредством размалывания в шаровой или бисерной мельнице твердого соединения формулы (I) в подходящей среде, необязательно с одним или несколькими диспергирующими средствами, с получением тонкодисперсной суспензии соединения. В композицию могут быть включены одно или несколько смачивающих
10 средств, а также может быть включено суспендирующее средство для снижения скорости оседания частиц. В качестве альтернативы соединения формулы (I) могут подвергаться сухому помолу и добавлять в воду, содержащую средства, описанные в данном документе выше, с получением требуемого конечного продукта.

15 Аэрозольные составы содержат соединение формулы (I) и подходящий газ-вытеснитель (например, *n*-бутан). Соединение формулы (I) также можно растворять или диспергировать в подходящей среде (например, в воде или в смешивающейся с водой жидкости, такой как *n*-пропанол) с получением композиций, предназначенных для применения в не находящихся под давлением насосах для опрыскивания с ручным управлением.

20 Капсульные суспензии (CS) могут быть получены аналогично получению составов EW, но с дополнительной стадией полимеризации с получением водной дисперсии капель масла, в которой каждая капля масла инкапсулирована полимерной оболочкой и содержит соединение формулы (I) и необязательно его носитель или разбавитель. Полимерную оболочку могут получать либо с помощью осуществления
25 реакции межфазной поликонденсации, либо с помощью процедуры коацервации. Композиции могут обеспечивать контролируемое высвобождение соединения формулы (I) и их могут применять для обработки семян. Соединение формулы (I) также могут составлять в биоразлагаемую полимерную матрицу с обеспечением медленного контролируемого высвобождения соединения.

30 Композиция может включать одну или несколько добавок для улучшения биологической эффективности композиции, например, посредством улучшения смачивания, удержания на поверхностях или распределения по поверхностям; устойчивости к смыванию дождем с обработанных поверхностей или же поглощения или подвижности соединения формулы (I). Такие добавки включают поверхностно-

активные вещества (SAA), добавки для опрыскивания на основе масел, например, определенные минеральные масла или природные растительные масла (такие как соевое и рапсовое масло), модифицированные растительные масла, такие как метилированное рапсовое масло (MRSO), и их смеси с другими биоусиливающими вспомогательными средствами (ингредиентами, которые могут способствовать действию соединения формулы (I) или модифицировать его).

Смачивающие средства, диспергирующие средства и эмульгирующие средства могут представлять собой SAA катионного, анионного, амфотерного или неионогенного типа.

10 Подходящие SAA катионного типа включают соединения четвертичного аммония (например, бромид цетилтриметиламмония), имидазолины и соли аминов.

Подходящие анионные SAA включают соли щелочных металлов и жирных кислот, соли алифатических сложных моноэфиров серной кислоты (например, лаурилсульфат натрия), соли сульфонированных ароматических соединений (например, додецилбензолсульфонат натрия, додецилбензолсульфонат кальция, бутилнафталинсульфонат и смеси *ди*изопропил- и *три*изопропилнафталинсульфонатов натрия), эфирсульфаты, эфирсульфаты спиртов (например, лаурет-3-сульфат натрия), эфиркарбоксилаты (например, лаурет-3-карбоксилат натрия), сложные эфиры фосфорной кислоты (продукты реакции между одним или несколькими жирными спиртами и фосфорной кислотой (преимущественно сложные моноэфиры) или пентаоксидом фосфора (преимущественно сложные диэфиры), например, при реакции между лауриловым спиртом и тетрафосфорной кислотой; дополнительно эти продукты могут быть этоксилированы), сульфосукцинаматы, парафин- или олефинсульфонаты, таураты, лигносульфонаты и фосфаты/сульфаты тристирилфенолов.

25 Подходящие SAA амфотерного типа включают бетаины, пропионаты и глицинаты.

Подходящие SAA неионогенного типа включают продукты конденсации алкиленоксидов, таких как этиленоксид, пропиленоксид, бутиленоксид или их смеси, с жирными спиртами (такими как олеиловый спирт или цетиловый спирт) или с алкилфенолами (такими как октилфенол, нонилфенол или октилкрезол); неполные сложные эфиры, полученные из длинноцепочечных жирных кислот или ангидридов гексита; продукты конденсации указанных неполных сложных эфиров с этиленоксидом; блок-сополимеры (содержащие этиленоксид и пропиленоксид); алканоламиды; сложные эфиры с простой структурой (например, сложные эфиры

жирной кислоты и полиэтиленгликоля); аминоксиды (например, лаурилдиметиламиноксид); лецитины и сорбитаны и их сложные эфиры, алкилполигликозиды и тристирилфенолы.

5 Подходящие суспендирующие средства включают гидрофильные коллоиды (такие как полисахариды, поливинилпирролидон или натрий-карбоксиметилцеллюлоза) и набухающие глины (такие как бентонит или аттапульгит).

Соединения по настоящему изобретению могут быть также использованы в смеси с одним или несколькими дополнительными гербицидами и/или регуляторами роста растений. Примеры таких дополнительных гербицидов или регуляторов роста растений включают ацетохлор, ацифлуорфен (включая ацифлуорфен-натрий), аклонифен, аметрин, амикарбазон, аминопиралид, аминотриазол, атразин, бефлубутамид-М, бенквистрион, бенсульфурон (включая бенсульфурон-метил), бентазон, бициклопирон, биланафос, бипиразон, биспирибак-натрий, бикслозон, бромацил, бромоксинил, бутахлор, бутафенацил, карфентразон (включая карфентразон-этил), клорансулам (включая клорансулам-метил), хлоримурон (включая хлоримурон-этил), хлоротолурон, хлорсульфурон, цинметилин, клацифос, клетодим, клодинафоп (включая клодинафоп-пропаргил), кломазон, клопиралид, циклопиранил, циклопириморат, циклосульфамурон, цигалофоп (включая цигалофоп-бутил), 2,4-Д (включая соль холина и его сложный 2-этилгексильный эфир), 2,4-ДБ, десмедифам, 20 дикамба (включая ее алюминиевую, аминопропиловую, бисаминопропилметильную, холиновую, дихлорпроповую, дигликольаминную, диметиламинную, диметиламмониевую, калиевую и натриевую соли), диклосулам, дифлуфеникан, дифлуфензопир, диметахлор, диметенамид-П, диоксопиритрион, дикват дибромид, диурон, эпирифенацил, эталфлуралин, этофумезат, феноксапроп (включая 25 феноксапроп-П-этил), феноксасульфен, фенпиразон, фенквинотрион, фентразамид, флазасульфурон, флорасулам, флорпирауксифен (включая флорпирауксифен-бензил), флуазифоп (включая флуазифоп-П-бутил), флукарбазон (включая флукарбазон-натрий), флуфенацет, флуметсулам, флумиоксазин, флуометурон, фомесафен, флупирсульфурон (включая флупирсульфурон-метил-натрий), флуорокспир (включая 30 флуорокспир-мептил), фомесафен, форамсульфурон, глюфосинат (включая L-глюфосинат и аммониевые соли обоих), глифосат (включая его диаммониевую, изопропиламмониевую и калиевую соли), галауксифен (включая галауксифен-метил), галоксифоп (включая галоксифоп-метил), гексазион, гидантоцидин, имазамокс (включая R-имазамокс), имазапик, имазапир, имазетапир, индазифлам, йодосульфурон

(включая йодосульфурон-метил-натрий), иофенсульфурон (включая иофенсульфурон-натрий), иоксинил, изопротурон, изоксафлютол, ланкотрион, МЦПА, МЦПБ, мекопроп-П, мезосульфурон (включая мезосульфурон-метил), мезотрион, метамитрон, метазахлор, метиозолин, метолахлор, метосулам, метрибузин, метсульфурон, напропамид, никосульфурон, норфлуразон, оксадиазон, оксасульфурон, оксифлуорфен, дихлорид параквата, пендиметалин, пеноксулам, фенмедифам, пихлорам, пиноксаден, претилахлор, примисульфурон-метил, прометрин, пропанил, пропаквизафоп, пропирисульфурон, пропизамид, просульфоккарб, просульфурон, пираклонил, пирафлуфен (включая пирафлуфен-этил), пирасульфотол, пиридат, пирифталид, пиримисульфан, пироксасульфен, пироксулам, квинкlorак, квинмерак, квизалофоп (включая квизалофоп-П-этил и квизалофоп-П-тефурил), римисоксафен, римсульфурон, сафлуфенацил, сетоксидим, симазин, S-металохлор, сульфентразон, сульфосульфурон, тебутиурон, тефурилтрион, темботрион, тербутилазин, тербутрин, тетфлупиролимет, тиенкарбазон, тифенсульфурон, тиафенацил, толпиралат, топрамезон, тралкоксидим, триафамон, триаллат, триасульфурон, трибенурон (включая трибенурон-метил), триклопир, трифлорисульфурон (включая трифлорисульфурон-натрий), трифлудимоксазин, трифлуралин, трифлусульфурон, трипирасульфен, сложный этиловый эфир 3-(2-хлор-4-фтор-5-(3-метил-2,6-диоксо-4-трифторметил-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил)фенил)-5-метил-4,5-дигидроизоксазол-5-карбоновой кислоты, 4-гидрокси-1-метокси-5-метил-3-[4-(трифторметил)-2-пиридил]имидазолидин-2-он, 4-гидрокси-1,5-диметил-3-[4-(трифторметил)-2-пиридил]имидазолидин-2-он, 5-этоксид-4-гидрокси-1-метил-3-[4-(трифторметил)-2-пиридил]имидазолидин-2-он, 4-гидрокси-1-метил-3-[4-(трифторметил)-2-пиридил]имидазолидин-2-он, 4-гидрокси-1,5-диметил-3-[1-метил-5-(трифторметил)пиразол-3-ил]имидазолидин-2-он, (4R)-1-(5-трет-бутилизоксазол-3-ил)-4-этоксид-5-гидрокси-3-метилимидазолидин-2-он, 4-амино-3-хлор-5-фтор-6-(7-фтор-1H-индол-6-ил)пиридин-2-карбоновая кислота (включая ее агрохимически приемлемые сложные эфиры, например, метил-4-амино-3-хлор-5-фтор-6-(7-фтор-1H-индол-6-ил)пиридин-2-карбоксилат, проп-2-инил-4-амино-3-хлор-5-фтор-6-(7-фтор-1H-индол-6-ил)пиридин-2-карбоксилат и цианометил-4-амино-3-хлор-5-фтор-6-(7-фтор-1H-индол-6-ил)пиридин-2-карбоксилат), 3-этилсульфанил-N-(1,3,4-оксадиазол-2-ил)-5-(трифторметил)-[1,2,4]триазоло[4,3-а]пиридин-8-карбоксамид, 3-(изопропилсульфанилметил)-N-(5-метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил)-5-(трифторметил)-[1,2,4]триазоло[4,3-а]пиридин-8-карбоксамид, 3-(изопропилсульфонилметил)-N-(5-

метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил)-5-(трифторметил)-[1,2,4]триазоло[4,3-а]пиридин-8-карбоксамид, 3-(этилсульфонилметил)-N-(5-метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил)-5-(трифторметил)-[1,2,4]триазоло[4,3-а]пиридин-8-карбоксамид, этил-2-[3-[3-хлор-5-фтор-6-[3-метил-2,6-диоксо-4-(трифторметил)пиримидин-1-ил]-2-пиридил]окси]ацетат, 6-хлор-4-(2,7-диметил-1-нафтил)-5-гидрокси-2-метилпиридазин-3-он, тетрагидрофуран-2-илметил-(2R)-2-[(4-амино-3,5-дихлор-6-фтор-2-пиридил)окси]пропаноат, (2R)-2-[(4-амино-3,5-дихлор-6-фтор-2-пиридил)окси]пропановая кислота, тетрагидрофуран-2-илметил-2-[(4-амино-3,5-дихлор-6-фтор-2-пиридил)окси]пропаноат, 2-[(4-амино-3,5-дихлор-6-фтор-2-пиридил)окси]пропановая кислота, 2-фтор-N-(5-метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил)-3-[(R)-пропилсульфинил]-4-(трифторметил)бензамид, 2-фтор-N-(5-метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил)-3-пропилсульфинил-4-(трифторметил)бензамид, (2-фторфенил)метил-6-амино-5-хлор-2-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифенил)пиримидин-4-карбоксилат, 6-амино-5-хлор-2-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифенил)пиримидин-4-карбоновая кислота, 3-(3-хлорфенил)-6-(5-гидрокси-1,3-диметилпиразол-4-карбонил)-1,5-диметилхиназолин-2,4-дион и [4-[3-(3-хлорфенил)-1,5-диметил-2,4-диоксохиназолин-6-карбонил]-2,5-диметилпиразол-3-ил]-N,N-диэтилкарбамат.

Смешиваемые компоненты для соединения формулы (I) также могут находиться в форме сложных эфиров или солей, как упоминается, например, в *The Pesticide Manual*, Sixteenth Edition, British Crop Protection Council, 2012. Соотношение в смеси соединения формулы (I) и смешиваемого с ним компонента предпочтительно составляет от 1: 100 до 1000:1.

Смеси преимущественно могут применять в упомянутых выше составах (в этом случае выражение "активный ингредиент" относится к соответствующей смеси соединения формулы (I) со смешиваемым компонентом).

Соединения или смеси по настоящему изобретению также могут использовать в комбинации с одним или несколькими антидотами гербицидов. Примеры таких антидотов включают беноксакор, клоквинтосет (включая клоквинтосет-мексил), ципросульфамид, дихлормид, фенхлоразол (включая фенхлоразол-этил), фенклорим, флуксофеним, фурилазол, изоксадифен (включая изоксадифен-этил), мефенпир (включая мефенпир-диэтил), меткамифен и оксабетринил.

Особенно предпочтительными являются смеси соединения формулы (I) с ципросульфамидом, изоксадифен-этилом, клоквинтосет-мексиллом и/или меткамифеном.

Антидоты соединения формулы (I) также могут находиться в форме сложных эфиров или солей, как упоминается, например, в The Pesticide Manual, 16th Edition (BCPC), 2012. Ссылка на клоквинтосет-мексил также относится к его соли с литием, натрием, калием, кальцием, магнием, алюминием, железом, аммонием, четвертичным аммонием, сульфонием или фосфонием, как раскрыто в WO 02/34048.

Соотношение в смеси соединения формулы (I) и антидота составляет предпочтительно от 100:1 до 1:10, в частности от 20:1 до 1:1.

Соединения формулы (I) обычно применяют в форме агрохимических композиций, и их можно применять в отношении посевной площади или растения, подлежащего обработке, одновременно или последовательно с дополнительными соединениями. Такие дополнительные соединения могут представлять собой, например, удобрения, или доноры микроэлементов, или другие препараты, которые влияют на рост растений. Они также могут представлять собой селективные гербициды или неселективные гербициды, а также инсектициды, фунгициды, бактерициды, нематоциды, моллюскоциды или смеси из нескольких этих препаратов, при необходимости вместе с дополнительными носителями, поверхностно-активными веществами или облегчающими применение вспомогательными веществами, обычно используемыми в области составления.

Термин "место произрастания", используемый в данном документе, означает поля, в которых или на которых выращивают растения, или где высевают семена культивируемых растений, или где семена будут помещать в почву. Он включает почву, семена и проростки, а также имеющиеся зеленые растения.

Термин "растения" относится ко всем физическим частям растения, включая семена, проростки, побеги, корни, клубни, стебли, черешки, листья и плоды.

Термин "материал для размножения растений" понимают как обозначающий генеративные органы растения, такие как семена, которые можно применять для размножения последнего, и вегетативный материал, такой как ростки или клубни, например, картофеля. В данном случае могут быть упомянуты, например, семена (в строгом смысле), корни, плоды, клубни, луковицы, корневища и части растений. Также можно упомянуть проросшие растения и молодые растения, которые следует пересадить после прорастания или после появления из почвы. Эти молодые растения можно защитить до пересадки посредством полной или частичной обработки путем погружения. Предпочтительно "растительный материал для размножения" следует понимать как означающий семена.

Пестицидные средства, указанные в данном документе с использованием их общепринятых названий, известны, например, из "The Pesticide Manual", 15th Ed., British Crop Protection Council 2009.

5 Соединения формулы (I) можно применять в немодифицированной форме или, предпочтительно, вместе со вспомогательными веществами, традиционно применяемыми в области составления. Поэтому в целях удобства их можно составлять с помощью известного способа в эмульгируемые концентраты, наносимые в виде покрытия пасты, непосредственно распыляемые или разбавляемые растворы или суспензии, разбавленные эмульсии, смачиваемые порошки, растворимые порошки, 10 пылевидные препараты, грануляты, а также инкапсулированные формы, например, в полимерных веществах. Как и в случае с типом композиций, способы применения, такие как распыление, мелкодисперсное распыление, опыление, рассеивание, нанесение покрытия или полив, выбирают в соответствии с предполагаемыми целями и преобладающими условиями. Композиции также могут содержать дополнительные 15 вспомогательные вещества, такие как стабилизаторы, противовспениватели, регуляторы вязкости, связующие вещества или вещества для повышения клейкости, а также удобрения, доноры микроэлементов или другие составы для получения особых эффектов.

20 Подходящие носители и вспомогательные вещества, например, для сельскохозяйственного применения, могут быть твердыми или жидкими и представлять собой вещества, пригодные в технологии составления, например, природные или регенерированные минеральные вещества, растворители, диспергирующие вещества, смачивающие вещества, вещества для повышения клейкости, загустители, связующие вещества или удобрения. Такие носители, например, описаны в WO 97/33890.

25 Соединения формулы (I) обычно применяют в форме композиций, и их можно применять по отношению к посевной площади или растению, подлежащему обработке, одновременно или последовательно с дополнительными соединениями. Такие дополнительные соединения могут представлять собой, например, удобрения, или доноры микроэлементов, или другие препараты, которые влияют на рост растений. Они 30 также могут представлять собой селективные гербициды или неселективные гербициды, а также инсектициды, фунгициды, бактерициды, нематоциды, моллюскоциды или смеси из нескольких этих препаратов, при необходимости вместе с дополнительными носителями, поверхностно-активными веществами или

облегчающими применение вспомогательными веществами, обычно используемыми в области составления.

Соединение формулы (I) может быть единственным активным ингредиентом в композиции, или оно может быть смешано с одним или несколькими дополнительными активными ингредиентами, такими как пестицид, фунгицид, синергист, гербицид или регулятор роста растений, если это необходимо. Дополнительный активный ингредиент может, в некоторых случаях, приводить к появлению неожиданных синергических видов активности.

Как правило, составы содержат от 0,01 до 90% по весу активного средства, от 0 до 20% приемлемого с точки зрения сельского хозяйства поверхностно-активного вещества и от 10 до 99,99% твердых или жидких инертных компонентов состава и вспомогательного(вспомогательных) вещества(веществ), при этом активное средство состоит из по меньшей мере соединения формулы (I) вместе с компонентом (B) и (C) и необязательно других активных средств, в частности, микробиоцидов, или консервантов, или т. п. Концентрированные формы композиций, как правило, содержат приблизительно от 2 до 80%, предпочтительно приблизительно от 5 до 70% по весу активного средства. Применяемые формы состава могут, например, содержать от 0,01 до 20% по весу, предпочтительно от 0,01 до 5% по весу активного средства. Поскольку коммерческие продукты предпочтительно будут составлены в виде концентратов, конечный потребитель будет обычно использовать разбавленные составы.

В таблицах ниже проиллюстрированы примеры отдельных соединений формулы (I) в соответствии с настоящим изобретением:

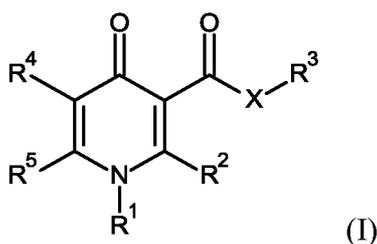


Таблица 1. Отдельные соединения формулы (I) в соответствии с настоящим изобретением

| № соед. | R ⁴ | R ⁵ | № соед. | R ⁴ | R ⁵ |
|---------|----------------|----------------|---------|----------------------|----------------|
| 001 | фенил | метил | 051 | 4-нитрофенил | метоксиметил |
| 002 | фенил | этил | 052 | 1-метилпиразол-4-ил | метил |
| 003 | фенил | метоксиметил | 053 | 1-метилпиразол-4-ил | этил |
| 004 | 2-метилфенил | метил | 054 | 1-метилпиразол-4-ил | метоксиметил |
| 005 | 2-метилфенил | этил | 055 | 3-метилимидазол-4-ил | метил |

| № соед. | R ⁴ | R ⁵ | № соед. | R ⁴ | R ⁵ |
|------------|-----------------------------|----------------|------------|----------------------|----------------|
| 006 | 2-метилфенил | метоксиметил | 056 | 3-метилимидазол-4-ил | этил |
| 007 | 2-хлорфенил | метил | 057 | 3-метилимидазол-4-ил | метоксиметил |
| 008 | 2-хлорфенил | этил | 058 | оксазол-2-ил | метил |
| 009 | 2-хлорфенил | метоксиметил | 059 | оксазол-2-ил | этил |
| 010 | 4-хлорфенил | метил | 060 | оксазол-2-ил | метоксиметил |
| 011 | 4-хлорфенил | этил | 061 | 3-фурил | метил |
| 012 | 4-хлорфенил | метоксиметил | 062 | 3-фурил | этил |
| 013 | 2,4-дихлорфенил | метил | 063 | 3-фурил | метоксиметил |
| 014 | 2,4-дихлорфенил | этил | 064 | 3-тиенил | метил |
| 015 | 2,4-дихлорфенил | метоксиметил | 065 | 3-тиенил | этил |
| 016 | 3,4-дихлорфенил | метил | 066 | 3-тиенил | метоксиметил |
| 017 | 3,4-дихлорфенил | этил | 067 | 4-метил-3-тиенил | метил |
| 018 | 3,4-дихлорфенил | метоксиметил | 068 | 4-метил-3-тиенил | этил |
| 019 | 2-фторфенил | метил | 069 | 4-метил-3-тиенил | метоксиметил |
| 020 | 2-фторфенил | этил | 070 | 4-хлор-3-тиенил | метил |
| 021 | 2-фторфенил | метоксиметил | 071 | 4-хлор-3-тиенил | этил |
| 022 | 4-фторфенил | метил | 072 | 4-хлор-3-тиенил | метоксиметил |
| 023 | 4-фторфенил | этил | 073 | 2-пиридил | метил |
| 024 | 4-фторфенил | метоксиметил | 074 | 2-пиридил | этил |
| 025 | 2,4-дифторфенил | метил | 075 | 2-пиридил | метоксиметил |
| 026 | 2,4-дифторфенил | этил | 076 | 3-пиридил | метил |
| 027 | 2,4-дифторфенил | метоксиметил | 077 | 3-пиридил | этил |
| 028 | 3-хлор-4-фторфенил | метил | 078 | 3-пиридил | метоксиметил |
| 029 | 3-хлор-4-фторфенил | этил | 079 | 4-пиридил | метил |
| 030 | 3-хлор-4-фторфенил | метоксиметил | 080 | 4-пиридил | этил |
| 031 | 4-хлор-3-фторфенил | метил | 081 | 4-пиридил | метоксиметил |
| 032 | 4-хлор-3-фторфенил | этил | 082 | 2-фтор-3-пиридил | метил |
| 033 | 4-хлор-3-фторфенил | метоксиметил | 083 | 2-фтор-3-пиридил | этил |
| 034 | 3- (трифторметокси)фенил | метил | 084 | 2-фтор-3-пиридил | метоксиметил |
| 035 | 3- (трифторметокси)фенил | этил | 085 | 2-фтор-4-пиридил | метил |
| 036 | 3- (трифторметокси)фенил | метоксиметил | 086 | 2-фтор-4-пиридил | этил |
| 037 | 4-трифторметил | метил | 087 | 2-фтор-4-пиридил | метоксиметил |
| 038 | 4-трифторметил | этил | 088 | 6-фтор-3-пиридил | метил |
| 039 | 4-трифторметил | метоксиметил | 089 | 6-фтор-3-пиридил | этил |
| 040 | 4-метилсульфонил | метил | 090 | 6-фтор-3-пиридил | метоксиметил |
| 041 | 4-метилсульфонил | этил | 091 | 5-хлор-3-пиридил | метил |
| 042 | 4-метилсульфонил | метоксиметил | 092 | 5-хлор-3-пиридил | этил |
| 043 | 4-метоксифенил | метил | 093 | 5-хлор-3-пиридил | метоксиметил |
| 044 | 4-метоксифенил | этил | 094 | 6-хлор-3-пиридил | метил |
| 045 | 4-метоксифенил | метоксиметил | 095 | 6-хлор-3-пиридил | этил |
| 046 | 4-бензилоксифенил | метил | 096 | 6-хлор-3-пиридил | метоксиметил |
| 047 | 4-бензилоксифенил | этил | 097 | пиридазин-4-ил | метил |
| 048 | 4-бензилоксифенил | метоксиметил | 098 | пиридазин-4-ил | этил |
| 049 | 4-нитрофенил | метил | 099 | пиридазин-4-ил | метоксиметил |
| 050 | 4-нитрофенил | этил | | | |

В таблице А-1 представлены 99 соединений от А-1.001 до А.1.099 формулы (I), где X представляет собой O, и R¹ представляет собой метил, R² представляет собой 3,4-дихлорфенил, R³ представляет собой водород, и R⁴ и R⁵ определены в таблице 1.

В таблице А-2 представлены 99 соединений от А-2.001 до А.2.099 формулы (I), где X представляет собой O, и R¹ представляет собой этил, R² представляет собой 3,4-дихлорфенил, R³ представляет собой водород, и R⁴ и R⁵ определены в таблице 1.

5 В таблице А-3 представлены 99 соединений от А-3.001 до А.3.099 формулы (I), где X представляет собой NH, и R¹ представляет собой метил, R² представляет собой 3,4-дихлорфенил, R³ представляет собой -N(CH₃)₂, и R⁴ и R⁵ определены в таблице 1.

В таблице А-4 представлены 99 соединений от А-4.001 до А.4.099 формулы (I), где X представляет собой NH, и R¹ представляет собой этил, R² представляет собой 3,4-дихлорфенил, R³ представляет собой -N(CH₃)₂, и R⁴ и R⁵ определены в таблице 1.

10 В таблице А-5 представлены 99 соединений от А-5.001 до А.5.099 формулы (I), где X представляет собой O, и R¹ представляет собой этил, R² представляет собой 3,4-дихлорфенил, R³ представляет собой метил, и R⁴ и R⁵ определены в таблице 1.

15 В таблице А-6 представлены 99 соединений от А-6.001 до А.6.099 формулы (I), где X представляет собой NH, и R¹ представляет собой этил, R² представляет собой 3,4-дихлорфенил, R³ представляет собой метил, и R⁴ и R⁵ определены в таблице 1.

Примеры составов

Смачиваемые порошки

| | a) | b) | c) |
|---|------|------|------|
| активный ингредиент [соединение формулы (I)] | 25 % | 50 % | 75 % |
| лигносульфонат натрия | 5 % | 5 % | - |
| лаурилсульфат натрия | 3 % | - | 5 % |
| диизобутилнафталинсульфонат натрия | - | 6 % | 10 % |
| простой феноловый эфир полиэтиленгликоля (7-8 моль этиленоксида) | - | 2 % | - |
| высокодисперсная кремниевая кислота | 5 % | 10 % | 10 % |
| каолин | 62 % | 27 % | - |

Активный ингредиент тщательно смешивают со вспомогательными веществами и смесь тщательно измельчают в подходящей мельнице, получая смачиваемые порошки, которые можно разбавить водой с получением суспензий требуемой концентрации.

20

Порошки для сухой обработки семян

| | a) | b) | c) |
|--|------|------|------|
| активный ингредиент [соединение формулы (I)] | 25 % | 50 % | 75 % |
| легкое минеральное масло | 5 % | 5 % | 5 % |
| высокодисперсная кремниевая кислота | 5 % | 5 % | - |

| | | | |
|--------|------|------|------|
| каолин | 65 % | 40 % | - |
| тальк | - | | 20 % |

Активный ингредиент тщательно смешивают со вспомогательными веществами и смесь тщательно измельчают в подходящей мельнице, получая порошки, которые можно применять непосредственно для обработки семян.

Эмульгируемый концентрат

| | |
|--|------|
| активный ингредиент [соединение формулы (I)] | 10 % |
| простой октилфеноловый эфир полиэтиленгликоля (4-5 моль этиленоксида) | 3 % |
| додецилбензолсульфонат кальция | 3 % |
| простой полигликолевый эфир касторового масла (35 моль этиленоксида) | 4 % |
| циклогексанон | 30 % |
| смесь ксилолов | 50 % |

5 Из этого концентрата путем разбавления водой можно получить эмульсии любой необходимой степени разведения, которые можно применять для защиты растений.

Пылевидные препараты

| | a) | b) | c) |
|--|------|------|------|
| активный ингредиент [соединение формулы (I)] | 5 % | 6 % | 4 % |
| тальк | 95 % | - | - |
| каолин | - | 94 % | - |
| минеральный наполнитель | - | - | 96 % |

Готовые к применению пылевидные препараты получают путем смешивания активного ингредиента с носителем и измельчения смеси в подходящей мельнице. Такие порошки также можно применять для вариантов сухого протравливания семени.

Экструдированные гранулы

| | |
|--|------|
| активный ингредиент [соединение формулы (I)] | 15 % |
| лигносульфонат натрия | 2 % |
| карбоксиметилцеллюлоза | 1 % |
| каолин | 82 % |

10 Активный ингредиент смешивают и измельчают со вспомогательными веществами и смесь увлажняют водой. Смесь экструдировать и затем сушат в потоке воздуха.

Гранулы, покрытые оболочкой

| | |
|--|------|
| активный ингредиент [соединение формулы (I)] | 8 % |
| полиэтиленгликоль (мол. масса 200) | 3 % |
| каолин | 89 % |

Тонкоизмельченный активный ингредиент в перемешивающем устройстве равномерно наносят на увлажненный полиэтиленгликолем каолин. Таким способом получают непылевидные гранулы, покрытые оболочкой.

5 Суспензионный концентрат

| | |
|--|------|
| активный ингредиент [соединение формулы (I)] | 40 % |
| пропиленгликоль | 10 % |
| полиэтиленгликолевый эфир нонилфенола (15 моль этиленоксида) | 6 % |
| лигносульфонат натрия | 10 % |
| карбоксиметилцеллюлоза | 1 % |
| силиконовое масло (в виде 75% эмульсии в воде) | 1 % |
| вода | 32 % |

10 Тонкоизмельченный активный ингредиент тщательно перемешивают со вспомогательными веществами, получая концентрат суспензии, из которого можно получить суспензии любой требуемой степени разбавления путем разведения водой. С помощью таких разбавленных растворов можно обработать и защитить от заражения микроорганизмами живые растения, а также материал для размножения растений путем опрыскивания, полива или погружения.

Текущий концентрат для обработки семян

| | |
|---|-------|
| активный ингредиент [соединение формулы (I)] | 40 % |
| пропиленгликоль | 5 % |
| сополимер бутанола и РО/ЕО | 2 % |
| тристиролфенол с 10-20 молями ЕО | 2 % |
| 1,2-бензизотиазолин-3-он (в виде 20% раствора в воде) | 0,5 % |
| кальциевая соль моноазопигмента | 5 % |
| силиконовое масло (в виде 75% эмульсии в воде) | 0,2 % |

вода 45,3 %

Тонкоизмельченный активный ингредиент тщательно перемешивают со вспомогательными веществами, получая концентрат суспензии, из которого можно получить суспензии любой требуемой степени разбавления путем разведения водой. С помощью таких разбавленных растворов можно обработать и защитить от заражения микроорганизмами живые растения, а также материал для размножения растений путем опрыскивания, полива или погружения.

Капсульная суспензия медленного высвобождения

Смешивают 28 частей комбинации соединения формулы (I) с 2 частями ароматического растворителя и 7 частями смеси толуолдиизоцианат/полиметиленаполифенилизоцианат (8:1). Эту смесь эмульгируют в смеси из 1,2 части поливинилового спирта, 0,05 части пеногасителя и 51,6 части воды до получения частиц требуемого размера. К этой эмульсии добавляют смесь из 2,8 части 1,6-диаминогексана в 5,3 части воды. Смесь взбалтывают до завершения реакции полимеризации. Полученную капсульную суспензию стабилизируют путем добавления 0,25 части загустителя и 3 частей диспергирующего средства. Состав капсульной суспензии содержит 28% активных ингредиентов. Средний диаметр капсул составляет 8-15 микрон. Полученный состав применяют в виде водной суспензии по отношению к семенам в подходящем для этой цели устройстве.

Примеры

В следующих неограничивающих примерах предусмотрены конкретные способы синтеза иллюстративных соединений по настоящему изобретению, указанных в таблице 2 ниже.

По всему данному описанию значения температуры приведены в градусах Цельсия (°C), а “m.p.” означает температуру плавления. LC/MS означает жидкостную хроматографию–масс-спектрометрию, а описание устройства и способов следующее:

Способ А.

Waters ACQUITY UPLC-MS с применением Sample Organizer с Sample Manager FTN+, H-class QSM, Column Manager, 2 x Column Manager Aux, фотодиодной матрицы, ELSD (диапазон длин волн (нм): от 210 до 400) и SQD 2.

Способ ионизации: положительное и отрицательное электрораспыление: напряжение на капилляре (кВ) 3,0, напряжение на конусе (В) 35,0, температура источника (°C) 150, скорость поток газа в конусе (л/ч.) 10, скорость потока газа десольватации (л/ч.) 500,

температура десольватации (°C) 500. Диапазон масс (Да): положительный 95–800, отрицательный 115–800. Колонка: Waters ACQUITY UPLC HSS T3 1,8 мкм 2,1x50мм

В колонках применяли следующий градиент при 40°C:

| Время (мин.) | Растворитель А (%) | Растворитель В (%) | Поток (мл/мин.) |
|--------------|--------------------|--------------------|-----------------|
| 0,00 | 95,0 | 5,0 | 0,6 |
| 3,30 | 0,0 | 100 | 0,6 |
| 3,50 | 0,0 | 100 | 0,6 |
| 3,55 | 95,0 | 5,0 | 0,6 |
| 4,10 | 95,0 | 5,0 | 0,6 |

5 Растворитель А: H₂O с 0,05% TFA, растворитель В: CH₃CN с 0,05% TFA

Способ В.

Waters Aquity UPLC-MS с применением Sample Organizer с Sample Manager FTN, H-class QSM, Column Manager, 2 x Column Manager Aux, фотодиодной матрицы, ELSD и QDA SQD 2. Способ SQD масс-спектрометр-ионизации: электрораспыление (ESI),

10 полярность: положительные ионы, напряжение на капилляре (кВ) 3,00, напряжение на конусе (В) 30,00, напряжение на экстракторе (В) 2,00, температура источника (°C) 150, температура десольватации (°C) 350, газовый поток в конусе (л/ч.) 0, поток газа для десольватации (л/ч.) 650. Прибор, оснащенный колонкой Waters HSS T3 C18 (длина колонки 50 мм, внутренний диаметр колонки 2,3 мм, размер частиц 1,8 микрон).

15 Градиентное элюирование 5-100% MeCN в воде в течение 3,3 мин. при 0,6 мл/мин. И MeCN, и вода содержат 0,05% об./об. TFA.

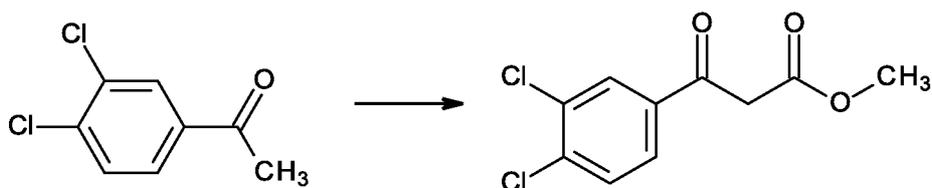
Перечень сокращений

Å = ангстрем, br m = широкий мультиплет, °C = градусы Цельсия, d = дублет, DMSO = диметилсульфоксид, HPLC = высокоэффективная жидкостная хроматография, LCMS = жидкостная хроматография–масс-спектрометрия, M = молярный, m = мультиплет, МГц = мегагерц, q = квартет, s = синглет, t = триплет, THF = тетрагидрофуран, TMT = 2,4,6-триметилмеркаптотриазин.

20

Пример 1. Синтез 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-(1-метилпиразол-4-ил)-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (соединение номер 1)

25 **Стадия 1. Синтез метил-3-(3,4-дихлорфенил)-3-оксо-пропаноата**



К перемешанному раствору 1-(3,4-дихлорфенил)этанона (5,00 г, 26,5 ммоль) и диметилкарбоната (40 мл, 466 ммоль) в атмосфере азота и охлажденному до 0°C порциями добавляли гидрид натрия (3,17 г, 79,5 ммоль, 60% по массе). Обеспечивали

5 нагревание реакционной смеси до комнатной температуры и перемешивали в течение 16 часов. В течение ночи реакционная смесь превращалась в твердую пасту, которую невозможно было размешать. Добавляли дополнительное количество диметилкарбоната (10 мл) в попытке создать подвижную взвесь для гашения. Реакционную смесь охлаждали до 0°C и гасили посредством добавления воды (25 мл) в

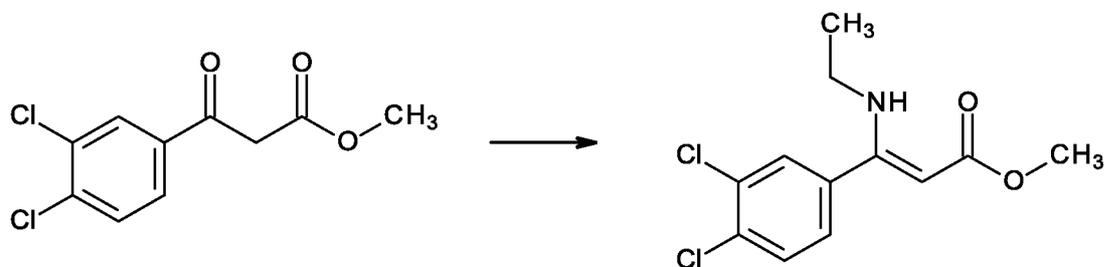
10 атмосфере азота. Реакционную смесь подкисляли до pH 3 путем добавления водного раствора хлористоводородной кислоты (2 М) и затем экстрагировали этилацетатом. Органический экстракт сушили над сульфатом магния и выпаривали до сухого состояния при пониженном давлении. Неочищенный остаток очищали с помощью

15 флэш-хроматографии на силикагеле с применением градиента 0-15% этилацетата в изогексане в качестве элюента с получением метил-3-(3,4-дихлорфенил)-3-оксопропаноата (смесь таутомеров) в виде бесцветной жидкости (5,78 г, 23,5 ммоль, 89%).

Енольная форма: ^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) $\delta = 12,47$ (s, 1H), 7,87 (d, 1H), 7,59 (m, 3H), 7,49 (d, 1H), 5,65 (s, 1H), 3,82 (s, 3H)

20 Кетоформа: ^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) $\delta = 8,03$ (d, 1H), 7,77 (m, 1H), 7,58 (d, 2H), 3,97 (s, 2H), 3,76 (s, 3H).

Стадия 2. Синтез метил-(Z)-3-(3,4-дихлорфенил)-3-(этиламино)проп-2-еноата



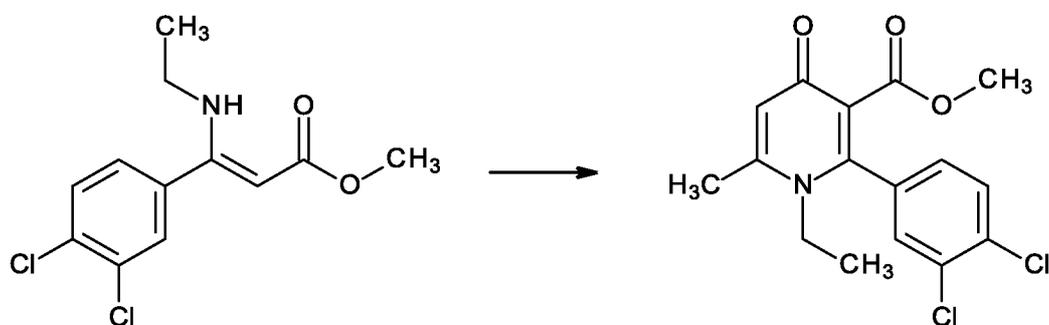
К перемешанному раствору этиламина (2М в THF) (12,2 мл, 24,34 ммоль) при 0°C

25 добавляли по каплям уксусную кислоту (1,39 мл, 24,3 ммоль). Обеспечивали нагревание смеси до комнатной температуры и перемешивали в течение 1 часа, прежде

чем выпаривали до сухого состояния при пониженном давлении с получением ацетата этиламмония (2,55 г, 24,3 ммоль). Ацетат этиламмония (2,55 г, 24,3 ммоль) добавляли к раствору метил-3-(3,4-дихлорфенил)-3-оксипропаноата (2,00 г, 8,09 ммоль) в толуоле (20 мл) с последующим добавлением уксусной кислоты (0,46 мл, 8,09 ммоль) и порошкообразных молекулярных сит 4Å. Реакционную смесь нагревали с обратным холодильником в течение 18 часов. Охлажденную реакционную смесь разбавляли этилацетатом, фильтровали и промывали насыщенным водным раствором бикарбоната натрия. Фазы разделяли и водную фазу экстрагировали этилацетатом (x3). Объединенные органические экстракты промывали солевым раствором, сушили над сульфатом магния и выпаривали до сухого состояния при пониженном давлении. Неочищенный остаток очищали с помощью флэш-хроматографии на силикагеле с применением градиента 0-10% этилацетата в изогексане в качестве элюента с получением метил-(Z)-3-(3,4-дихлорфенил)-3-(этиламино)проп-2-еноата в виде бледно-желтого масла (1,54 г, 5,61 ммоль, 69%).

¹H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 8,37 (br s, 1H), 7,48 (d, 1H), 7,46 (d, 1H), 7,20 (m, 1H), 4,55 (s, 1H), 3,68 (s, 3H), 3,07 (m, 2H), 1,13 - 1,09 (m, 3H).

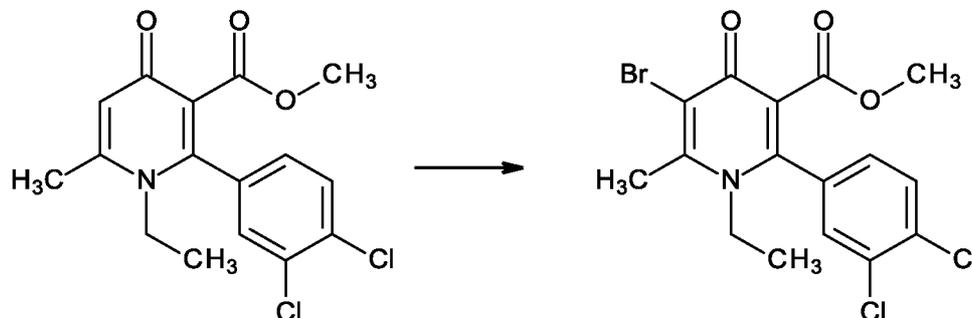
Стадия 3. Синтез метил-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилата



Перемешанную смесь метил-(Z)-3-(3,4-дихлорфенил)-3-(этиламино)проп-2-еноата (1,50 г, 5,5 ммоль) и 2,2,6-триметил-1,3-диоксин-4-она (0,82 г, 5,5 ммоль) в атмосфере азота нагревали при 120°C в течение 3 часов. Охлажденную реакционную смесь выпаривали до сухого состояния при пониженном давлении. Неочищенный остаток очищали с помощью флэш-хроматографии на силикагеле с применением градиента 0-10% метанола в дихлорметане в качестве элюента с получением метил-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилата в виде грязно-белого твердого вещества (0,95 г, 2,78 ммоль, 51%).

^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) $\delta = 7,56$ (d, 1H), 7,50 (d, 1H), 7,24 (m, 1H), 6,41 (s, 1H), 3,72 (q, 2H), 3,55 (s, 3H), 2,42 (s, 3H), 1,13 (t, 3H).

Стадия 4. Синтез метил-5-бром-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилата



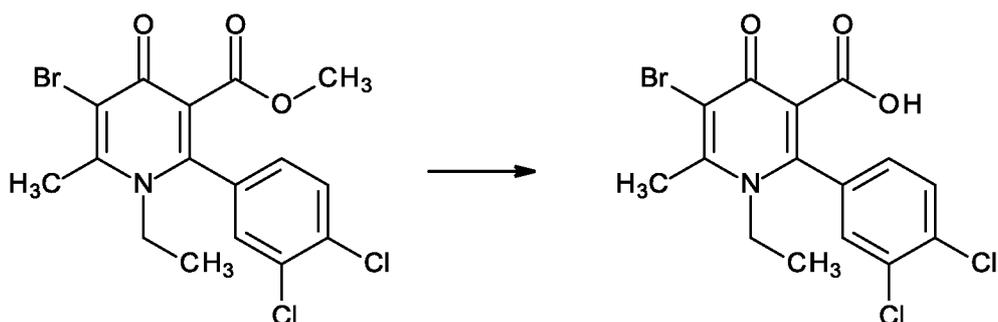
5

К перемешанному раствору метил-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилата (0,500 г, 1,47 ммоль) в ацетонитриле (5,0 мл, 95,7 ммоль) при комнатной температуре порциями добавляли N-бромсукцинимид (0,26 г, 1,47 ммоль). Реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре до момента, когда результаты LCMS указали полное израсходование исходного материала. Реакционную смесь гасили посредством добавления насыщенного водного раствора гидрокарбоната натрия (30 мл) и водную фазу экстрагировали дихлорметаном (3 x 15 мл). Объединенные органические экстракты пропускали через разделитель фаз и выпаривали до сухого состояния при пониженном давлении. Неочищенный остаток очищали с помощью флэш-хроматографии на силикагеле с применением градиента 50-100% этилацетата в изогексане в качестве элюента с получением метил-5-бром-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилата в виде бесцветного твердого вещества (0,602 г, 1,44 ммоль, 98%).

^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) $\delta = 7,57$ (d, 1H), 7,49 (d, 1H), 7,23 (m, 1H), 3,85 (q, 2H), 3,57 (s, 3H), 2,74 (s, 3H), 1,17 (t, 3H).

20

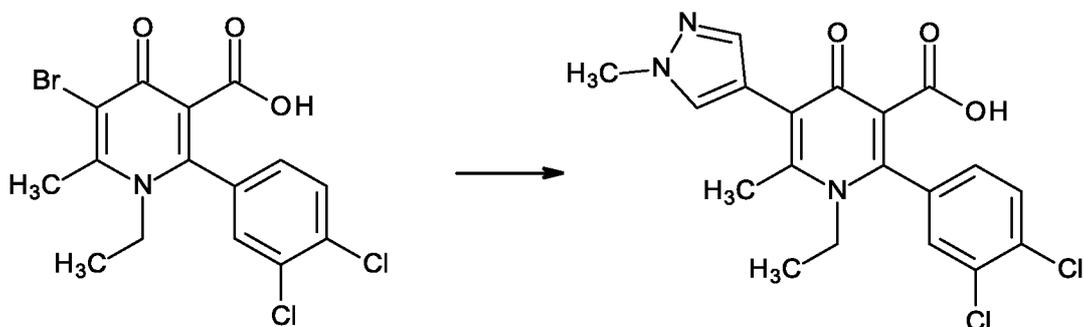
Стадия 5. Синтез 5-бром-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты



К раствору метил-5-бром-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилата (2,50 г, 5,97 ммоль) в метаноле (15 мл) добавляли раствор моногидрата гидроксида лития (1,00 г, 23,9 ммоль) в воде (6 мл). Полученный раствор нагревали до 80°C в течение 2 часов. Охлажденную реакционную смесь подкисляли до pH 1-2 посредством добавления концентрированной хлористоводородной кислоты. Осажденное твердое вещество собирали фильтрацией, промывали холодной водой и сушили с получением 5-бром-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты в виде белого порошка (1,84 г, 4,54 ммоль, 76%).

¹H ЯМР (400 МГц, метанол-d₄) δ = 7,68 (d, 1H), 7,64 (d, 1H), 7,33 (m, 1H), 4,03 (q, 2H), 2,89 (s, 3H), 1,19 (t, 3H).

Стадия 6. Синтез 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-(1-метилпиразол-4-ил)-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (соединение номер 1)

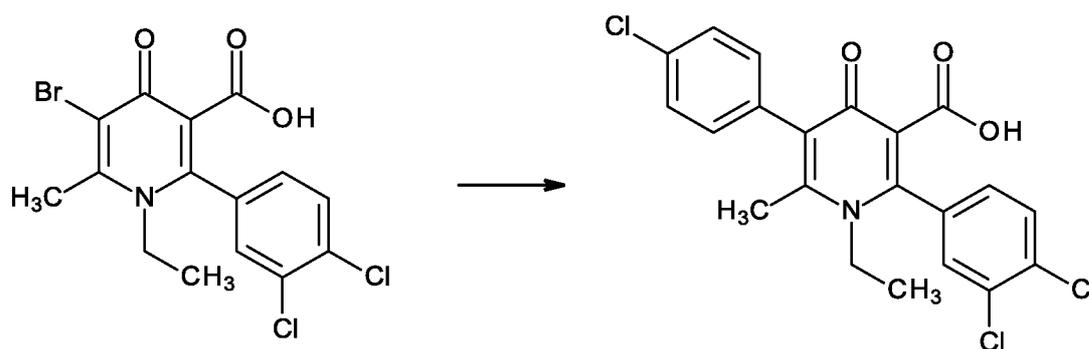


Смесь 5-бром-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (0,25 г, 0,62 ммоль), 1-метил-4-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)пиразола (0,32 г, 1,54 ммоль), карбоната калия (0,17 г, 1,23 ммоль) и комплекса дихлор[1,1'-бис(дифенилфосфино)ферроцен]палладия(II) с дихлорметаном (1:1) (0,10 г, 0,123 ммоль) в ацетонитриле (1,4 мл) и воде (0,27 мл) нагревали в условиях микроволнового излучения при 100°C в течение 0,5 часов. Охлажденную реакционную смесь гасили посредством добавления водного раствора хлористоводородной кислоты (2M) и экстрагировали этилацетатом (x2). Объединенные органические экстракты

выпаривали до сухого состояния при пониженном давлении. Неочищенный остаток очищали масс-направленной обращенно-фазовой HPLC с получением 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-(1-метилпиразол-4-ил)-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты в виде оранжевого твердого вещества (0,073 г, 0,18 ммоль, 29%).

5 ^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) $\delta = 7,70$ (s, 1H), 7,58 (d, 1H), 7,53 (s, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,14 (m, 1H), 3,99 (s, 3H), 3,94 (q, 2H), 2,64 (s, 3H), 1,23 (t, 3H).

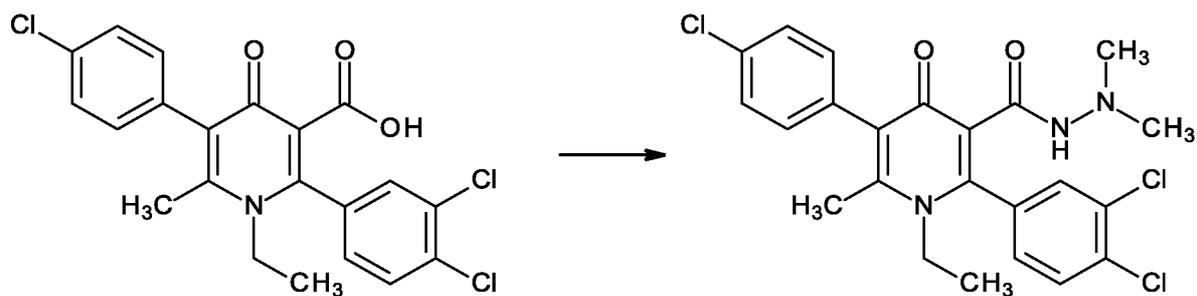
Пример 2. Синтез 5-(4-хлорфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (соединение номер 10)



10 К смеси 5-бром-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (500 мг, 1,234 ммоль), дихлорбис(трифенилфосфин)палладия(II) (0,175 г, 0,25 ммоль), карбоната калия (0,69 г, 4,94 ммоль) и (4-хлорфенил)бороновой кислоты (0,579 г, 3,70 ммоль) при комнатной температуре и в атмосфере азота добавляли смесь дегазированного ацетонитрила (15 мл) и воды (3 мл). Реакционную смесь нагревали в
 15 условиях микроволнового излучения при 100°C в течение 0,5 часов. Охлажденную реакционную смесь фильтровали через картридж Isolute TMT и раствор лиофилизировали. Неочищенный остаток экстрагировали дихлорметаном и объединенные экстракты выпаривали до сухого состояния при пониженном давлении. Неочищенный остаток очищали с помощью масс-направленной обращенно-фазовой
 20 HPLC с получением 5-(4-хлорфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (296 мг, 0,68 ммоль, 55%).

^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) $\delta = 7,61$ (d, 1H), 7,49 (d, 2H), 7,41 (d, 1H), 7,21-7,16 (m, 3H), 3,94 (q, 2H), 2,42 (s, 3H), 1,25 (t, 3H).

25 **Пример 3. Синтез 5-(4-хлорфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-N',N',6-триметил-4-оксопиридин-3-карбогидрида (соединение номер 2)**

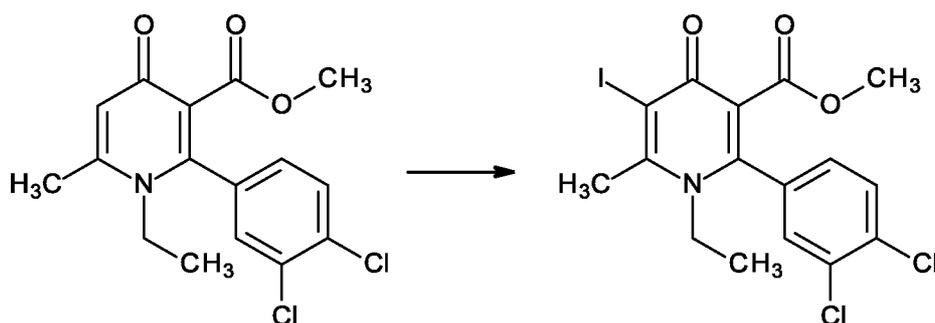


К перемешанному раствору 5-(4-хлорфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (0,060 г, 0,14 ммоль) в дихлорметане (1,2 мл) добавляли 1,1-диметилгидразин (0,025 г, 0,41 ммоль), диметиламинопиридин (0,017 г, 0,14 ммоль) и раствор пропилфосфонового ангидрида (50 вес.% в этилацетате, 0,13 г, 0,21 ммоль). Реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 4 часов. Реакционную смесь выпаривали до сухого состояния при пониженном давлении. Неочищенный остаток очищали с помощью масс-направленной обращенно-фазовой HPLC с получением 5-(4-хлорфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-N',N',6-триметил-4-оксопиридин-3-карбогидрида (0,038 г, 0,08 ммоль, 58%).

^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,58 (d, 1H), 7,52 - 7,42 (m, 3H), 7,31 - 7,22 (m, 1H), 7,16 (d, 2H), 3,88 (q, 2H), 2,75 (s, 6H), 2,33 (s, 3H), 1,20 (t, 3H).

Пример 4. Синтез 2-(3,4-дихлорфенил)-5-(2,4-дифторфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (соединение номер 3)

Стадия 1. Синтез метил-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-йод-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилата



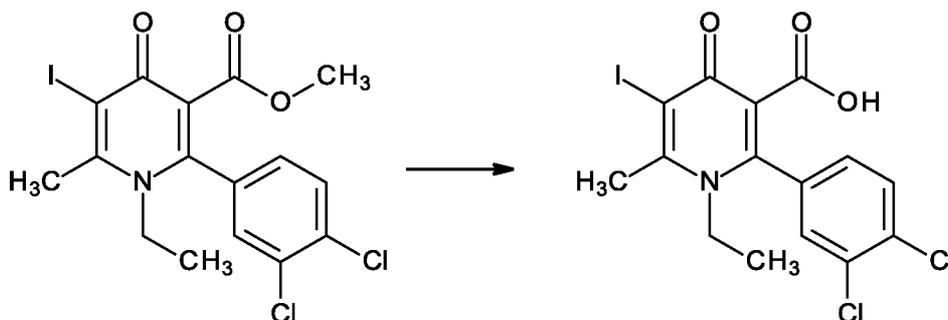
К раствору метил-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилата (5,60 г, 16,5 ммоль) в ацетонитриле (56,0 мл) при комнатной температуре и в атмосфере азота добавляли 1-йодпирролидин-2,5-дион (3,70 г, 16,5 ммоль) с последующим добавлением 2,2,2-трифторуксусной кислоты (0,564 г, 0,381 мл, 4,94 ммоль). Реакционную смесь нагревали при 80°C в течение 36 часов и затем перемешивали при комнатной температуре в течение 48 часов. Охлажденную реакционную смесь гасили

посредством добавления насыщенного водного раствора гидрокарбоната натрия (200 мл) и экстрагировали дихлорметаном (x3). Объединенные органические экстракты промывали насыщенным раствором тиосульфата натрия, затем соевым раствором, сушили над сульфатом магния, фильтровали и выпаривали при пониженном давлении.

5 Неочищенный остаток очищали с помощью флэш-хроматографии на силикагеле с применением градиента 0-100% этилацетата в циклогексане в качестве элюента с получением метил-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-йод-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилата в виде белого твердого вещества (5,33 г, 11,4 ммоль, 70%).

10 ^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,57 (d, 1H), 7,49 (d, 1H), 7,23 (m, 1H), 3,89 (q, 2H), 3,57 (s, 3H), 2,88 (s, 3H), 1,17 (t, 3H).

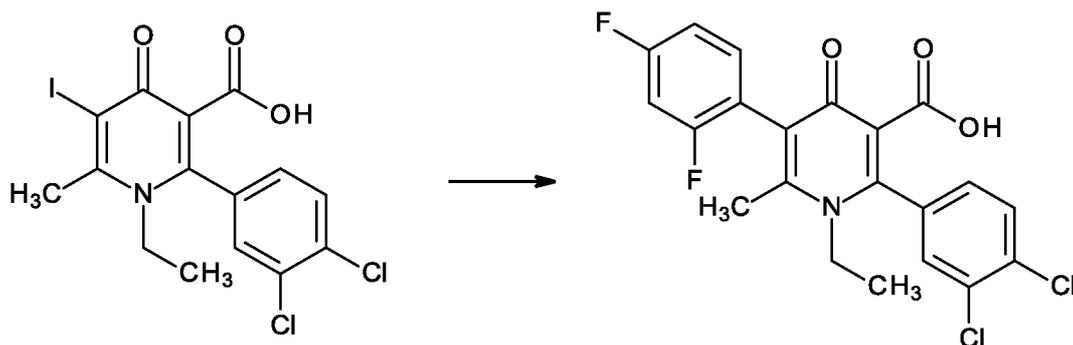
Стадия 2. Синтез 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-йод-6-метил-4-оксо-пиридин-3-карбоновой кислоты



15 Получали так же, как 5-бром-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновую кислоту с применением метил-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-йод-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилата (1,00 г, 2,15 ммоль) и гидрата гидроксида лития (0,360 г, 8,58 ммоль) при нагревании при 80°C в течение 18 часов с получением 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-йод-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (0,93 г, 2,06 ммоль, 96%).

20 ^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,60 (d, 1H), 7,34 (d, 1H), 7,10 (dd, 1H), 4,02 (q, 2H), 3,00 (s, 3H), 1,23 (t, 3H).

Стадия 3. Синтез 2-(3,4-дихлорфенил)-5-(2,4-дифторфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты

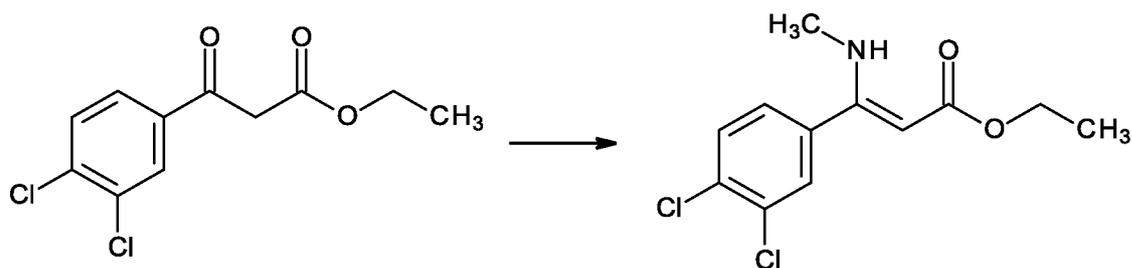


К смеси 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-йод-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (0,400 г, 0,88 ммоль), (2,4-дифторфенил)бороновой кислоты (0,215 г, 1,36 ммоль) и хлор(2-дициклогексилфосфино-2',4',6'-триизопропил-1,1'-бифенил)[2-(2'-амино-1,1'-бифенил)]палладия(II) (XPhos Pd G2, 0,070 г, 0,089 ммоль) в смеси дегазированного 1,4-диоксана (6 мл) и воды (1 мл) в атмосфере азота и при комнатной температуре добавляли моногидрат трикалийфосфата (0,560 г, 2,6 ммоль). Реакционную смесь нагревали в условиях микроволнового излучения при 100°C в течение 1 часа. Охлажденную реакционную смесь выливали в водный раствор хлористоводородной кислоты (2 М) и экстрагировали дихлорметаном. Объединенные органические экстракты сушили над сульфатом магния и выпаривали до сухого состояния при пониженном давлении. Неочищенный остаток очищали с помощью флэш-хроматографии на силикагеле с применением градиента 0-100% этилацетата в циклогексане в качестве элюента. Выделенный материал дополнительно очищали с помощью масс-направленной обращенно-фазовой HPLC с получением 2-(3,4-дихлорфенил)-5-(2,4-дифторфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты в виде кремового твердого вещества (0,15 г, 0,34 ммоль, 39%).

^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,62 (m, 1H), 7,43 (m, 1H), 7,27-7,33 (m, 1H), 7,18 (m, 1H), 6,95-7,09 (m, 2H), 3,91-4,02 (m, 2H), 2,43 (d, 3H), 1,26 (t, 3H).

Пример 5. Синтез 5-(4-хлорфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1,6-диметил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (соединение номер 5)

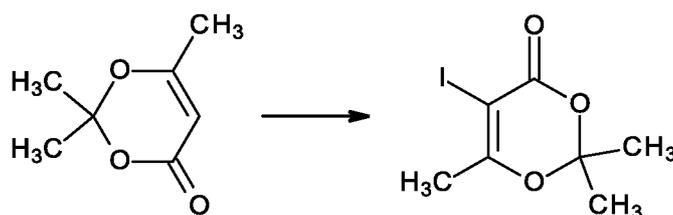
Стадия 1'. Синтез этил-(Z)-3-(3,4-дихлорфенил)-3-(метиламино)проп-2-еноата



Этил-(Z)-3-(3,4-дихлорфенил)-3-(метиламино)проп-2-еноат получали так же, как метил-(Z)-3-(3,4-дихлорфенил)-3-(этиламино)проп-2-еноат с применением этил-3-(3,4-дихлорфенил)-3-оксопропаноата (1,5 г, 5,7 ммоль) и ацетата метиламмония (1,6 г, 17 ммоль) с получением этил-(Z)-3-(3,4-дихлорфенил)-3-(метиламино)проп-2-еноата (0,702 г, 2,56 ммоль, 45%).

^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 8,39 (br m, 1H), 7,49-7,46 (m, 2H), 7,20 (m, 1H), 6,86 (m, 1H), 4,57 (s, 1H), 4,14 (q, 2H), 2,76 (d, 3H), 1,27 (t, 3H).

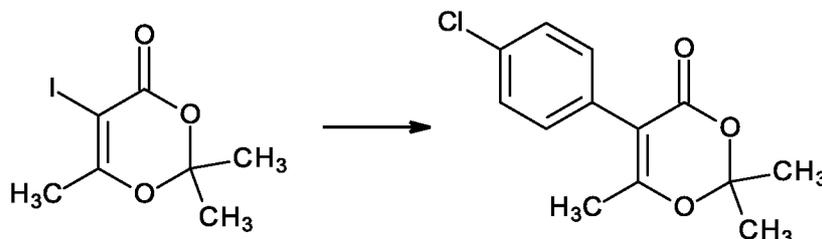
Стадия 1. Синтез 5-йод-2,2,6-триметил-1,3-диоксин-4-она



К раствору 2,2,6-триметил-1,3-диоксин-4-она (2,5 г, 18 ммоль) в уксусной кислоте (45 мл) при комнатной температуре и в атмосфере азота добавляли 1-йодпирролидин-2,5-дион (4,0 г, 18 ммоль). Реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 18 часов. Реакционную смесь гасили водой и экстрагировали дихлорметаном (2 x 200 мл). Объединенные органические экстракты промывали последовательно раствором метабисульфита натрия и 10% водным раствором гидрокарбоната натрия, сушили над сульфатом магния, фильтровали и концентрировали. Неочищенный остаток очищали с помощью флэш-хроматографии на силикагеле с применением градиента 0-100% этилацетата в циклогексане в качестве элюента с получением 5-йод-2,2,6-триметил-1,3-диоксин-4-она (0,900 г, 3,36 ммоль, 19%) в виде желтого твердого вещества.

^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 2,34 - 2,24 (m, 3H), 1,75 - 1,68 (m, 6H).

Стадия 2. Синтез 5-(4-хлорфенил)-2,2,6-триметил-1,3-диоксин-4-она

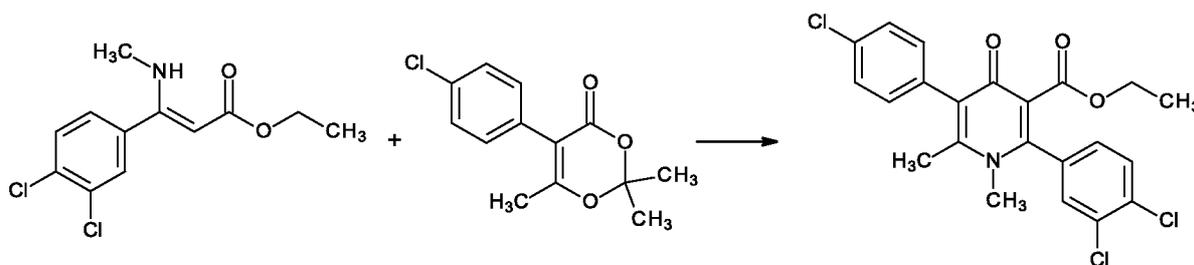


К перемешиваемому раствору 5-йод-2,2,6-триметил-1,3-диоксин-4-она (0,300 г, 1,12 ммоль) в ацетонитриле (6 мл) и воде (4 мл) добавляли (4-хлорфенил)бороновую кислоту (0,525 г, 3,36 ммоль) и карбоната калия (0,625 г, 4,48 ммоль) и раствор

дегазировали в атмосфере азота в течение 5 минут. К смеси добавляли дихлорбис(трифенилфосфин)палладий(II) (0,159 г, 0,224 ммоль) и реакционную смесь нагревали в условиях микроволнового излучения при 100°C в течение 0,75 часов. Охлажденную реакционную смесь разбавляли водой и экстрагировали этилацетатом (x2). Объединенные органические экстракты выпаривали до сухого состояния. Неочищенный остаток очищали с помощью флэш-хроматографии на силикагеле с применением градиента 0-15% этилацетата в циклогексане в качестве элюента с получением 5-(4-хлорфенил)-2,2,6-триметил-1,3-диоксин-4-она (0,190 г, 0,752 ммоль, 67%).

¹H ЯМР (500 МГц, хлороформ) δ = 7,40 - 7,34 (m, 2H), 7,24 - 7,18 (m, 2H), 1,97 - 1,91 (m, 3H), 1,79 - 1,74 (m, 6H).

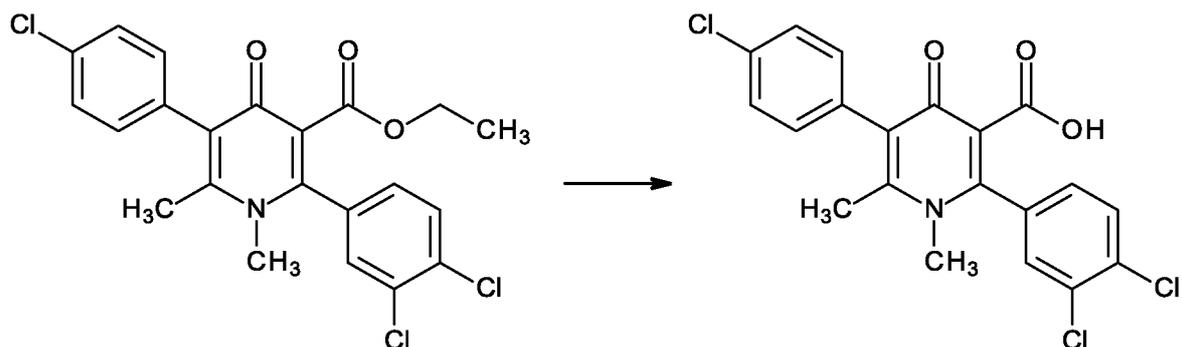
Стадия 3. Синтез этил-5-(4-хлорфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1,6-диметил-4-оксопиридин-3-карбоксилата



Перемешиваемую смесь этил-(Z)-3-(3,4-дихлорфенил)-3-(метиламино)проп-2-еноата (0,206 г, 0,752 ммоль) и 5-(4-хлорфенил)-2,2,6-триметил-1,3-диоксин-4-она (0,190 г, 0,752 ммоль) в атмосфере азота нагревали при 120°C в течение 4 часов и затем выдерживали при комнатной температуре в течение 18 часов. После выпаривания на диатомовой земле неочищенный остаток очищали с помощью флэш-хроматографии на силикагеле с применением градиента 5-100% этилацетата в циклогексане в качестве элюента с получением этил-5-(4-хлорфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1,6-диметил-4-оксопиридин-3-карбоксилата (0,050 г, 0,11 ммоль, 15%).

¹H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,63 - 7,58 (m, 1H), 7,57 - 7,52 (m, 1H), 7,42 - 7,37 (m, 2H), 7,27 - 7,26 (m, 1H), 7,21 - 7,15 (m, 2H), 4,09 - 4,01 (m, 2H), 3,41 - 3,30 (m, 3H), 2,30 - 2,24 (m, 3H), 1,10 - 1,00 (m, 3H).

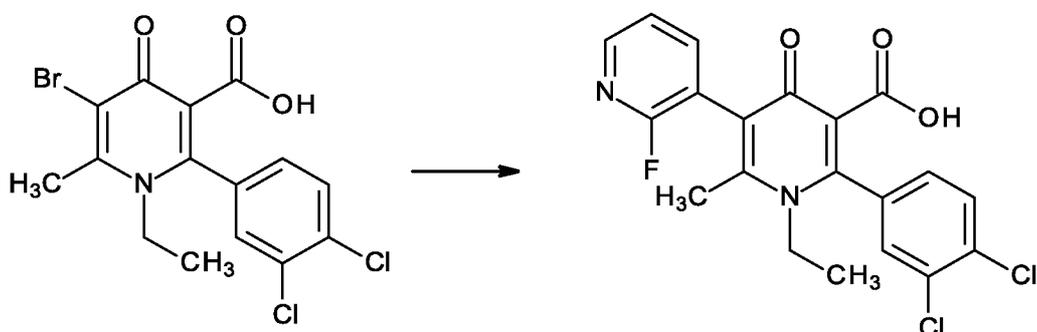
Стадия 4. Синтез 5-(4-хлорфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1,6-диметил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты



Получали так же, как 5-бром-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновую кислоту с применением этил-5-(4-хлорфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1,6-диметил-4-оксопиридин-3-карбоксилата (0,050 г, 0,11 ммоль) и гидрата гидроксида лития (0,019 г, 0,44 ммоль) при нагревании при 80°C в течение 1,5 часов с получением 5-(4-хлорфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1,6-диметил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (0,037 г, 0,086 ммоль).

^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) $\delta = 7,66 - 7,61$ (m, 1H), $7,53 - 7,46$ (m, 2H), $7,39 - 7,33$ (m, 1H), $7,23 - 7,18$ (m, 2H), $7,16 - 7,08$ (m, 1H), $3,50 - 3,39$ (m, 3H), $2,42 - 2,32$ (m, 3H).

10 **Пример 6. Синтез 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-(2-фтор-3-пиридил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (соединение номер 6)**



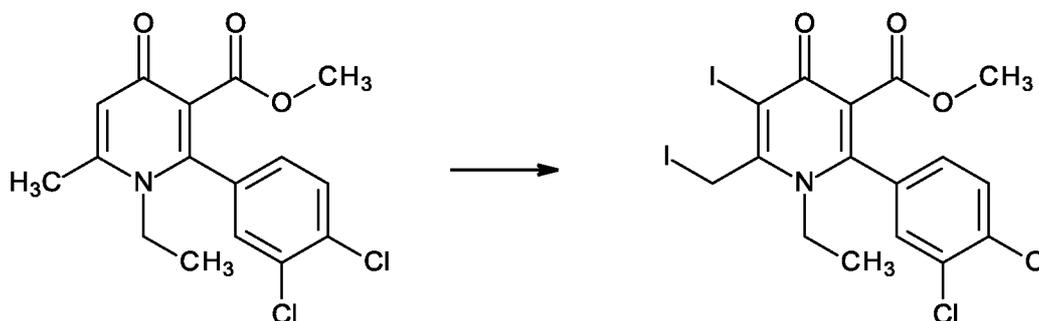
К смеси 5-бром-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (200 мг, 0,49 ммоль), карбоната калия (0,27 г, 1,975 ммоль), дихлорбис(трифенилфосфин)палладия(II) (0,070 г, 0,099 ммоль) и (2-фтор-3-пиридил)бороновой кислоты (0,209 г, 1,48 ммоль) при комнатной температуре и в атмосфере азота добавляли смесь дегазированного ацетонитрила (6 мл) и воды (1,2 мл). Реакционную смесь нагревали в условиях микроволнового излучения при 100°C в течение 0,5 часа. Охлажденную реакционную смесь разбавляли водой и затем выпаривали до сухого состояния с помощью лиофилизатора. Неочищенный остаток экстрагировали дихлорметаном и раствор фильтровали и выпаривали до сухого состояния при пониженном давлении. Неочищенный остаток очищали с помощью

масс-направленной обращенно-фазовой HPLC с получением 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-(2-фтор-3-пиридил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты в виде белого твердого вещества (0,022 г, 0,054 ммоль, 11%).

^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 8,36 - 8,35 (m, 1H), 7,85 (m, 1H), 7,63 (m, 1H), 7,45 - 7,37 (m, 2H), 7,18 (m, 1H), 4,01-3,95 (m, 2H), 2,45 (d, 3H), 3,10 (t, 3H).

Пример 7. Синтез 5-(4-хлорфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-(метоксиметил)-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (соединение номер 7)

Стадия 1. Синтез метил-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-йод-6-(йодметил)-4-оксопиридин-3-карбоксилата



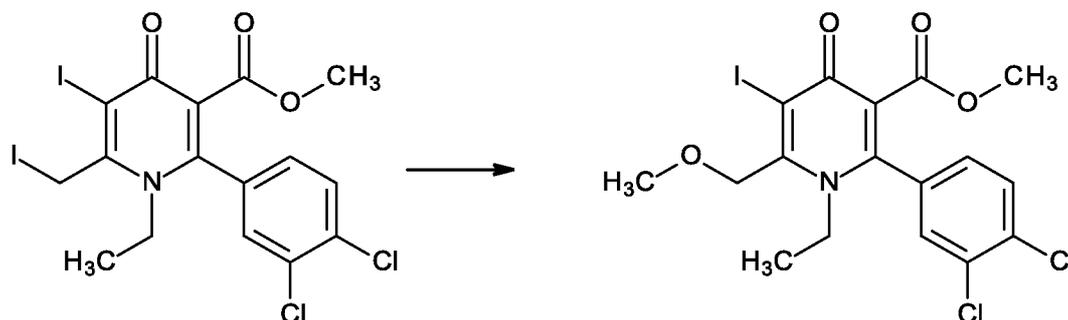
10

К перемешиваемому раствору метил-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилата (10,0 г, 29,4 ммоль) в ацетонитриле (100 мл) при комнатной температуре и в атмосфере азота добавляли 1-йодпирролидин-2,5-дион (6,61 г, 29,4 ммоль) с последующим добавлением 2,2,2-трифторуксусной кислоты (1,01 г, 8,82 ммоль). Реакционную смесь нагревали при 80°C в течение 5 часов. Добавляли дополнительное количество 1-йодпирролидин-2,5-диона (0,500 г, 2,22 ммоль) и реакционную смесь нагревали при 80°C в течение дополнительных 2 часов. Реакционную смесь гасили посредством добавления насыщенного раствора гидрокарбоната натрия (100 мл) и экстрагировали дихлорметаном (3 x 100 мл). Объединенные органические экстракты промывали 5% водным раствором метабисульфата натрия (50 мл), затем водой (50 мл), сушили над сульфатом магния, фильтровали и выпаривали до сухого состояния при пониженном давлении. Неочищенный остаток очищали с помощью флэш-хроматографии на силикагеле с применением градиента 5-100% этилацетата в циклогексане в качестве элюента с получением метил-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-йод-6-(йодметил)-4-оксопиридин-3-карбоксилата (1,124 г, 1,90 ммоль, 6%).

25

^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,61 - 7,55 (m, 1H), 7,54 - 7,45 (m, 1H), 7,26 - 7,22 (m, 1H), 4,99 - 4,32 (m, 2H), 4,05 - 3,91 (m, 2H), 3,60 - 3,50 (m, 3H), 1,30 - 1,22 (m, 3H).

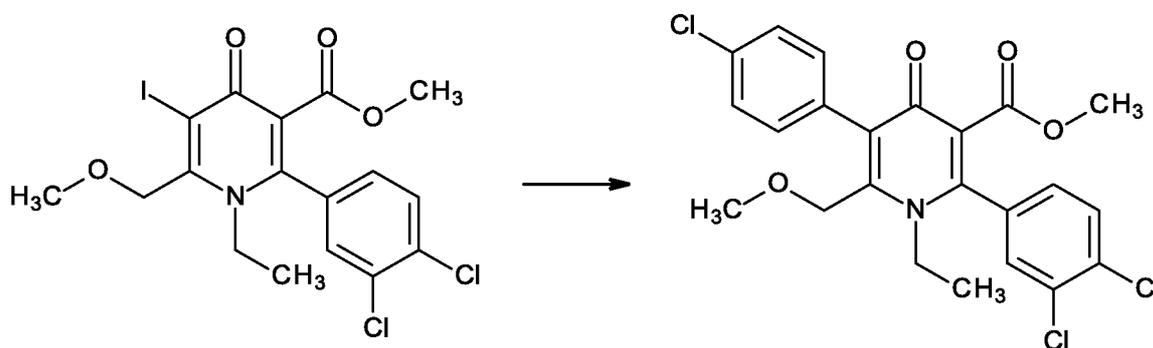
Стадия 2. Синтез метил-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-йод-6-(метоксиметил)-4-оксопиридин-3-карбоксилата



К раствору метил-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-йод-6-(йодметил)-4-оксопиридин-3-карбоксилата (0,200 г, 0,338 ммоль) в метаноле (3 мл) при комнатной температуре добавляли раствор метоксида натрия в метаноле (0,236 мл, 1,01 ммоль). Реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 2 часов. Реакционную смесь выпаривали при пониженном давлении и остаток подкисляли до рН 2 путем осторожного добавления концентрированной хлористоводородной кислоты. Осажденное твердое вещество собирали фильтрацией с получением метил-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-йод-6-(метоксиметил)-4-оксопиридин-3-карбоксилата (0,1492 г, 0,3007 ммоль, 89,0) в виде желтого порошка.

^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) $\delta = 7,60 - 7,56$ (m, 1H), $7,52 - 7,48$ (m, 1H), $7,26 - 7,20$ (m, 1H), $5,04 - 4,98$ (m, 2H), $4,09 - 4,00$ (m, 2H), $3,62 - 3,57$ (m, 3H), $3,54 - 3,47$ (m, 3H), $1,18 - 1,11$ (m, 3H).

Стадия 3. Синтез метил-5-(4-хлорфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-(метоксиметил)-4-оксопиридин-3-карбоксилата

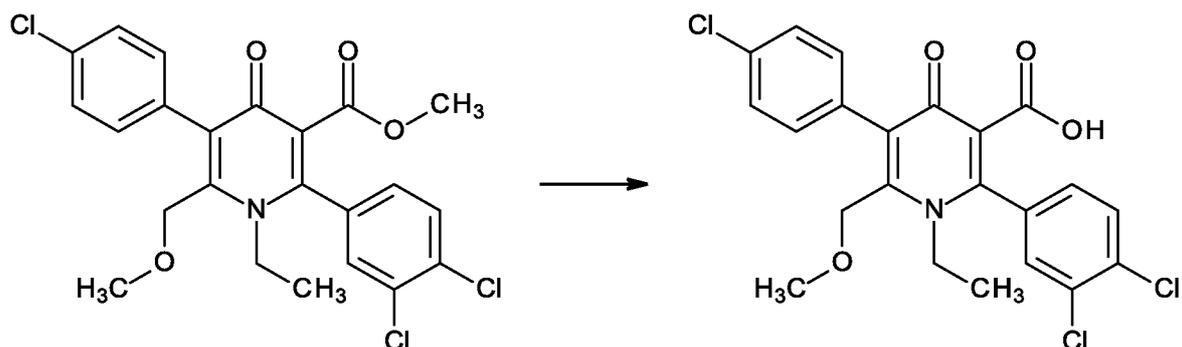


Получали так же, как 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-(2-фтор-3-пиридил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновую кислоту с применением метил-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-йод-6-(метоксиметил)-4-оксопиридин-3-карбоксилата (0,137 г, 0,276 ммоль) и (4-хлорфенил)бороновой кислоты (0,130 г, 0,828 ммоль) с нагреванием при 100°C в

течение 1 часа с получением метил-5-(4-хлорфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-(метоксиметил)-4-оксопиридин-3-карбоксилата (0,109 г, 0,227 ммоль, 82%).

^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) $\delta = 7,61 - 7,55$ (m, 2H), 7,42 - 7,39 (m, 2H), 7,33 - 7,29 (m, 1H), 7,29 - 7,28 (m, 1H), 7,27 - 7,26 (m, 1H), 4,25 - 4,17 (m, 2H), 4,01 - 3,90 (m, 2H), 3,59 - 3,53 (m, 3H), 3,32 - 3,24 (m, 3H), 1,21 - 1,14 (m, 3H).

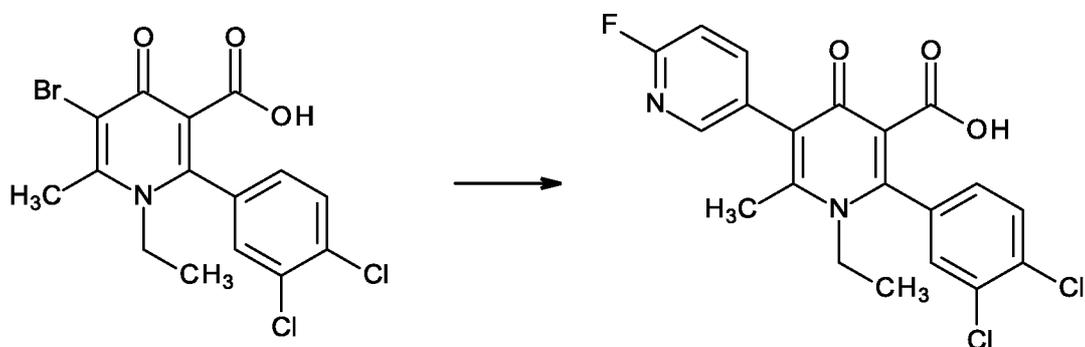
Стадия 4. Синтез 5-(4-хлорфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-(метоксиметил)-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты



Получали так же, как 5-бром-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновую кислоту с применением метил-5-(4-хлорфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-(метоксиметил)-4-оксопиридин-3-карбоксилата (0,109 г, 0,227 ммоль) и гидрата гидроксида лития (0,038 г, 0,907 ммоль) с получением 5-(4-хлорфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-(метоксиметил)-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (0,076 г, 0,162 ммоль, 71%) в виде грязно-белого порошка.

^1H ЯМР (400 МГц, метанол- d_4) $\delta = 7,77 - 7,70$ (m, 2H), 7,57 - 7,51 (m, 2H), 7,45 - 7,38 (m, 1H), 7,39 - 7,31 (m, 2H), 4,40 - 4,32 (m, 2H), 4,26 - 4,12 (m, 2H), 3,31 - 3,27 (m, 3H), 1,32 - 1,21 (m, 3H).

Пример 8. Синтез 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-(6-фтор-3-пиридил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (соединение номер 8)

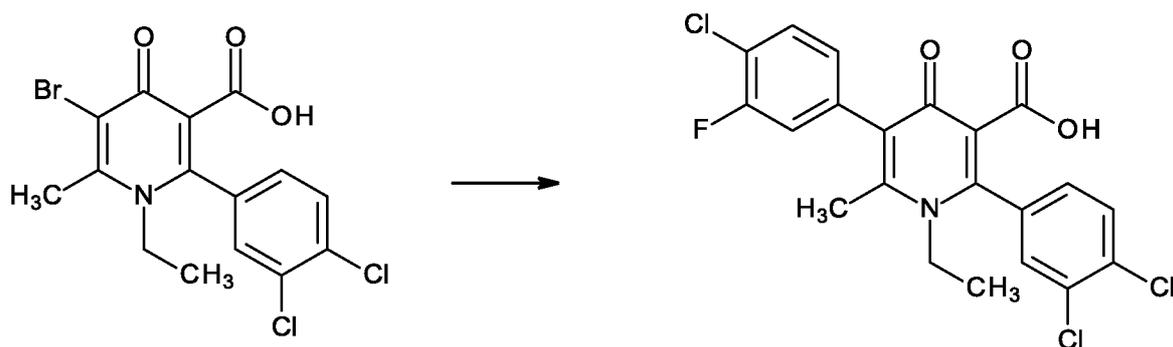


Получали 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-(2-фтор-3-пиридил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновую кислоту с применением 5-бром-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-

оксопиридин-3-карбоновой кислоты (0,100 г, 0,25 ммоль) и (6-фтор-3-пиридил)бороновой кислоты (0,104 г, 0,7406 ммоль) с получением 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-(6-фтор-3-пиридил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты в виде белого твердого вещества (0,065 г, 0,15 ммоль, 63%).

5 ^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) $\delta = 8,11$ (br m, 1H), 7,79 (m, 1H), 7,63-7,59 (m, 1H), 7,41 (d, 1H), 7,17 (m, 1H), 7,10 (m, 1H), 3,96 (q, 2H), 2,46 (s, 3H), 1,27 (t, 3H).

Пример 9. Синтез 5-(4-хлор-3-фторфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (соединение номер 9)

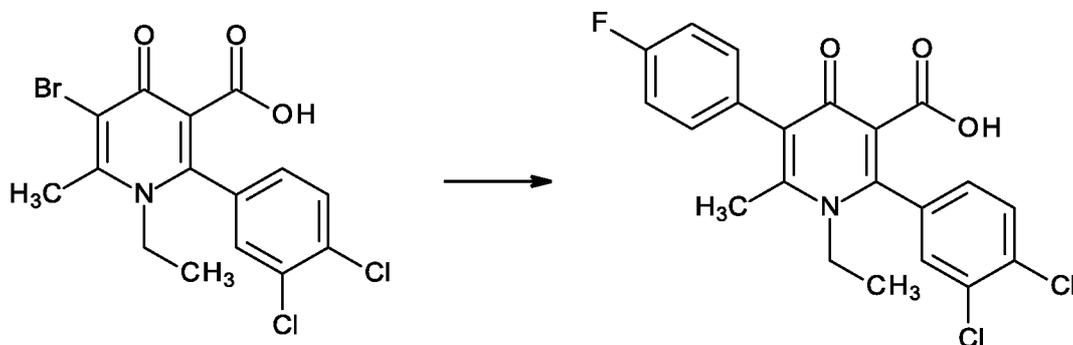


10 Получали так же, как 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-(2-фтор-3-пиридил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновую кислоту из 5-бром-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (100 мг, 0,25 ммоль) и (4-хлор-3-фторфенил)бороновой кислоты (0,130 г, 0,75 ммоль) с получением 5-(4-хлор-3-фторфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты

15 (0,044 г, 0,098 ммоль, 39%).

^1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) $\delta = 7,70$ (d, 1H), 7,65 (d, 1H), 7,60 (t, 1H), 7,35 (m, 1H), 7,26 - 7,18 (m, 1H), 7,15 - 7,06 (m, 1H), 4,02 (q, 2H), 2,45 (s, 3H), 1,22 (t, 3H).

Пример 10. Синтез 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-(4-фторфенил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (соединение номер 11)



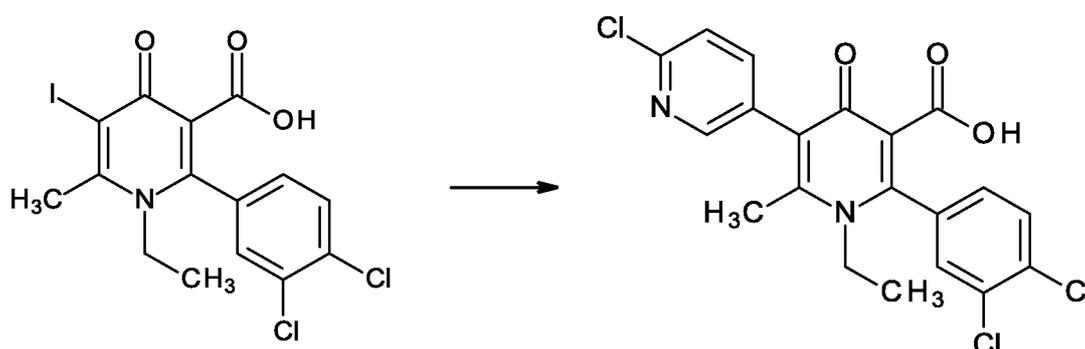
20

Получали так же, как 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-(2-фтор-3-пиридил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновую кислоту с применением 5-бром-2-(3,4-дихлорфенил)-1-

этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (0,250 г, 0,62 ммоль), (4-фторфенил)бороновой кислоты (0,130 г, 0,926 ммоль, 100 вес.%) и карбоната калия (0,172 г, 1,23 ммоль) с получением 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-(4-фторфенил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (0,088 г, 0,21 ммоль, 34%).

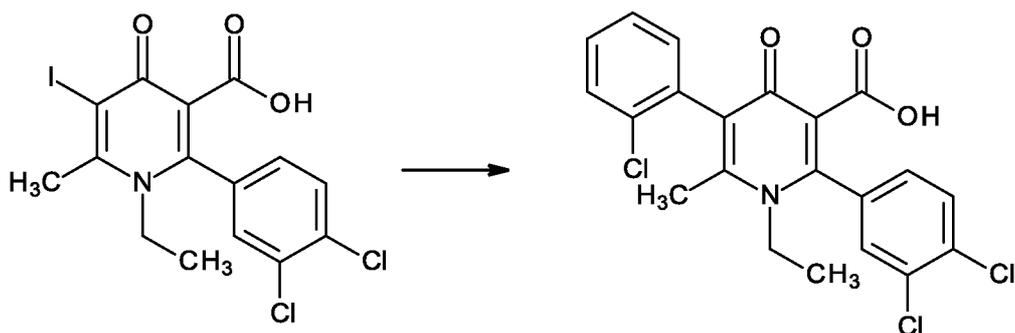
- 5 ^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) $\delta = 7,66 - 7,60$ (m, 1H), 7,43 - 7,35 (m, 1H), 7,24 - 7,12 (m, 5H), 4,02 - 3,94 (m, 2H), 2,46 - 2,38 (m, 3H), 1,28 - 1,17 (m, 3H).

Пример 11. Синтез 5-(6-хлор-3-пиридил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (соединение номер 12)



- 10 Перемешанную смесь 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-йод-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (0,800 г, 1,77 ммоль), (6-хлор-3-пиридил)бороновой кислоты (0,557 г, 3,54 ммоль), 1,4-диоксана (14,4 мл) и воды (3,20 мл) дегазировали в потоке азота в течение 20 минут. По истечении этого времени добавляли метансульфонат (2-дициклогексилфосфино-2',4',6'-триизопропил-1,1'-бифенил)[2-(2'-амино-1,1'-
- 15 бифенил)]палладия(II) (XPhos Pd G3, 0,150 г, 0,177 ммоль) с последующим добавлением трехосновного фосфата калия (1,13 г, 5,31 ммоль). Реакционную смесь нагревали в условиях микроволнового излучения при 100°C в течение 1 часа. Охлажденную реакционную смесь выливали в водный раствор хлористоводородной кислоты (2 М) и экстрагировали дихлорметаном. Объединенные экстракты выпаривали
- 20 до сухого состояния при пониженном давлении. Неочищенный остаток очищали с помощью флэш-хроматографии на силикагеле с применением градиента 0-100% этилацетата в циклогексане в качестве элюента с получением 5-(6-хлор-3-пиридил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты в виде белого твердого вещества (0,207 г, 0,47 ммоль, 27%).
- 25 ^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) $\delta = 8,28$ (d, 1H), 7,65 (m, 1H), 7,62 (d, 1H), 7,48 (d, 1H), 7,40 (d, 1H), 7,16 (m, 1H), 3,96 (m, 2H), 2,46 (s, 3H), 1,26 (t, 3H).

Пример 12. Синтез 5-(2-хлорфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (соединение номер 13)



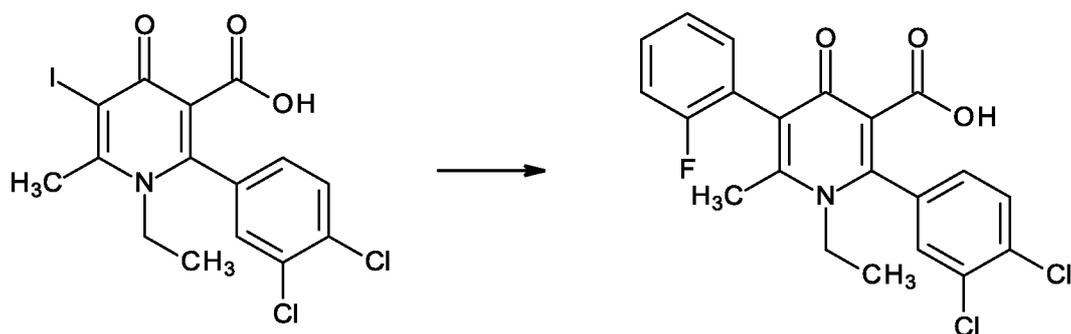
К смеси 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-йод-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (0,117 г, 0,25 ммоль), (2-хлорфенил)бороновой кислоты (0,405 г, 2,59 ммоль), трехосновного фосфата калия (0,165 г, 0,78 ммоль) и метансульфоната (2-дициклогексилфосфино-2',6'-диметоксибифенил)[2-(2'-амино-1,1'-

5 бифенил)]палладия(II) (S Phos G3, 0,044 г, 0,052 ммоль) при комнатной температуре и в атмосфере азота добавляли смесь дегазированного 1,4-диоксана (1,8 мл) и воды (0,4 мл). Реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 18 часов. Реакционную смесь разбавляли водой и лиофилизировали. Неочищенный остаток

10 очищали с помощью масс-направленной обращенно-фазовой HPLC с получением 5-(2-хлорфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты в виде коричневого твердого вещества (0,039 мг, 0,089 ммоль, 35%).

^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,62 (m, 1H), 7,58-7,54 (m, 1H), 7,47-7,39 (m, 3H), 7,27-7,25 (m, 1H), 7,20 (m, 1H), 3,98 (q, 2H), 2,37 (s, 3H), 1,26 (t, 3H).

15 **Пример 13. Синтез 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-(2-фторфенил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (соединение номер 14)**



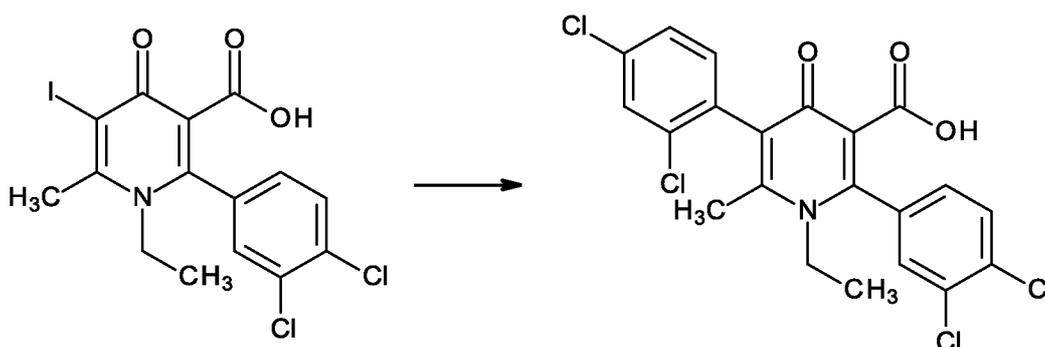
Получали так же, как 5-(6-хлор-3-пиридил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновую кислоту с применением 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-йод-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (117 мг, 0,26 ммоль) и 2-фторфенилбороновой кислоты (0,381 г, 2,59 ммоль) при комнатной температуре в течение 18 часов с получением 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-(2-фторфенил)-6-метил-4-

20

оксопиридин-3-карбоновой кислоты в виде белого твердого вещества (0,019 г, 0,045 ммоль, 17%).

^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) $\delta = 7,62$ (m, 1H), 7,49 - 7,42 (m, 2H), 7,32 - 7,17 (m, 4H), 3,96 (q, 2H), 2,43 (s, 3H), 1,26 (t, 3H).

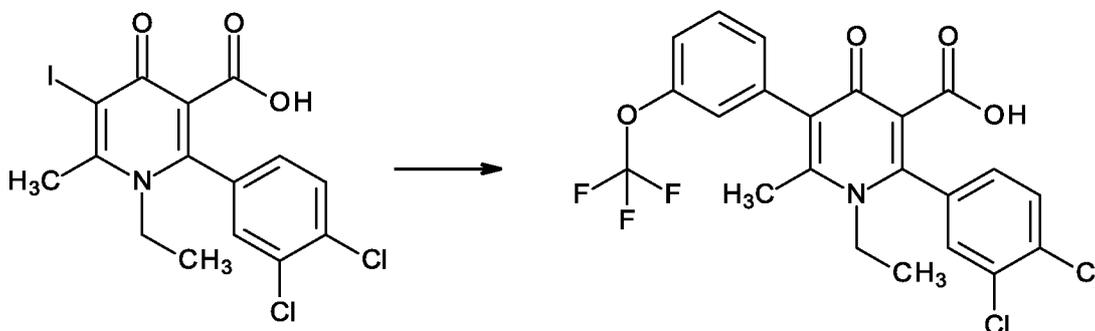
5 Пример 14. Синтез 5-(2,4-дихлорфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (соединение номер 15)



Получали так же, как 5-(2-хлорфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновую кислоту с применением 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-йод-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (0,700 г, 1,55 ммоль) и (2,4-дихлорфенил)бороновой кислоты (0,591 г, 3,10 ммоль) при нагревании в условиях микроволнового излучения при 100°C в течение 1 часа с получением 5-(2,4-дихлорфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты в виде смеси атропоизомеров (0,195 г, 0,41 ммоль, 27%).

^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) $\delta = 7,64 - 7,56$ (m, 2H), 7,45 - 7,38 (m, 2H), 7,22 - 7,15 (m, 2H), 3,96 (q, 2H), 2,37 (s, 3H), 1,25 (t, 3H).

Пример 15. Синтез 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-[3-(трифторметокси)фенил]пиридин-3-карбоновой кислоты (соединение номер 16)

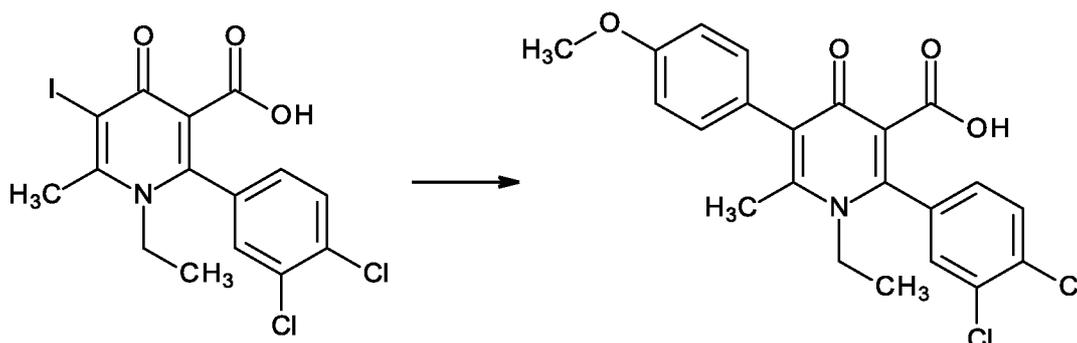


Получали так же, как 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-(2-фтор-3-пиридил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновую кислоту с применением 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-йод-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (0,110 г, 0,2433 ммоль) и 3-

(трифторметокси)фенилбороновой кислоты (0,153 г, 0,73 ммоль) с получением 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-[3-(трифторметокси)фенил]пиридин-3-карбоновой кислоты (0,063 г, 0,13 ммоль, 53%).

^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) $\delta = 7,61$ (d, 1H), 7,54 (t, 1H), 7,41 (d, 1H), 7,32-7,30 (m, 1H), 7,21 (d, 1H), 7,16 (dd, 1H), 7,12 (br m, 1H), 3,96 (q, 2H), 2,42 (s, 3H), 1,26 (t, 3H).

Пример 16. Синтез 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-(4-метоксифенил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (соединение номер 18)

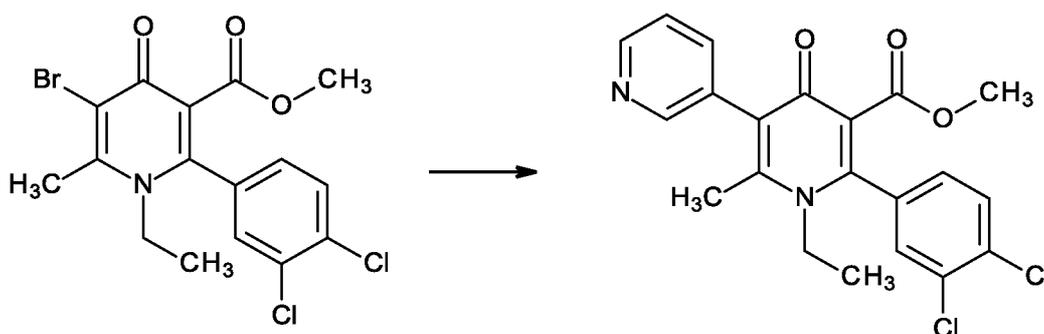


Получали так же, как 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-(2-фтор-3-пиридил)-6-метил-4-оксо-пиридин-3-карбоновую кислоту с применением 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-йод-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (0,110 г, 0,24 ммоль и 4-метоксифенилбороновой кислоты (0,113 г, 0,73 ммоль) с получением 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-(4-метоксифенил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты в виде коричневого твердого вещества (0,060 г, 0,14 ммоль, 57%).

^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) $\delta = 7,60$ (d, 1H), 7,41 (d, 1H), 7,18-7,15 (m, 3H), 7,03 (d, 2H), 3,95 (q, 2H), 3,86 (s, 3H), 2,44 (s, 3H), 1,25 (t, 3H).

Пример 17. Синтез 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-(3-пиридил)пиридин-3-карбоновой кислоты (соединение номер 19)

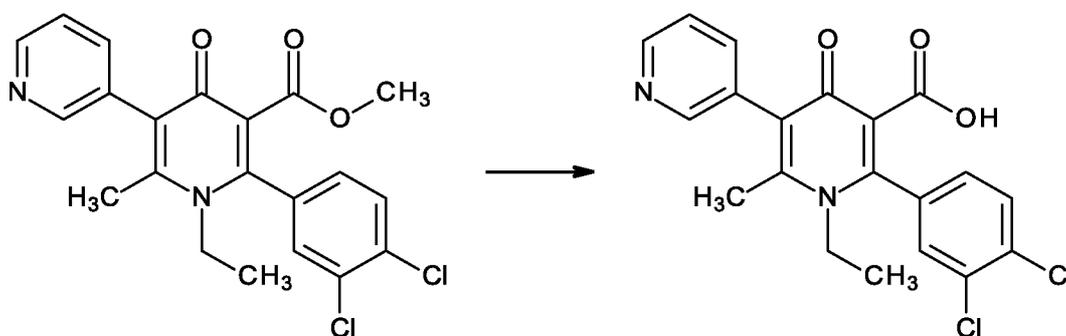
Стадия 1. Синтез метил-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-(3-пиридил)пиридин-3-карбоксилата



Получали так же, как 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-(2-фтор-3-пиридил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновую кислоту с применением 5-бром-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилата (0,100 г, 0,24 ммоль) и 3-пиридилбороновой кислоты (0,088 г, 0,72 ммоль) с получением метил-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-(3-пиридил)пиридин-3-карбоксилата в виде коричневой смолы (0,050 г, 0,119 ммоль).

^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) $\delta = 8,59$ (m, 1H), 8,47 (d, 1H), 7,68 (m, 1H), 7,59 (d, $J=8,2$ Гц, 1H), 7,57 (d, 1H), 7,37 (m, 1H), 7,31 (m, 1H), 3,84 (q, 2H), 3,57 (s, 3H), 2,34 (s, 3H), 1,20 (t, 3H).

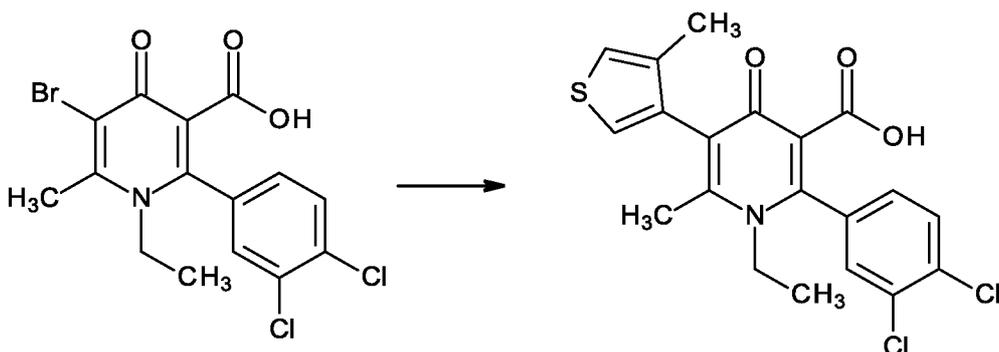
10 Стадия 2. Синтез 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-(3-пиридил)пиридин-3-карбоновой кислоты



К раствору метил-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-(3-пиридил)пиридин-3-карбоксилата (0,185 г, 0,443 ммоль) в метаноле (5 мл) и воде (2,5 мл) добавляли моногидрат гидроксида лития (0,037 г, 0,89 ммоль). Реакционную смесь нагревали с обратным холодильником в течение 5 часов. Метанол удаляли при пониженном давлении и рН доводили до рН 4 посредством добавления концентрированной хлористоводородной кислоты. Осажденное твердое вещество собирали фильтрацией, промывали циклогексаном и сушили с применением 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-(3-пиридил)пиридин-3-карбоновой кислоты (0,106 г, 0,26 ммоль, 59%).

^1H ЯМР (500 МГц, DMSO- d_6): $\delta = 8,96 - 8,81$ (m, 2H), 8,37 - 8,24 (m, 1H), 8,05 - 7,96 (m, 1H), 7,73 - 7,66 (m, 1H), 7,60 - 7,52 (m, 1H), 7,36 - 7,27 (m, 1H), 4,03 - 3,97 (m, 3H), 2,52 - 2,45 (m, 3H), 1,29 - 1,20 (m, 3H).

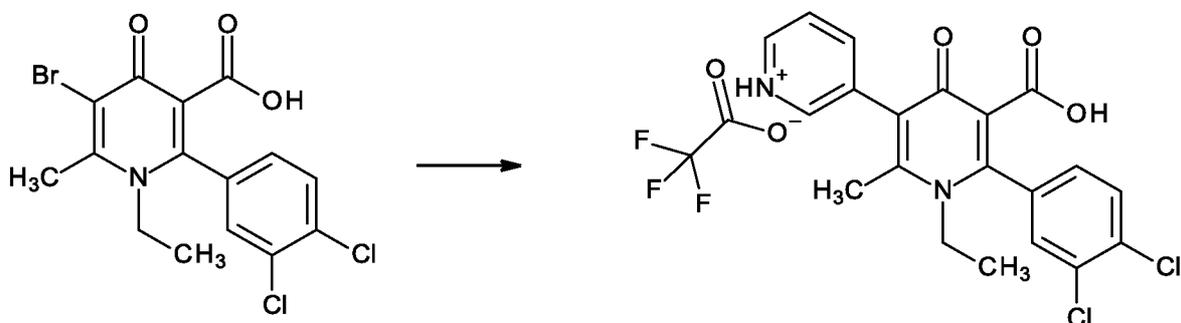
25 **Пример 18. Синтез 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-(4-метил-3-тиенил)-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (соединение номер 20)**



Получали так же, как 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-(2-фтор-3-пиридил)-6-метил-4-оксо-пиридин-3-карбоновую кислоту с применением 5-бром-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилата (0,100 г, 0,24 ммоль) и (4-метил-3-тиенил)бороновой кислоты (0,105 г, 0,74 ммоль) с получением 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-(4-метил-3-тиенил)-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты в виде коричневого масла (0,025 г, 0,059 ммоль, 24%).

^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,62 (m, 1H), 7,43 (m, 1H), 7,22 - 7,14 (m, 3H), 3,92 (q, 2H), 2,42 (s, 3H), 2,08 (d, 3H), 1,26 (t, 3H).

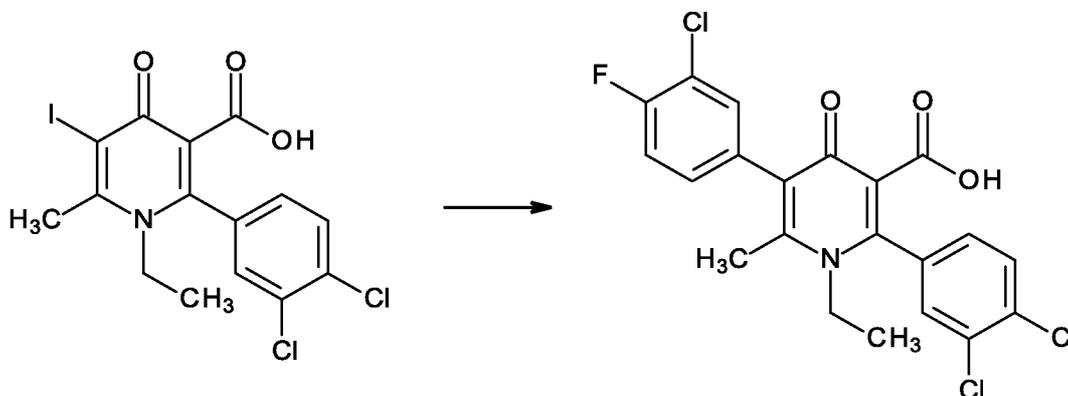
10 **Пример 19. Синтез 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-пиридин-1-ий-3-илпиридин-3-карбоновой кислоты; 2,2,2-трифторацетата (соединение номер 21)**



Получали так же, как 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-(2-фтор-3-пиридил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновую кислоту с применением 5-бром-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилата (0,250 г, 0,617 ммоль) и 3-пиридилбороновой кислоты (0,228 г, 1,85 ммоль) при нагревании в условиях микроволнового излучения при 100°C в течение 0,5 часов. С помощью очистки масс-направленной обращенно-фазовой HPLC в присутствии трифторуксусной кислоты получали 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-пиридин-1-ий-3-илпиридин-3-карбоновую кислоту; 2,2,2-трифторацетат (0,044 г, 0,085 ммоль, 14%).

^1H ЯМР (400 МГц, метанол- d_4) $\delta = 8,80 - 8,77$ (m, 1H), $8,75 - 8,68$ (m, 1H), $8,29 - 8,23$ (m, 1H), $7,96 - 7,90$ (m, 1H), $7,75 - 7,72$ (m, 1H), $7,69 - 7,64$ (m, 1H), $7,41 - 7,29$ (m, 1H), $4,10 - 3,99$ (m, 2H), $2,53 - 2,44$ (m, 3H), $1,26 - 1,18$ (m, 3H).

Пример 20. Синтез 5-(3-хлор-4-фторфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (соединение номер 22)

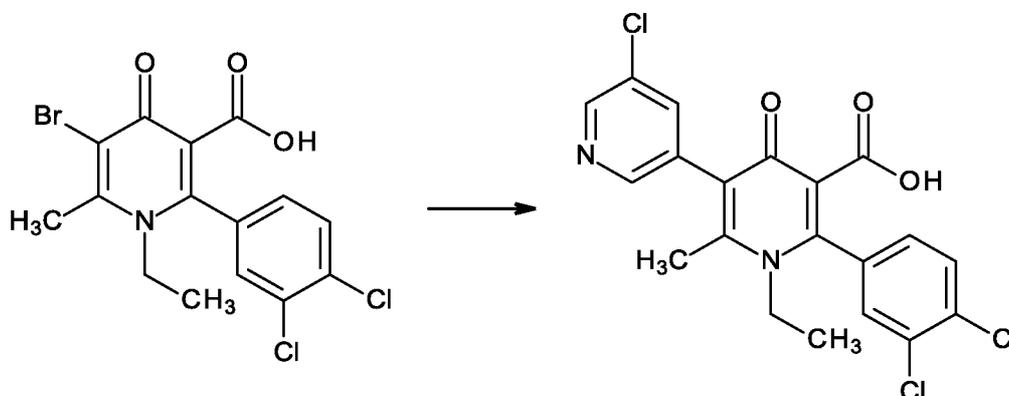


Получали так же, как 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-(2-фтор-3-пиридил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновую кислоту с применением 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-йод-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты

(0,110 г, 0,243 ммоль) и (3-хлор-4-фторфенил)бороновой кислоты (0,127 г, 0,73 ммоль) с получением 5-(3-хлор-4-фторфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты в виде прозрачного масла (0,065 г, 0,142 ммоль, 58%).

^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) $\delta = 7,60$ (d, 1H), $7,40$ (d, 1H), $7,32$ (m, 1H), $7,29-7,15$ (m, 2H), $7,17-7,12$ (m, 2H), $3,94$ (q, 2H), $2,42$ (s, 3H), $1,24$ (t, 3H).

Пример 21. Синтез 5-(5-хлор-3-пиридил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (соединение номер 23)



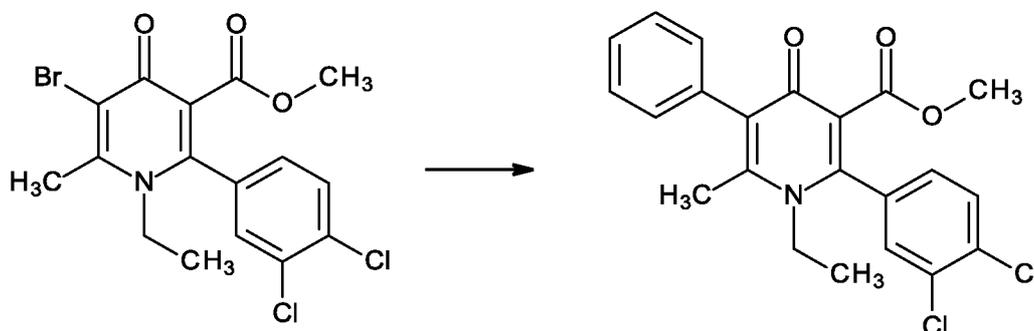
Получали так же, как 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-(2-фтор-3-пиридил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновую кислоту с применением 5-бром-2-(3,4-дихлорфенил)-1-

этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилата (0,100 г, 0,243 ммоль) и (5-хлор-3-пиридил)бороновой кислоты (0,117 г, 0,74 ммоль) с получением 5-(5-хлор-3-пиридил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (0,023 г, 0,053 ммоль, 21%).

5 ^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 8,66 (br m, 1H), 8,40 (br m, 1H), 7,22 (s, 1H), 7,62 (d, 1H), 7,41 (d, 1H), 7,17 (m, 1H), 3,96 (q, 2H), 2,45 (s, 3H), 1,26 (t, 3H).

Пример 22. Синтез 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-фенилпиридин-3-карбоновой кислоты (соединение номер 24)

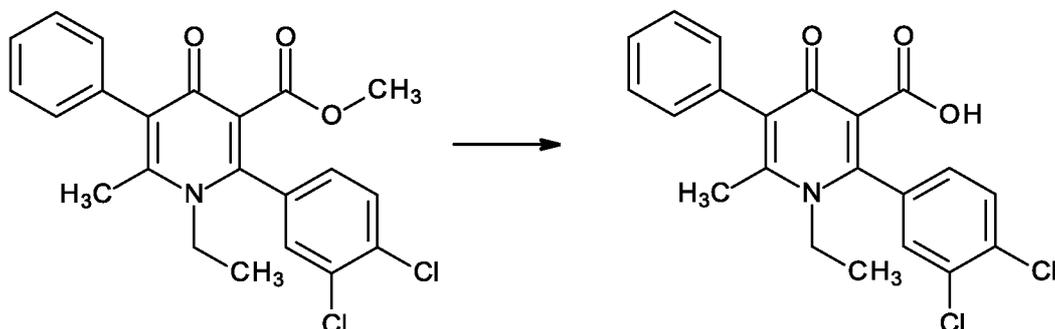
10 **Стадия 1. Синтез метил-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-фенилпиридин-3-карбоксилата**



15 Получали так же, как 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-(1-метилпирозол-4-ил)-4-оксопиридин-3-карбоновую кислоту с применением метил-5-бром-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилата (0,100 г, 0,24 ммоль) и фенилбороновой кислоты (0,087 г, 0,72 ммоль) с получением метил-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-фенилпиридин-3-карбоксилата в виде белого твердого вещества (0,053 г, 0,13 ммоль, 53%).

20 ^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,59 (d, 1H), 7,57 (d, 1H), 7,44 - 7,39 (m, 2H), 7,36 - 7,32 (m, 1H), 7,30 (m, 1H), 7,25 - 7,21 (m, 2H), 3,84 (q, 2H), 3,56 (s, 3H), 2,31 (s, 3H), 1,19 (t, 3H).

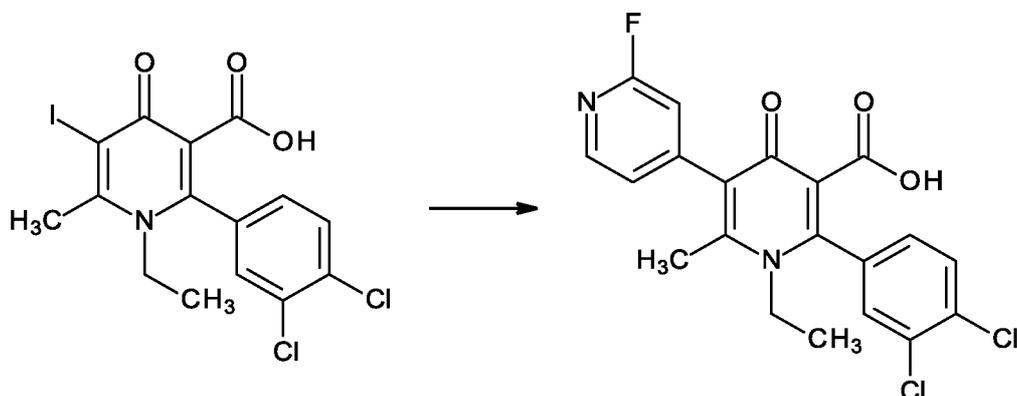
Стадия 2. Синтез 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-фенилпиридин-3-карбоновой кислоты



Получали так же, как 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-(3-
 5 пиридил)пиридин-3-карбоновую кислоту с применением метил-2-(3,4-дихлорфенил)-1-
 1-этил-6-метил-4-оксо-5-фенилпиридин-3-карбоксилата (0,052 г, 0,12 ммоль) и
 моногидрата гидроксида лития (0,010 г, 0,25 ммоль) с получением 2-(3,4-дихлорфенил)-
 1-этил-6-метил-4-оксо-5-фенилпиридин-3-карбоновой кислоты в виде белого твердого
 вещества (0,051 г, 0,13 ммоль, 100%).

10 ^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,60 (d, 1H), 7,53 - 7,48 (m, 2H), 7,46 - 7,40 (m, 2H),
 7,26 - 7,22 (m, 2H), 7,18 (m, 1H), 3,94 (m, 2H), 2,41 (s, 3H), 1,25 (m, 3H).

Пример 23. Синтез 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-(2-фтор-4-пиридил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (соединение номер 17)

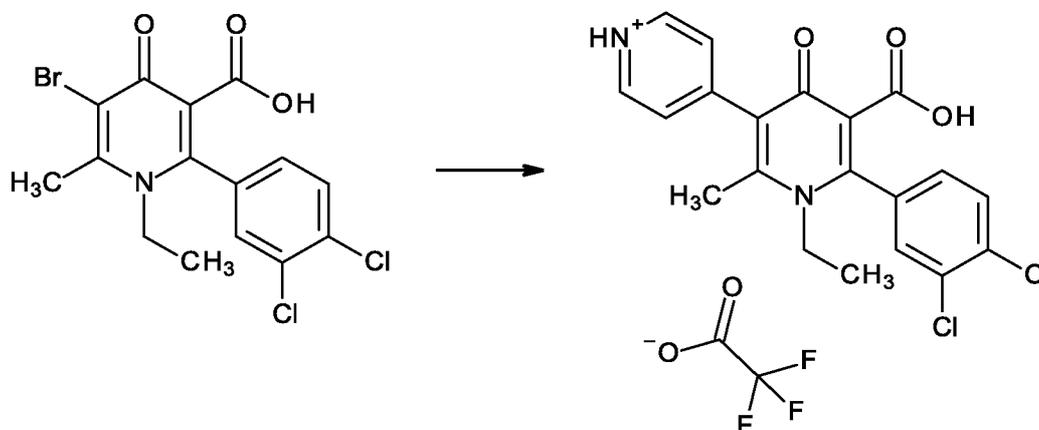


15 К смеси комплекса дихлор[1,1'-бис(дифенилфосфино)ферроцен]палладия(II) с
 дихлорметаном (1:1) (0,054 г, 0,123 ммоль), трикалийфосфата (0,281 г, 1,33 ммоль), (2-
 фтор-4-пиридил)бороновой кислоты (0,094 г, 0,66 ммоль) и 2-(3,4-дихлорфенил)-1-
 1-этил-5-йод-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (150 мг, 0,33 ммоль) при
 комнатной температуре и в атмосфере азота добавляли смесь дегазированного 1,2-
 20 диметоксиэтана (2,0 мл) и воды (0,51 мл). Реакционную смесь нагревали в условиях
 микроволнового излучения при 120°C в течение 0,75 часа. Охлажденную реакцию

смесь разбавляли водой и затем лиофилизировали в течение ночи. Неочищенный остаток экстрагировали дихлорметаном, фильтровали и выпаривали до сухого состояния при пониженном давлении. Неочищенный остаток очищали с помощью масс-направленной обращенно-фазовой HPLC с получением 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-(2-фтор-4-пиридил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (0,031 г, 0,073 ммоль, 22%) в виде коричневого твердого вещества.

^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 8,35 (d, 1H), 7,59 (d, 1H), 7,40 (s, 1H), 7,17-7,12 (m, 2H), 6,89 (s, 1H), 3,94 (br m, 2H), 2,41 (s, 3H), 1,24 (t, 3H).

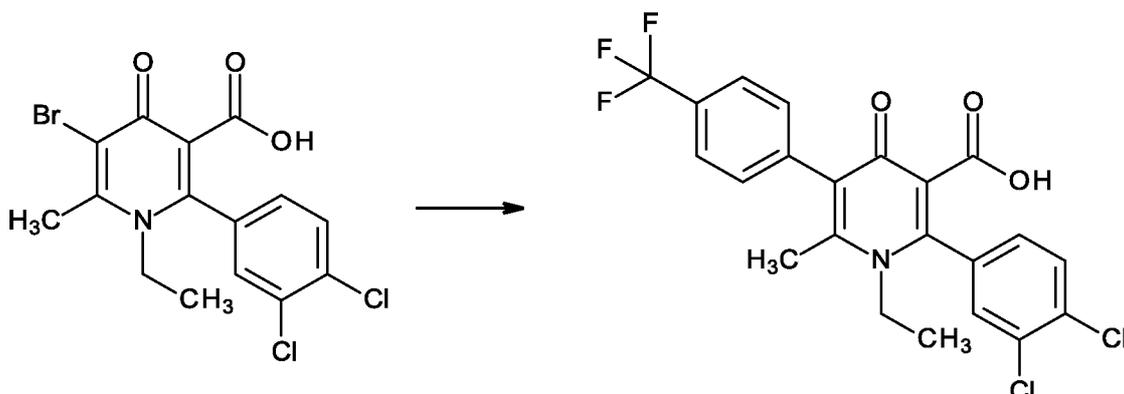
Пример 24. Синтез 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-пиридин-1-ий-4-илпиридин-3-карбоновой кислоты; 2,2,2-трифторацетата (соединение номер 25)



Получали так же, как 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-(2-фтор-3-пиридил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновую кислоту с применением 5-бром-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (0,100 г, 0,24 ммоль) и 4-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)пиридина (0,152 г, 0,74 ммоль). С помощью очистки посредством масс-направленной обращенно-фазовой HPLC в присутствии трифторуксусной кислоты получали 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-пиридин-1-ий-4-илпиридин-3-карбоновую кислоту 2,2,2-трифторацетат (0,054 г, 0,104 ммоль, 42%) в виде белого твердого вещества.

^1H ЯМР (400 МГц, метанол- d_4) δ = 8,89 (d, 2H), 7,92 (d, 2H), 7,73 (d, 1H), 7,67 (d, 1H), 7,38 (m, 1H), 4,04 (q, 2H), 2,48 (s, 3H), 1,24 (t, 3H).

Пример 25. Синтез 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-[4-(трифторметил)фенил]пиридин-3-карбоновой кислоты (соединение номер 26)

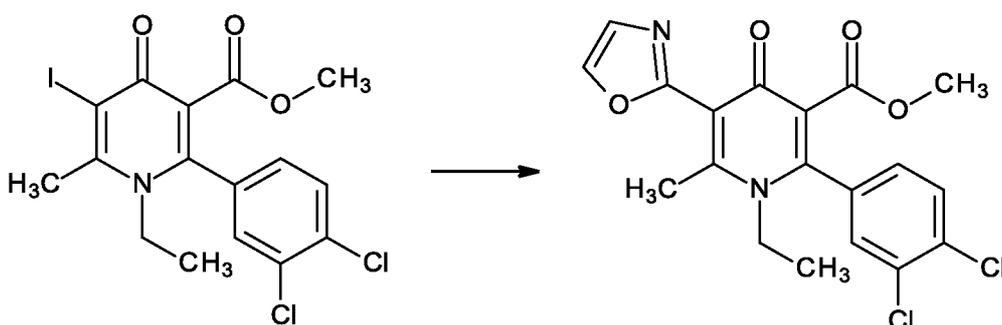


Получали так же, как 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-(2-фтор-3-пиридил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновую кислоту из 5-бром-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (100 мг, 0,25 ммоль) и [4-(трифторметил)фенил]бороновой кислоты (0,143 г, 0,75 ммоль) с получением 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-[4-(трифторметил)фенил]пиридин-3-карбоновой кислоты (0,030 г, 0,064 ммоль, 26%).

^1H ЯМР (500 МГц, метанол- d_4) δ = 7,81 (d, 2H), 7,71 (d, 1H), 7,67 (d, 1H), 7,50 (d, 2H), 7,37 (m, 1H), 4,03 (q, 2H), 2,43 (s, 3H), 1,23 (t, 3H).

Пример 26. Синтез 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-оксазол-2-ил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (соединение номер 27)

Стадия 1. Синтез метил-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-оксазол-2-ил-4-оксопиридин-3-карбоксилата

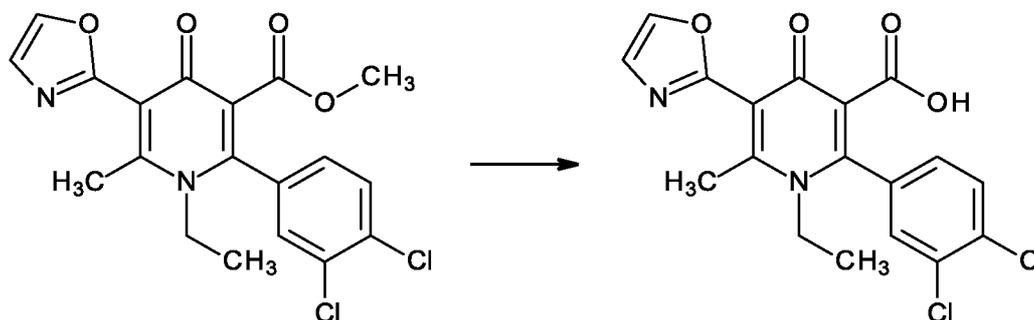


К смеси метил-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-йод-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилата (150 мг, 0,32 ммоль) и тетраakis(трифенилфосфин)палладия(0) (0,075 г, 0,064 ммоль) при комнатной температуре и в атмосфере азота добавляли дегазированный толуол (1,3 мл) с последующим посредством добавления по каплям трибутил(оксазол-2-ил)станнана (0,27 г, 0,76 ммоль). Реакционную смесь нагревали

при перемешивании при 100°C в течение 18 часов. Охлажденную реакционную смесь выпаривали до сухого состояния при пониженном давлении. Неочищенный остаток очищали с помощью масс-направленной обращенно-фазовой HPLC с получением метил-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-оксазол-2-ил-4-оксопиридин-3-

5 карбоксилата (0,050 г, 0,12 ммоль, 38%) в виде белого твердого вещества.
¹H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 8,09 (s, 1H), 7,77 - 7,72 (m, 2H), 7,46 (m, 1H), 7,38 (s, 1H), 3,95 (q, 2H), 3,51 (s, 3H), 2,43 (s, 3H), 1,19 (t, 3H).

Стадия 2. Синтез 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-оксазол-2-ил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты



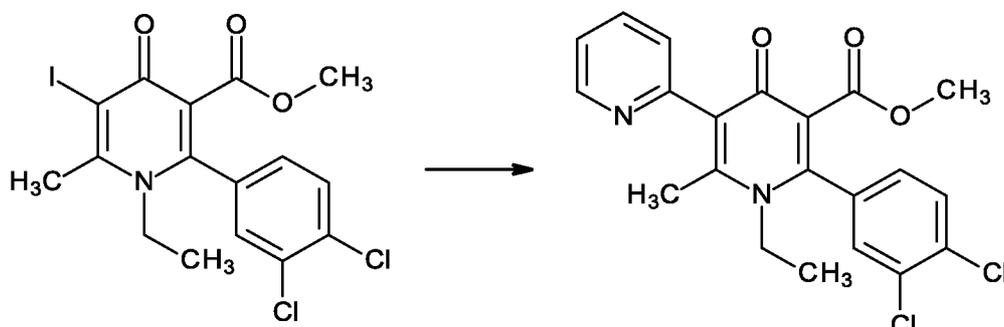
10 Получали так же, как 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-(3-пиридил)пиридин-3-карбоновую кислоту с применением метил-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-оксазол-2-ил-4-оксопиридин-3-карбоксилата (0,040 г, 0,098 ммоль) и гидроксида лития (0,033 г, 0,79 ммоль) при нагревании при 80°C в течение 18 часов с

15 получением 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-оксазол-2-ил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (0,020 г, 0,050 ммоль, 51%) в виде белого твердого вещества.

¹H ЯМР (400 МГц, метанол-d₄) δ = 8,13 (d, 1H), 7,72-7,68 (m, 2H), 7,42-7,37 (m, 2H), 4,00 (q, 2H), 2,49 (s, 3H), 1,21 (t, 3H).

Пример 27. Синтез 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-пиридин-1-ий-2-илпиридин-3-карбоновой кислоты; хлорида (соединение номер 28)

Стадия 1. Синтез метил-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-(2-пиридил)пиридин-3-карбоксилата



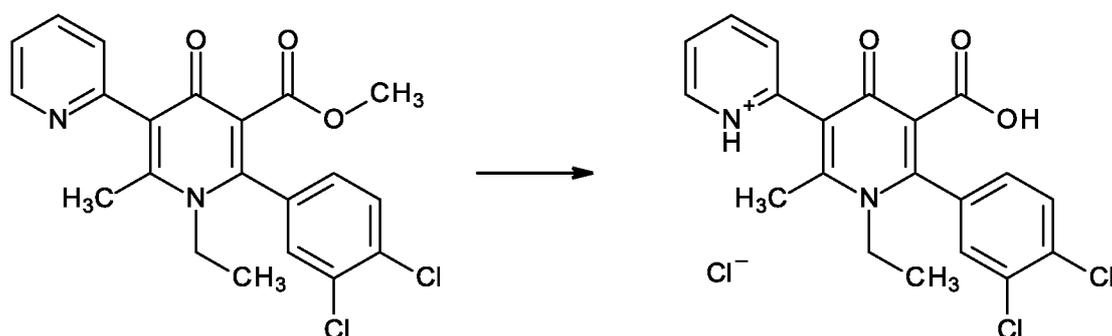
5

Получали так же, как метил-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-оксазол-2-ил-4-оксопиридин-3-карбоксилат с применением метил-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-йод-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилата (0,100 г, 0,215 ммоль) и трибутил(2-пиридил)станнана (0,110 г, 0,32 ммоль) с получением метил-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-(2-пиридил)пиридин-3-карбоксилата (0,060 г, 0,144 ммоль, 67%) в виде коричневого масла.

10

^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 9,18 (br m, 1H), 8,95 (d, 1H), 8,42 (m, 1H), 7,98 (d, 1H), 7,85 (t, 1H), 7,62 (d, 1H), 7,57 (d, 1H), 7,32 (m, 1H), 3,91 (q, 2H), 3,52 (s, 3H), 2,39 (s, 3H), 1,23 (t, 3H).

15 Стадия 2. Синтез 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-пиридин-1-ий-2-илпиридин-3-карбоновой кислоты; хлорида



20

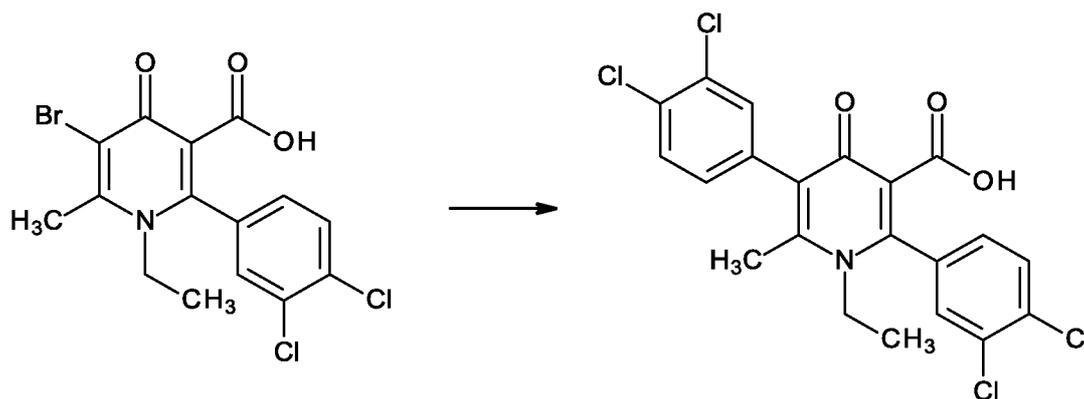
Получали так же, как 5-бром-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты с применением метил-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-(2-пиридил)пиридин-3-карбоксилата (0,030 г, 0,072 ммоль) и моногидрата гидроксида лития (0,024 г, 0,58 ммоль) при нагревании при 80°C в течение 18 часов с получением

2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-пиридин-1-ий-2-илпиридин-3-карбоновой кислоты; хлорида (0,012 г, 0,0275 ммоль, 38%).

^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 8,84 (s, 1H), 8,28 (br m, 1H), 7,85 (br m, 1H), 7,75 (br m, 1H), 7,63 (d, 1H), 7,43 (s, 1H), 7,19 (d, 1H), 4,72 (br m, 1H), 3,97 (q, 2H), 2,58 (s, 3H), 1,33 (t, 3H).

5

Пример 28. Синтез 2,5-бис(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (соединение номер 29)



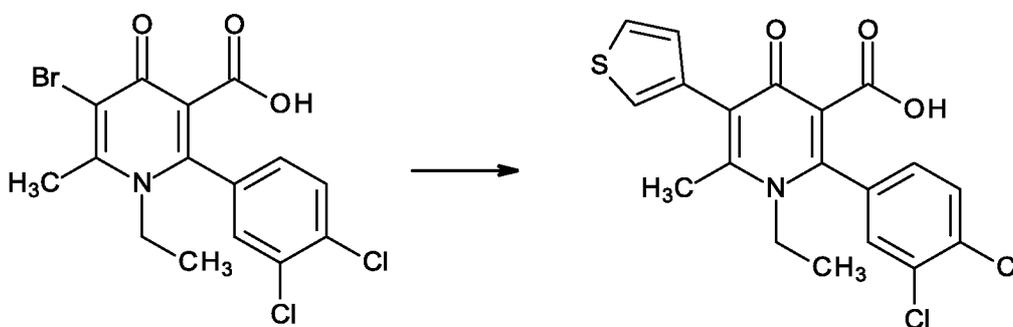
Получали так же, как 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-(2-фтор-3-пиридил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновую кислоту с применением 5-бром-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (0,200 г, 0,493 ммоль) и (3,4-дихлорфенил)бороновой кислоты (0,283 г, 1,48 ммоль) с получением 2,5-бис(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (0,115 г, 0,243 ммоль, 49%) в виде грязно-белого твердого вещества.

10

^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,62 - 7,57 (m, 2H), 7,40 - 7,37 (m, 2H), 7,17 - 7,10 (m, 2H), 3,94 (q, 2H), 2,43 (s, 3H), 1,25 (t, 3H).

15

Пример 29. Синтез 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-(3-тиенил)пиридин-3-карбоновой кислоты (соединение номер 30)



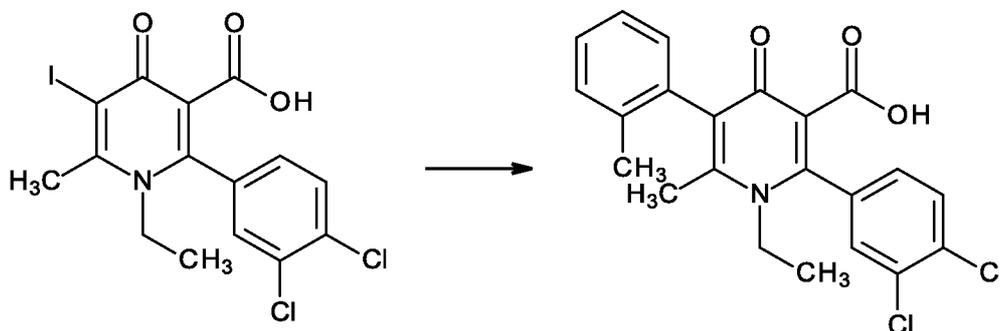
Получали так же, как 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-(2-фтор-3-пиридил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновую кислоту с применением 5-бром-2-(3,4-дихлорфенил)-1-

20

этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (0,200 г, 0,494 ммоль) и (2-фтор-3-пиридил)бороновой кислоты (0,209 г, 1,481 ммоль) при нагревании в условиях микроволнового излучения при 100°C в течение 1 часа с получением 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-(3-тиенил)пиридин-3-карбоновой кислоты (0,023 г, 0,0537 ммоль, 11%) в виде белого твердого вещества.

^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 8,36 - 8,35 (m, 1H), 7,85 (m, 1H), 7,63 (m, 1H), 7,45-7,37 (m, 2H), 7,18 (m, 1H), 4,01 - 3,95 (m, 2H), 2,45 (d, 3H), 3,10 (t, 3H).

Пример 30. Синтез 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-(о-толил)-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (соединение номер 31)



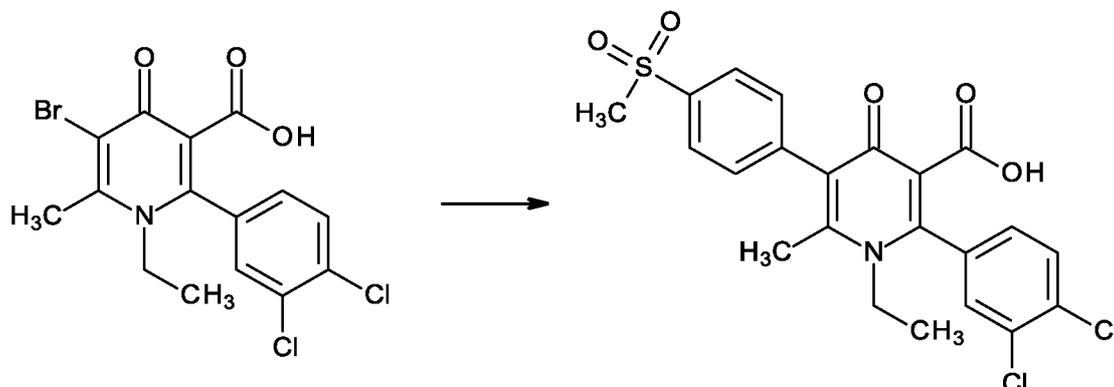
10

Смесь 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-йод-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (0,117 г, 0,259 ммоль), трехосновного фосфата калия (0,165 г, 0,776 ммоль), хлор(2-дициклогексилфосфино-2',6'-диметокси-1,1'-бифенил)[2-(2'-амино-1,1'-бифенил)]палладия(II) (SPhos Pd G2, 0,043 г, 0,0518 ммоль) и о-толилбороновой кислоты (0,359 г, 2,59 ммоль) перемешивали в дегазированной смеси 1,4-диоксана (1,8 мл) и воды (0,4 мл) при комнатной температуре в течение 18 часов. Реакционную смесь разбавляли водой и затем лиофилизировали. Неочищенный остаток экстрагировали дихлорметаном, фильтровали и выпаривали до сухого состояния при пониженном давлении. Неочищенный остаток очищали с помощью масс-направленной обращенно-фазовой HPLC с получением 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-(о-толил)-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (0,043 г, 0,104 ммоль, 40%).

20

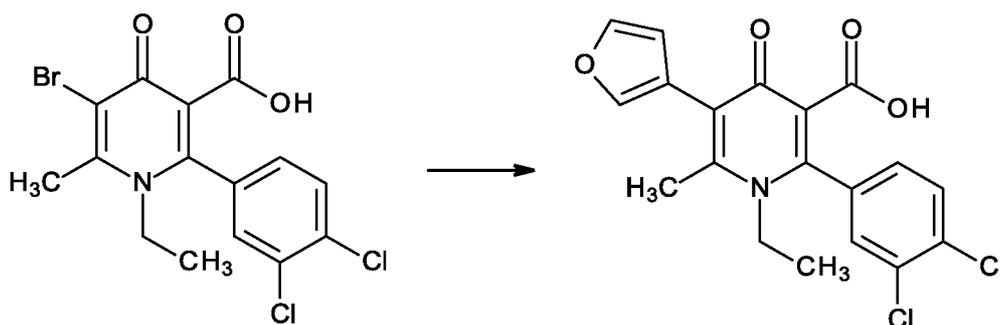
^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,62 (m, 1H), 7,45 (m, 1H), 7,36 - 7,30 (m, 3H), 7,21 (m, 1H), 7,08 - 7,06 (m, 1H), 3,96 (q, 2H), 2,34 (s, 3H), 2,15 (d, 3H), 1,25 (t, 3H).

Пример 31. Синтез 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-(4-метилсульфонилфенил)-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (соединение номер 32)



- 5 Получали так же, как 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-(2-фтор-3-пиридил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновую кислоту с применением 5-бром-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (0,200 г, 0,494 ммоль) и (4-метилсульфонилфенил)бороновой кислоты (0,296 г, 1,48 ммоль) с получением 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-(4-метилсульфонилфенил)-4-оксопиридин-3-
- 10 карбоновой кислоты (0,073 г, 0,141 ммоль, 31%) в виде белого твердого вещества.
 ^1H ЯМР (500 МГц, DMSO-d_6): $\delta = 8,05$ (d, 2H), 7,83 - 7,79 (m, 2H), 7,57 - 7,53 (m, 2H), 7,47 (m, 1H), 3,91 (q, 2H), 3,26 (s, 3H), 2,38 (s, 3H), 1,14 (t, 3H).

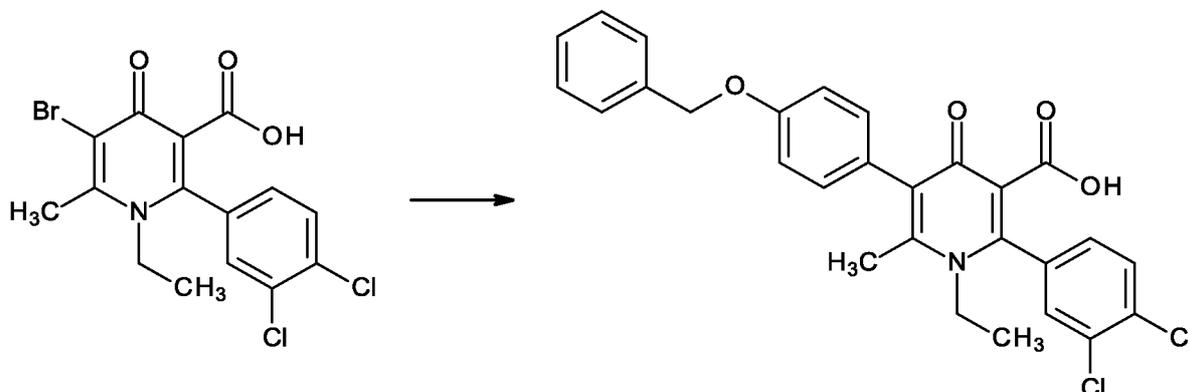
Пример 32. Синтез 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-(3-фурил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (соединение номер 33)



- 15 Получали так же, как 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-(2-фтор-3-пиридил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновую кислоту с применением 5-бром-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (0,100 г, 0,247 ммоль) и 3-фурилбороновой кислоты (0,083 г, 0,74 ммоль) с получением 2-(3,4-дихлорфенил)-1-
- 20 этил-5-(3-фурил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (0,032 г, 0,082 ммоль, 33%) в виде коричневого масла.

^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) $\delta = 7,61 - 7,59$ (m, 3H), 7,38 (d, 1H), 7,14 (m, 1H), 6,50 - 6,49 (m, 1H), 3,96 (q, 2H), 2,61 (s, 3H), 1,24 (t, 3H).

Пример 33. Синтез 5-(4-бензилоксифенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (соединение номер 35)



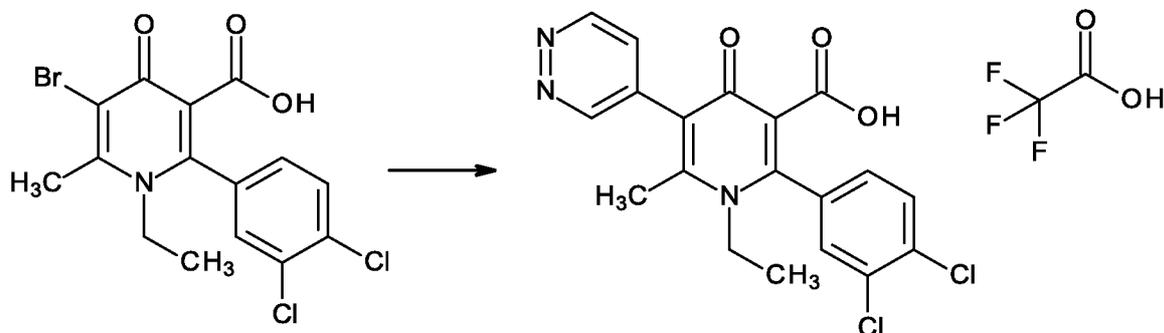
5

Получали так же, как 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-(2-фтор-3-пиридил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновую кислоту с применением 5-бром-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (0,200 г, 0,494 ммоль) и 4-бензилоксифенилбороновой кислоты (0,345 г, 1,48 ммоль) с получением 5-(4-бензилоксифенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (0,079 г, 0,156 ммоль, 32%) в виде грязно-белого твердого вещества.

10

^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) $\delta = 7,61$ (d, 1H), 7,48 - 7,46 (m, 2H), 7,43 - 7,39 (m, 3H), 7,37 - 7,33 (m, 1H), 7,19 - 7,16 (m, 3H), 7,12 - 7,10 (m, 2H), 5,12 (s, 2H), 3,94 (q, 2H), 2,44 (s, 3H), 1,25 (t, 3H).

15 Пример 34. Синтез 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-пиридазин-4-илпиридин-3-карбоновой кислоты; 2,2,2-трифторуксусной кислоты (соединение номер 35)



20

Получали так же, как 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-(2-фтор-3-пиридил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновую кислоту с применением 5-бром-2-(3,4-дихлорфенил)-1-

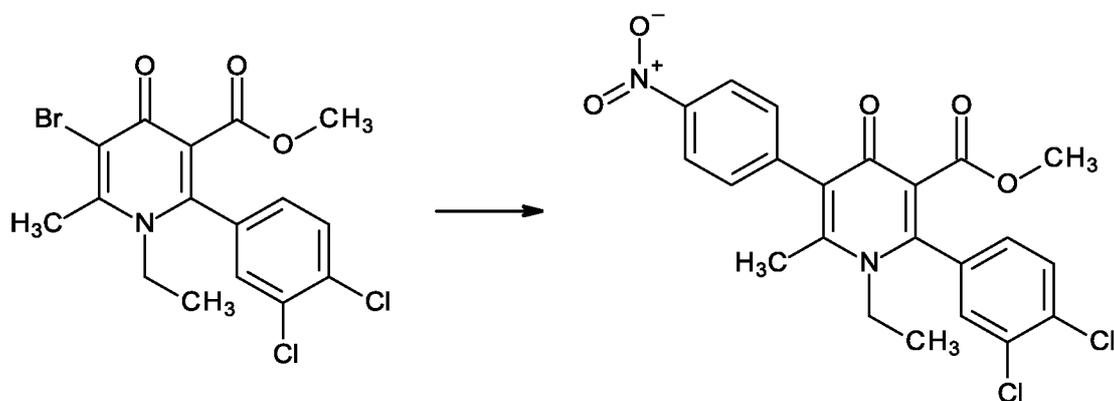
этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (0,100 г, 0,247 ммоль) и пиридазин-4-илбороновой кислоты (0,092 г, 0,74 ммоль) с получением 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-пиридазин-4-илпиридин-3-карбоновой кислоты; 2,2,2-трифторуксусной кислоты (0,050 г, 0,096 ммоль, 39%) в виде белого твердого

5

вещества.
 ^1H ЯМР (400 МГц, метанол- d_4) δ = 9,38 (d, 1H), 9,25 (br m, 1H), 7,87 (d, 1H), 7,72 (d, 1H), 7,67 (d, 1H), 7,37 (m, 1H), 4,04 (q, 2H), 2,49 (s, 3H), 1,24 (t, 3H).

Пример 35. Синтез 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-(4-нитрофенил)-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (соединение номер 36)

10 **Стадия 1. Синтез метил-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-(4-нитрофенил)-4-оксопиридин-3-карбоксилата**



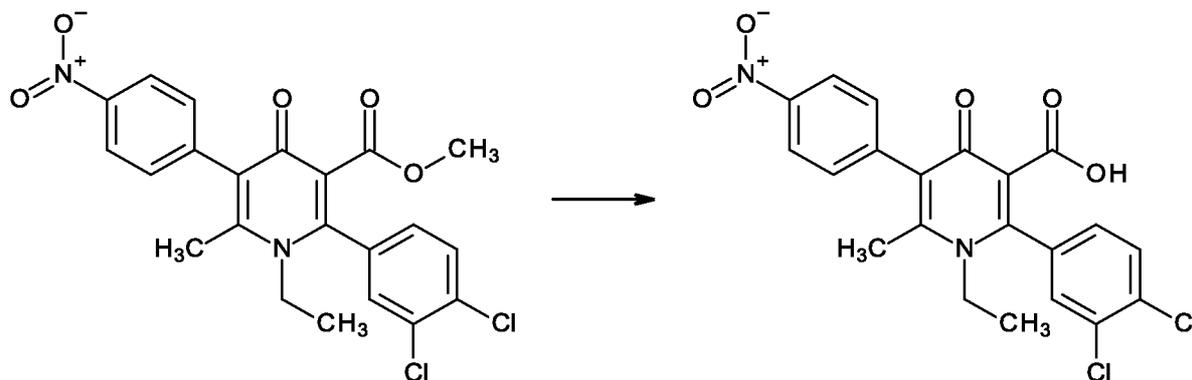
Получали так же, как 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-(2-фтор-3-пиридил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновую кислоту с применением метил-5-бром-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (0,250 г, 0,597 ммоль) и (4-нитрофенил)бороновой кислоты (0,149 г, 0,895 ммоль) с получением метил-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-(4-нитрофенил)-4-оксопиридин-3-карбоксилата (0,179 г, 0,388 ммоль, 65%) в виде оранжевого твердого вещества.

15

^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,59 - 7,52 (m, 2H), 7,46 - 7,36 (m, 4H), 7,24 - 7,15 (m, 2H), 3,98 - 3,86 (m, 3H), 2,50 - 2,31 (m, 2H), 0,87 - 0,60 (m, 3H).

20

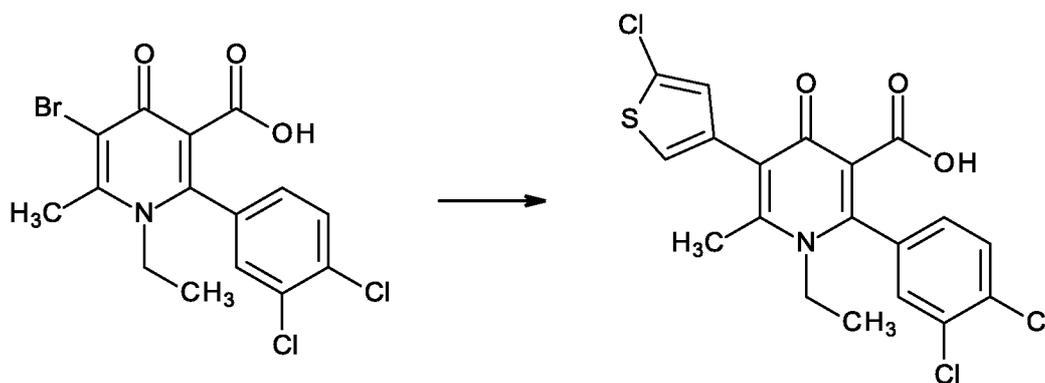
Стадия 2. Синтез 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-(4-нитрофенил)-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты



Получали так же, как 5-бром-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновую кислоту с применением метил-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-(4-нитрофенил)-4-оксопиридин-3-карбоксилата (0,179 г, 0,388 ммоль) с получением 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-(4-нитрофенил)-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (0,055 г, 0,123 ммоль, 32%) в виде грязно-белого порошка.

^1H ЯМР (400 МГц, DMSO- d_6) δ = 8,40 - 8,27 (m, 2H), 7,84 - 7,77 (m, 2H), 7,62 - 7,53 (m, 2H), 7,49 - 7,41 (m, 1H), 3,96 - 3,79 (m, 2H), 2,42 - 2,36 (m, 3H), 1,18 - 1,03 (m, 3H).

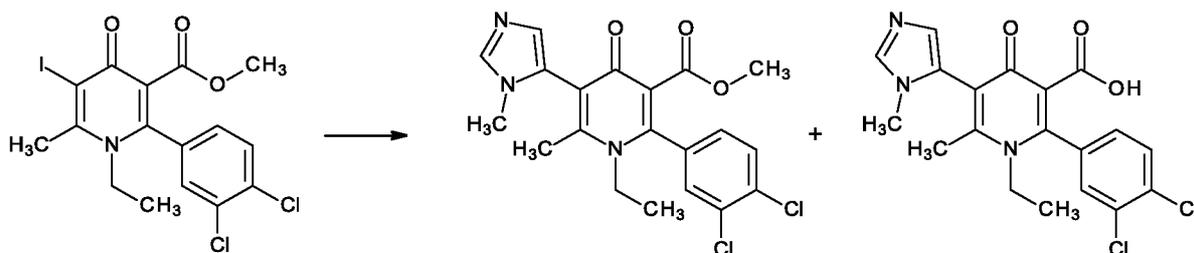
Пример 36. Синтез 5-(5-хлор-3-тиенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (соединение номер 37)



Получали так же, как 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-(2-фтор-3-пиридил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновую кислоту с применением 5-бром-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (0,200 г, 0,494 ммоль) и (5-хлор-3-тиенил)бороновой кислоты (0,241 г, 1,481 ммоль) при нагревании при 100°C в течение 18 часов с получением 5-(5-хлор-3-тиенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (0,102 г, 0,23 ммоль, 47%) в виде грязно-белого твердого вещества.

^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) $\delta = 7,59$ (d, 1H), 7,39 (d, 1H), 7,15 (m, 1H), 7,08 (d, 1H), 6,91 (d, 1H), 3,93 (q, 2H), 2,51 (s, 3H), 1,24 (t, 3H).

Примеры 37 и 38. Синтез метил-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-(3-метилимидазол-4-ил)-4-оксо-пиридин-3-карбоксилата (соединение номер 39) и 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-(3-метилимидазол-4-ил)-4-оксо-пиридин-3-карбоновой кислоты (соединение номер 40)

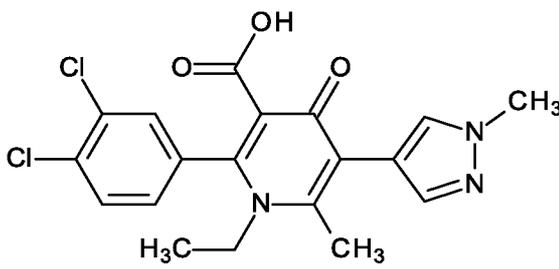
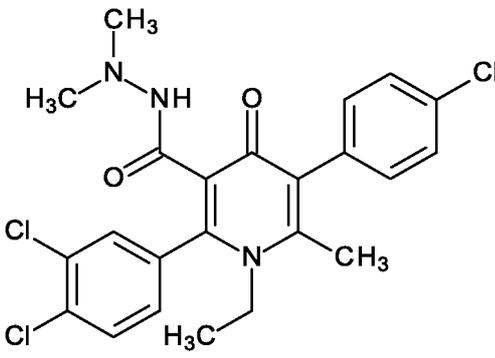
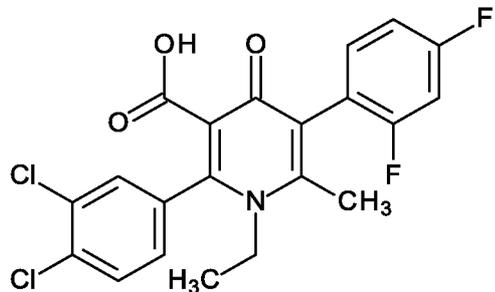
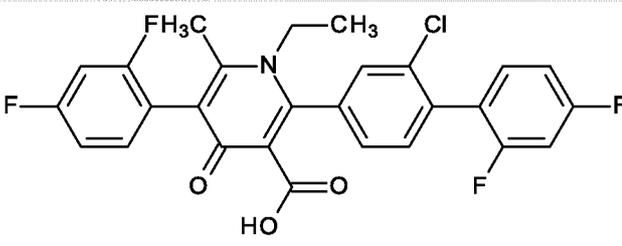


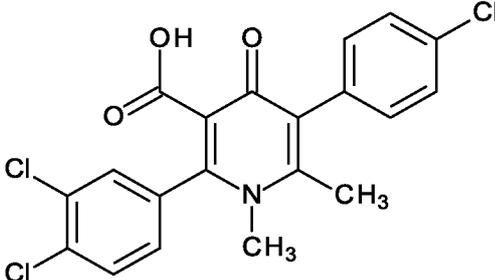
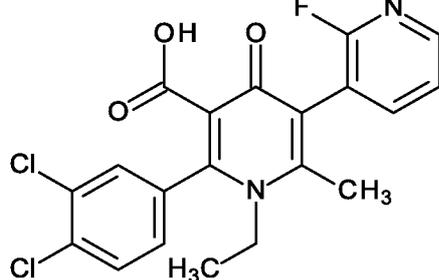
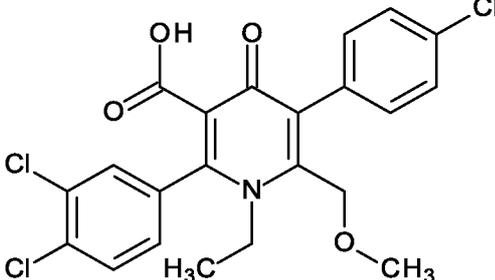
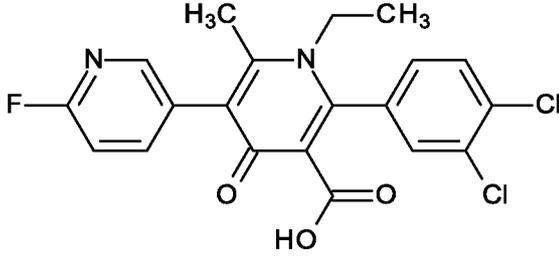
Получали так же, как метил-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-оксазол-2-ил-4-оксопиридин-3-карбоксилат с применением метил-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-йод-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилата (0,150 г, 0,322 ммоль) и 1-метил-5-(трибутилстаннил)имидазола (0,189 г, 0,483 ммоль) с получением после очистки посредством масс-направленной обращенно-фазовой HPLC метил-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-(3-метилимидазол-4-ил)-4-оксопиридин-3-карбоксилата (0,019 г, 0,045 ммоль, 14%) и 2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-(3-метилимидазол-4-ил)-4-оксопиридин-3-карбоновой кислоты (0,019 г, 0,046 ммоль, 14%).

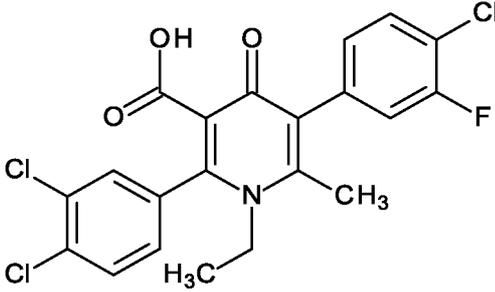
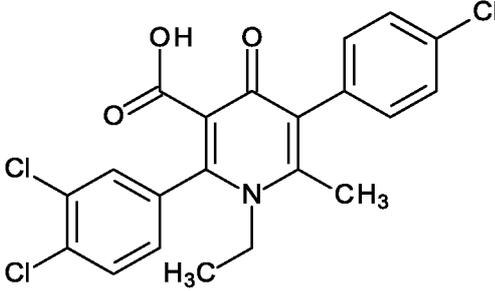
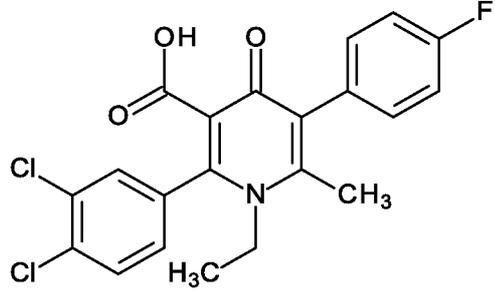
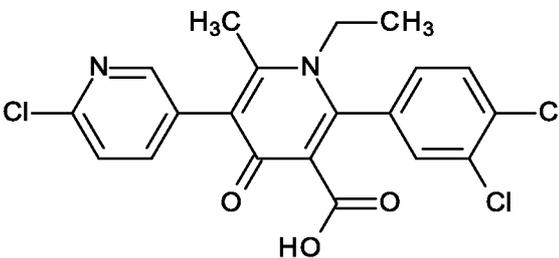
^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) $\delta = 7,65 - 7,54$ (m, 3H), 7,37 - 7,26 (m, 1H), 7,24 (d, 1H), 3,91 - 3,84 (m, 2H), 3,80 (s, 3H), 3,56 (d, 3H), 2,47 (s, 3H), 1,23 (m, 3H).

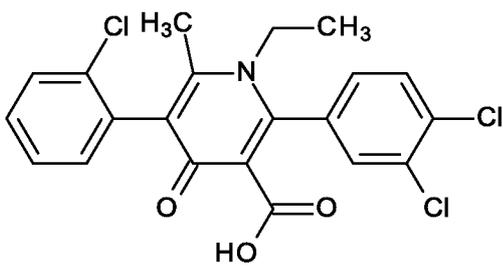
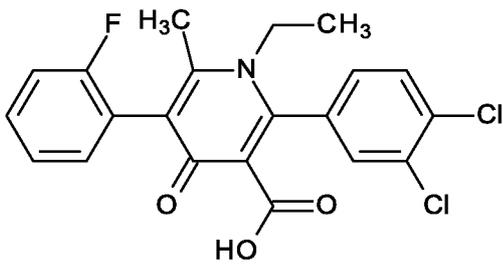
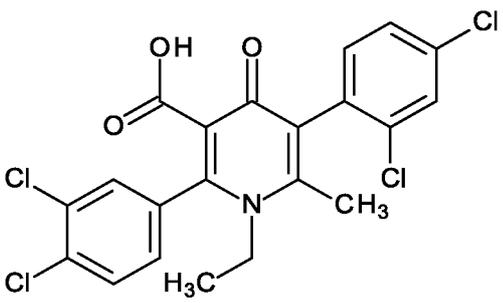
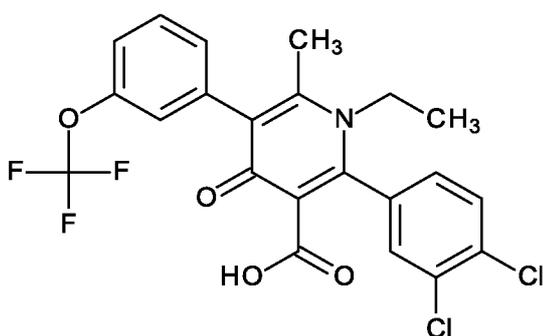
^1H ЯМР (400 МГц, метанол- d_4) $\delta = 7,78$ (d, 1H), 7,76 - 7,74 (m, 2H), 7,71 (m, 1H), 7,74 - 7,70 (m, 1H), 4,08 - 3,96 (m, 2H), 3,81 (s, 3H), 2,45 (s, 3H), 1,23 (t, 3H).

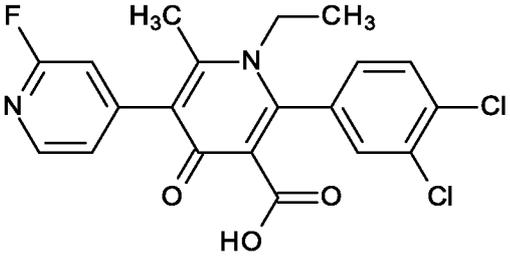
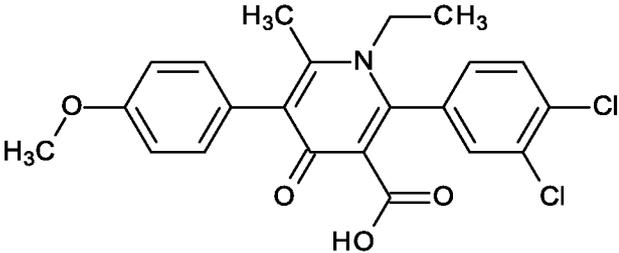
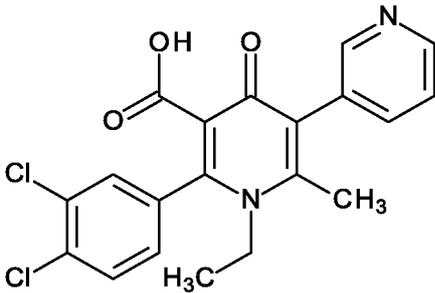
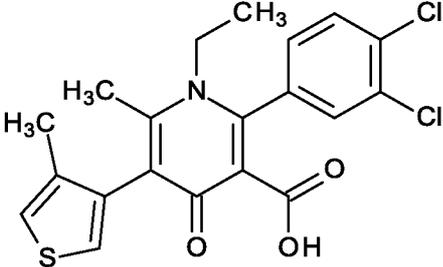
Таблица 2. Данные ^1H ЯМР и LC/MS для выбранных соединений из таблицы 1.

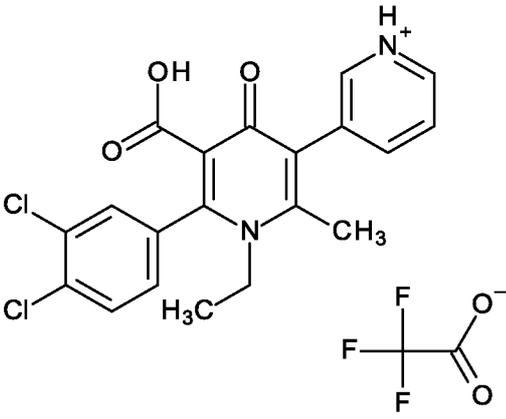
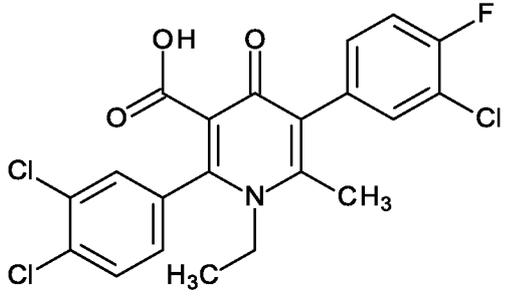
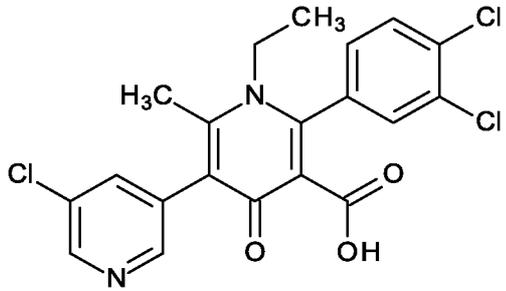
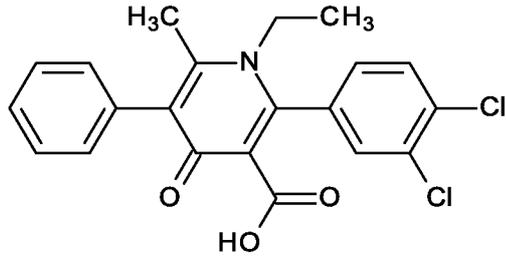
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ^1H ЯМР | LC/MS |
|--------------|---|---|-------|
| 1 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-(1-метилпиразол-4-ил)-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p>^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ = 7,70 (s, 1H), 7,58 (d, 1H), 7,53 (s, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,14 (m, 1H), 3,99 (s, 3H), 3,94 (q, 2H), 2,64 (s, 3H), 1,23 (t, 3H)</p> | |
| 2 | 5-(4-Хлорфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-N,N',N'',6-триметил-4-оксопиридин-3-карбогидразид |  <p>^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ = 7,58 (d, 1H), 7,52 - 7,42 (m, 3H), 7,31 - 7,22 (m, 1H), 7,16 (d, 2H), 3,88 (q, 2H), 2,75 (s, 6H), 2,33 (s, 3H), 1,20 (t, 3H)</p> | |
| 3 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-5-(2,4-дифторфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p>^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ = 7,62 (m, 1H), 7,43 (m, 1H), 7,27-7,33 (m, 1H), 7,18 (m, 1H), 6,95-7,09 (m, 2H), 3,91-4,02 (m, 2H), 2,43 (d, 3H), 1,26 (t, 3H)</p> | |
| 4 | 2-[3-Хлор-4-(2,4-дифторфенил)фенил]-5-(2,4-дифторфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p>^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ = 7,52 - 7,38 (m, 3H), 7,34 - 7,27 (m, 2H), 7,10 - 6,88 (m, 4H), 4,08 - 3,94 (m, 2H), 2,47 - 2,42 (m, 3H), 1,34 - 1,26 (m, 3H)</p> | |

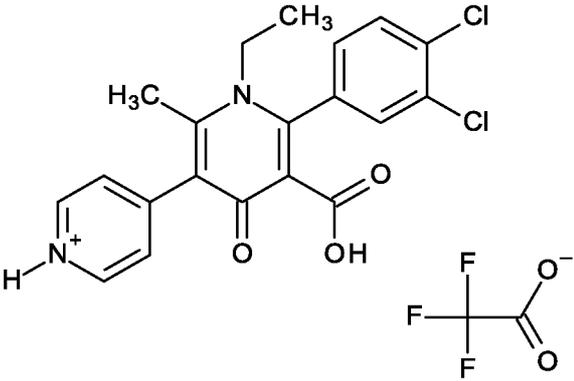
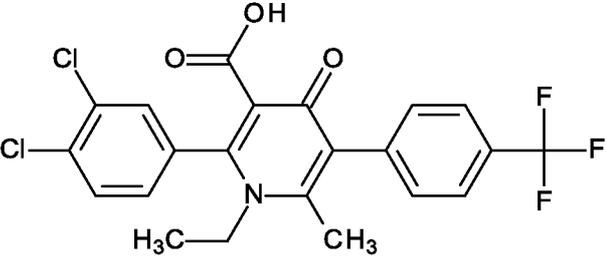
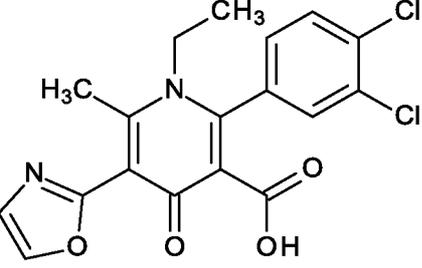
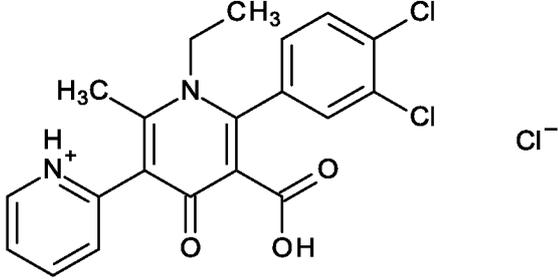
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ^1H ЯМР | LC/MS |
|--------------|--|--|-------|
| 5 | 5-(4-Хлорфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1,6-диметил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p>^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ = 7,66 - 7,61 (m, 1H), 7,53 - 7,46 (m, 2H), 7,39 - 7,33 (m, 1H), 7,23 - 7,18 (m, 2H), 7,16 - 7,08 (m, 1H), 3,50 - 3,39 (m, 3H), 2,42 - 2,32 (m, 3H)</p> | |
| 6 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-5-(2-фтор-3-пиридил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p>^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ = 8,36-8,35 (m, 1H), 7,85 (m, 1H), 7,63 (m, 1H), 7,45-7,37 (m, 2H), 7,18 (m, 1H), 4,01-3,95 (m, 2H), 2,45 (d, 3H), 3,10 (t, 3H)</p> | |
| 7 | 5-(4-Хлорфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-(метоксиметил)-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p>^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ = 7,77 - 7,70 (m, 2H), 7,57 - 7,51 (m, 2H), 7,45 - 7,38 (m, 1H), 7,39 - 7,31 (m, 2H), 4,40 - 4,32 (m, 2H), 4,26 - 4,12 (m, 2H), 3,31 - 3,27 (m, 3H), 1,32 - 1,21 (m, 3H)</p> | |
| 8 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-5-(6-фтор-3-пиридил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p>^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ = 8,11 (br m, 1H), 7,79 (m, 1H), 7,63-7,59 (m, 1H), 7,41 (d, 1H), 7,17 (m, 1H), 7,10 (m, 1H), 3,96 (q, 2H), 2,46 (s, 3H), 1,27 (t, 3H)</p> | |

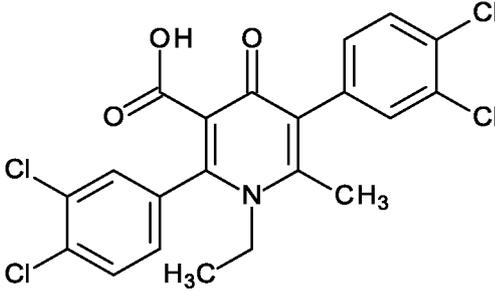
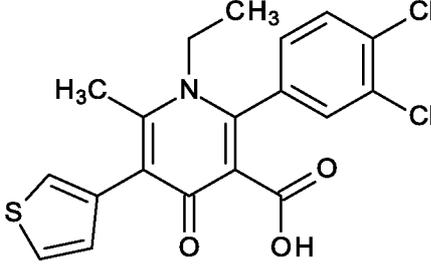
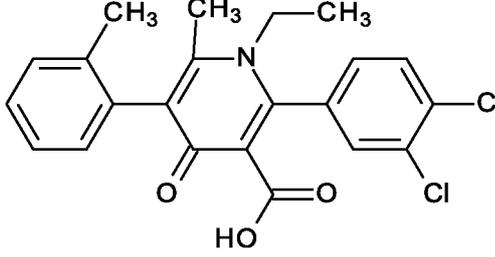
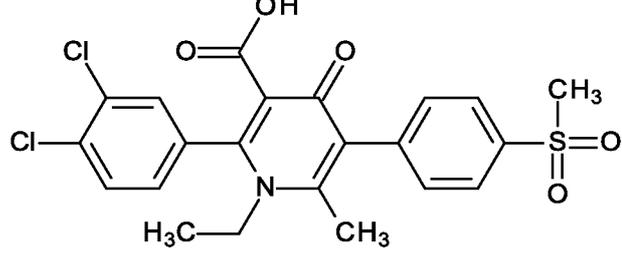
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ^1H ЯМР | LC/MS |
|--------------|---|--|-------|
| 9 | 5-(4-Хлор-3-фтор-фенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p>^1H ЯМР (500 МГц, метанол-d_4) δ = 7,70 (d, 1H), 7,65 (d, 1H), 7,60 (t, 1H), 7,35 (m, 1H), 7,26 - 7,18 (m, 1H), 7,15 - 7,06 (m, 1H), 4,02 (q, 2H), 2,45 (s, 3H), 1,22 (t, 3H)</p> | |
| 10 | 5-(4-Хлорфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p>^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ = 7,61 (d, 1H), 7,49 (d, 2H), 7,41 (d, 1H), 7,21-7,16 (m, 3H), 3,94 (q, 2H), 2,42 (s, 3H), 1,25 (t, 3H)</p> | |
| 11 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-5-(4-фторфенил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p>^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ = 7,66 - 7,60 (m, 1H), 7,43 - 7,35 (m, 1H), 7,24 - 7,12 (m, 5H), 4,02 - 3,94 (m, 2H), 2,46 - 2,38 (m, 3H), 1,28 - 1,17 (m, 3H)</p> | |
| 12 | 5-(6-Хлор-3-пиридил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p>^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ = 8,28 (d, 1H), 7,65 (m, 1H), 7,62 (d, 1H), 7,48 (d, 1H), 7,40 (d, 1H), 7,16 (m, 1H), 3,96 (q, 2H), 2,46 (s, 3H), 1,26 (t, 3H)</p> | |

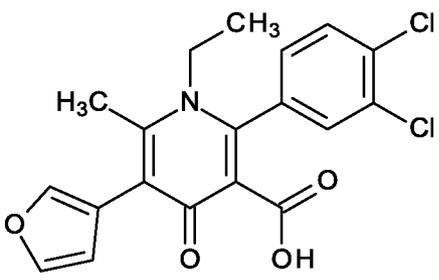
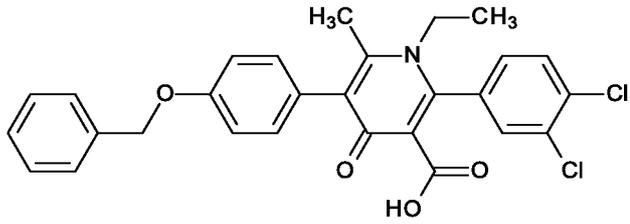
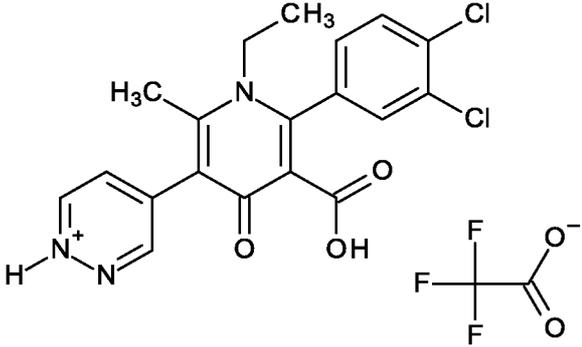
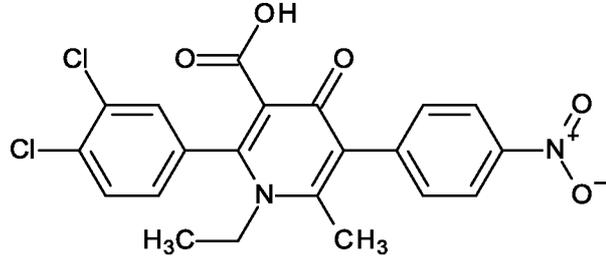
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ^1H ЯМР | LC/MS |
|--------------|---|---|-------|
| 13 | 5-(2-Хлорфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p>^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ = 7,62 (m, 1H), 7,58-7,54 (m, 1H), 7,47-7,39 (m, 3H), 7,27-7,25 (m, 1H), 7,20 (m, 1H), 3,98 (q, 2H), 2,37 (s, 3H), 1,26 (t, 3H)</p> | |
| 14 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-5-(2-фторфенил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p>^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ = 7,62 (m, 1H), 7,49-7,42 (m, 2H), 7,32-7,17 (m, 4 H), 3,96 (q, 2H), 2,43 (s, 3H), 1,26 (t, 3H)</p> | |
| 15 | 5-(2,4-Дихлорфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p>^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ = 7,64 - 7,56 (m, 2H), 7,45 - 7,38 (m, 2H), 7,22 - 7,15 (m, 2H), 3,96 (q, J = 7,1Гц, 2H), 2,37 (s, 3H), 1,25 (t, J = 7,1Гц, 3H)</p> | |
| 16 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-[3-(трифторметокси)фенил]пиридин-3-карбоновая кислота |  <p>^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ = 7,64 - 7,56 (m, 2H), 7,45 - 7,38 (m, 2H), 7,22 - 7,15 (m, 2H), 3,96 (q, J = 7,1Гц, 2H), 2,37 (s, 3H), 1,25 (t, J = 7,1Гц, 3H)</p> | |

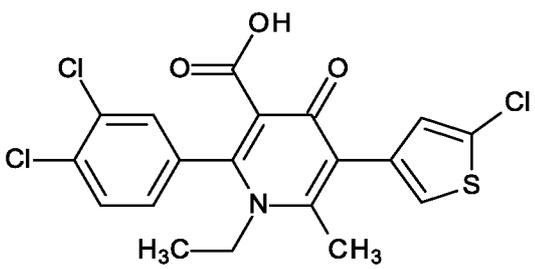
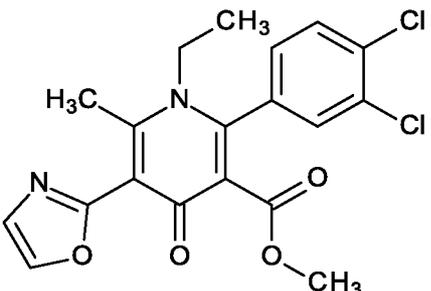
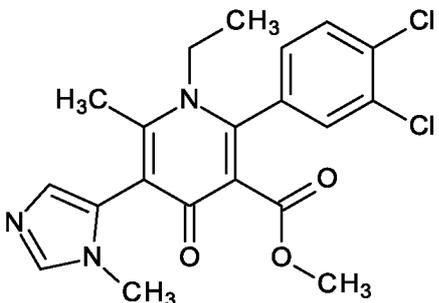
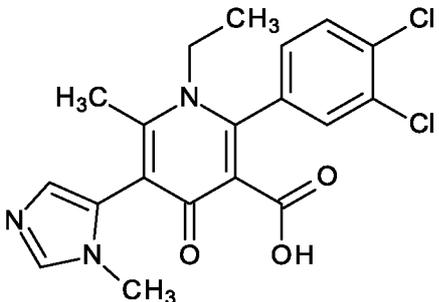
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ^1H ЯМР | LC/MS |
|--------------|--|---|-------|
| 17 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-5-(2-фтор-4-пиридил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p>^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ = 8,35 (d, 1H), 7,59 (d, 1H), 7,40 (s, 1H), 7,17-7,12 (m, 2H), 6,89 (s, 1H), 3,94 (br m, 2H), 2,41 (s, 3H), 1,24 (t, 3H)</p> | |
| 18 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-5-(4-метоксифенил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p>^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ = 7,60 (d, 1H), 7,41 (d, 1H), 7,18-7,15 (m, 3H), 7,03 (d, 2H), 3,95 (q, 2H), 3,86 (s, 3H), 2,44 (s, 3H), 1,25 (t, 3H)</p> | |
| 19 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-(3-пиридил)пиридин-3-карбоновая кислота |  <p>^1H ЯМР (500 МГц, DMSO-d_6) δ = 8,96 - 8,81 (m, 2H), 8,37 - 8,24 (m, 1H), 8,05 - 7,96 (m, 1H), 7,73 - 7,66 (m, 1H), 7,60 - 7,52 (m, 1H), 7,36 - 7,27 (m, 1H), 4,03 - 3,97 (m, 3H), 2,52 - 2,45 (m, 3H), 1,29 - 1,20 (m, 3H)</p> | |
| 20 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-(4-метил-3-тиенил)-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p>^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ = 7,62 (m, 1H), 7,43 (m, 1H), 7,22-7,14 (m, 3H), 3,92 (q, 2H), 2,42 (s, 3H), 2,08 (d, 3H), 1,26 (t, 3H)</p> | |

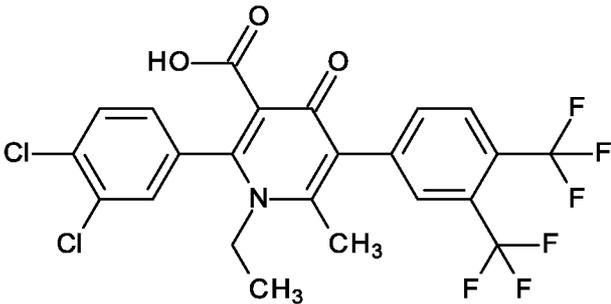
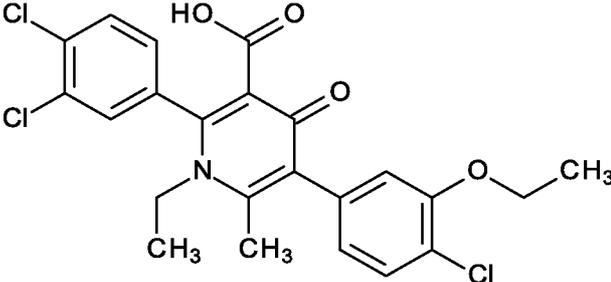
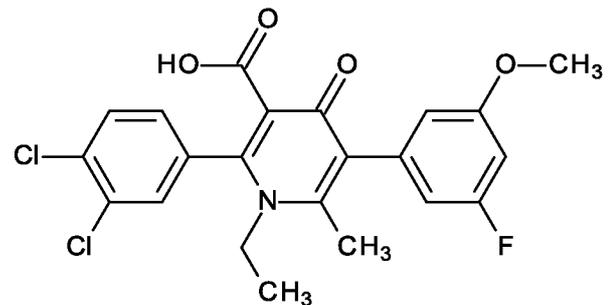
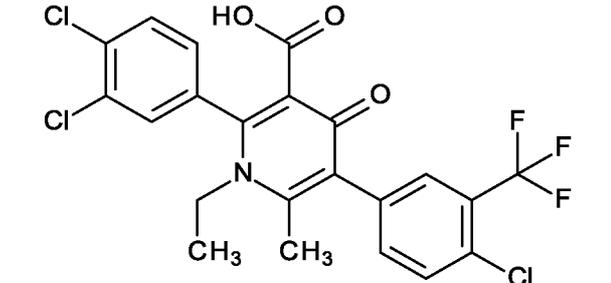
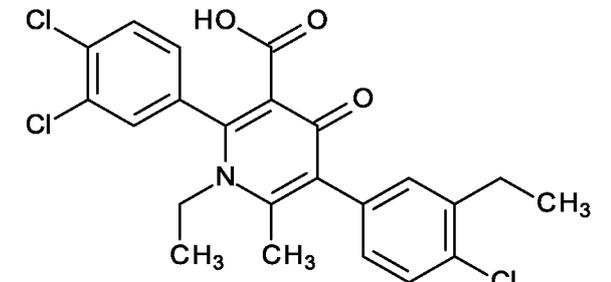
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ^1H ЯМР | LC/MS |
|--------------|--|--|-------|
| 21 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-пиридин-1-ий-3-илпиридин-3-карбоновая кислота; 2,2,2-трифторацетат |  <p>^1H ЯМР (400 МГц, метанол-d_4) δ = 8,80 - 8,77 (m, 1H), 8,75 - 8,68 (m, 1H), 8,29 - 8,23 (m, 1H), 7,96 - 7,90 (m, 1H), 7,75 - 7,72 (m, 1H), 7,69 - 7,64 (m, 1H), 7,41 - 7,29 (m, 1H), 4,10 - 3,99 (m, 2H), 2,53 - 2,44 (m, 3H), 1,26 - 1,18 (m, 3H)</p> | |
| 22 | 5-(3-Хлор-4-фтор-фенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p>^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ = 7,60 (d, 1H), 7,40 (d, 1H), 7,32 (m, 1H), 7,29-7,15 (m, 2H), 7,17-7,12 (m, 2H), 3,94 (q, 2H), 2,42 (s, 3H), 1,24 (t, 3H)</p> | |
| 23 | 5-(5-Хлор-3-пиридил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p>^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ = 8,66 (br m, 1H), 8,40 (br m, 1H), 7,22 (s, 1H), 7,62 (d, 1H), 7,41 (d, 1H), 7,17 (m, 1H), 3,96 (q, 2H), 2,45 (s, 3H), 1,26 (t, 3H)</p> | |
| 24 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-фенилпиридин-3-карбоновая кислота |  <p>^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ = 7,60 (d, 1H), 7,53 - 7,48 (m, 2H), 7,46 - 7,40 (m, 2H), 7,26 - 7,22 (m, 2H), 7,18 (m, 1H), 3,94 (q, 2H), 2,41 (s, 3H), 1,25 (t, 3H)</p> | |
| 25 | 2-(3,4-Дихлорфенил)- | | |

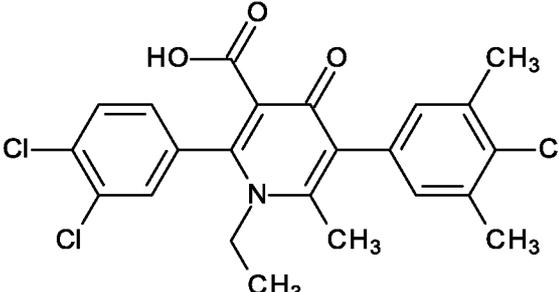
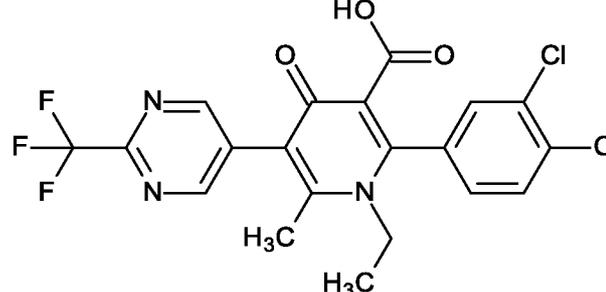
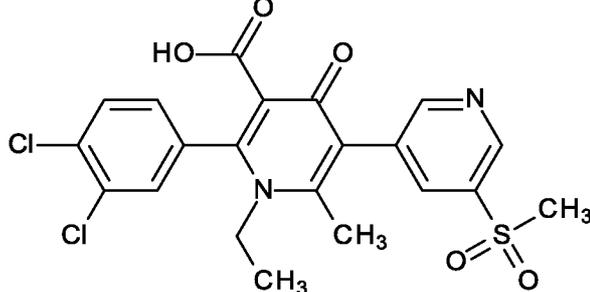
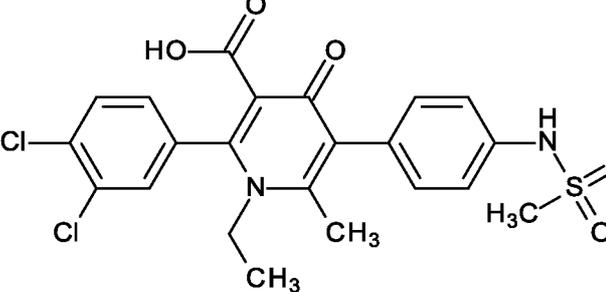
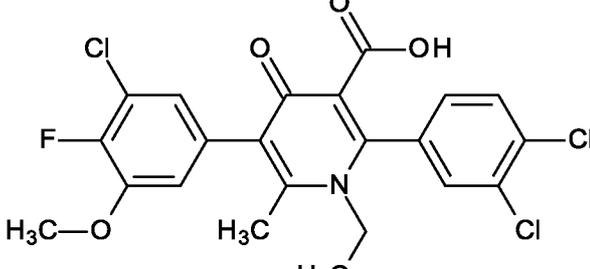
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ^1H ЯМР | LC/MS |
|--------------|---|---|-------|
| | 1-этил-6-метил-4-оксо-5-пиридин-1-ий-4-илпиридин-3-карбоновая кислота; 2,2,2-трифторацетат |  <p data-bbox="571 658 1270 752">^1H ЯМР (400 МГц, метанол-d_4) δ = 8,89 (d, 2H), 7,92 (d, 2H), 7,73 (d, 1H), 7,67 (d, 1H), 7,38 (m, 1H), 4,04 (q, 2H), 2,48 (s, 3H), 1,24 (t, 3H)</p> | |
| 26 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-[4-(трифторметил)фенил]пиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="571 1039 1270 1133">^1H ЯМР (500 МГц, метанол-d_4) δ = 7,81 (d, 2H), 7,71 (d, 1H), 7,67 (d, 1H), 7,50 (d, 2H), 7,37 (m, 1H), 4,03 (q, 2H), 2,43 (s, 3H), 1,23 (t, 3H)</p> | |
| 27 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-оксазол-2-ил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="571 1431 1270 1491">^1H ЯМР (400 МГц, метанол-d_4) δ = 8,13 (d, 1H), 7,72-7,68 (m, 2H), 7,42-7,37 (m, 2H), 4,00 (q, 2H), 2,49 (s, 3H), 1,21 (t, 3H)</p> | |
| 28 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-пиридин-1-ий-2-илпиридин-3-карбоновая кислота; хлорид |  <p data-bbox="571 1800 1270 1892">^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ = 8,84 (s, 1H), 8,28 (br m, 1H), 7,85 (br m, 1H), 7,75 (br m, 1H), 7,63 (d, 1H), 7,43 (s, 1H), 7,19 (d, 1H), 4,72 (br m, 1H), 3,97 (q, 2H), 2,58 (s, 3H), 1,33 (t, 3H)</p> | |

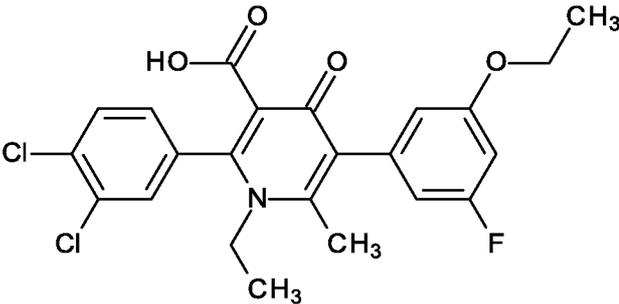
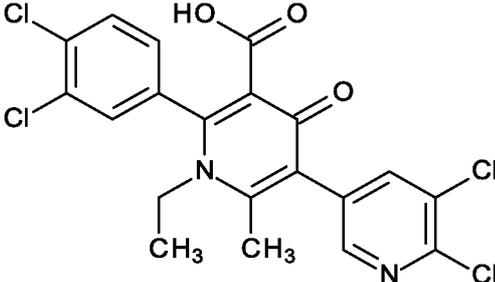
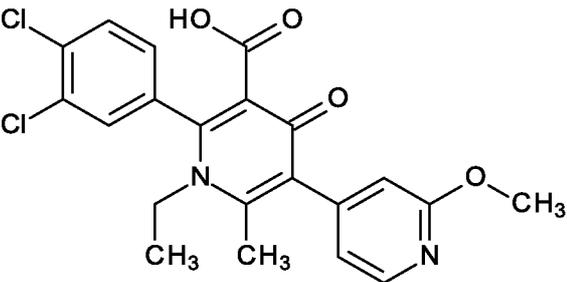
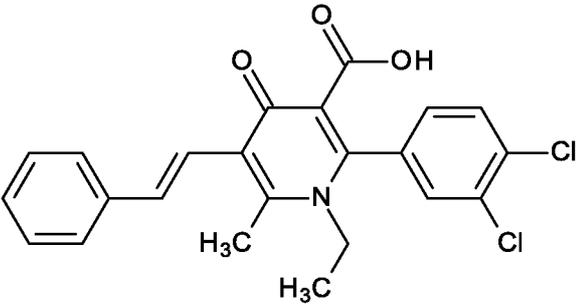
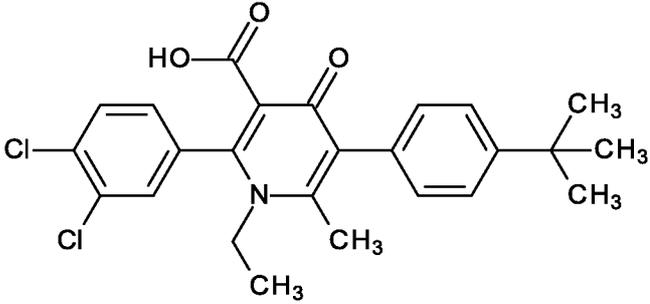
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ^1H ЯМР | LC/MS |
|--------------|---|--|-------|
| 29 | 2,5-бис(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p>^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ = 7,62-7,57 (m, 2H), 7,40-7,37 (m, 2H), 7,17-7,10 (m, 2H), 3,94 (q, 2H), 2,43 (s, 3H), 1,25 (t, 3H)</p> | |
| 30 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-(3-тиенил)пиридин-3-карбоновая кислота |  <p>^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ = 8,36-8,35 (m, 1H), 7,85 (m, 1H), 7,63 (m, 1H), 7,45-7,37 (m, 2H), 7,18 (m, 1H), 4,01-3,95 (m, 2H), 2,45 (d, 3H), 3,10 (t, 3H)</p> | |
| 31 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-(о-толил)-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p>^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ = 7,62 (m, 1H), 7,45 (m, 1H), 7,36-7,30 (m, 3H), 7,21 (m, 1H), 7,08-7,06 (m, 1H), 3,96 (q, 2H), 2,34 (s, 3H), 2,15 (d, 3H), 1,25 (t, 3H)</p> | |
| 32 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-(4-метилсульфонилфенил)-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p>500 МГц, DMSO-d_6 δ = 8,05 (d, 2H), 7,83-7,79 (m, 2H), 7,57-7,53 (m, 2H), 7,47 (m, 1H), 3,91 (q, 2H), 3,26 (s, 3H), 2,38 (s, 3H), 1,14 (t, 3H)</p> | |

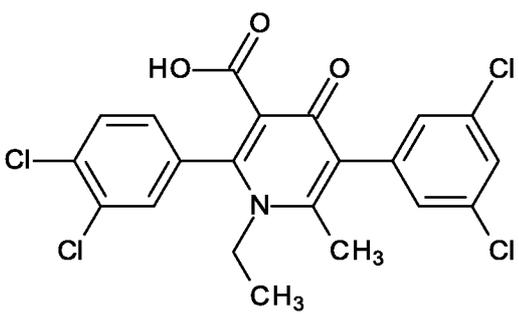
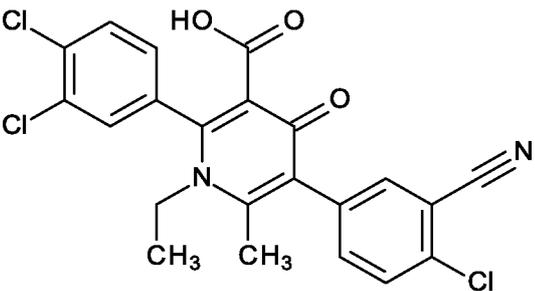
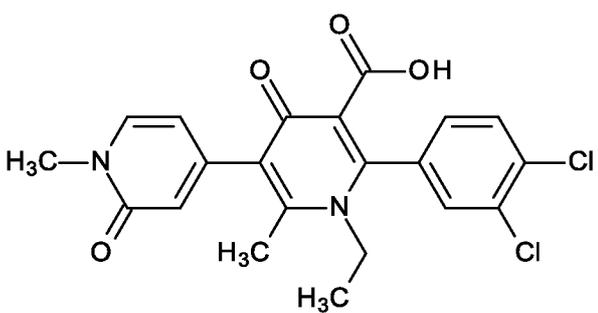
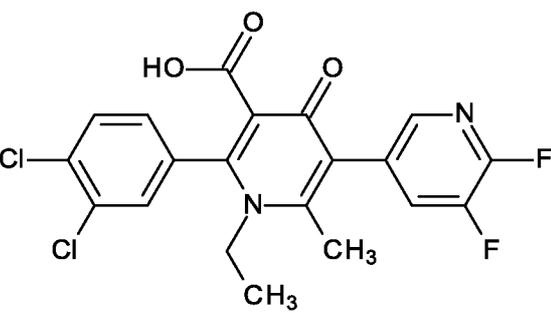
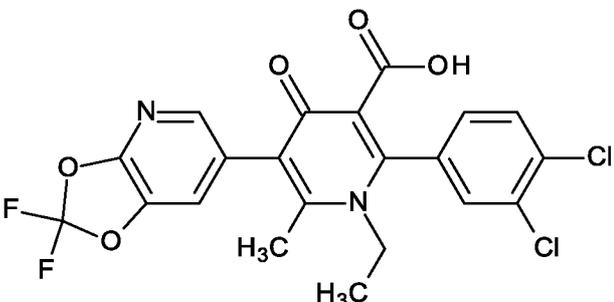
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ^1H ЯМР | LC/MS |
|--------------|--|---|-------|
| 33 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-5-(3-фурил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p>^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ = 7,61-7,59 (m, 3H), 7,38 (d, 1H), 7,14 (m, 1H), 6,50-6,49 (m, 1H), 3,96 (q, 2H), 2,61 (s, 3H), 1,24 (t, 3H)</p> | |
| 34 | 5-(4-Бензилоксифенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p>^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ = 7,61 (d, 1H), 7,48-7,46 (m, 2H), 7,43-7,39 (m, 3H), 7,37-7,33 (m, 1H), 7,19-7,16 (m, 3H), 7,12-7,10 (m, 2H), 5,12 (s, 2H), 3,94 (q, 2H), 2,44 (s, 3H), 1,25 (t, 3H)</p> | |
| 35 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-пиридазин-1-ий-4-илпиридин-3-карбоновая кислота; 2,2,2-трифторацетат |  <p>^1H ЯМР (400 МГц, метанол-d_4) δ = 9,38 (d, 1H), 9,25 (br m, 1H), 7,87 (d, 1H), 7,72 (d, 1H), 7,67 (d, 1H), 7,37 (m, 1H), 4,04 (q, 2H), 2,49 (s, 3H), 1,24 (t, 3H)</p> | |
| 36 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-(4-нитрофенил)-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p>^1H ЯМР (400 МГц, $\text{DMSO}-d_6$) δ = 8,40 - 8,27 (m, 2H), 7,84 - 7,77 (m, 2H), 7,62 - 7,53 (m, 2H), 7,49 - 7,41 (m, 1H), 3,96 - 3,79 (m, 2H), 2,42 - 2,36 (m, 3H), 1,18 - 1,03 (m, 3H)</p> | |

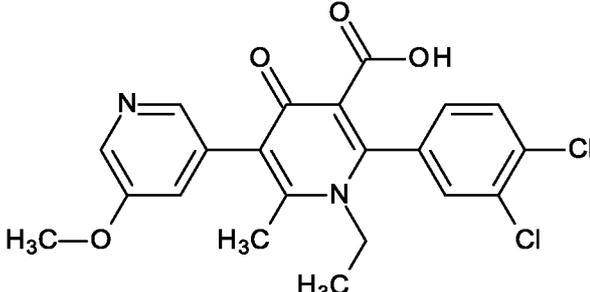
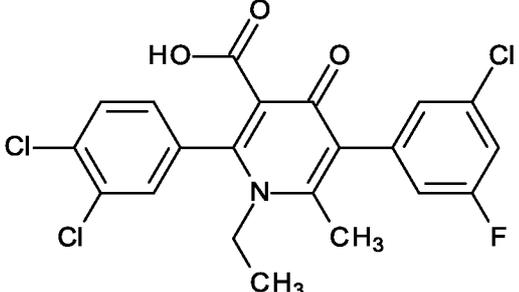
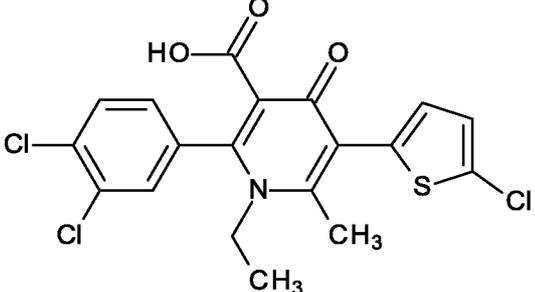
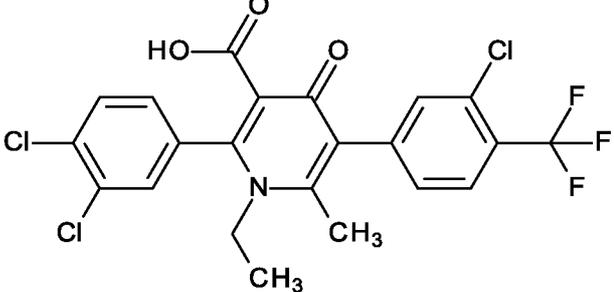
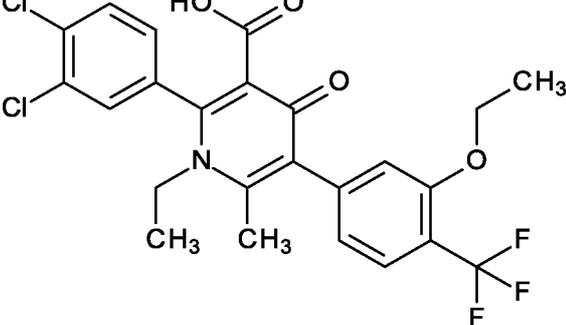
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ^1H ЯМР | LC/MS |
|--------------|--|---|-------|
| 37 | 5-(5-Хлор-3-тиенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p>^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ = 7,59 (d, 1H), 7,39 (d, 1H), 7,15 (m, 1H), 7,08 (d, 1H), 6,91 (d, 1H), 3,93 (q, 2H), 2,51 (s, 3H), 1,24 (t, 3H)</p> | |
| 38 | Метил-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-оксазол-2-ил-4-оксопиридин-3-карбоксилат |  <p>^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ = 8,09 (s, 1H), 7,77 - 7,72 (m, 2H), 7,46 (dd, 1H), 7,38 (s, 1H), 3,95 (q, 2H), 3,51 (s, 3H), 2,43 (s, 3H), 1,19 (t, 3H)</p> | |
| 39 | Метил-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-(3-метилимидазол-4-ил)-4-оксопиридин-3-карбоксилат |  <p>^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ = 7,65-7,54 (m, 3H), 7,37-7,26 (m, 1H), 7,24 (d, 1H), 3,91-3,84 (m, 2H), 3,80 (s, 3H), 3,56 (d, 3H), 2,47 (s, 3H), 1,23 (m, H)</p> | |
| 40 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-(3-метилимидазол-4-ил)-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p>^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ = 7,78 (d, 1H), 7,76-7,74 (m, 2H), 7,71 (m, 1H), 7,74-7,70 (m, 1H), 4,08-3,96 (m, 2H), 3,81 (s, 3H), 2,45 (s, 3H), 1,23 (t, 3H)</p> | |

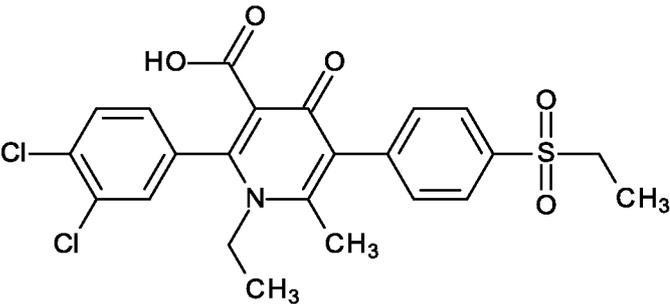
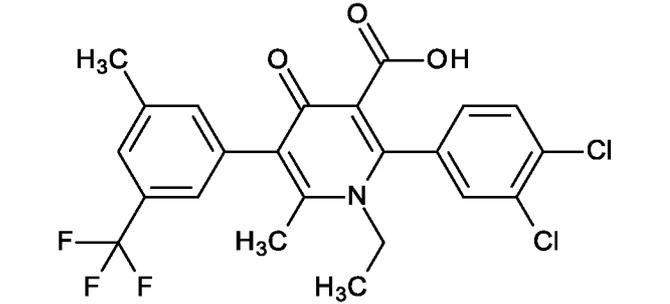
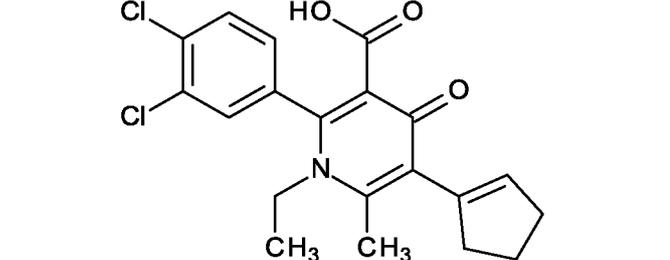
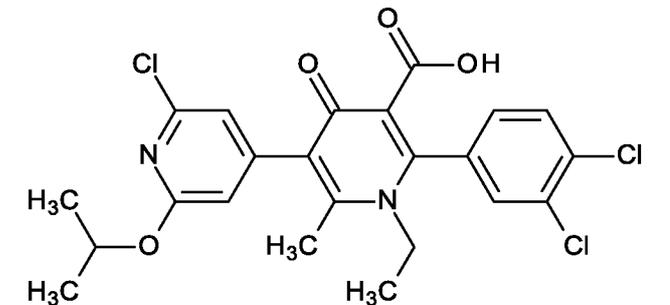
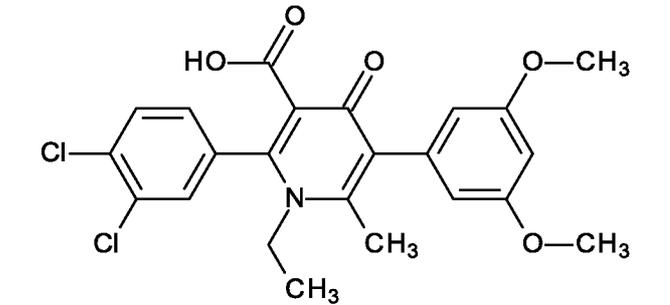
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|--|--|--|
| 41 | 5-[3,4-бис(Трифторметил)фенил]-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,64 мин. (A); MS: масса/заряд = 538,1 (M+1) |
| 42 | 5-(4-Хлор-3-этоксифенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,53 мин. (A); MS: масса/заряд = 480,2 (M+1) |
| 43 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-5-(3-фтор-5-метоксифенил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,34 мин. (A); MS: масса/заряд = 450,2 (M+1) |
| 44 | 5-[4-Хлор-3-(трифторметил)фенил]-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,60 мин. (A); MS: масса/заряд = 504,1 (M+1) |
| 45 | 5-(4-Хлор-3-этилфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,67 мин. (A); MS: масса/заряд = 464,1 (M+1) |

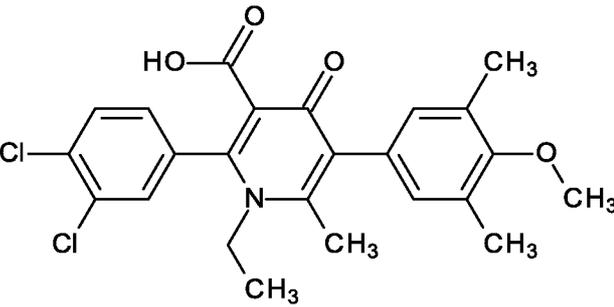
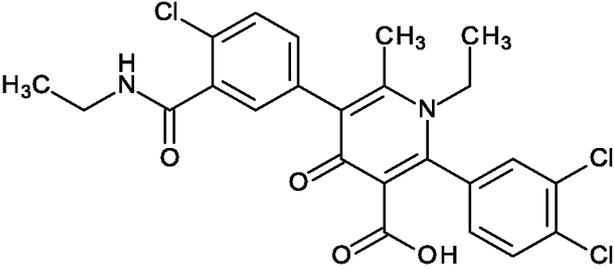
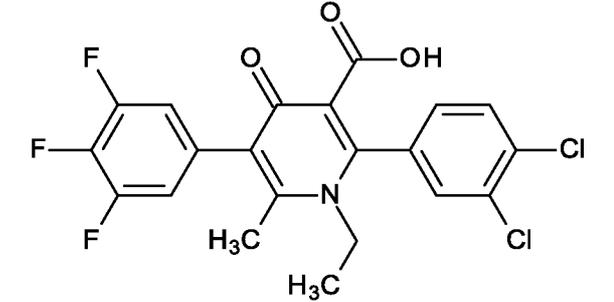
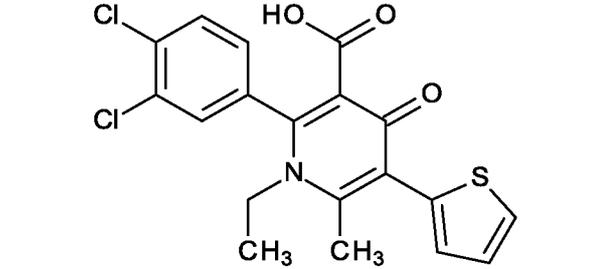
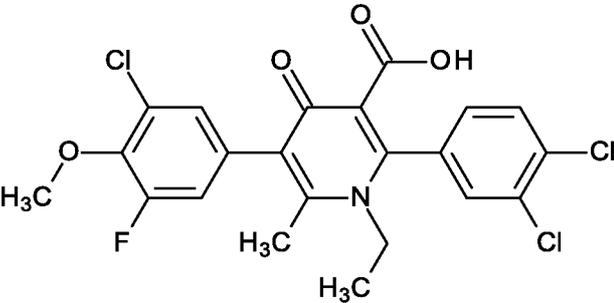
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|--|--|--|
| 46 | 5-(4-Хлор-3,5-диметилфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,67 мин. (A); MS: масса/заряд = 464,2 (M+1) |
| 47 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-[2-(трифторметил)пиримидин-5-ил]пиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,23 мин. (A); MS: масса/заряд = 472,2 (M+1) |
| 48 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-(5-метилсульфонил-3-пиридил)-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 1,83 мин. (A); MS: масса/заряд = 481,2 (M+1) |
| 49 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-5-[4-(метансульфонамидо)фенил]-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 1,96 мин. (A); MS: масса/заряд = 495,2 (M+1) |
| 50 | 5-(3-Хлор-4-фтор-5-метоксифенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,45 мин. (A); MS: масса/заряд = 484,2 (M+1) |

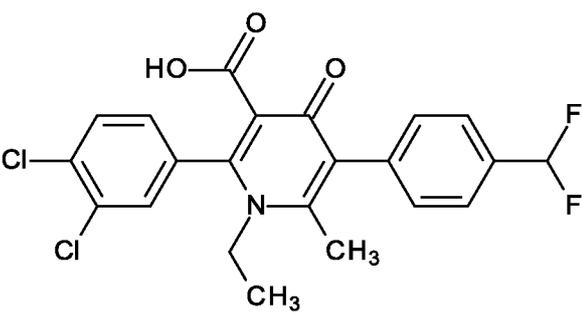
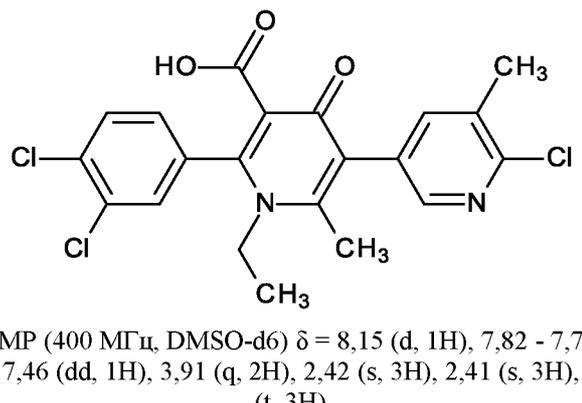
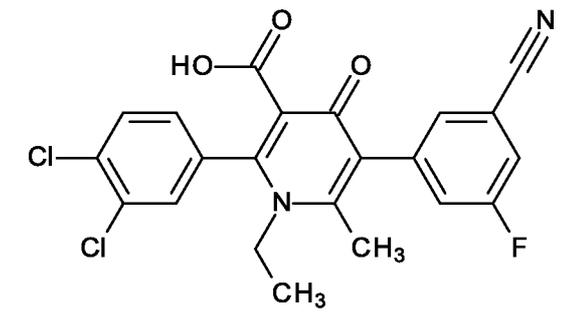
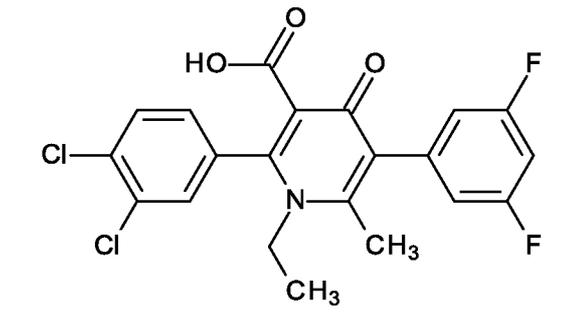
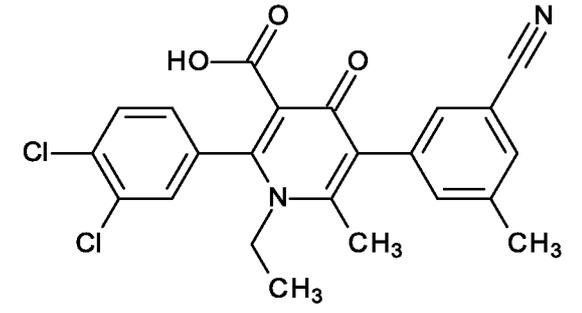
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|--|--|--|
| 51 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-5-(3-этокси-5-фторфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,46 мин. (A); MS: масса/заряд = 464,2 (M+1) |
| 52 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-5-(5,6-дихлор-3-пиридил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,36 мин. (A); MS: масса/заряд = 471,1 (M+1) |
| 53 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-5-(2-метокси-4-пиридил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 1,93 мин. (A); MS: масса/заряд = 433,2 (M+1) |
| 54 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-[(E)-стирил]пиридин-3-карбоновая кислота |  | MS: масса/заряд = 428,2 (M+1) |
| 55 | 5-(4-трет-Бутилфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,74 мин. (A); MS: масса/заряд = 458,2 (M+1) |

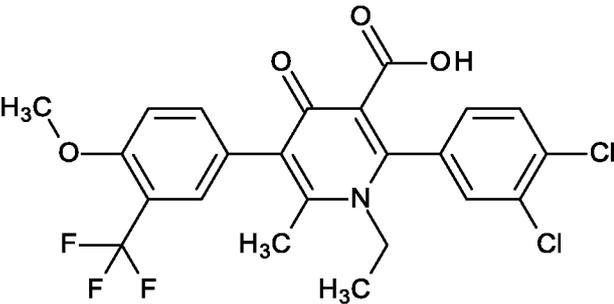
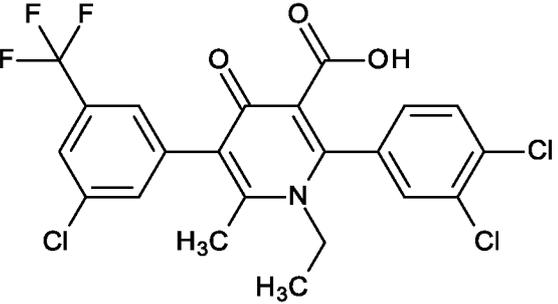
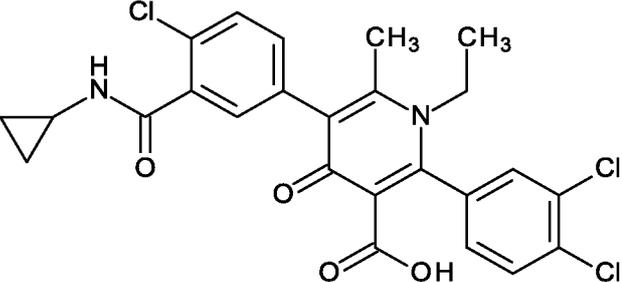
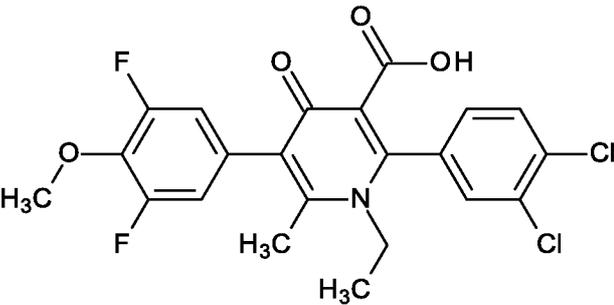
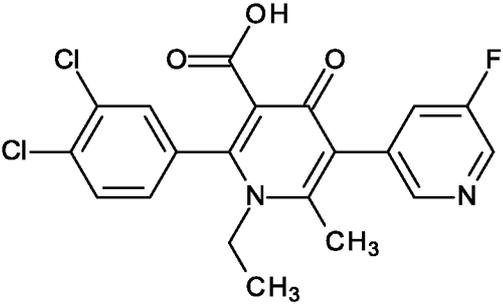
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|---|--|--|
| 56 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-5-(3,5-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,59 мин. (A); MS: масса/заряд = 470,1 (M+1) |
| 57 | 5-(4-Хлор-3-цианофенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,32 мин. (A); MS: масса/заряд = 461,1 (M+1) |
| 58 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-(1-метил-2-оксо-4-пиридил)-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 1,66 мин. (A); MS: масса/заряд = 433,2 (M+1) |
| 59 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-5-(5,6-дифтор-3-пиридил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,18 мин. (A); MS: масса/заряд = 439,1 (M+1) |
| 60 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-5-(2,2-дифтор-[1,3]диоксо[4,5-b]пиридин-6-ил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,33 мин. (A); MS: масса/заряд = 483,1 (M+1) |

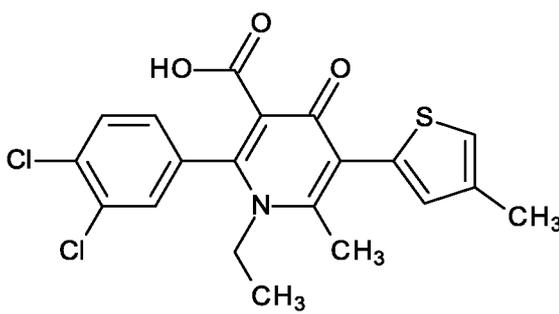
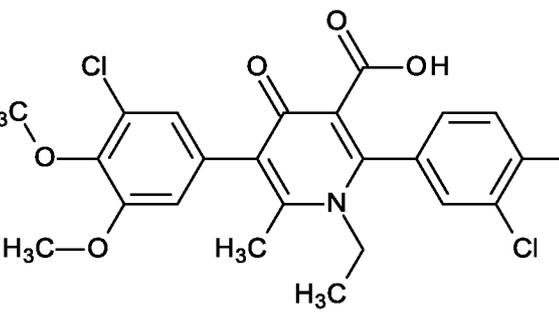
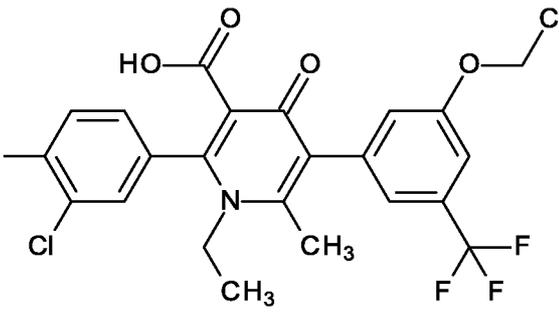
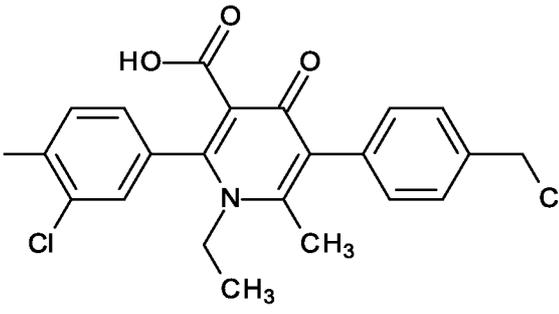
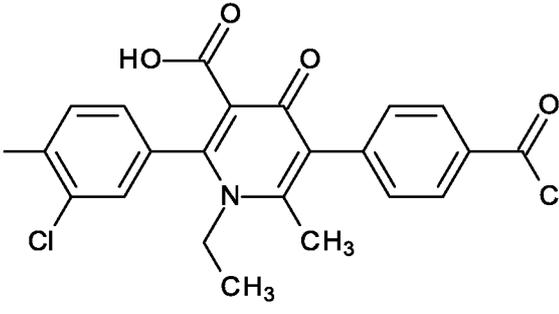
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ Н ЯМР | LC/MS |
|--------------|--|--|--|
| 61 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-5-(5-метокси-3-пиридил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 1,56 мин. (A); MS: масса/заряд = 433,2 (M+1) |
| 62 | 5-(3-Хлор-5-фторфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,47 мин. (A); MS: масса/заряд = 454,1 (M+1) |
| 63 | 5-(5-Хлор-2-тиенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,47 мин. (A); MS: масса/заряд = 442,1 (M+1) |
| 64 | 5-[3-Хлор-4-(трифторметил)фенил]-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,60 мин. (A); MS: масса/заряд = 504,0 (M+1) |
| 65 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-5-[3-этокси-4-(трифторметил)фенил]-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,61 мин. (A); MS: масса/заряд = 514,2 (M+1) |

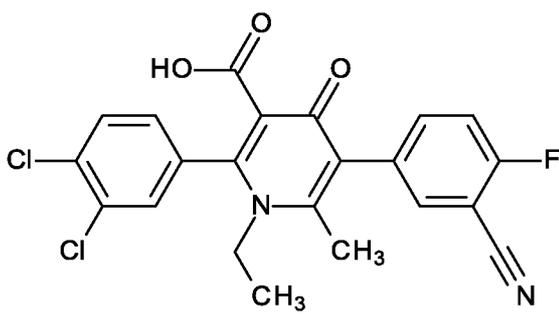
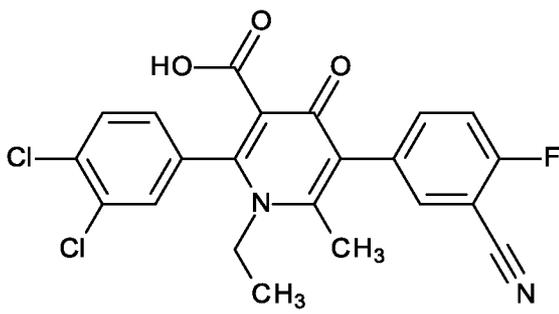
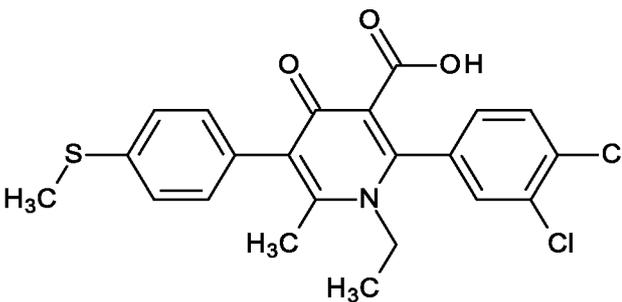
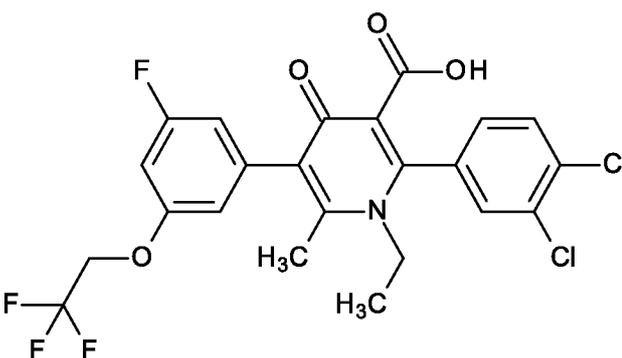
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ Н ЯМР | LC/MS |
|--------------|--|--|---|
| 66 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-5-(4-этилсульфонилфенил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R ₁ = 2,06 мин. (A); MS: масса/заряд = 494,2 (M+1) |
| 67 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-[3-метил-5-(трифторметил)фенил]-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R ₁ = 2,60 мин. (A); MS: масса/заряд = 484,2 (M+1) |
| 68 | 5-(Циклопентен-1-ил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R ₁ = 2,33 мин. (A); MS: масса/заряд = 392,2 (M+1) |
| 69 | 5-(2-Хлор-6-изопропокси-4-пиридил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R ₁ = 2,65 мин. (A); MS: масса/заряд = 495,2 (M+1) |
| 70 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-5-(3,5-диметоксифенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R ₁ = 2,29 мин. (A); MS: масса/заряд = 462,2 (M+1) |

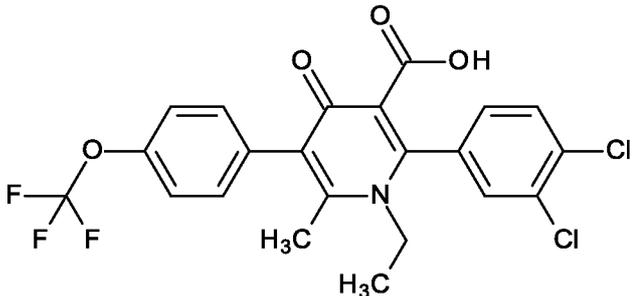
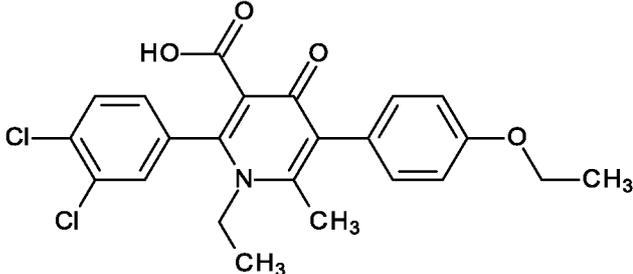
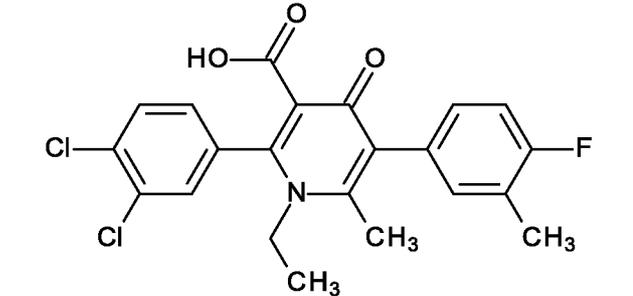
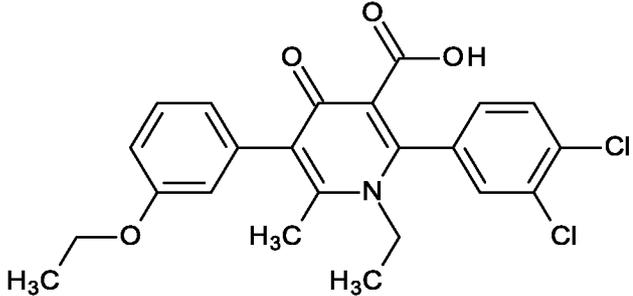
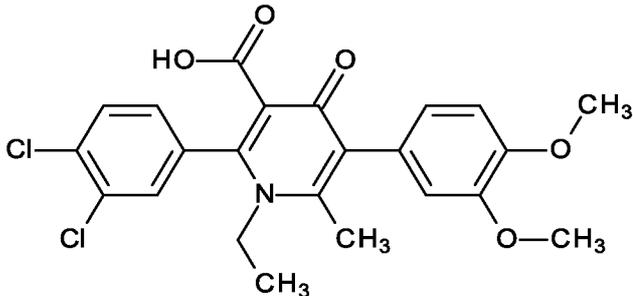
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|---|--|--|
| 71 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-5-(4-метокси-3,5-диметилфенил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,45 мин. (A); MS: масса/заряд = 460,2 (M+1) |
| 72 | 5-[4-Хлор-3-(этилкарбамоил)фенил]-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,04 мин. (A); MS: масса/заряд = 507,2 (M+1) |
| 73 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-(3,4,5-трифторфенил)пиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,40 мин. (A); MS: масса/заряд = 456,1 (M+1) |
| 74 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-(2-тиенил)пиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,24 мин. (A); MS: масса/заряд = 408,1 (M+1) |
| 75 | 5-(3-Хлор-5-фтор-4-метоксифенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,46 мин. (A); MS: масса/заряд = 484,1 (M+1) |

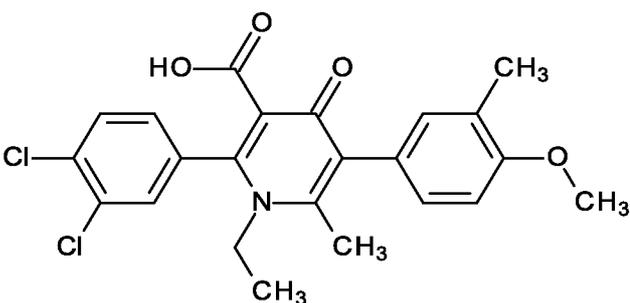
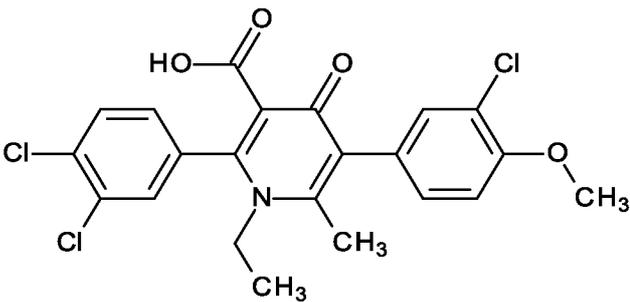
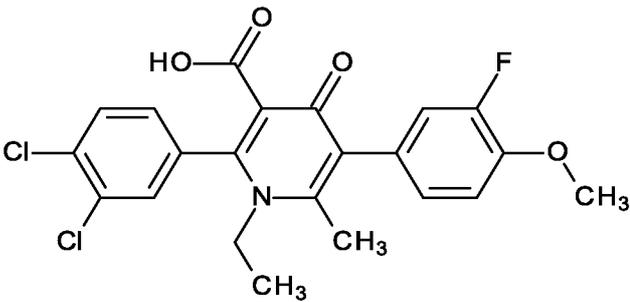
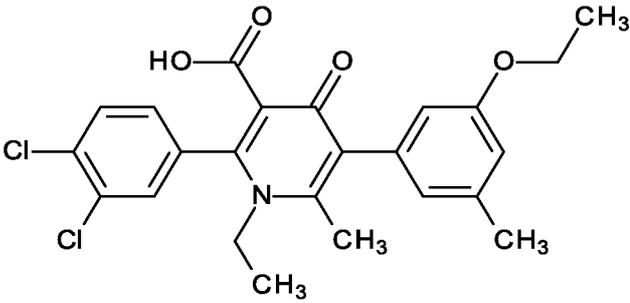
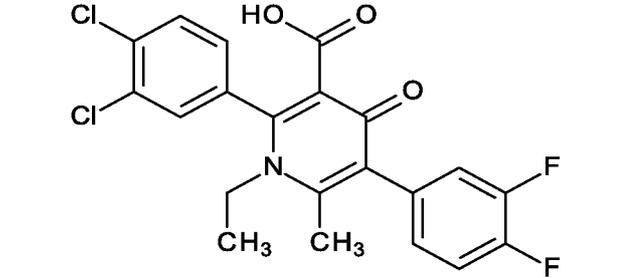
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|--|---|--|
| 76 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-5-[4-(дифторметил)фенил]-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,34 мин. (A); MS: масса/заряд = 452,2 (M+1) |
| 77 | 5-(6-Хлор-5-метил-3-пиридил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="566 907 1268 1008">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ = 8,15 (d, 1H), 7,82 - 7,75 (m, 3H), 7,46 (dd, 1H), 3,91 (q, 2H), 2,42 (s, 3H), 2,41 (s, 3H), 1,13 (t, 3H)</p> | MS: масса/заряд = 451,1 (M+1) |
| 78 | 5-(3-Циано-5-фторфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,24 мин. (A); MS: масса/заряд = 445,4 (M+1) |
| 79 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-5-(3,5-дифторфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,35 мин. (A); MS: масса/заряд = 438,1 (M+1) |
| 80 | 5-(3-Циано-5-метилфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,29 мин. (A); MS: масса/заряд = 441,2 (M+1) |

| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|---|--|--|
| 81 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-5-[4-метокси-3-(трифторметил)фенил]-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,47 мин. (A); MS: масса/заряд = 500,2 (M+1) |
| 82 | 5-[3-Хлор-5-(трифторметил)фенил]-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,64 мин. (A); MS: масса/заряд = 504,1 (M+1) |
| 83 | 5-[4-Хлор-3-(циклопропилкарбамил)фенил]-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,06 мин. (A); MS: масса/заряд = 519,2 (M+1) |
| 84 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-5-(3,5-дифтор-4-метоксифенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,36 мин. (A); MS: масса/заряд = 468,2 (M+1) |
| 85 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-5-(5-фтор-3-пиридил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 1,89 мин. (A); MS: масса/заряд = 421,1 (M+1) |

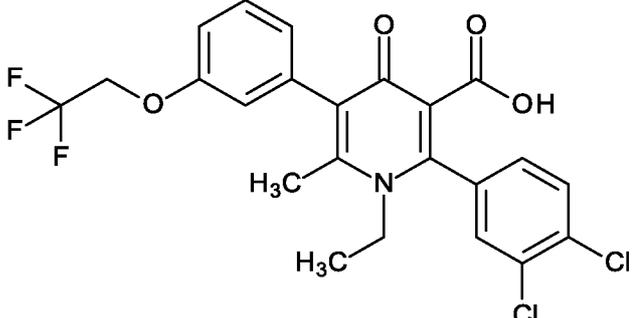
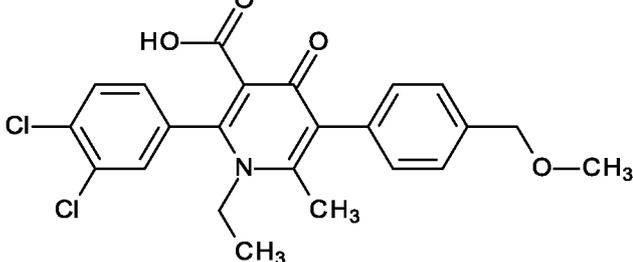
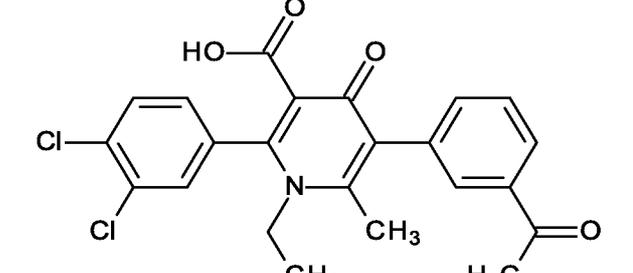
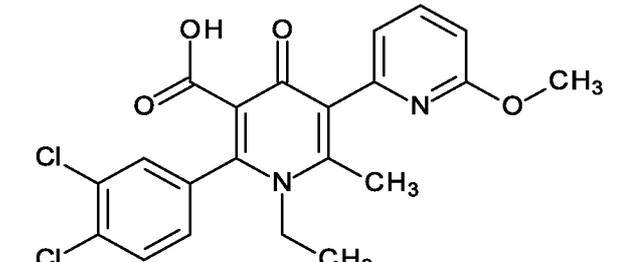
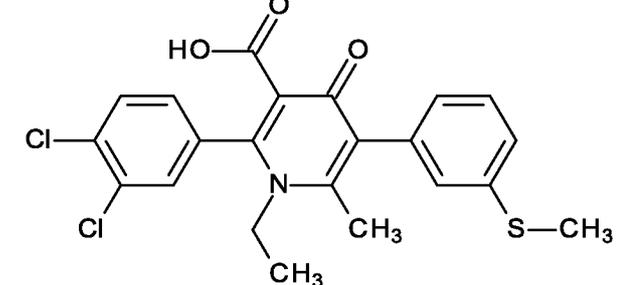
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|--|--|--|
| 86 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-(4-метил-2-тиенил)-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,38 мин. (A); MS: масса/заряд = 422,1 (M+1) |
| 87 | 5-(3-Хлор-4,5-диметоксифенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,40 мин. (A); MS: масса/заряд = 496,1 (M+1) |
| 88 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-5-[3-этокси-5-(трифторметил)фенил]-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,65 мин. (A); MS: масса/заряд = 514,2 (M+1) |
| 89 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-5-(4-этилфенил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,54 мин. (A); MS: масса/заряд = 430,3 (M+1) |
| 90 | 5-(4-Ацетилфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,14 мин. (A); MS: масса/заряд = 444,2 (M+1) |

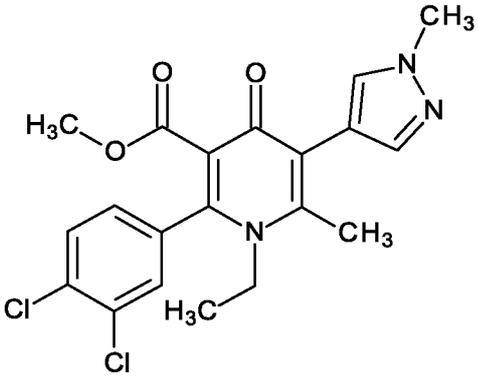
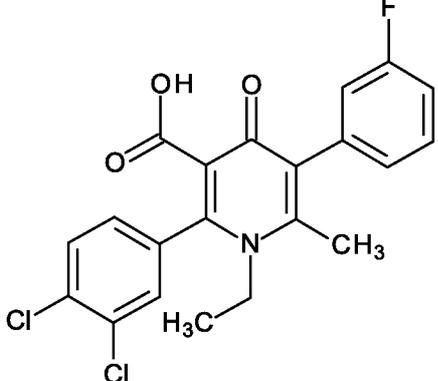
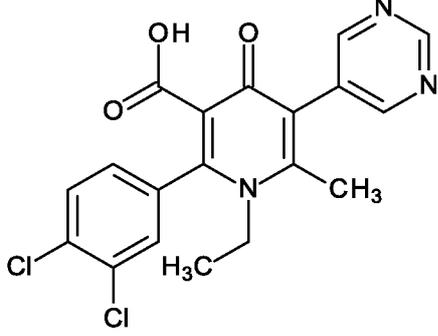
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|---|--|--|
| 91 | 5-(3-Циано-4-фторфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,23 мин. (A); MS: масса/заряд = 445,1 (M+1) |
| 92 | 5-(3-Циано-4-фторфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="568 913 1270 1010">¹H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ = 7,82 - 7,77 (m, 2H), 7,46 (dd, 1H), 7,24 (d, 1H), 7,01 (s, 1H), 6,96 (d, 1H), 3,89 (q, 2H), 2,38 (s, 3H), 2,28 (s, 3H), 2,27 (s, 3H), 1,13 (t, 3H)</p> | MS: масса/заряд = 430,2 (M+1) |
| 93 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-(4-метилсульфанилфенил)-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,41 мин. (A); MS: масса/заряд = 448,1 (M+1) |
| 94 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-5-[3-фтор-5-(2,2,2-трифторэтокси)фенил]-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,51 мин. (A); MS: масса/заряд = 518,2 (M+1) |

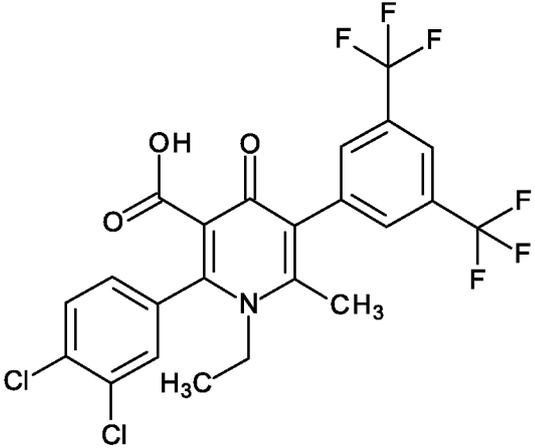
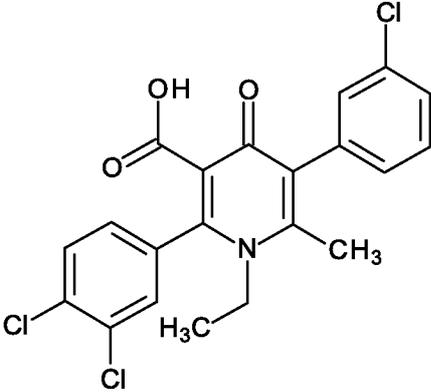
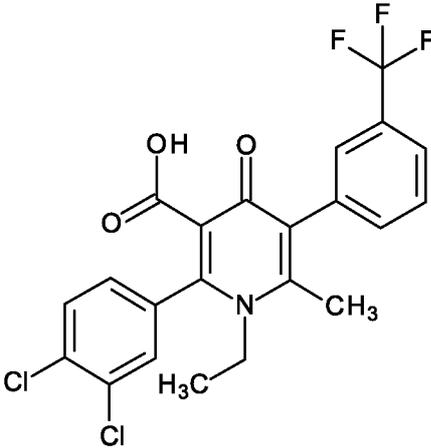
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|---|---|---|
| 95 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-[4-(трифторметокси)фенил]пиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,54 мин. (A); MS: масса/заряд = 486,1 (M+1) |
| 96 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-5-(4-этоксифенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,40 мин. (A); MS: масса/заряд = 446,2 (M+1) |
| 97 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-5-(4-фтор-3-метилфенил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="590 1209 1244 1299">¹H ЯМР (400МГц, DMSO-d₆) δ = 7,82 - 7,78 (m, 2H), 7,46 (dd, 1H), 7,25 (dd, 1H), 7,18 - 7,16 (brs, 1H), 7,10 (brs, 1H), 3,90 (q, 2H), 2,38 (s, 3H), 2,29 (s, 3H), 1,13 (t, 3H)</p> | MS: масса/заряд = 434,0 (M+1) |
| 98 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-5-(3-этоксифенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,40 мин. (A); MS: масса/заряд = 446,2 (M+1) |
| 99 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-5-(3,4-диметоксифенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,13 мин. (A); MS: масса/заряд = 462,2 (M+1) |

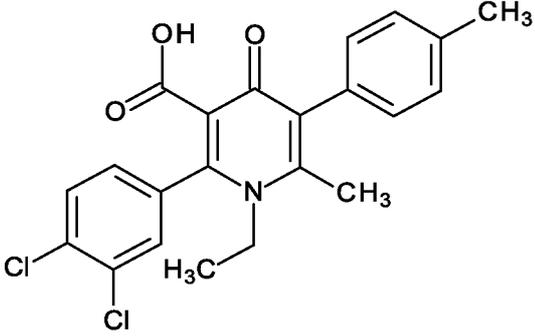
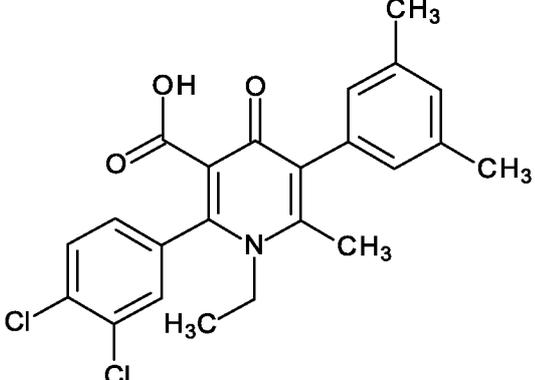
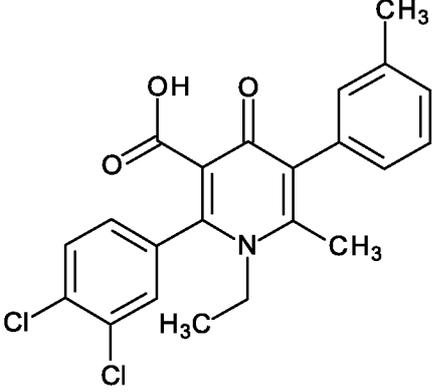
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ Н ЯМР | LC/MS |
|--------------|--|--|--|
| 100 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-5-(4-метокси-3-метилфенил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,42 мин. (A); MS: масса/заряд = 446,2 (M+1) |
| 101 | 5-(3-Хлор-4-метоксифенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,38 мин. (A); MS: масса/заряд = 466,2 (M+1) |
| 102 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-5-(3-фтор-4-метоксифенил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,28 мин. (A); MS: масса/заряд = 450,2 (M+1) |
| 103 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-5-(3-этокси-5-метилфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,51 мин. (A); MS: масса/заряд = 460,2 (M+1) |
| 104 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-5-(3,4-дифторфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,33 мин. (A); MS: масса/заряд = 438,1 (M+1) |

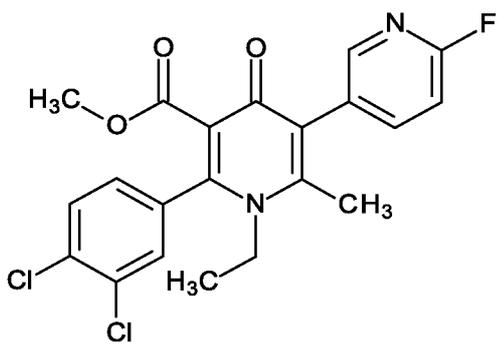
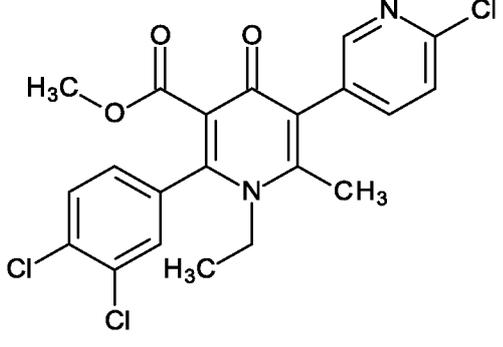
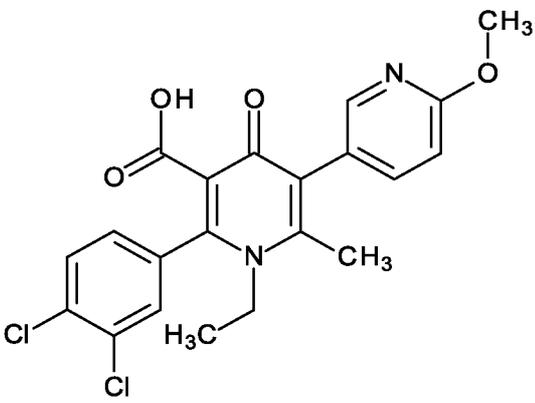
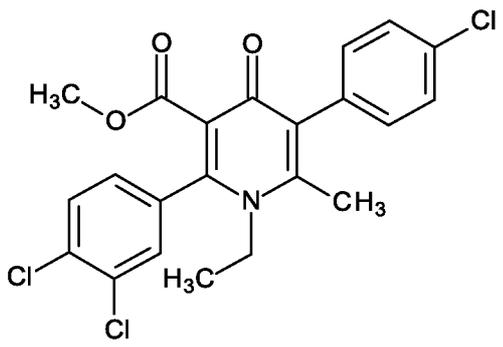
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ Н ЯМР | LC/MS |
|--------------|---|---------------------------------------|--|
| 105 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-5-[4-фтор-3-(2,2,2-трифторэтокси)фенил]-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота | | R _t = 2,48 мин. (A); MS: масса/заряд = 518,2 (M+1) |
| 106 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-5-[3-(диформетил)фенил]-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота | | R _t = 2,33 мин. (A); MS: масса/заряд = 452,2 (M+1) |
| 107 | 5-(4-Циано-3-этоксифенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота | | R _t = 2,31 мин. (A); MS: масса/заряд = 471,2 (M+1) |
| 108 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-[6-(трифторметил)-3-пиридил]пиридин-3-карбоновая кислота | | R _t = 2,26 мин. (A); MS: масса/заряд = 471,1 (M+1) |
| 109 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-5-[4-(диметилкарбамоил)фенил]-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота | | R _t = 1,89 мин. (A); MS: масса/заряд = 473,2 (M+1) |

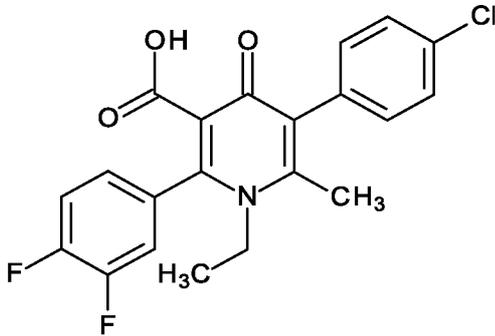
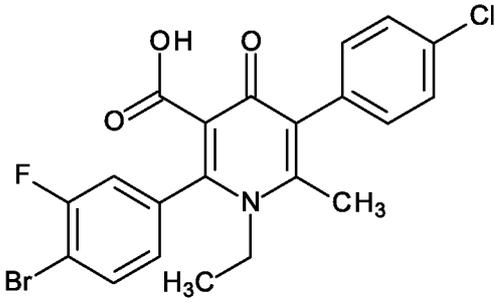
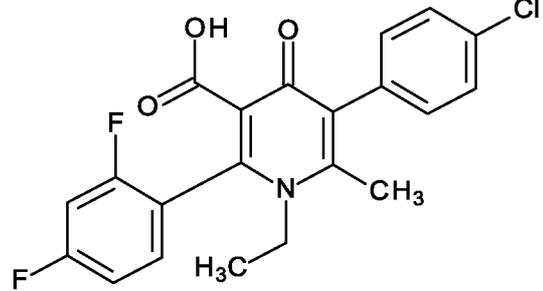
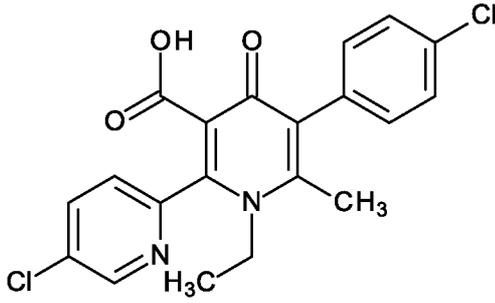
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ Н ЯМР | LC/MS |
|--------------|--|--|--|
| 110 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-[3-(2,2,2-трифторэтокси)фенил]пиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,46 мин. (A); MS: масса/заряд = 500,2 (M+1) |
| 111 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-5-[4-(метоксиметил)фенил]-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,23 мин. (A); MS: масса/заряд = 446,2 (M+1) |
| 112 | 5-(3-Ацетилфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,14 мин. (A); MS: масса/заряд = 444,2 (M+1) |
| 113 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-5-(6-метокси-2-пиридил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,11 мин. (A); MS: масса/заряд = 433,2 (M+1) |
| 114 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-(3-метилсульфанилфенил)-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,41 мин. (A); MS: масса/заряд = 448,1 (M+1) |

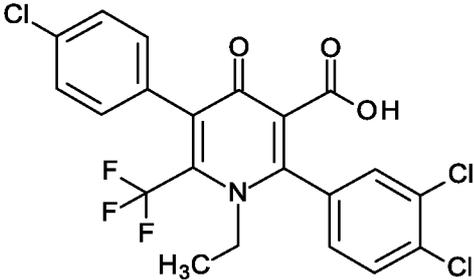
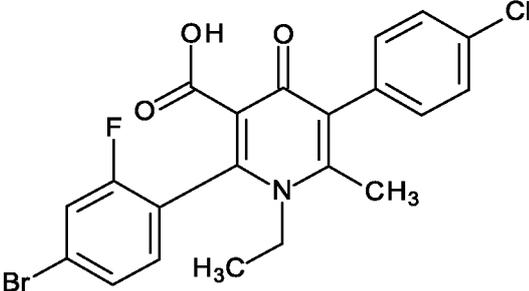
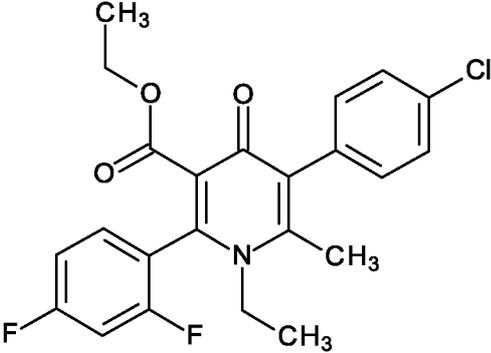
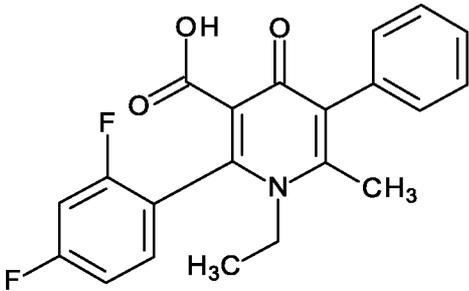
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|--|---|-------|
| 115 | Метил-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-(1-метилпиразол-4-ил)-4-оксопиридин-3-карбоксилат |  <p data-bbox="571 656 1273 745">1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,88 (s, 1H), 7,57 (d, 1H), 7,53 (d, 1H), 7,50 - 7,48 (m, 1H), 7,27 (dd, 1H), 3,94 (s, 3H), 3,83 (q, 2H), 3,57 (s, 3H), 2,59 (s, 3H), 1,18 (t, 3H)</p> | |
| 116 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-5-(3-фторфенил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="571 1171 1273 1261">1H ЯМР (500 МГц, метанол-d4) δ = 7,70 (d, 1H), 7,66 (d, 1H), 7,55 - 7,48 (m, 1H), 7,36 (dd, 1H), 7,18 (dt, 1H), 7,11 - 7,04 (m, 2H), 4,02 (q, J = 7,1 Гц, 2H), 2,43 (s, 3H), 1,22 (t, 3H)</p> | |
| 117 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-пиримидин-5-илпиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="571 1630 1273 1718">1H ЯМР (500 МГц, метанол-d4) δ = 9,38 - 9,07 (m, 1H), 8,78 (s, 2H), 7,75 - 7,69 (m, 1H), 7,68 - 7,65 (m, 1H), 7,41 - 7,33 (m, 1H), 4,11 - 3,90 (m, 2H), 2,49 (s, 3H), 1,24 (t, 3H)</p> | |

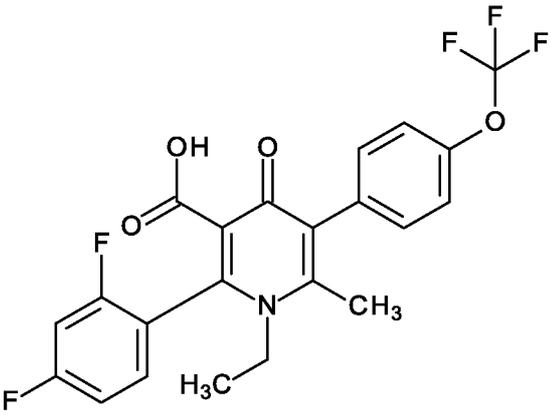
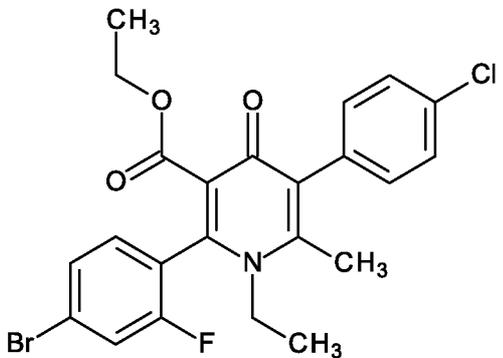
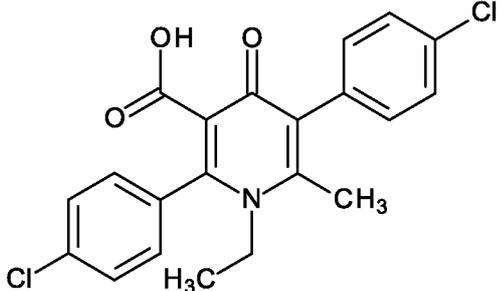
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|--|---|-------|
| 118 | 5-[3,5-бис(Трифторметил)фенил]-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p>1H ЯМР (500 МГц, метанол-d4) δ = 8,08 - 8,02 (m, 1H), 7,95 (s, 2H), 7,74 - 7,70 (m, 1H), 7,68 - 7,64 (m, 1H), 7,42 - 7,34 (m, 1H), 4,03 (q, 2H), 2,43 (s, 3H), 1,24 (t, 3H)</p> | |
| 119 | 5-(3-Хлорфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p>1H ЯМР (500 МГц, метанол-d4) δ = 7,70 (d, 1H), 7,66 (d, 1H), 7,54 - 7,41 (m, 2H), 7,40 - 7,30 (m, 2H), 7,21 (brd, 1H), 4,02 (q, 2H), 2,45 - 2,41 (m, 3H), 1,22 (t, 3H)</p> | |
| 120 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-[3-(трифторметил)фенил]пиридин-3-карбоновая кислота |  <p>1H ЯМР (500 МГц, метанол-d4) δ = 7,78 - 7,73 (m, 1H), 7,72 - 7,66 (m, 2H), 7,68 - 7,65 (m, 1H), 7,64 - 7,60 (m, 1H), 7,58 - 7,52 (m, 1H), 7,40 - 7,35 (m, 1H), 4,03 (q, 2H), 2,43 (s, 3H), 1,23 (t, 3H)</p> | |

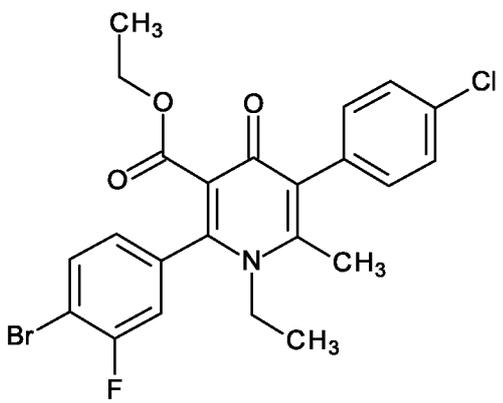
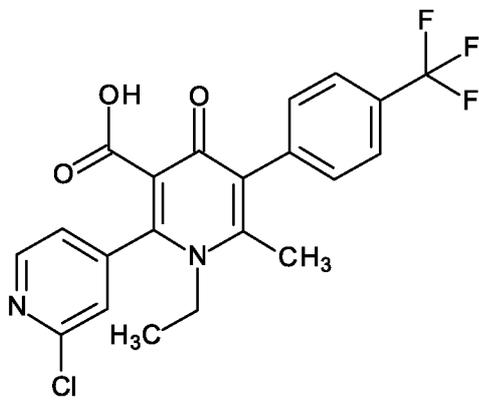
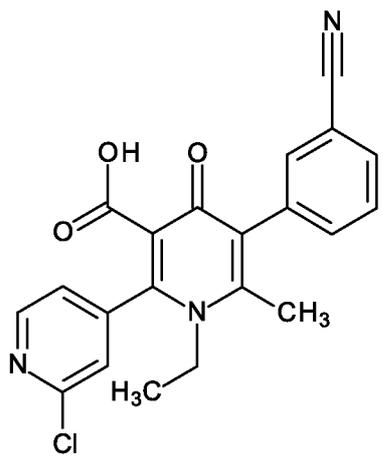
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ^1H ЯМР | LC/MS |
|--------------|--|--|-------|
| 121 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-(п-толил)пиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="571 616 1273 707">1H ЯМР (500 МГц, метанол-d4) δ = 7,70 (d, 1H), 7,65 (d, 1H), 7,37 - 7,31 (m, 3H), 7,15 (d, 2H), 4,03 (q, 2H), 2,44 (s, 3H), 2,42 (s, 3H), 1,22 (t, 3H)</p> | |
| 122 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-5-(3,5-диметилфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="571 1131 1273 1227">1H ЯМР (500 МГц, метанол-d4) δ = 7,70 (d, 1H), 7,66 (d, 1H), 7,36 (dd, 1H), 7,19 - 7,00 (m, 1H), 6,87 (s, 2H), 4,03 (q, 2H), 2,43 (s, 3H), 2,36 (s, 6H), 1,22 (t, 3H)</p> | |
| 123 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-(м-толил)-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="571 1646 1273 1767">1H ЯМР (500 МГц, метанол-d4) δ = 7,70 (d, 1H), 7,66 (d, 1H), 7,40 - 7,34 (m, 2H), 7,28 - 7,22 (m, 1H), 7,12 - 7,08 (m, 1H), 7,07 - 7,01 (m, 1H), 4,03 (q, 2H), 2,43 (s, 3H), 2,41 (s, 3H), 1,23 (t, 3H)</p> | |

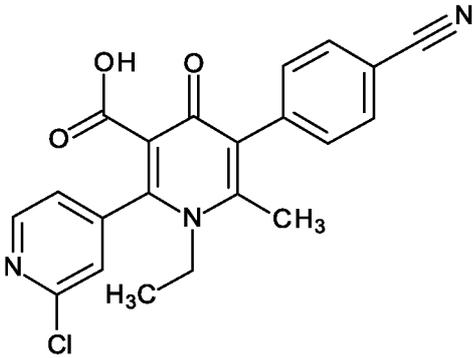
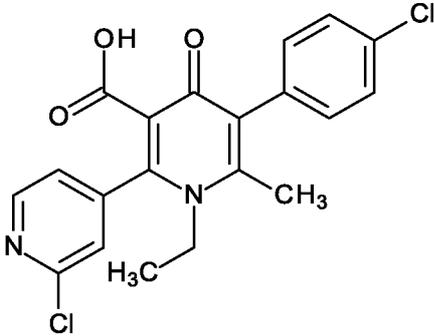
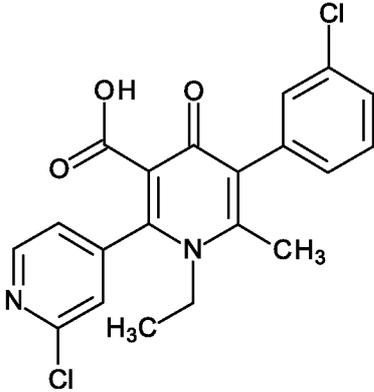
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|---|--|-------|
| 124 | Метил-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-(6-фтор-3-пиридил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилат |  <p data-bbox="568 616 1273 712">1H ЯМР (400МГц, хлороформ) δ = 8,07 (d, 1H), 7,79 (td, 1H), 7,62 - 7,56 (m, 2H), 7,30 (dd, 1H), 7,03 (dd, 1H), 3,87 (q, 2H), 3,57 (s, 3H), 2,37 (s, 3H), 1,22 (t, 3H)</p> | |
| 125 | Метил-5-(6-хлор-3-пиридил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилат |  <p data-bbox="568 1086 1273 1167">1H ЯМР (400МГц, хлороформ) δ = 8,27 (d, 1H), 7,70 (dd, 1H), 7,61 (d, 1H), 7,55 (d, 1H), 7,44 (d, 1H), 7,30 (dd, 1H), 3,93 - 3,87 (m, 2H), 3,56 (s, 3H), 2,38 (s, 3H), 1,23 (t, 3H)</p> | |
| 126 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-5-(6-метокси-3-пиридил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="568 1590 1273 1682">1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 8,04 (d, 1H), 7,61 (d, 1H), 7,54 (dd, 1H), 7,41 (d, 1H), 7,17 (dd, 1H), 6,93 - 6,86 (m, 1H), 4,00 (s, 3H), 3,95 (q, 2H), 2,48 (s, 3H), 1,26 (t, 3H)</p> | |
| 127 | Метил-5-(4-хлорфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилат |  | |

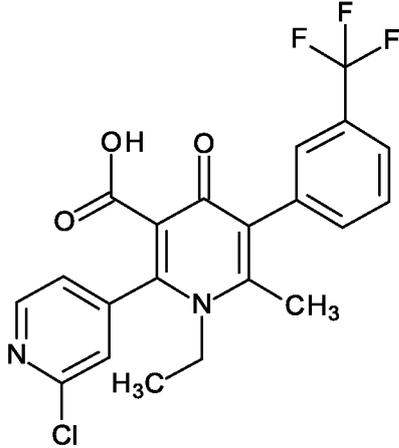
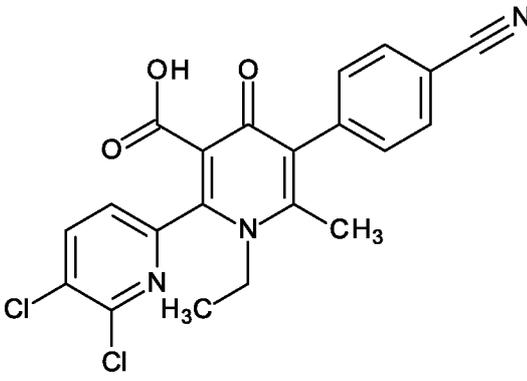
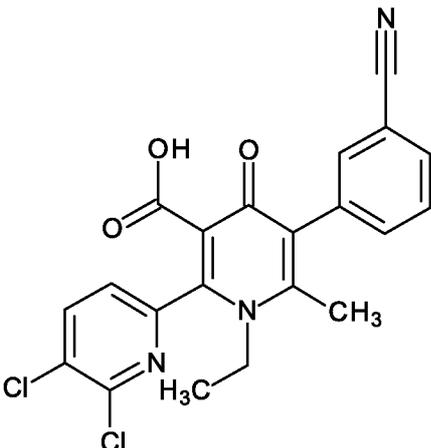
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|--|---|-------|
| | | <p>¹H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,58 (d, 1H), 7,56 (d, 1H), 7,42 - 7,37 (m, 2H), 7,30 (dd, 1H), 7,21 - 7,16 (m, 2H), 3,81 (q, 2H), 3,57 (s, 3H), 2,30 (s, 3H), 1,18 (t, 3H)</p> | |
| 128 | 5-(4-Хлорфенил)-2-(3,4-дифторфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p>¹H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,48 (d, 2H), 7,33 (dt, 1H), 7,23 - 7,18 (m, 2H), 7,15 (ddd, 1H), 7,08 - 7,00 (m, 1H), 3,95 (q, 2H), 2,42 (s, 3H), 1,25 (t, 3H)</p> | |
| 129 | 2-(4-Бром-3-фторфенил)-5-(4-хлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p>¹H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,72 (dd, 1H), 7,48 (d, 2H), 7,20 (d, 2H), 7,09 (dd, 1H), 6,99 (dd, 1H), 3,94 (q, 2H), 2,42 (s, 3H), 1,25 (t, 3H)</p> | |
| 130 | 5-(4-Хлорфенил)-2-(2,4-дифторфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p>¹H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,48 (brd, 2H), 7,25 - 7,17 (m, 3H), 7,11 - 6,97 (m, 2H), 4,11 - 4,00 (m, 1H), 3,99 - 3,87 (m, 1H), 2,42 (s, 3H), 1,24 (t, 3H)</p> | |
| 131 | 5-(4-Хлорфенил)-2-(5-хлор-2-пиридил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p>¹H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 8,71 (d, 1H), 7,82 (dd, 1H), 7,48 (d, 2H), 7,39 (d, 1H), 7,20 (brs, 2H), 3,98 - 3,87 (m,</p> | |

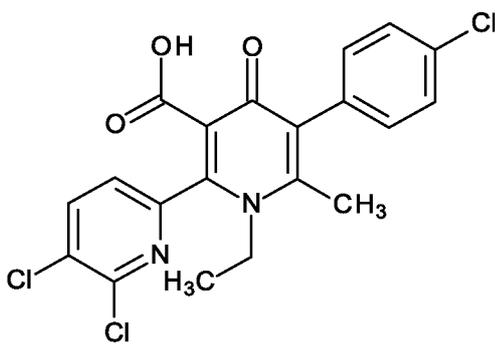
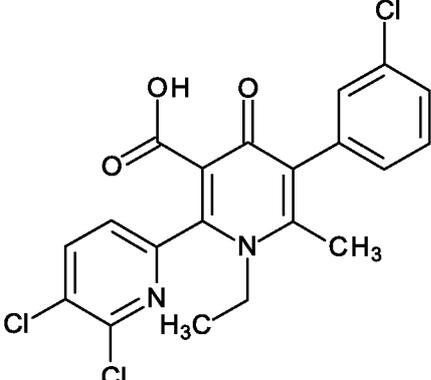
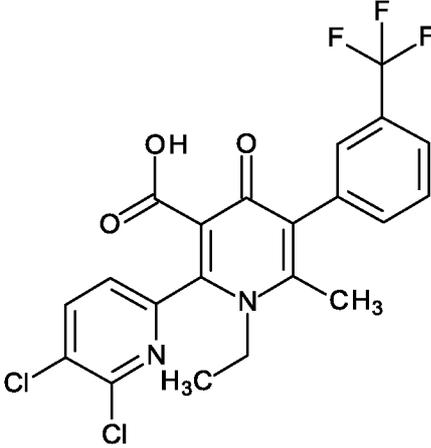
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|--|--|-------|
| 132 | 5-(4-Хлорфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-4-оксо-6-(трифторметил)пиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="571 255 1109 286">1H), 3,87 - 3,76 (m, 1H), 2,40 (s, 3H), 1,28 (t, 3H)</p> <p data-bbox="571 593 1268 683">1H ЯМР (400МГц, хлороформ) δ = 7,65 (d, 1H), 7,48 (d, 2H), 7,46 (d, 1H), 7,21 (dd, 1H), 7,17 (d, 2H), 4,13 (q, 2H), 1,21 (t, 3H)</p> | |
| 133 | 2-(4-Бром-2-фторфенил)-5-(4-хлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="571 1010 1268 1102">1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,51 - 7,40 (m, 4H), 7,21 (brs, 2H), 7,12 (t, 1H), 4,08 - 3,97 (m, 1H), 3,90 (dq, 1H), 2,42 (s, 3H), 1,24 (t, 3H)</p> | |
| 134 | Этил-5-(4-хлорфенил)-2-(2,4-дифторфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилат |  <p data-bbox="571 1489 1268 1610">1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,44 - 7,36 (m, 3H), 7,24 - 7,17 (m, 2H), 7,07 - 6,94 (m, 2H), 4,08 - 3,96 (m, 2H), 3,94 - 3,82 (m, 1H), 3,73 (dq, 1H), 2,30 (s, 3H), 1,17 (t, 3H), 1,02 (t, 3H)</p> | |
| 135 | 2-(2,4-Дифторфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-фенилпиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="571 1937 1268 2027">1H ЯМР (500 МГц, метанол-d4) δ = 7,54 - 7,48 (m, 2H), 7,47 - 7,40 (m, 2H), 7,36 - 7,26 (m, 2H), 7,21 - 7,12 (m, 2H), 4,21 - 4,10 (m, 1H), 4,07 - 3,98 (m, 1H), 2,45 (s, 3H), 1,23 (t, 3H)</p> | |

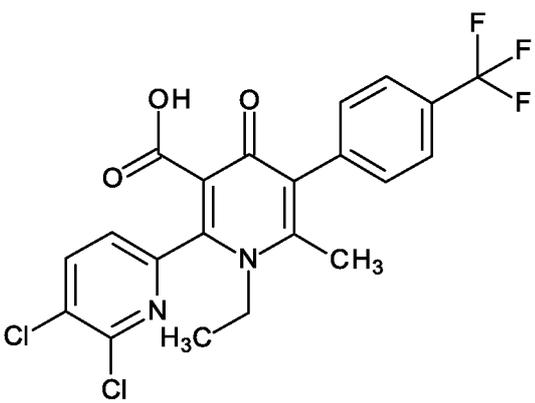
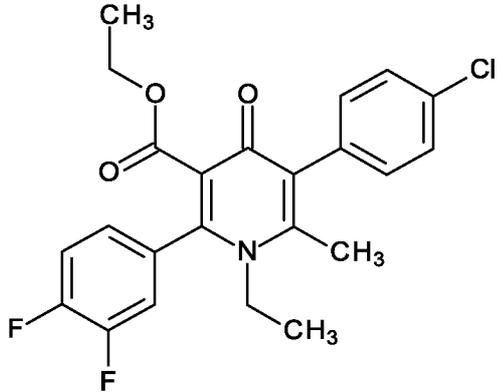
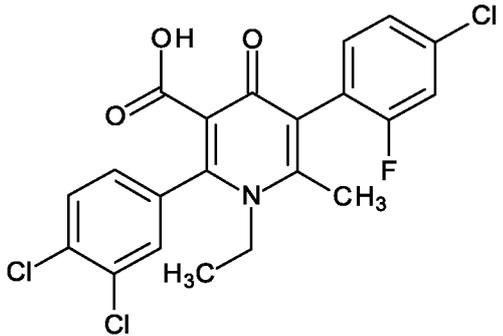
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|---|---|-------|
| 136 | 2-(2,4-Дифторфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-[4-(трифторметокси)фенил]пиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="571 689 1268 779">1H ЯМР (400МГц, хлороформ) $\delta = 7,41 - 7,29$ (m, 4H), $7,26 - 7,19$ (m, 1H), $7,04$ (dtd, 2H), $4,11 - 4,00$ (m, 1H), $3,99 - 3,88$ (m, 1H), $2,43$ (s, 3H), $1,26$ (t, 3H)</p> | |
| 137 | Этил-2-(4-бром-2-фторфенил)-5-(4-хлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилат |  <p data-bbox="571 1164 1268 1281">1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) $\delta = 7,46 - 7,41$ (m, 2H), $7,41 - 7,35$ (m, 2H), $7,33 - 7,27$ (m, 1H), $7,20$ (d, 2H), $4,09 - 3,95$ (m, 2H), $3,88$ (dq, 1H), $3,78 - 3,65$ (m, 1H), $2,30$ (s, 3H), $1,17$ (t, 3H), $1,02$ (t, 3H)</p> | |
| 138 | 2,5-бис(4-Хлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="571 1612 1268 1706">1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) $\delta = 7,51$ (d, 2H), $7,48$ (d, 2H), $7,24$ (d, 2H), $7,22 - 7,19$ (m, 2H), $3,93$ (q, 2H), $2,41$ (s, 3H), $1,22$ (t, 3H)</p> | |

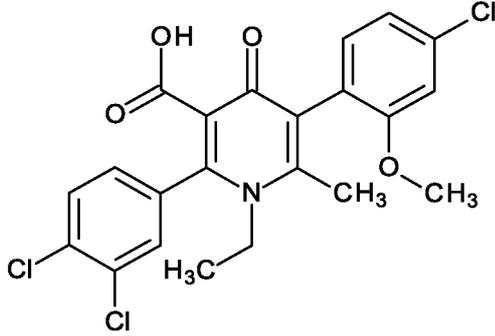
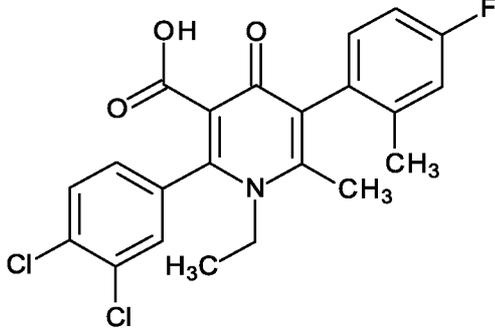
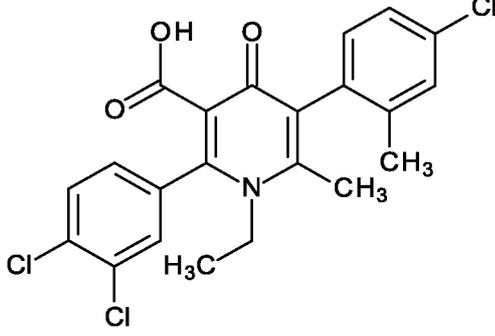
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|--|---|-------|
| 139 | Этил-3-(4-бром-2-фторфенил)-5-(4-хлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилат |  <p data-bbox="571 672 1273 795">1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,70 (dd, 1H), 7,39 (d, 2H), 7,24 (brd, 1H), 7,22 - 7,18 (m, 2H), 7,15 (dd, 1H), 4,06 - 4,00 (m, 2H), 3,83 (q, 2H), 2,31 (s, 3H), 1,19 (t, 3H), 1,03 (t, 3H)</p> | |
| 140 | 2-(2-Хлор-4-пиридил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-[4-(трифторметил)фенил]пиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="571 1220 1273 1310">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ = 8,61 (d, 1H), 7,79 (d, 2H), 7,72 (s, 1H), 7,12 (d, 1H), 6,99 (d, 2H), 3,85 (t, 2H), 2,35 (s, 3H), 1,16 (t, 3H)</p> | |
| 141 | 2-(2-Хлор-4-пиридил)-5-(3-цианофенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="571 1792 1273 1881">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ = 8,58 (d, 1H), 8,08 (d, 1H), 7,86 (s, 1H), 7,73 (s, 1H), 7,68 (t, 1H), 7,55 (d, 2H), 3,89 (d, 2H), 2,37 (s, 3H), 1,15 (t, 3H)</p> | |

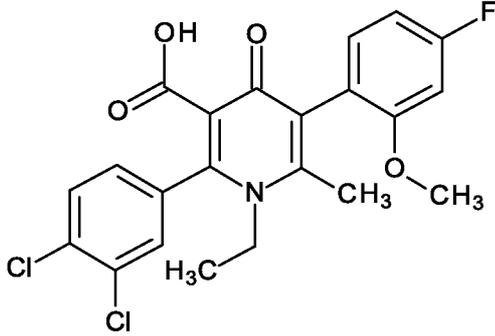
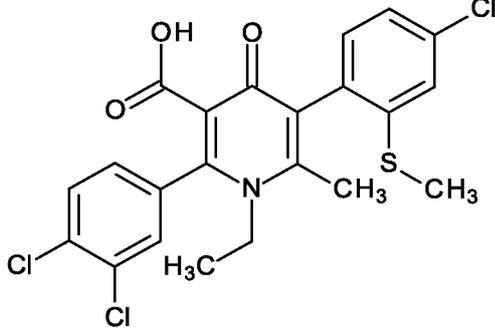
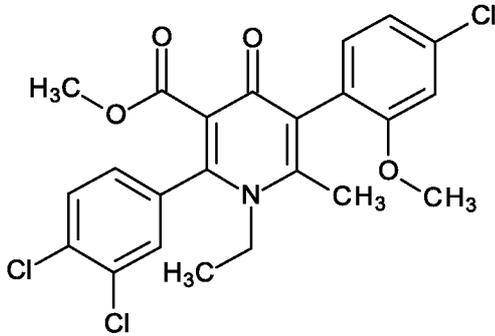
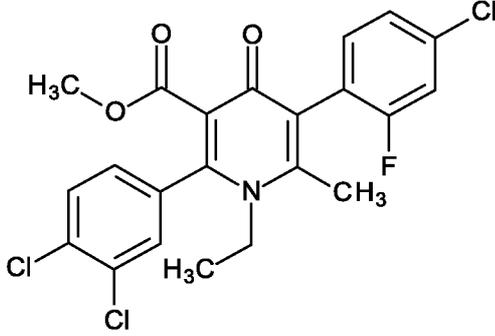
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|--|---|-------|
| 142 | 2-(2-Хлор-4-пиридил)-5-(4-цианопенил)-1-этил-6-метил-4-оксопириндин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="571 638 1273 728">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ = 8,48 (d, 1H), 7,98 (d, 2H), 7,76 (s, 1H), 7,58 (d, 1H), 7,50 (d, 2H), 3,89 (q, 2H), 2,37 (s, 3H), 1,14 (t, 3H)</p> | |
| 143 | 5-(4-Хлорфенил)-2-(2-хлор-4-пиридил)-1-этил-6-метил-4-оксопириндин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="571 1095 1273 1187">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ = 8,59 (d, 1H), 7,75 (s, 1H), 7,56 (m, 3H), 7,25 (d, 2H), 3,89 (q, 2H), 2,39 (s, 3H), 1,14 (t, 3H)</p> | |
| 144 | 5-(3-Хлорфенил)-2-(2-хлор-4-пиридил)-1-этил-6-метил-4-оксопириндин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="571 1612 1273 1700">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ = 8,59 (d, 1H), 7,79 (s, 1H), 7,68 (m, 3H), 7,35 (s, 1H), 7,21 (m, 1H), 3,88 (q, 2H), 2,35 (s, 3H), 1,16 (t, 3H)</p> | |

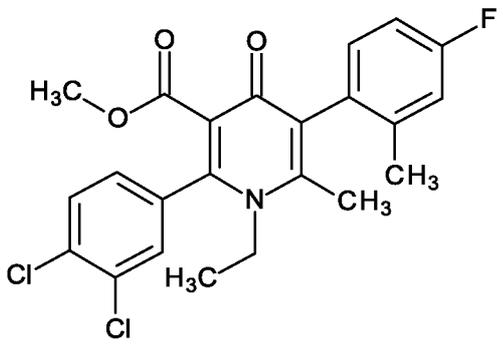
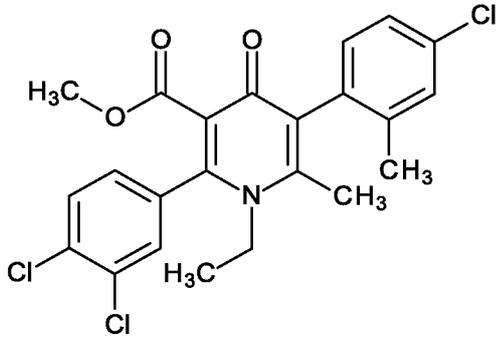
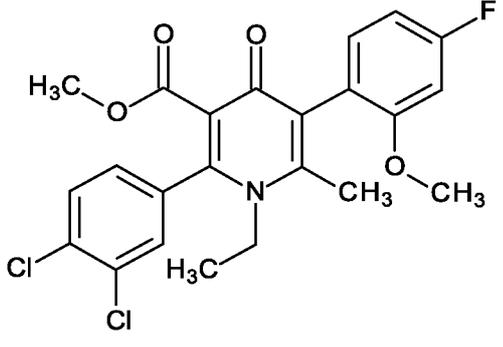
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ^1H ЯМР | LC/MS |
|--------------|--|---|-------|
| 145 | 2-(2-Хлор-4-пиридил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-[3-(трифторметил)фенил]пиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="566 728 1268 795">^1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ = 8,59 (d, 1H), 7,79 (m, 3H), 7,68 (m, 3H), 3,85 (t, 2H), 2,45 (s, 3H), 1,26 (t, 3H)</p> | |
| 146 | 5-(4-Цианофенил)-2-(5,6-дихлор-2-пиридил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="566 1198 1268 1288">^1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ = 8,34 (d, 1H), 7,99 – 7,97 (m, 2H), 7,78 – 7,69 (m, 2H), 7,51 (s, 1H), 3,92 – 3,89 (q, 2H), 2,39 (s, 3H), 1,17 (t, 3H)</p> | |
| 147 | 5-(3-Цианофенил)-2-(5,6-дихлор-2-пиридил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="566 1758 1268 1825">^1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ = 8,36 (d, 1H), 7,91 (d, 1H), 7,77 (m, 4H), 3,91 (q, 2H), 2,63 (s, 3H), 1,19 (t, 3H)</p> | |

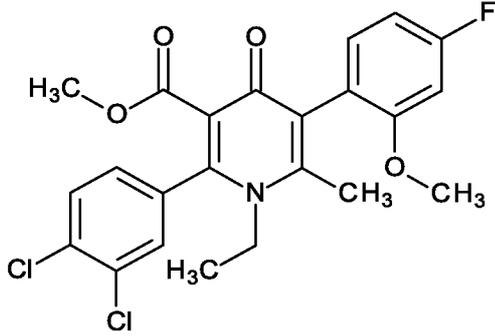
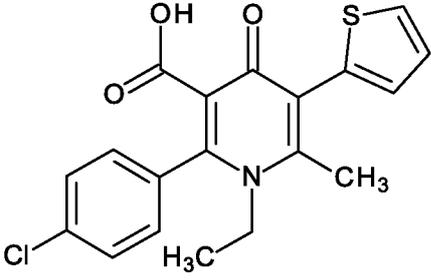
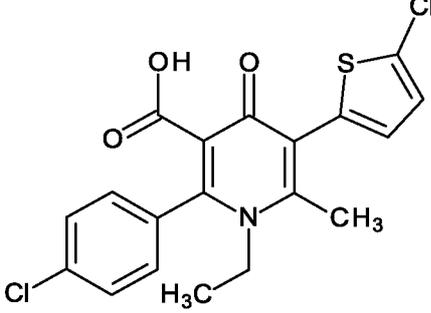
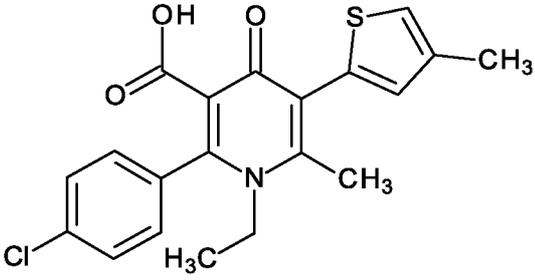
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|--|---|-------|
| 148 | 5-(4-Хлорфенил)-2-(5,6-дихлор-2-пиридил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="568 616 1270 712">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ = 8,35 (d, 1H), 7,84 (m, 2H), 7,73 (d, 1H), 7,56 (m, 2H), 3,91 (q, 2H), 2,67 (s, 3H), 1,13 (t, 3H)</p> | |
| 149 | 5-(3-Хлорфенил)-2-(5,6-дихлор-2-пиридил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="568 1131 1270 1227">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ = 8,27 (d, 1H), 7,70 (m, 1H), 7,46 (m, 2H), 7,27 (d, 1H), 7,17 (d, 1H), 3,78 (q, 2H), 2,67 (s, 3H), 1,14 (t, 3H)</p> | |
| 150 | 2-(5,6-Дихлор-2-пиридил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-[3-(трифторметил)фенил]пиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="568 1702 1270 1765">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ = 8,35 (d, 1H), 7,80 (m, 2H), 7,77 (t, 2H), 7,64 (s, 1H), 3,90 (q, 2H), 2,67 (s, 3H), 1,13 (t, 3H)</p> | |

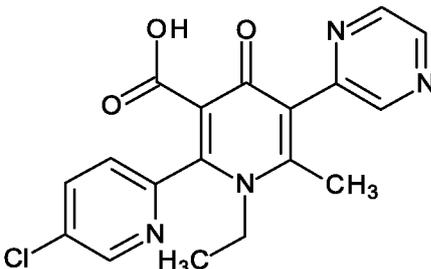
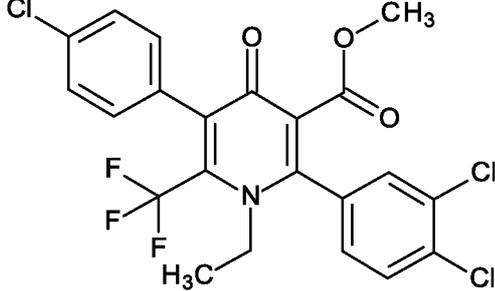
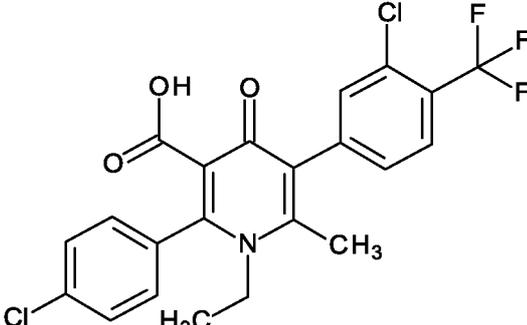
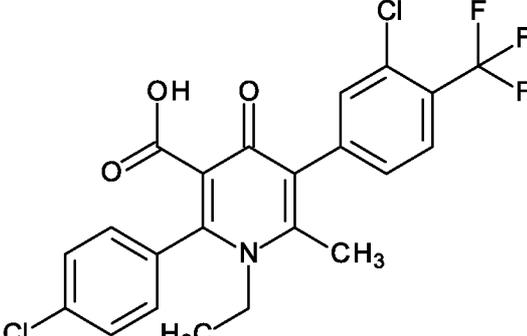
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|--|--|-------|
| 151 | 2-(5,6-Дихлор-2-пиридил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-[4-(трифторметил)фенил]пиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="571 672 1273 734">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ = 8,36 (d, 1H), 7,86 (q, 2H), 7,77 (d, 1H), 7,53 (q, 2H), 3,89 (q, 2H), 2,67 (s, 3H), 1,19 (t, 3H)</p> | |
| 152 | Этил-5-(4-хлорфенил)-2-(3,4-дифторфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилат |  <p data-bbox="571 1153 1273 1249">1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,42 - 7,37 (m, 2H), 7,35 - 7,27 (m, 2H), 7,24 - 7,16 (m, 3H), 4,07 - 3,98 (m, 2H), 3,82 (q, 2H), 2,30 (s, 3H), 1,18 (t, 3H), 1,04 (t, 3H)</p> | |
| 153 | 5-(4-Хлор-2-фторфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="571 1612 1273 1709">1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,61 (dd, 1H), 7,42 (dd, 1H), 7,32 - 7,27 (m, 2H), 7,25 - 7,22 (m, 1H), 7,17 (ddd, 1H), 3,94 (q, 2H), 2,42 (s, 3H), 1,25 (t, 3H)</p> | |

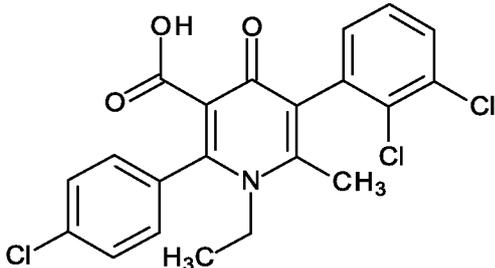
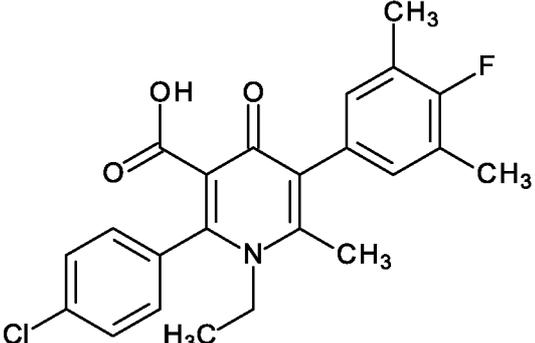
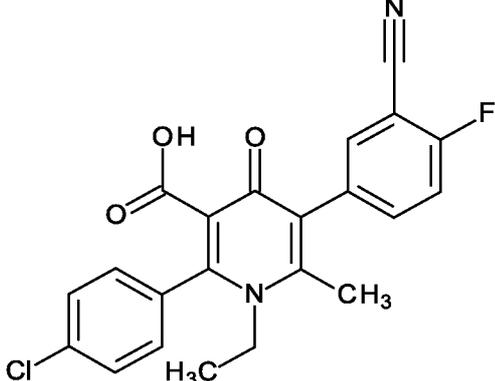
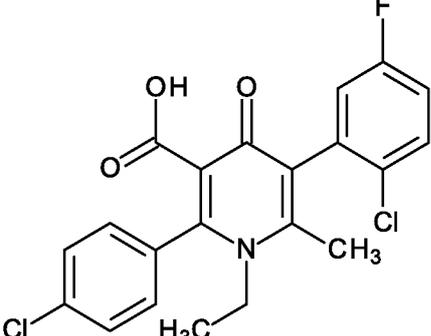
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|---|--|-------|
| 154 | 5-(4-Хлор-2-метоксифенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="571 616 1273 741">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ = 7,93 (d, 0,5H), 7,79 - 7,77 (m, 1,5H), 7,55 - 7,53 (m, 0,5H), 7,44 - 7,41 (m, 0,5H), 7,24 (s, 1H), 7,14 - 7,12 (m, 2H), 3,90 - 3,88 (m, 2H), 3,77 (s, 3H), 2,31 (s, 3H), 1,11 (t, 3H)</p> | |
| 155 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-5-(4-фтор-2-метилфенил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="571 1108 1273 1200">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ = 7,88 (d, 0,5H), 7,82 - 7,78 (m, 1,5H), 7,52 - 7,45 (m, 1H), 7,23 (d, 1H), 7,15 - 7,07 (m, 2H), 3,92 - 3,88 (m, 2H), 2,28 (s, 3H), 2,08 (s, 3H), 1,12 (t, 3H)</p> | |
| 156 | 5-(4-Хлор-2-метилфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="571 1568 1273 1684">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ = 7,87 (d, 0,5H), 7,80 - 7,77 (m, 1,5H), 7,46 - 7,44 (m, 2H), 7,36 - 7,34 (dd, 1H), 7,13 - 7,07 (m, 1H), 3,92 - 3,86 (m, 2H), 2,28 (s, 3H), 2,08 (s, 3H), 1,12 (t, 3H)</p> | |

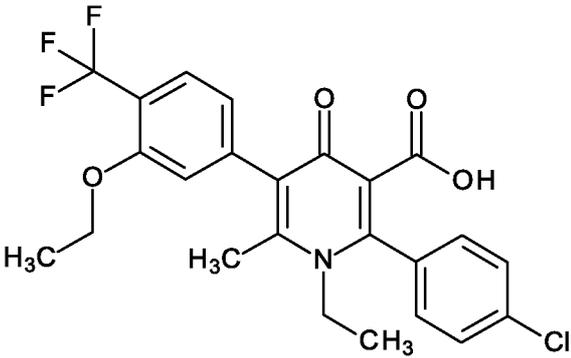
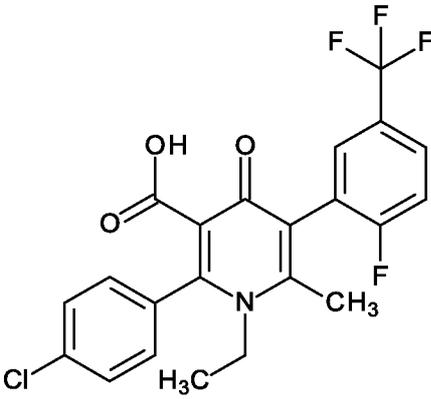
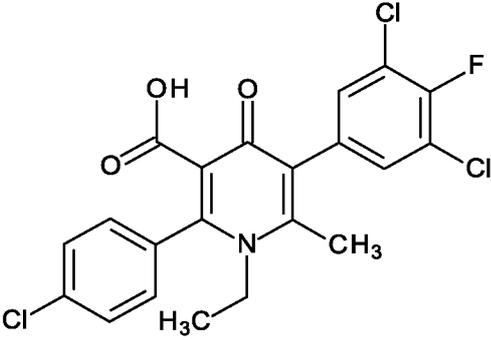
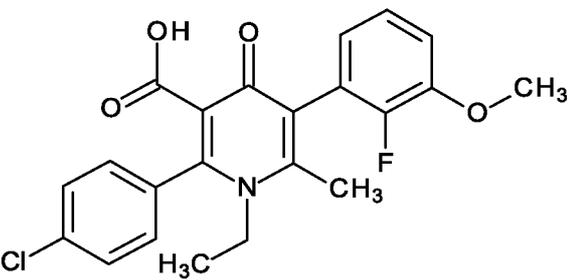
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|--|---|--|
| 157 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-5-(4-фтор-2-метоксифенил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="571 616 1273 741">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ = 7,93 (d, 0,5H), 7,80 - 7,76 (m, 1,5H), 7,55 (dd, 0,5H), 7,42 (dd, 0,5H), 7,17 - 7,05 (m, 2H), 6,90 - 6,86 (m, 1H), 3,94 - 3,87 (m, 2H), 3,76 (s, 3H), 2,30 (s, 3H), 1,11 (t, 3H)</p> | |
| 158 | 5-(4-Хлор-2-метилсульфанилфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,52 мин. (B); MS: масса/заряд = 480,1 (M+1) |
| 159 | Метил-5-(4-хлор-2-метоксифенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилат |  <p data-bbox="571 1467 1273 1592">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ = 7,94 (d, 0,5H), 7,87 (d, 0,5H), 7,81 (dd, 1H), 7,56 - 7,48 (m, 1H), 7,16 (s, 1H), 7,04 - 7,02 (m, 2H), 3,76 - 3,75 (m, 5H), 3,36 (s, 3H), 2,15 (s, 3H), 1,07 (t, 3H)</p> | |
| 160 | Метил-5-(4-хлор-2-фторфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилат |  <p data-bbox="571 1960 1273 2020">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ = 7,96 (d, 0,5H), 7,86 (d, 0,5H), 7,80 (dd, 1H), 7,58 - 7,48 (m, 2H), 7,37 - 7,34 (m, 1H),</p> | |

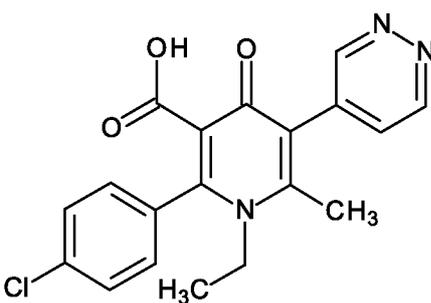
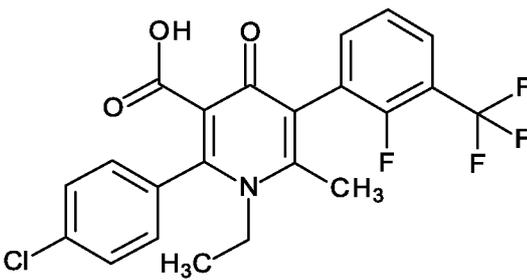
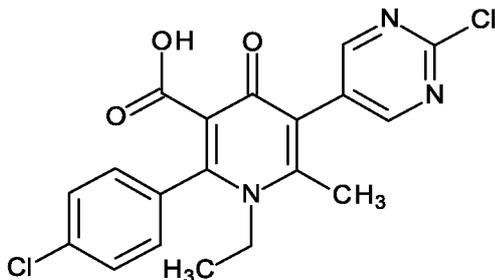
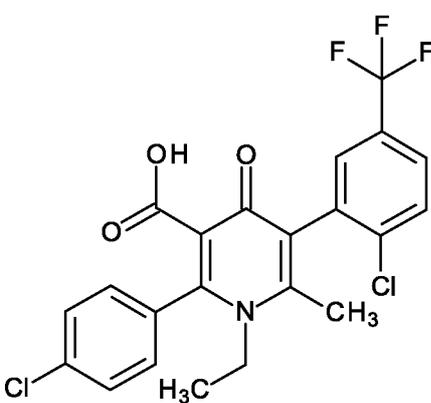
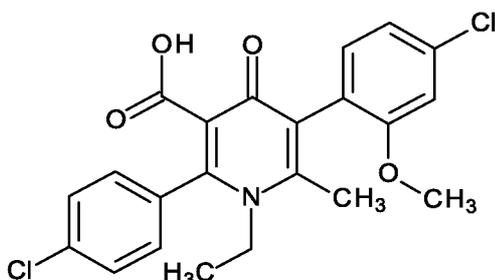
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|--|--|-------|
| 161 | Метил-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-(4-фтор-2-метилфенил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилат |  <p data-bbox="566 683 1273 801">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ = 7,93 (d, 0,5H), 7,87 (d, 0,5H), 7,82 (dd, 1H), 7,56 - 7,49 (dd, 1H), 7,16 (s, 1H), 7,05 - 6,98 (m, 2H), 3,80 - 3,75 (m, 2H), 3,37 (s, 3H), 2,14 (s, 3H), 2,06 (s, 3H), 1,09 (t, 3H)</p> | |
| 162 | Метил-5-(4-хлор-2-метилфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилат |  <p data-bbox="566 1176 1273 1294">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ = 7,93 (d, 0,5H), 7,87 (d, 0,5H), 7,81 (d, 1H), 7,56 - 7,49 (m, 1H), 7,38 (s, 1H), 7,28 (d, 1H), 7,04 - 6,99 (m, 1H), 3,80 - 3,75 (q, 2H), 3,37 (s, 3H), 2,14 (s, 3H), 2,06 (s, 3H), 1,09 (t, 3H)</p> | |
| 163 | Метил-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-(4-фтор-2-метоксифенил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилат |  <p data-bbox="566 1668 1273 1778">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ = 7,94 (d, 0,5H), 7,87 (d, 0,5H), 7,82 - 7,79 (dd, 1H), 7,56 - 7,54 (dd, 0,5H), 7,50 - 7,48 (dd, 0,5H), 7,06 - 6,97 (m, 2H), 6,83 - 6,78 (m, 1H), 3,77 - 3,73 (m, 5H), 3,36 (s, 3H), 2,15 (s, 3H), 1,09 (t, 3H)</p> | |

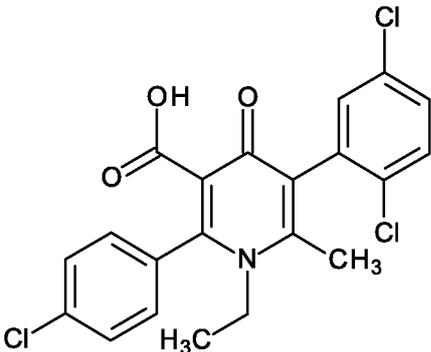
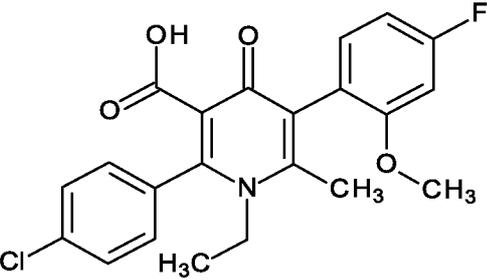
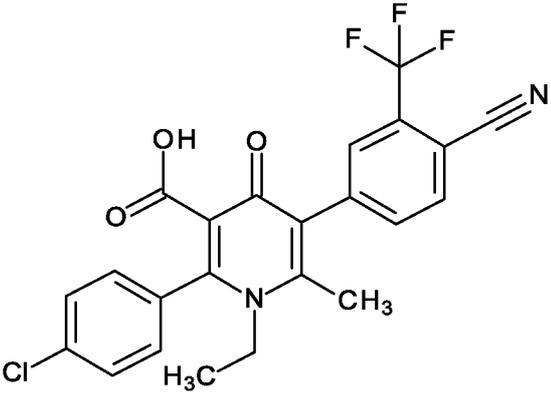
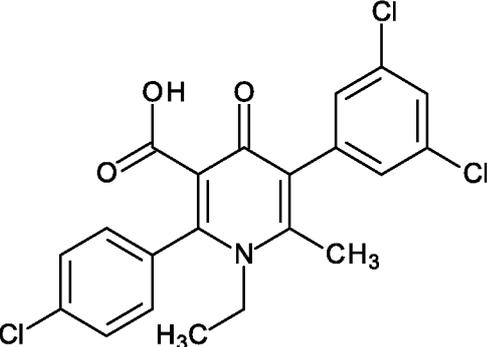
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|--|--|-------|
| 164 | Метил-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-5-(4-фтор-2-метоксифенил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилат |  <p data-bbox="571 616 1273 712">1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 8,72 (d, 1H), 7,83 (dd, 1H), 7,50 (d, 1H), 7,39 (d, 2H), 7,18 (d, 2H), 3,83 (brs, 2H), 3,56 (s, 3H), 2,30 (s, 3H), 1,21 (t, 3H)</p> | |
| 165 | 2-(4-Хлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-(2-тиенил)пиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="571 1019 1273 1108">1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,54 - 7,48 (m, 3H), 7,23 (d, 2H), 7,17 (dd, 1H), 7,03 (dd, 1H), 3,93 (q, 2H), 2,54 (s, 3H), 1,22 (t, 3H)</p> | |
| 166 | 2-(4-Хлорфенил)-5-(5-хлор-2-тиенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="571 1456 1273 1518">1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,49 (d, 2H), 7,20 (d, 2H), 6,97 (d, 1H), 6,80 (d, 1H), 3,92 (q, 2H), 2,58 (s, 3H), 1,20 (t, 3H)</p> | |
| 167 | 2-(4-Хлорфенил)-1-этил-6-метил-5-(4-метил-2-тиенил)-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="571 1825 1273 1910">1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,50 (d, 2H), 7,22 (d, 2H), 7,09 (s, 1H), 6,82 (d, 1H), 3,92 (q, 2H), 2,54 (s, 3H), 2,32 (s, 3H), 1,21 (t, 3H)</p> | |

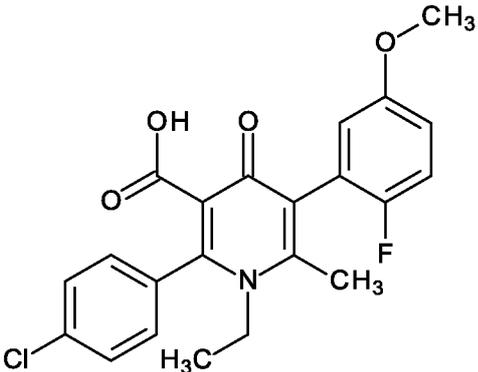
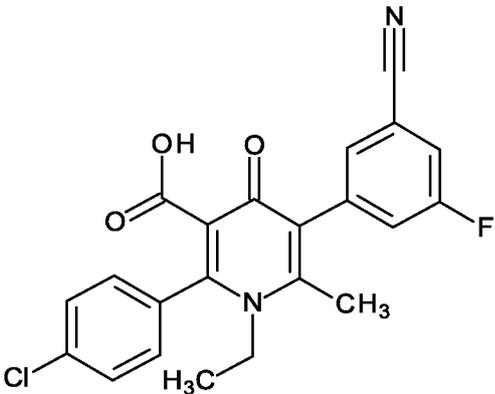
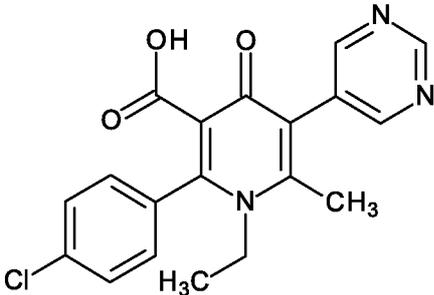
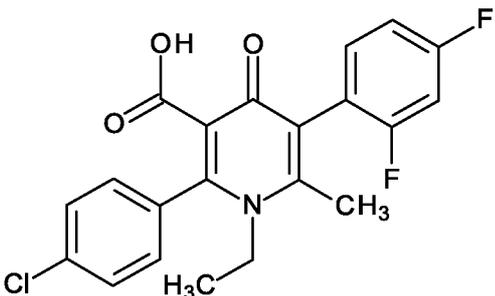
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|--|---|--|
| 168 | 2-(5-Хлор-2-пиридил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-пиазин-2-илпиридин-3-карбоновая кислота |  <p>1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 8,80 (s, 1H), 8,76 (s, 1H), 8,73 (d, 1H), 8,64 (d, 1H), 7,85 (dd, 1H), 7,38 (d, 1H), 4,03 - 3,91 (m, 1H), 3,89 - 3,78 (m, 1H), 2,46 (s, 3H), 1,30 (t, 3H)</p> | |
| 169 | Метил-5-(4-хлорфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-4-оксо-6-(трифторметил)пиридин-3-карбоксилат |  <p>1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,62 (d, 1H), 7,60 (d, 1H), 7,39 (d, 2H), 7,34 (dd, 1H), 7,14 (d, 2H), 3,99 (q, 2H), 3,60 (s, 3H), 1,14 (t, 3H)</p> | |
| 170 | 2-(4-Хлорфенил)-5-[3-хлор-4-(трифторметил)фенил]-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,50 мин. (B); MS: масса/заряд = 470,2 (M+1) |
| 171 | 2-(4-Хлорфенил)-5-[3-хлор-4-(трифторметил)фенил]-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,35 мин. (B); MS: масса/заряд = 420,2 (M+1) |

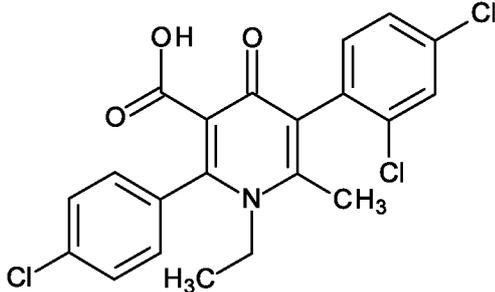
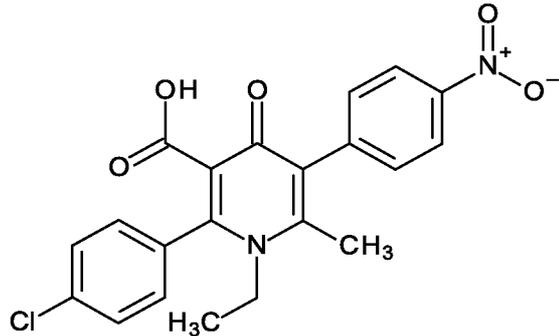
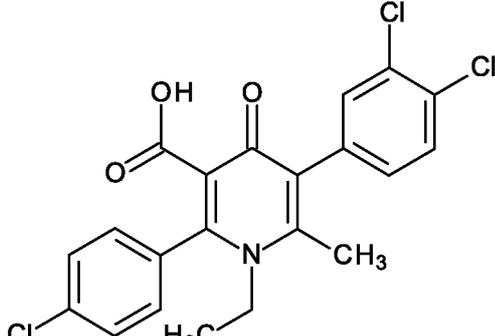
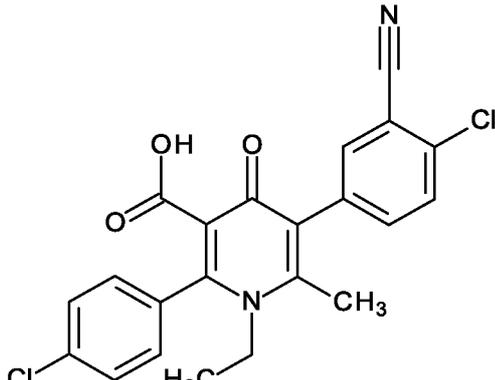
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ Н ЯМР | LC/MS |
|--------------|---|--|--|
| 172 | 2-(4-Хлорфенил)-5-(2,3-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,37 мин. (B); MS: масса/заряд = 436,2 (M+1) |
| 173 | 2-(4-Хлорфенил)-1-этил-5-(4-фтор-3,5-диметилфенил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,43 мин. (B); MS: масса/заряд = 414,3 (M+1) |
| 174 | 2-(4-Хлорфенил)-5-(3-циано-4-фторфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,10 мин. (B); MS: масса/заряд = 411,2 (M+1) |
| 175 | 5-(2-Хлор-5-фторфенил)-2-(4-хлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,26 мин. (B); MS: масса/заряд = 420,2 (M+1) |

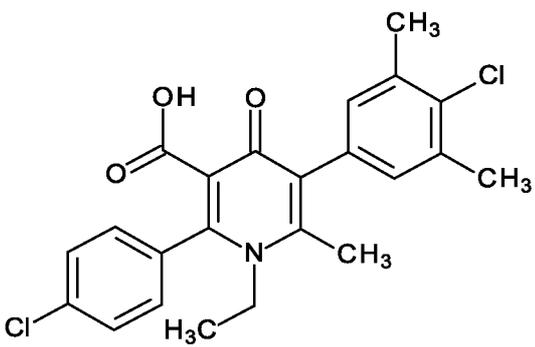
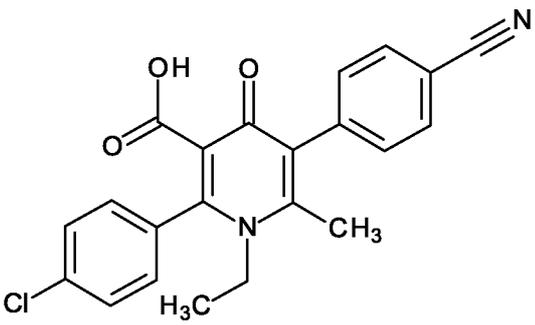
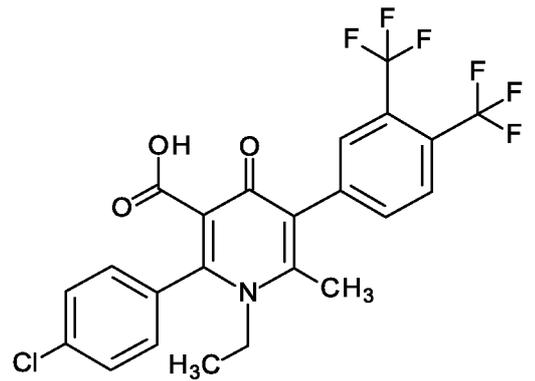
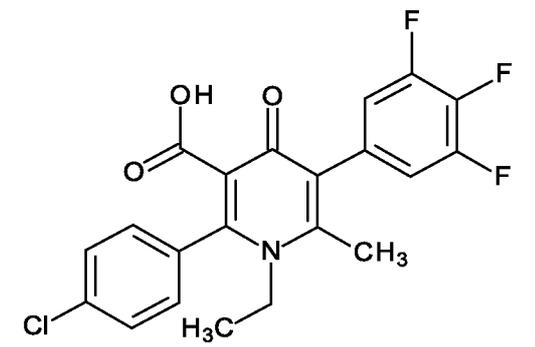
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|--|--|--|
| 176 | 2-(4-Хлорфенил)-5-[3-этокси-4-(трифторметил)фенил]-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,52 мин. (B); MS: масса/заряд = 480,3 (M+1) |
| 177 | 2-(4-Хлорфенил)-1-этил-5-[2-фтор-5-(трифторметил)фенил]-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,38 мин. (B); MS: масса/заряд = 454,2 (M+1) |
| 178 | 2-(4-Хлорфенил)-5-(3,5-дихлор-4-фторфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,49 мин. (B); MS: масса/заряд = 454,2 (M+1) |
| 179 | 2-(4-Хлорфенил)-1-этил-5-(2-фтор-3-метоксифенил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,13 мин. (B); MS: масса/заряд = 416,3 (M+1) |

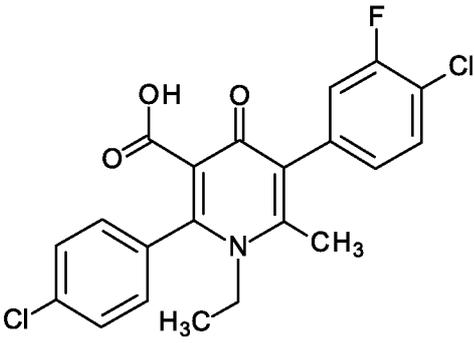
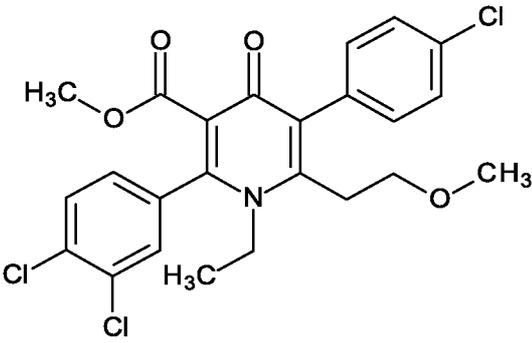
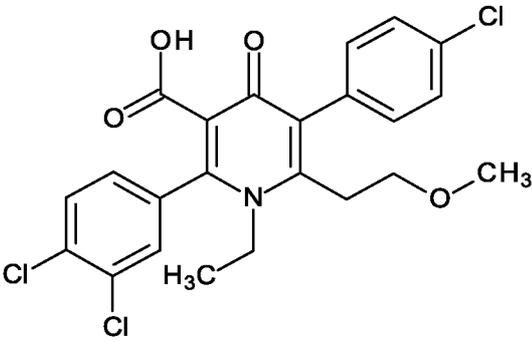
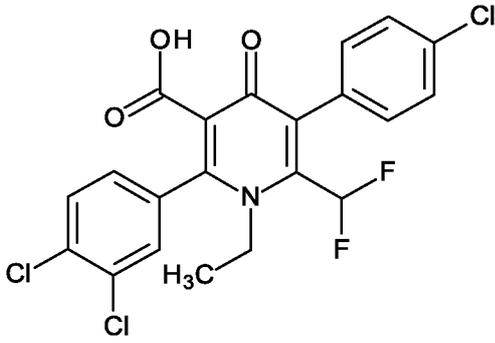
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ Н ЯМР | LC/MS |
|--------------|--|--|---|
| 180 | 2-(4-Хлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-пиридазин-4-илпиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 1,45 мин. (B); MS: масса/заряд = 370,2 (M+1) 1,45 |
| 181 | 2-(4-Хлорфенил)-1-этил-5-[2-фтор-3-(трифторметил)фенил]-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,38 мин. (B); MS: масса/заряд = 454,2 (M+1) |
| 182 | 2-(4-Хлорфенил)-5-(2-хлорпиримидин-5-ил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 1,86 мин. (B); MS: масса/заряд = 404,2 (M+1) |
| 183 | 2-(4-Хлорфенил)-5-[2-хлор-5-(трифторметил)фенил]-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,45 мин. (B); MS: масса/заряд = 470,2 (M+1) |
| 184 | 5-(4-Хлор-2-метоксифенил)-2-(4-хлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,30 мин. (B); MS: масса/заряд = 432,2 (M+1) |

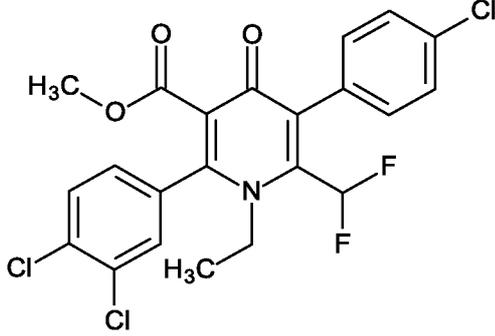
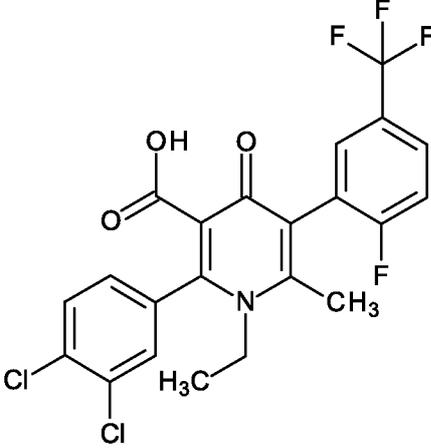
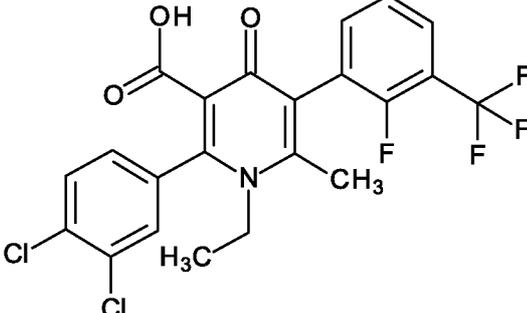
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ Н ЯМР | LC/MS |
|--------------|---|--|--|
| 185 | 2-(4-Хлорфенил)-5-(2,5-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,39 мин. (B); MS: масса/заряд = 436,2 (M+1) |
| 186 | 2-(4-Хлорфенил)-1-этил-5-(4-фтор-2-метоксифенил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,15 мин. (B); MS: масса/заряд = 416,3 (M+1) |
| 187 | 2-(4-Хлорфенил)-5-[4-циано-3-(трифторметил)фенил]-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,28 мин. (B); MS: масса/заряд = 461,3 (M+1) |
| 188 | 2-(4-Хлорфенил)-5-(3,5-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,49 мин. (B); MS: масса/заряд = 436,2 (M+1) |

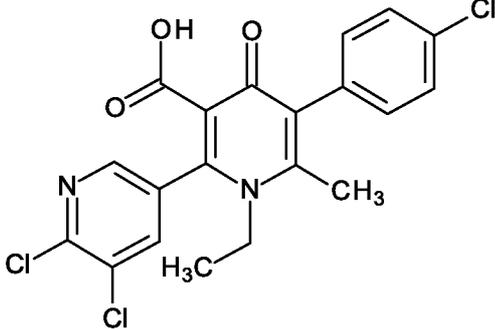
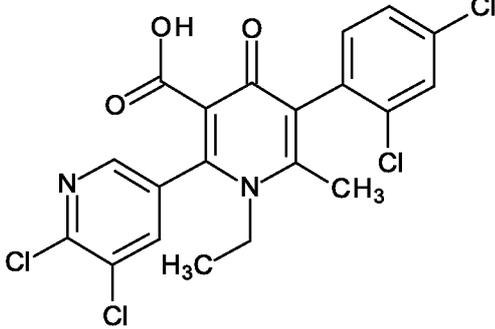
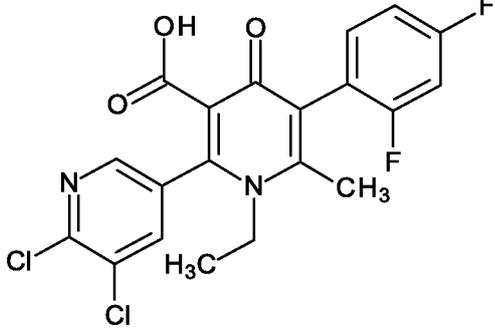
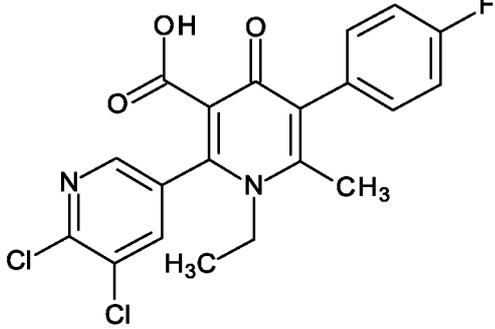
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|---|--|---|
| 189 | 2-(4-Хлорфенил)-1-этил-5-(2-фтор-5-метоксифенил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,17 мин. (B); MS: масса/заряд = 416,3 (M+1) |
| 190 | 2-(4-Хлорфенил)-5-(3-циано-5-фторфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,11 мин. (B); MS: масса/заряд = 411,2 (M+1) |
| 191 | 2-(4-Хлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-пиримидин-5-илпиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 1,53 мин. (B); MS: масса/заряд = 370,2 (M+1) |
| 192 | 2-(4-Хлорфенил)-5-(2,4-дифторфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,19 мин. (B); MS: масса/заряд = 404,2 (M+1) |

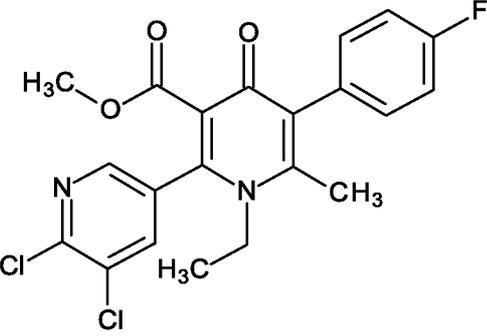
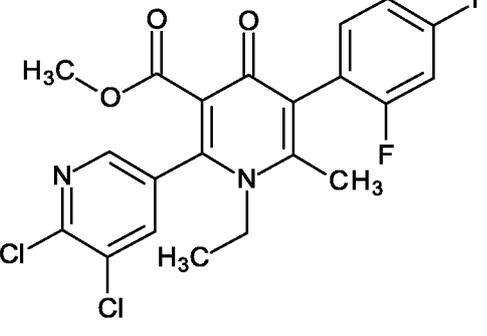
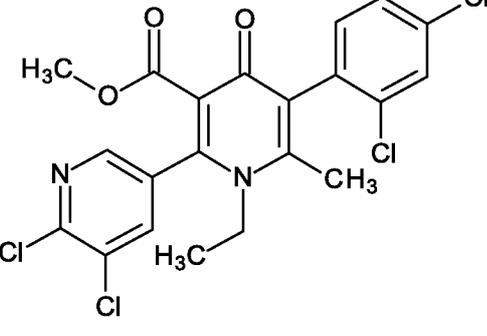
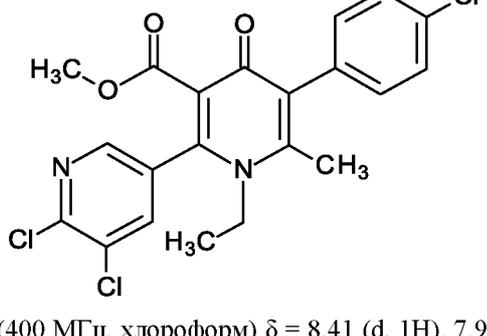
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ Н ЯМР | LC/MS |
|--------------|---|--|--|
| 193 | 2-(4-Хлорфенил)-5-(2,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,42 мин. (B); MS: масса/заряд = 436,2 (M+1) |
| 194 | 2-(4-Хлорфенил)-1-этил-6-метил-5-(4-нитрофенил)-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,13 мин. (B); MS: масса/заряд = 413,2 (M+1) |
| 195 | 2-(4-Хлорфенил)-5-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,45 мин. (B); MS: масса/заряд = 436,2 (M+1) |
| 196 | 5-(4-Хлор-3-цианофенил)-2-(4-хлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,20 мин. (B); MS: масса/заряд = 427,2 (M+1) |

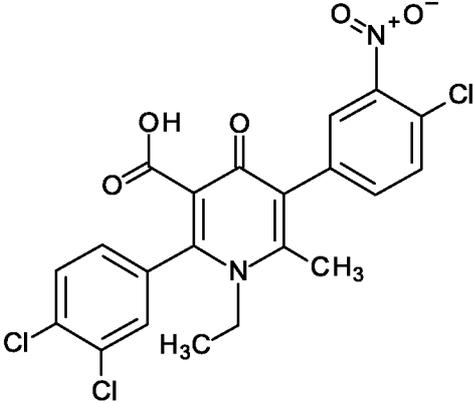
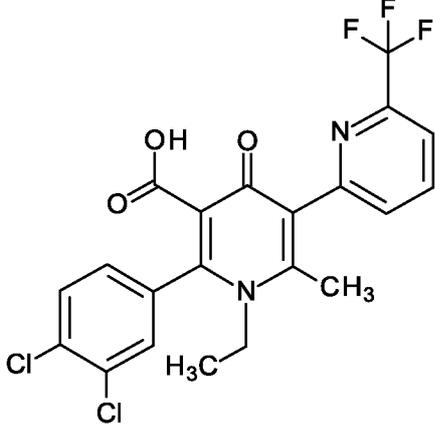
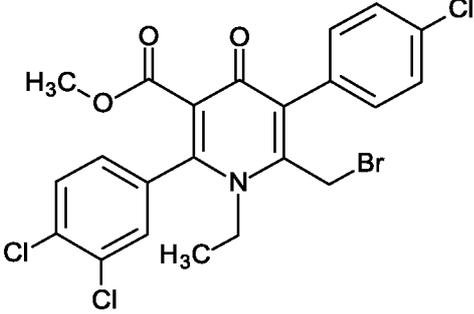
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ Н ЯМР | LC/MS |
|--------------|--|--|---|
| 197 | 5-(4-Хлор-3,5-диметилфенил)-2-(4-хлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,57 мин. (B); MS: масса/заряд = 430,2 (M+1) |
| 198 | 2-(4-Хлорфенил)-5-(4-цианофенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,03 мин. (B); MS: масса/заряд = 393,2 (M+1) |
| 199 | 5-[3,4-бис(Трифторметил)фенил]-2-(4-хлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,55 мин. (B); MS: масса/заряд = 504,2 (M+1) |
| 200 | 2-(4-Хлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-(3,4,5-трифторфенил)пиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,28 мин. (B); MS: масса/заряд = 422,2 (M+1) |

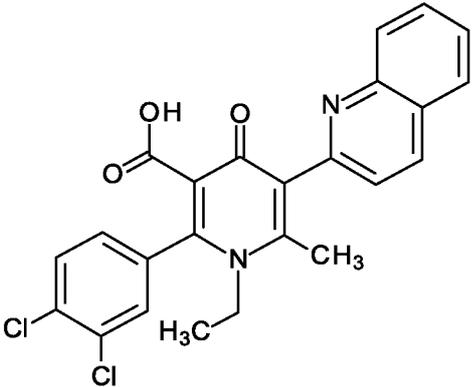
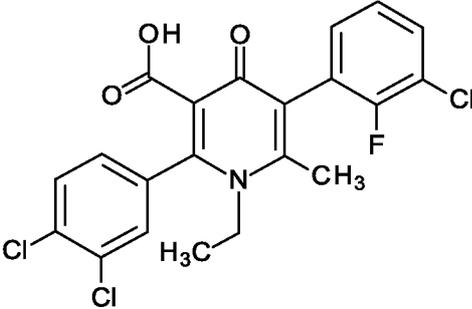
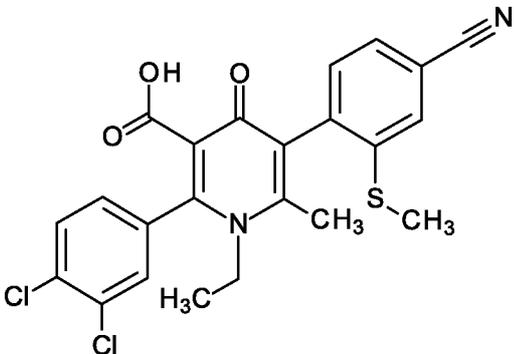
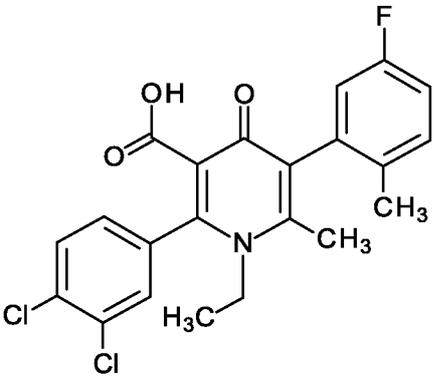
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|---|--|---|
| 201 | 5-(4-Хлор-3-фторфенил)-2-(4-хлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,33 мин. (B); MS: масса/заряд = 420,2 (M+1) |
| 202 | Метил-5-(4-хлорфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-(2-метоксиэтил)-4-оксопиридин-3-карбоксилат |  <p data-bbox="569 1014 1267 1133">1H ЯМР (400МГц, хлороформ) δ = 7,57 - 7,60 (m, 1H), 7,56 (d, 1H), 7,40 (d, 2H), 7,30 (dd, 1H), 7,15 - 7,20 (m, 2H), 3,94 (qd, 2H), 3,57 (s, 3H), 3,40 (t, 2H), 3,24 (s, 3H), 2,85 - 2,90 (m, 2H), 1,14 (t, 3H)</p> | |
| 203 | 5-(4-Хлорфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-(2-метоксиэтил)-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="569 1503 1267 1592">1H ЯМР (400МГц, хлороформ) δ = 7,61 (d, 1H), 7,50 (d, 2H), 7,41 (d, 1H), 7,20 (d, 2H), 7,14 - 7,19 (m, 1H), 4,12 (brd, 2H), 3,42 (t, 2H), 3,25 (s, 3H), 2,99 (t, 2H), 1,20 (t, 3H)</p> | |
| 204 | 5-(4-Хлорфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-6-(дифторметил)-1-этил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="569 1962 1267 2020">1H ЯМР (400МГц, хлороформ) δ = 15,53 (brs, 1H), 7,64 (d, 1H), 7,54 (d, 2H), 7,45 (d, 1H), 7,28 (d, 2H), 7,21 (dd, 1H), 6,40</p> | |

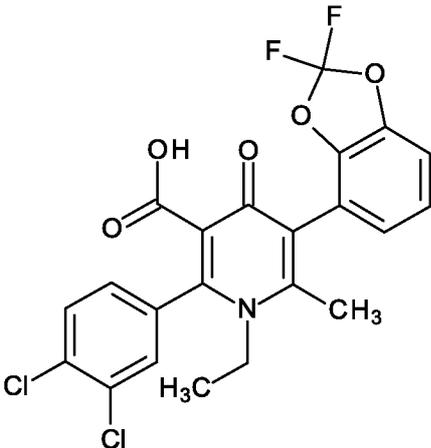
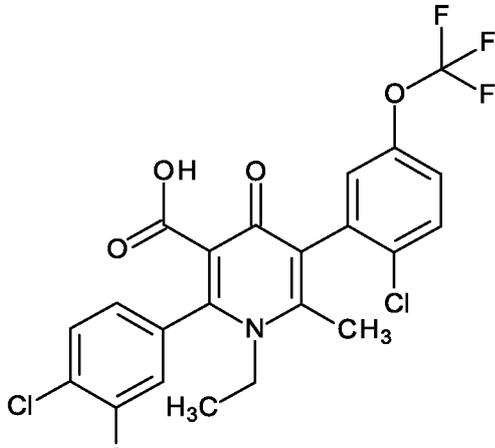
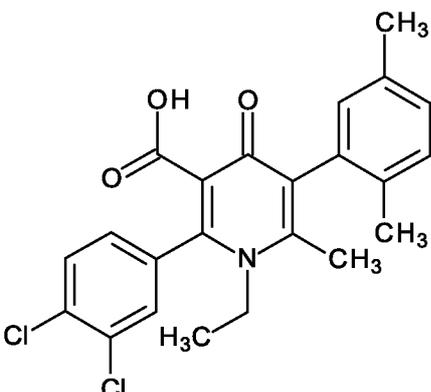
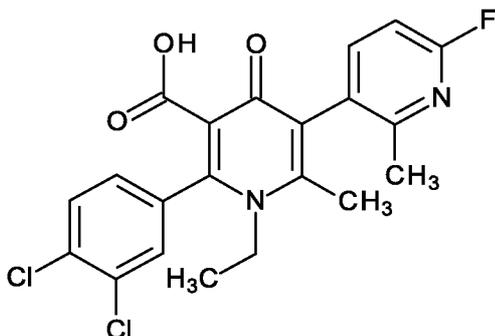
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|--|--|-------|
| 205 | Метил-5-(4-хлорфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-6-(дифторметил)-1-этил-4-оксопиридин-3-карбоксилат | <p data-bbox="566 257 1005 291">- 6,78 (m, 1H), 4,21 (q, 2H), 1,24 (t, 3H)</p>  <p data-bbox="566 649 1268 739">1H ЯМР (400МГц, хлороформ) δ = 7,54 - 7,67 (m, 2H), 7,45 (brd, 2H), 7,33 (brd, 1H), 7,24 (brd, 2H), 6,36 - 6,72 (m, 1H), 4,02 - 4,20 (m, 2H), 3,59 (s, 3H), 1,16 (brt, 3H)</p> | |
| 206 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-5-[2-фтор-5-(трифторметил)фенил]-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="566 1220 1268 1310">1H ЯМР (400 МГц, DMSO) δ = 7,93 - 7,90 (m, 1,3H), 7,82 - 7,77 (m, 1,7H), 7,73 (d, 1H), 7,63 - 7,54 (m, 1,5H), 7,42 - 7,39 (m, 0,5H), 3,95 - 3,85 (m, 2H), 2,39 (s, 3H), 1,13 (t, 3H)</p> | |
| 207 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-5-[2-фтор-3-(трифторметил)фенил]-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="566 1680 1268 1769">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ = 7,94 - 7,79 (m, 3H), 7,71 - 7,65 (m, 1H), 7,57 - 7,44 (m, 2H), 3,93 - 3,88 (q, 2H), 2,39 (s, 3H), 1,13 (t, 3H)</p> | |

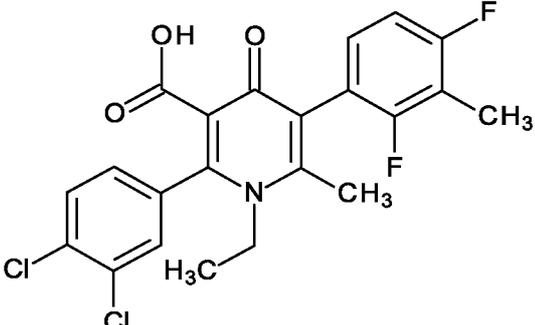
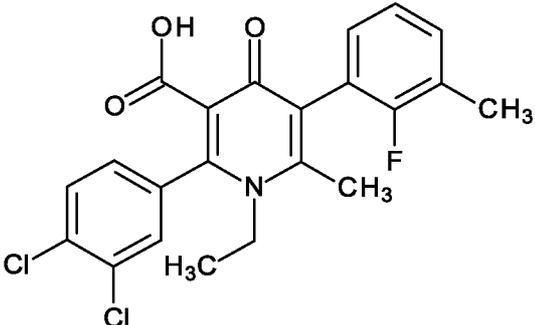
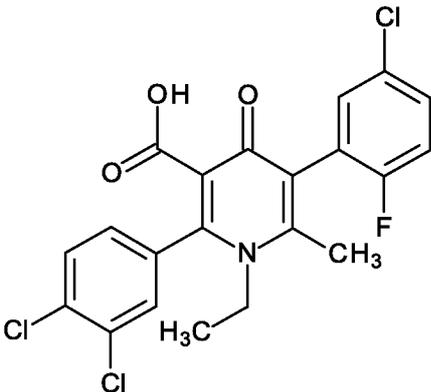
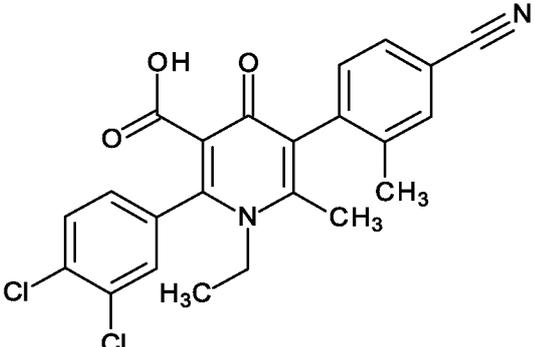
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ^1H ЯМР | LC/MS |
|--------------|--|---|-------|
| 208 | 5-(4-Хлорфенил)-2-(5,6-дихлор-3-пиридил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="569 618 1270 678">^1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ = 8,18 (d, 1H), 8,09 (d, 1H), 7,58 (d, 2H), 7,26 (d, 2H), 3,95 (q, 2H), 3,27 (s, 3H), 1,13 (t, 3H)</p> | |
| 209 | 5-(2,4-Дихлорфенил)-2-(5,6-дихлор-3-пиридил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="569 1048 1270 1137">^1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ = 8,61 - 8,54 (dd, 1H), 8,49 (dd, 1H), 7,83 (t, 1H), 7,59 - 7,57 (dt, 1H), 7,36 - 7,30 (m, 1H), 4,02 - 3,96 (q, 2H), 2,34 (s, 3H), 1,13 (t, 3H)</p> | |
| 210 | 2-(5,6-Дихлор-3-пиридил)-5-(2,4-дифторфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="569 1507 1270 1597">^1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ = 8,49 (m, 1H), 7,96 - 7,84 (m, 1H), 7,42 - 7,33 (m, 2H), 7,26 - 7,21 (m, 1H), 4,03 - 3,95 (m, 2H), 2,41 (t, 3H), 1,15 (t, 3H)</p> | |
| 211 | 2-(5,6-Дихлор-3-пиридил)-1-этил-5-(4-фторфенил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="569 1966 1270 2020">^1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ = 8,18 (d, 1H), 8,09 (d, 1H), 7,32 - 7,30 (m, 4H), 4,03 - 3,92 (m, 2H), 2,39 (s, 3H), 1,13 (t,</p> | |

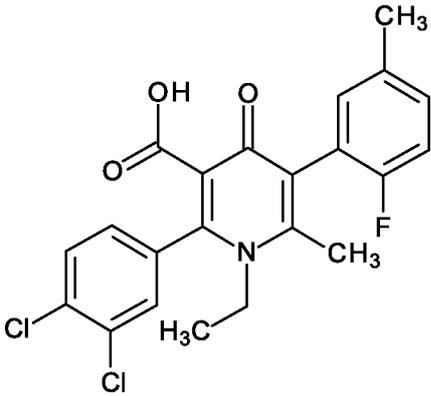
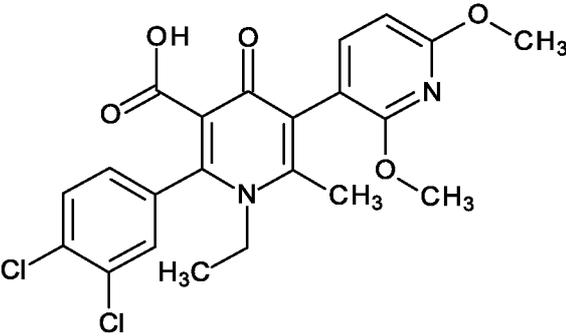
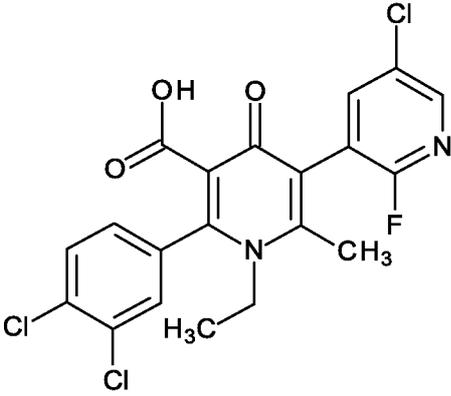
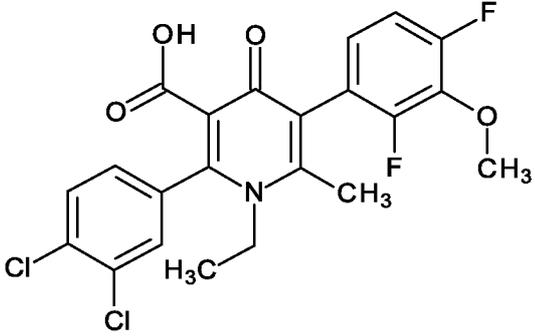
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ^1H ЯМР | LC/MS |
|--------------|---|---|-------|
| 212 | Метил-2-(5,6-дихлор-3-пиридил)-1-этил-5-(4-фторфенил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилат |  <p data-bbox="569 649 1270 741">^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 8,45 (d, 1H), 7,92 (d, 1H), 7,24 (d, 2H), 7,15 (d, 2H), 3,88 (q, 2H), 3,65 (s, 3H), 2,29 (s, 3H), 1,19 (t, 3H)</p> | |
| 213 | Метил-2-(5,6-дихлор-3-пиридил)-5-(2,4-дифторфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилат |  <p data-bbox="569 1108 1270 1200">^1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ = 8,56 (dd, 1H), 8,50 (dd, 1H), 7,32 (m, 2H), 7,17 (m, 1H), 3,85 (m, 2H), 3,45 (s, 3H), 2,22 (s, 3H), 1,17 (s, 3H)</p> | |
| 214 | Метил-5-(2,4-дихлорфенил)-2-(5,6-дихлор-3-пиридил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилат |  <p data-bbox="569 1568 1270 1659">^1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ = 8,56 (dd, 1H), 8,50 (dd, 1H), 7,87 (d, 1H), 7,39 (m, 1H), 7,22 (m, 1H), 3,81 (m, 2H), 3,45 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 1,11 (s, 3H)</p> | |
| 215 | Метил-5-(4-хлорфенил)-2-(5,6-дихлор-3-пиридил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилат |  <p data-bbox="569 2027 1270 2033">^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 8,41 (d, 1H), 7,92 (d, 1H),</p> | |

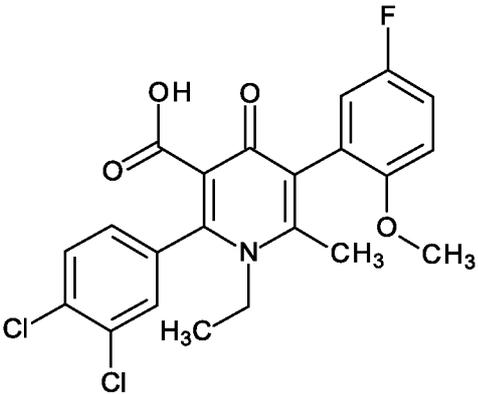
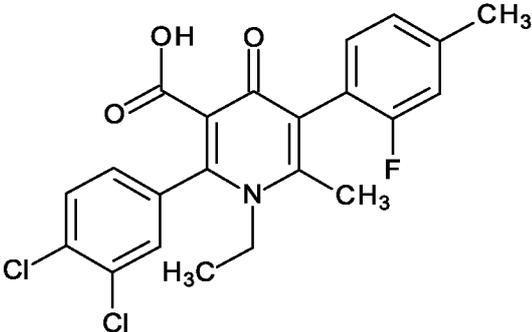
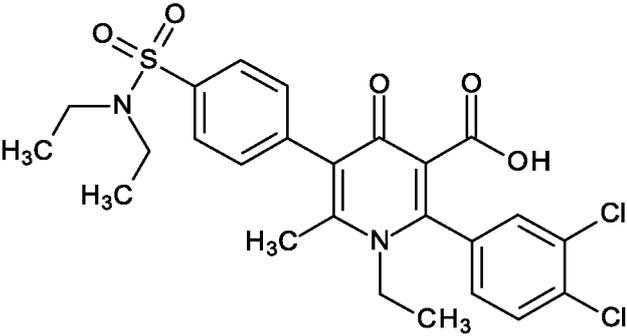
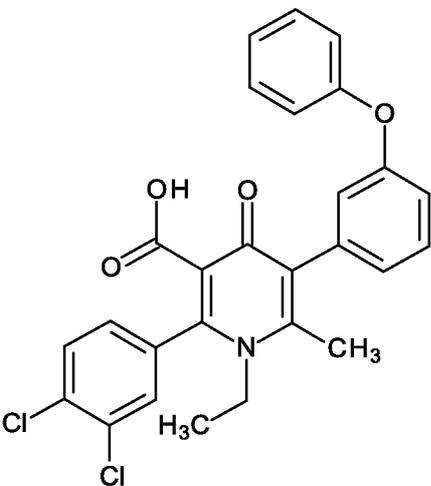
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|--|---|-------|
| 216 | 5-(4-Хлор-3-нитрофенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота | <p>7,44 (d, 2H), 7,15 (d, 2H), 3,88 (q, 2H), 3,65 (s, 3H), 2,29 (s, 3H), 1,19 (t, 3H)</p>  <p>¹H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,82 (d, 1H), 7,69 (d, 1H), 7,61 (d, 1H), 7,46 (dd, 1H), 7,40 (d, 1H), 7,16 (dd, 1H), 2,46 (s, 3H), 1,88 (q, 2H), 1,27 (t, 3H)</p> | |
| 217 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-[6-(трифторметил)-2-пиридил]пиридин-3-карбоновая кислота |  <p>¹H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 8,04 (t, 1H), 7,76 (t, 2H), 7,62 (d, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,14 (dd, 1H), 3,95 (q, 2H), 2,47 (s, 3H), 1,31 - 1,24 (m, 3H)</p> | |
| 218 | Метил-6-(бромметил)-5-(4-хлорфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-4-оксопиридин-3-карбоксилат |  <p>¹H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,60 (d, 1H), 7,58 (d, 1H), 7,44 (d, 2H), 7,36 - 7,30 (m, 3H), 4,24 (s, 2H), 3,99 (q, 2H), 3,58 (s, 3H), 1,25 - 1,21 (m, 3H)</p> | |

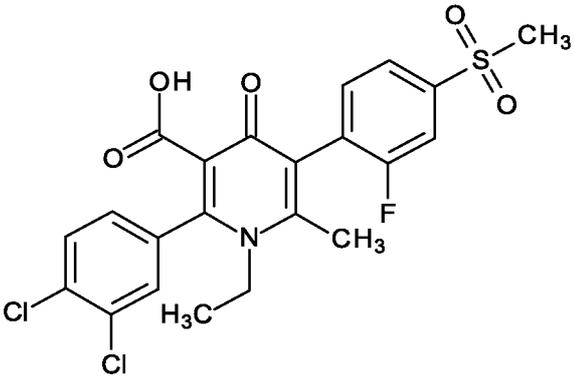
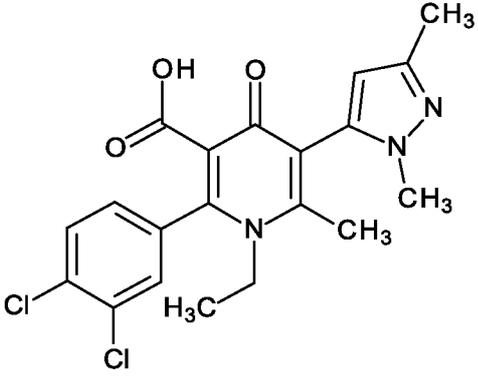
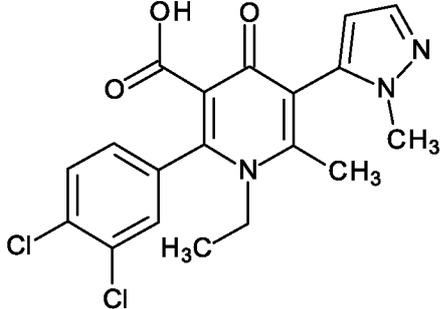
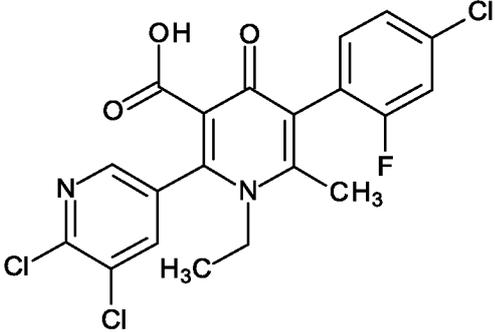
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|---|--|--|
| 219 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-(2-хинолил)пиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="568 674 1270 797">1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 8,33 (d, 1H), 8,12 (d, 1H), 7,92 (d, 1H), 7,78 (ddd, 1H), 7,66 - 7,61 (m, 2H), 7,57 (d, 1H), 7,40 (d, 1H), 7,16 (dd, 1H), 4,02 - 3,92 (m, 2H), 2,48 (s, 3H), 1,28 (t, 3H)</p> | |
| 220 | 5-(3-Хлор-2-фторфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R ₁ = 2,44 мин. (B); MS: масса/заряд = 454,1 (M+1) |
| 221 | 5-(4-Циано-2-метилсульфанилфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R ₁ = 2,29 мин. (B); MS: масса/заряд = 473,1 (M+1) |
| 222 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-5-(5-фтор-2-метилфенил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R ₁ = 2,37 мин. (B); MS: масса/заряд = 434,2 (M+1) |

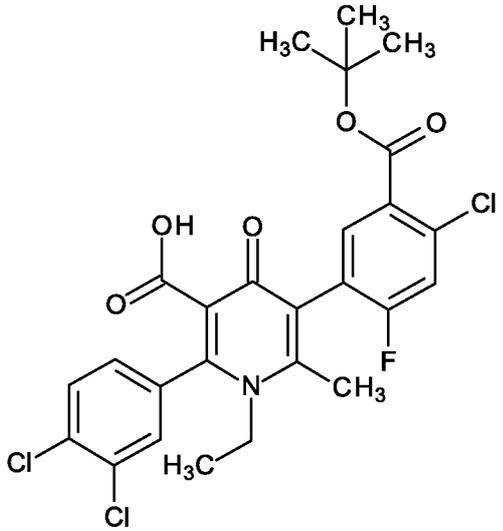
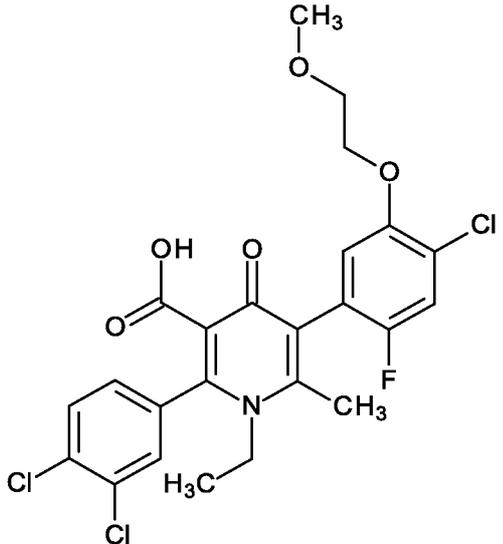
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|--|--|--|
| 223 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-5-(2,2-дифтор-1,3-бензодиоксол-4-ил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,48 мин. (B); MS: масса/заряд = 482,1 (M+1) |
| 224 | 5-[2-Хлор-5-(трифторметокси)фенил]-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,61 мин. (B); MS: масса/заряд = 520,1 (M+1) |
| 225 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-5-(2,5-диметилфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,47 мин. (B); MS: масса/заряд = 430,2 (M+1) |
| 226 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-5-(6-фтор-2-метил-3-пиридил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,07 мин. (B); MS: масса/заряд = 435,1 (M+1) |

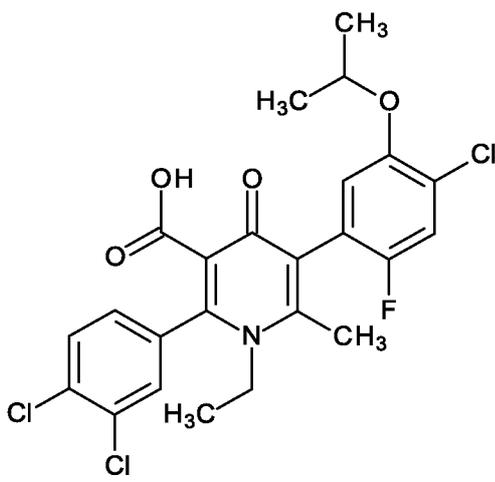
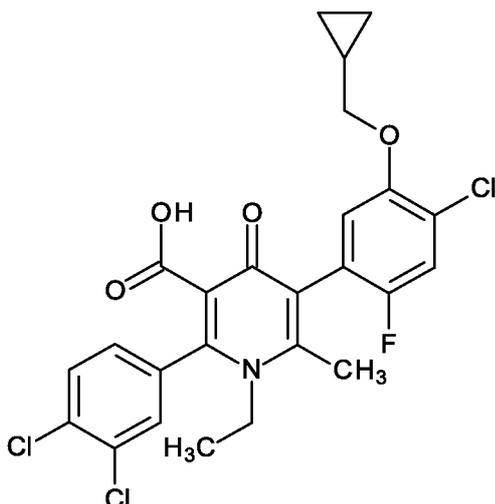
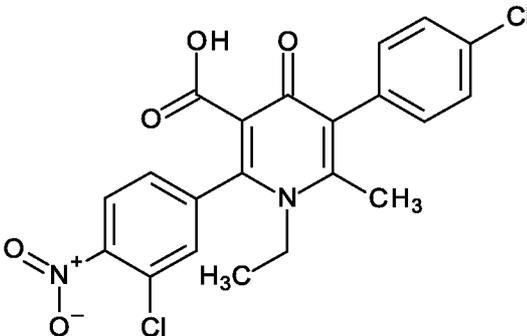
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ Н ЯМР | LC/MS |
|--------------|---|--|--|
| 227 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-5-(2,4-дифтор-3-метилфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,45 мин. (B); MS: масса/заряд = 452,1 (M+1) |
| 228 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-5-(2-фтор-3-метилфенил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,40 мин. (B); MS: масса/заряд = 434,1 (M+1) |
| 229 | 5-(5-Хлор-2-фторфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,43 мин. (B); MS: масса/заряд = 454,1 (M+1) 2,43 |
| 230 | 5-(4-Циано-2-метилфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,25 мин. (B); MS: масса/заряд = 441,2 (M+1) |

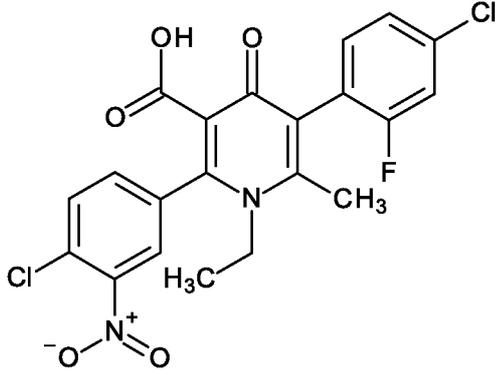
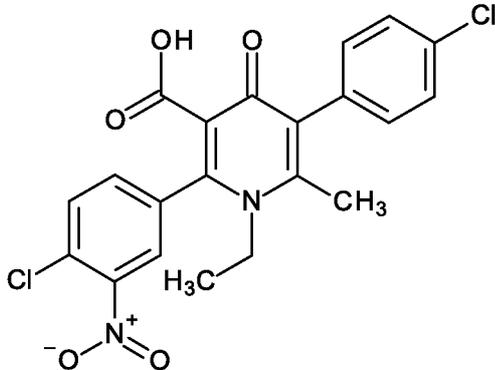
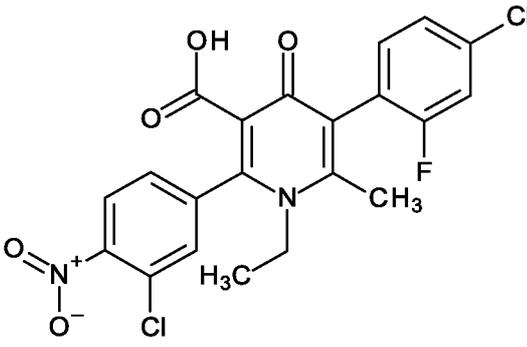
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|---|--|--|
| 231 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-5-(2-фтор-5-метилфенил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,41 мин. (B); MS: масса/заряд = 434,1 (M+1) |
| 232 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-5-(2,6-диметокси-3-пиридил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,34 мин. (B); MS: масса/заряд = 463,2 (M+1) |
| 233 | 5-(5-Хлор-2-фтор-3-пиридил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,27 мин. (B); MS: масса/заряд = 455,1 (M+1) 2,27 |
| 234 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-5-(2,4-дифтор-3-метоксифенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,34 мин. (B); MS: масса/заряд = 468,1 (M+1) |

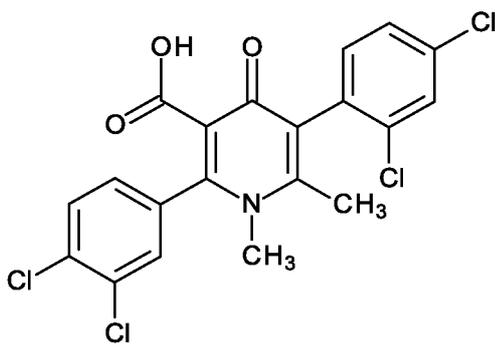
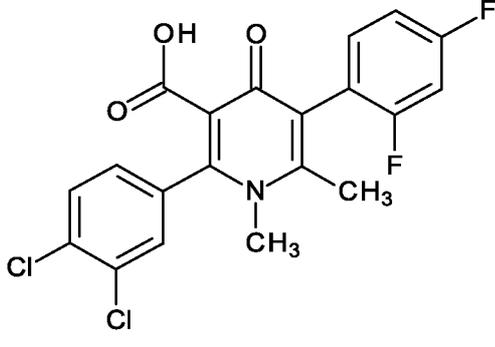
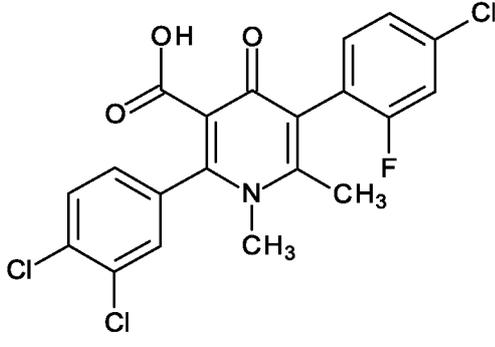
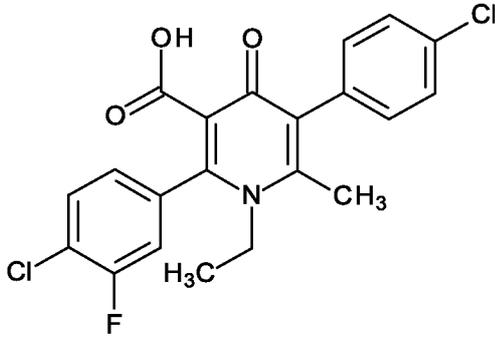
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|---|--|--|
| 235 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-5-(5-фтор-2-метоксифенил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,29 мин. (B); MS: масса/заряд = 450,1 (M+1) |
| 236 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-5-(2-фтор-4-метилфенил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,42 мин. (B); MS: масса/заряд = 434,1 (M+1) |
| 237 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-5-[4-(диэтилсульфамойл)фенил]-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,37 мин. (B); MS: масса/заряд = 537,2 (M+1) |
| 238 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-(3-феноксифенил)пиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,63 мин. (B); MS: масса/заряд = 494,2 (M+1) |

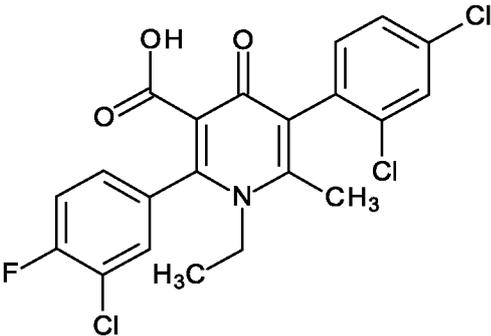
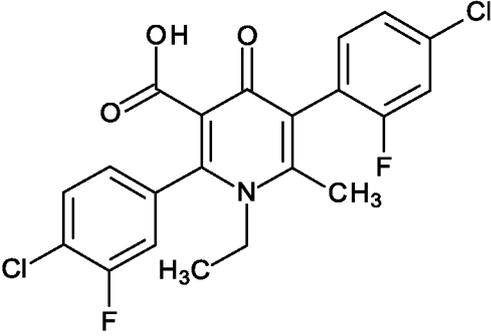
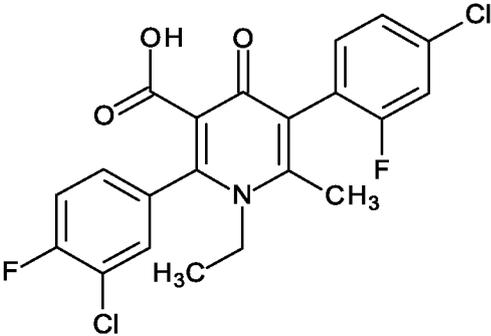
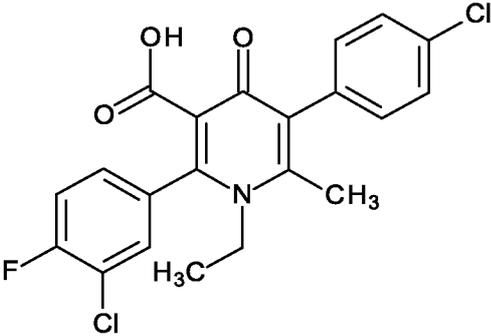
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|--|--|---|
| 239 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-5-(2-фтор-4-метилсульфонилфенил)-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,07 мин. (B); MS: масса/заряд = 498,1 (M+1) |
| 240 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-5-(2,5-диметилпиразол-3-ил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 1,86 мин. (B); MS: масса/заряд = 420,2 (M+1) |
| 241 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-6-метил-5-(2-метилпиразол-3-ил)-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 1,84 мин. (B); MS: масса/заряд = 406,1 (M+1) |
| 242 | 5-(4-Хлор-2-фторфенил)-2-(5,6-дихлор-3-пиридил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="571 1769 1268 1859">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ = 8,48 (m, 1,5H), 7,62 - 7,58 (m, 1,5H), 7,45 - 7,42 (m, 1H), 7,38 - 7,31 (m, 1H), 3,98 - 3,94 (m, 2H), 2,40 (s, 3H), 1,13 (t, 3H)</p> | |

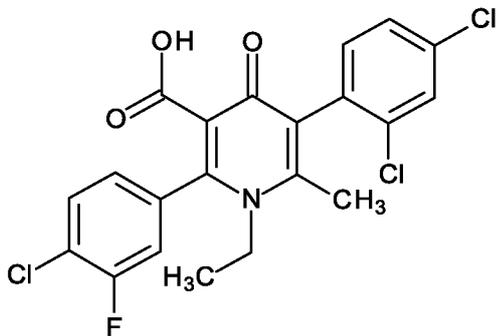
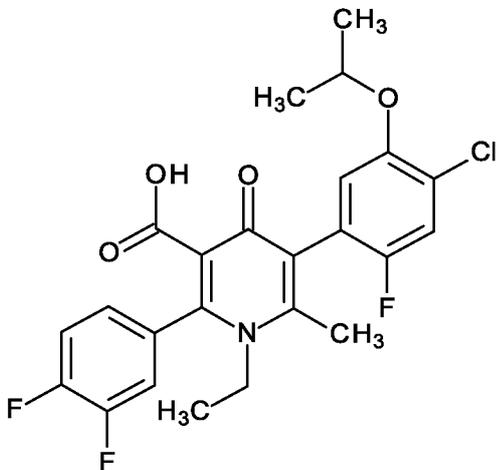
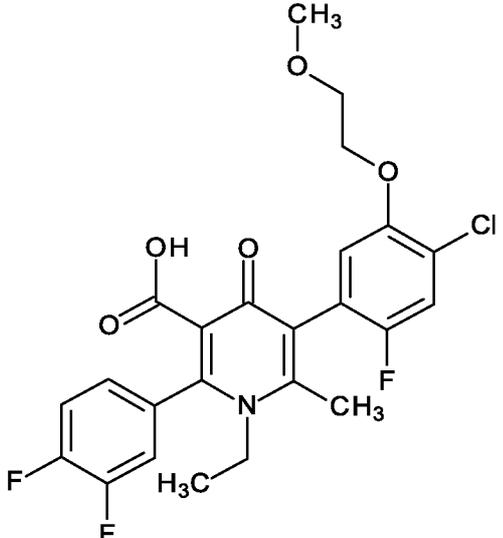
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|--|--|-------|
| 243 | 5-(5-трет-Бутоксикарбонил-4-хлор-2-(фторфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="569 806 1273 929">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ = 7,91 (d, 0,5H), 7,82 - 7,79 (m, 1H), 7,76 - 7,68 (m, 2,5H), 7,57 - 7,54 (m, 0,5H), 7,42 - 7,40 (m, 0,5H), 3,89 - 3,88 (m, 2H), 2,39 (s, 3H), 1,55 (s, 9H), 1,13 (t, 3H)</p> | |
| 244 | 5-[4-Хлор-2-фтор-5-(2-метоксиэтоксифенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="569 1500 1273 1628">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ = 7,93 (d, 0,5H), 7,81 - 7,74 (m, 1,5H), 7,60 - 7,53 (m, 1,5H), 7,41 - 7,38 (m, 0,5H), 7,10 - 7,04 (m, 1H), 4,20 - 4,09 (m, 2H), 3,95 - 3,81 (m, 2H), 3,68 (s, 2H), 3,38 (s, 3H), 2,41 (s, 3H), 1,13 (t, 3H)</p> | |

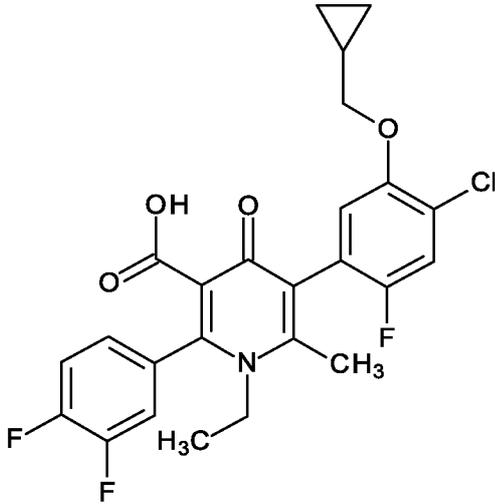
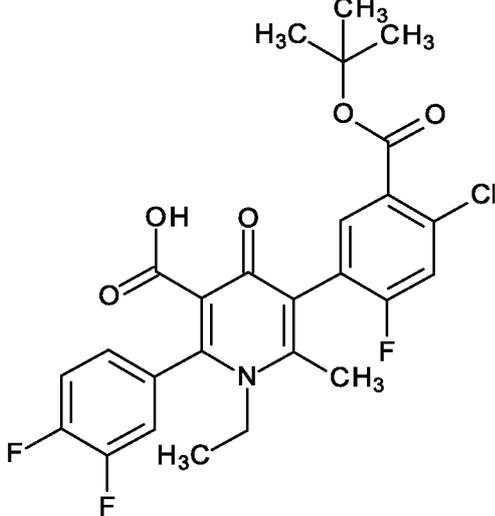
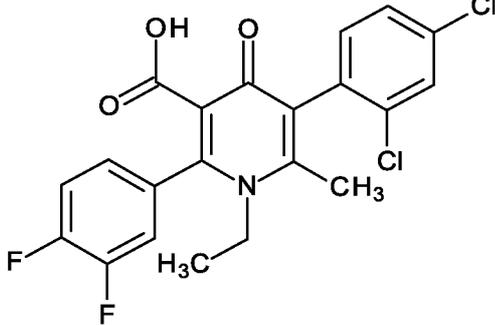
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|---|--|-------|
| 245 | 5-(4-Хлор-2-фтор-5-изопропоксифенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="568 750 1270 875">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ = 7,93 (d, 0,5H), 7,81 - 7,73 (m, 1,5H), 7,58 - 7,54 (m, 1,5H), 7,40 - 7,38 (m, 0,5H), 7,11 - 7,04 (m, 1H), 4,64 - 4,58 (m, 1H), 3,94 - 3,87 (m, 2H), 2,41 (s, 3H), 1,30 - 1,28 (m, 6H), 1,13 (t, 3H)</p> | |
| 246 | 5-[4-Хлор-5-(циклопропилметокси)-2-фторфенил]-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="568 1400 1270 1536">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ = 7,90 (d, 0,5H), 7,80 - 7,71 (m, 1,5H), 7,57 - 7,52 (m, 1,5H), 7,39 - 7,37 (d, 0,5H), 7,04 - 6,98 (dd, 1H), 3,93 - 3,85 (m, 4H), 2,38 (s, 3H), 1,24 - 1,22 (m, 1H), 1,13 (t, 3H), 0,59 - 0,56 (m, 2H), 0,35 - 0,33 (m, 2H)</p> | |
| 247 | 2-(3-Хлор-4-нитрофенил)-5-(4-хлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="568 1892 1270 1989">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ = 8,21 (d, 1H), 8,00 (d, 1H), 7,73 - 7,70 (dd, 1H), 7,57 - 7,55 (d, 2H), 7,29 (d, 2H), 3,92 - 3,87 (q, 2H), 2,40 (s, 3H), 1,14 (t, 3H)</p> | |

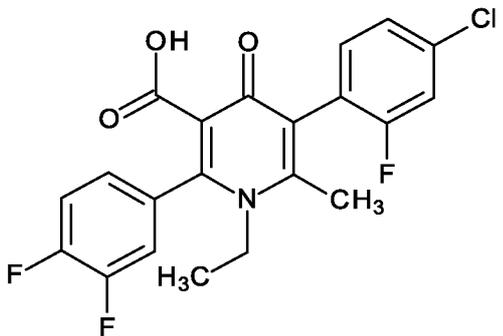
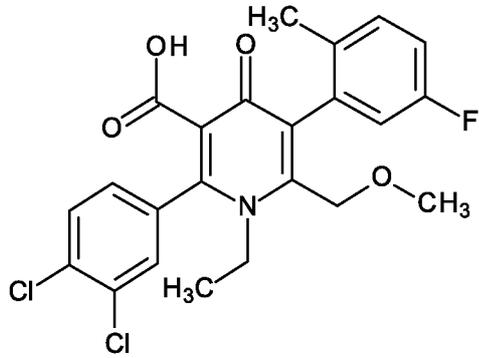
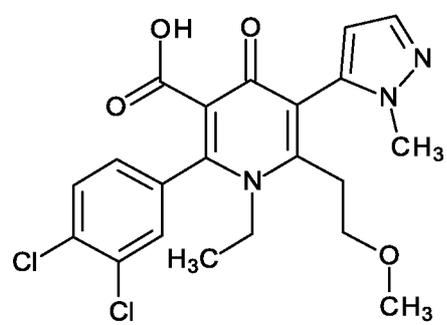
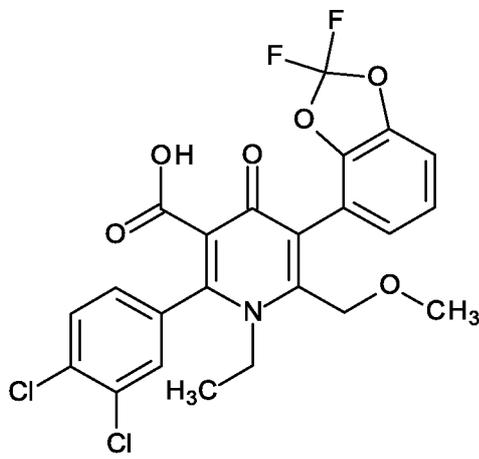
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|--|---|-------|
| 248 | 5-(4-Хлор-2-фторфенил)-2-(4-хлор-3-нитрофенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="566 649 1273 745">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ = 8,43 (d, 1H), 7,91 - 7,99 (m, 1H), 7,59 - 7,77 (m, 2H), 7,42 (m, 1H), 7,35 (m, 1H), 3,82 (s, 2H), 2,39 (m, 3H), 1,13 (t, 3H)</p> | |
| 249 | 2-(4-Хлор-3-нитрофенил)-5-(4-хлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="566 1142 1273 1243">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ = 8,29 (d, 1H), 7,95 (d, 1H), 7,85 (d, 1H), 7,54 (d, 2H), 7,29 (d, 2H), 3,91 (q, 2H), 2,39 (m, 3H), 1,13 (t, 3H)</p> | |
| 250 | 5-(4-Хлор-2-фторфенил)-2-(3-хлор-4-нитрофенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="566 1612 1273 1727">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ = 8,24 - 8,21 (dd, 1H), 8,11 (d, 0,5H), 7,99 (d, 0,5H), 7,82 - 7,80 (dd, 0,5H), 7,71 - 7,69 (dd, 0,5H), 7,62 - 7,59 (dd, 1H), 7,45 - 7,43 (dd, 1H), 7,39 - 7,32 (m, 1H), 3,93 - 3,87 (m, 2H), 2,40 (d, 3H), 1,14 (t, 3H)</p> | |

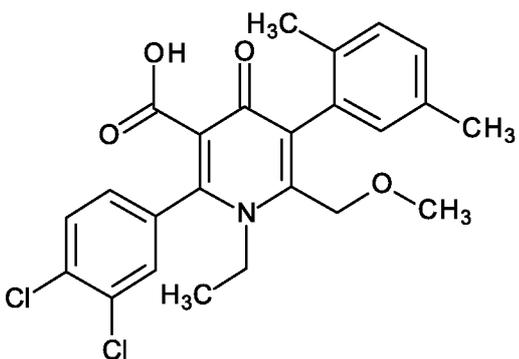
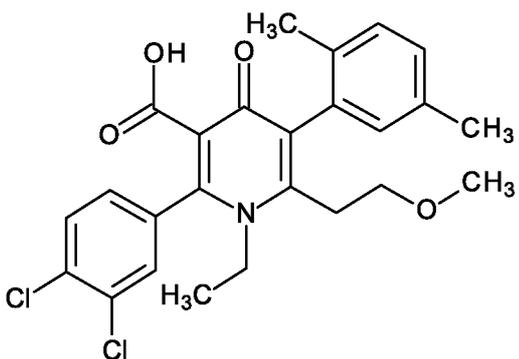
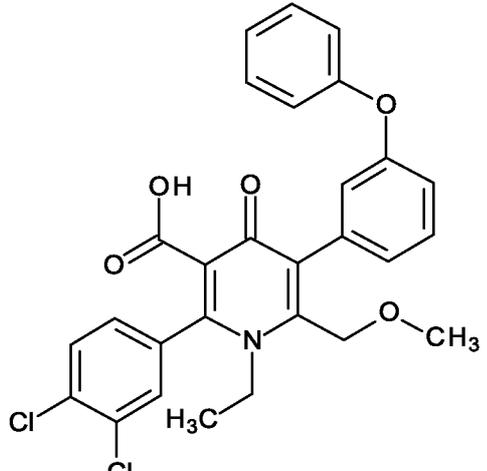
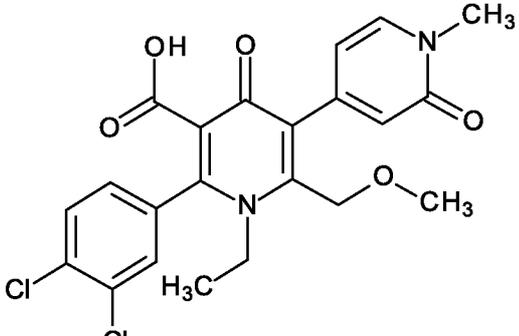
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|---|---|-------|
| 251 | 5-(2,4-Дихлорфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1,6-диметил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="574 616 1260 705">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ = 7,80 (m, 2H), 7,68 (d, 1H), 7,56 (m, 1H), 7,44 (m, 1H), 7,31 (m, 1H), 3,40 (s, 3H), 2,26 (d, 3H)</p> | |
| 252 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-5-(2,4-дифторфенил)-1,6-диметил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="574 1086 1260 1131">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ = 7,69 (m, 2H), 7,38 (m, 3H), 7,21 (t, 1H), 3,39 (s, 3H), 2,32 (s, 3H)</p> | |
| 253 | 5-(4-Хлор-2-фторфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1,6-диметил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="574 1512 1260 1556">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ = 7,80 (m, 2H), 7,58 (m, 1H), 7,42 (m, 3H), 3,39 (s, 3H), 2,33 (s, 3H)</p> | |
| 254 | 2-(4-Хлор-3-фторфенил)-5-(4-хлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="574 1937 1260 1982">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ = 7,82 (t, 1H), 7,65 (d, 1H), 7,56 (d, 2H), 7,32 (m, 3H), 3,91 (q, 2H), 3,37 (s, 3H), 1,13 (t, 3H)</p> | |

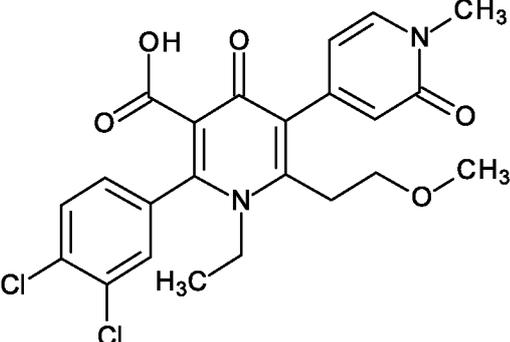
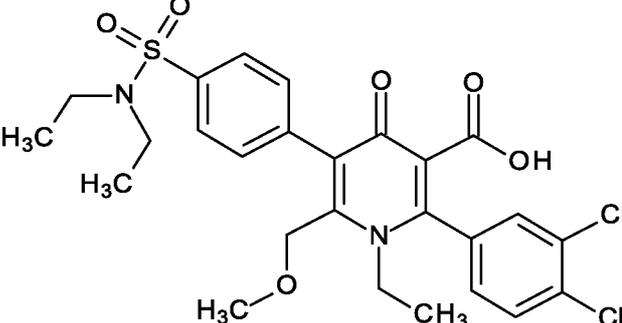
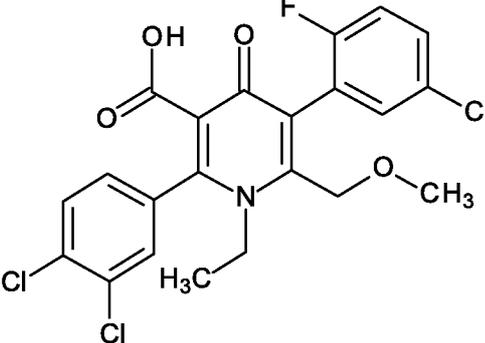
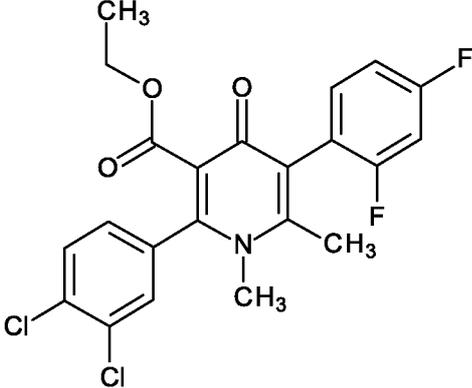
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|---|--|-------|
| 255 | 2-(3-Хлор-4-фтор-фенил)-5-(2,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="569 616 1270 741">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ = 7,90 - 7,88 (m, 0,5H), 7,82 - 7,81 (t, 1H), 7,76 - 7,74 (dd, 0,5H), 7,58 - 7,55 (m, 2,5H), 7,47 - 7,43 (m, 0,5H), 7,36 - 7,31 (m, 1H), 3,94 - 3,88 (q, 2H), 2,31 (d, 3H), 1,11 (t, 3H)</p> | |
| 256 | 5-(4-Хлор-2-фторфенил)-2-(4-хлор-3-фторфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="569 1108 1270 1167">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ = 7,81 - 7,55 (m, 3H), 7,39 (m, 3H), 3,95 (q, 2H), 3,27 (s, 3H), 1,13 (t, 3H)</p> | |
| 257 | 2-(3-Хлор-4-фторфенил)-5-(4-хлор-2-фторфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="569 1534 1270 1626">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ = 7,86 (d, 0,5H), 7,75 (t, 0,5H), 7,60 - 7,55 (m, 2,5H), 7,47 - 7,41 (m, 1,5H), 7,39 - 7,32 (m, 1H), 3,94 - 3,89 (m, 2H), 2,38 (s, 3H), 1,12 (t, 3H)</p> | |
| 258 | 2-(3-Хлор-4-фторфенил)-5-(4-хлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="569 1993 1270 2020">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ = 7,77 (m, 1H), 7,57 (m, 3H),</p> | |

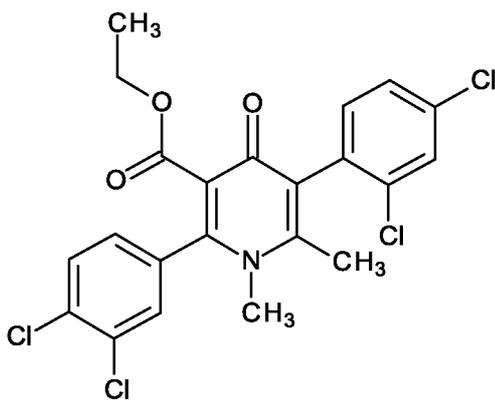
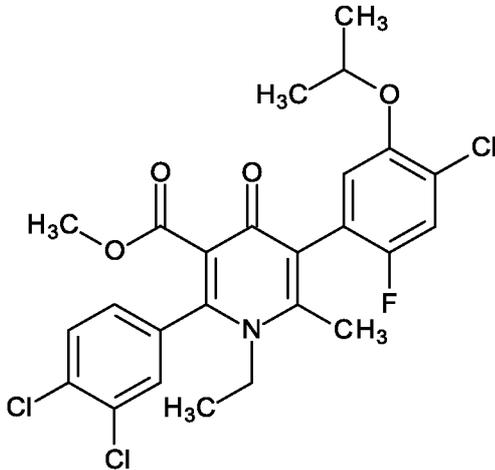
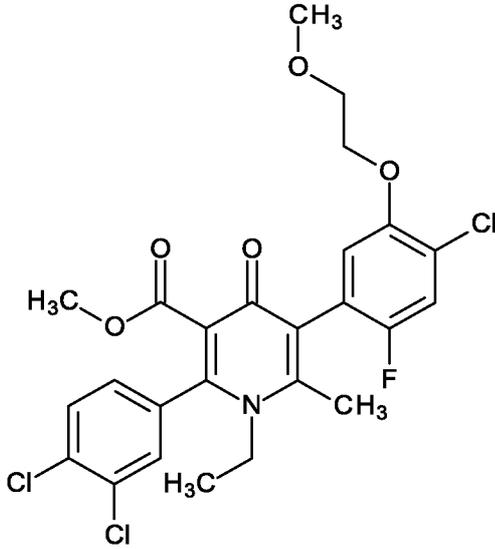
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|--|---|-------|
| 259 | 2-(4-Хлор-3-фтор-фенил)-5-(2,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота | <p>7,47 (m, 1H), 7,29 (d, 2H), 3,89 (q, 2H), 2,38 (s, 3H), 1,12 (t, 3H)</p>  <p>¹H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ = 7,88 (s, 1H), 7,79 - 7,63 (m, 3H), 7,42 (m, 2H), 3,90 (q, 2H), 3,27 (s, 3H), 1,13 (t, 3H)</p> | |
| 260 | 5-(4-Хлор-2-фтор-5-изопропоксифенил)-2-(3,4-дифторфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p>¹H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ = 7,78 - 7,73 (m, 0,5H), 7,64 - 7,54 (m, 2,5H), 7,40 - 7,38 (m, 0,5H), 7,24 - 7,21 (m, 0,5H), 7,11 - 7,06 (m, 1H), 4,64 - 4,57 (m, 1H), 3,91 - 3,90 (m, 2H), 2,41 (s, 3H), 1,30 - 1,28 (m, 6H), 1,13 (t, 3H)</p> | |
| 261 | 5-[4-Хлор-2-фтор-5-(2-метоксиэтокси)фенил]-2-(3,4-дифторфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p>¹H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ = 7,79 - 7,74 (m, 0,5H), 7,63 - 7,57 (m, 2,5H), 7,39 - 7,38 (m, 0,5H), 7,25 - 7,23 (m, 0,5H), 7,11 - 7,05 (m, 1H), 4,22 - 4,13 (m, 2H), 3,93 - 3,88 (m, 2H),</p> | |

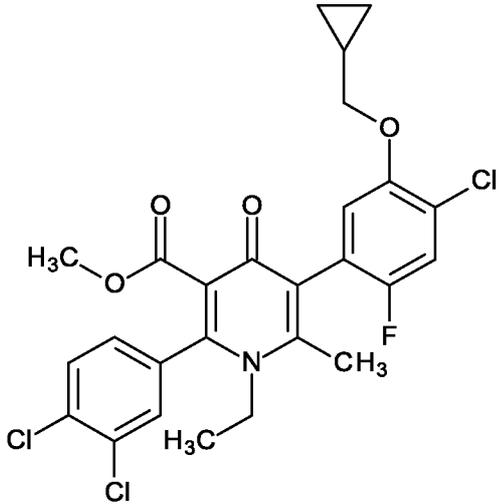
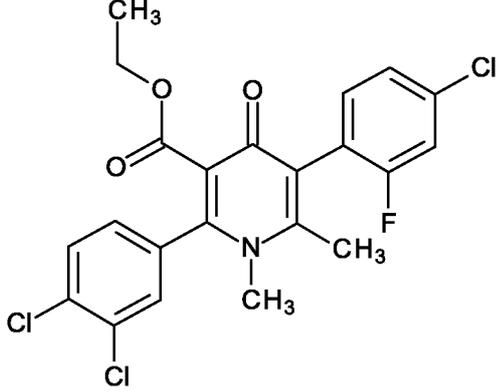
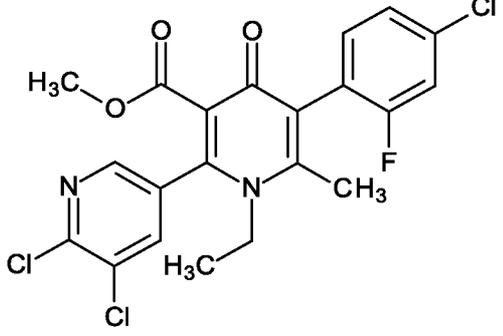
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|---|---|-------|
| 262 | 5-[4-Хлор-5-(циклопропилметокси)-2-фторфенил]-2-(3,4-дифторфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота | <p>3,68 (t, 2H), 3,41 (s, 3H), 2,41 (s, 3H), 1,13 (t, 3H)</p>  <p>¹H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ = 7,79 - 7,73 (m, 0,5H), 7,64 - 7,56 (m, 2,5H), 7,39 - 7,38 (m, 0,5H), 7,23 - 7,22 (m, 0,5H), 7,06 - 7,00 (m, 1H), 3,95 - 3,85 (m, 4H), 2,40 (s, 3H), 1,27 - 1,22 (m, 1H), 1,13 (t, 3H), 0,60 - 0,56 (m, 2H), 0,36 - 0,32 (m, 2H)</p> | |
| 263 | 5-(5-трет-Бутоксикарбонил-4-хлор-2-фторфенил)-2-(3,4-дифторфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p>¹H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ = 7,74 - 7,68 (m, 2,5H), 7,62 - 7,60 (m, 1,5H), 7,38 - 7,40 (m, 0,5H), 7,35 - 7,26 (m, 0,5H), 3,89 - 3,88 (m, 2H), 2,39 (s, 3H), 1,55 (s, 9H), 1,13 (t, 3H)</p> | |
| 264 | 5-(2,4-Дихлорфенил)-2-(3,4-дифторфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p>¹H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ = 7,81 - 7,75 (m, 1,5H), 7,66 -</p> | |

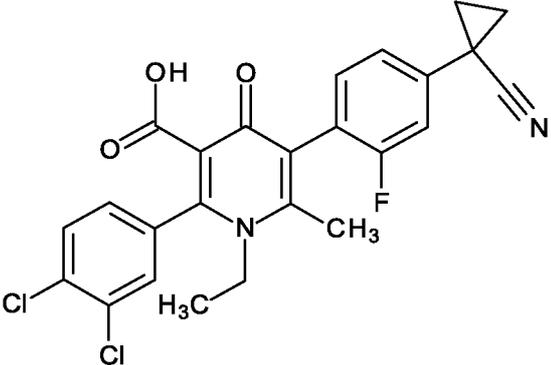
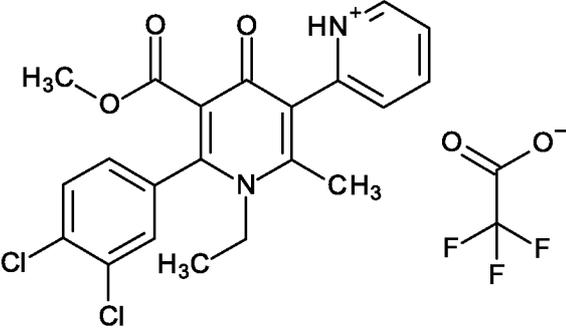
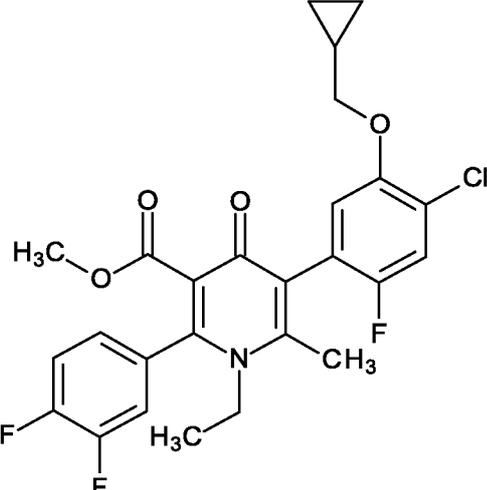
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|---|---|--|
| | | 7,55 (m, 2,5H), 7,39 - 7,32 (m, 1,5H), 7,28 - 7,26 (m, 0,5H), 3,89 - 3,87 (m, 2H), 2,32 (s, 3H), 1,1 2 (t, 3H) | |
| 265 | 5-(4-Хлор-2-фторфенил)-2-(3,4-дифторфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="568 672 1273 772">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ = 7,78 - 7,73 (m, 0,5H), 7,66 - 7,56 (m, 2,5H), 7,44 - 7,33 (m, 2,5H), 7,29 - 7,27 (m, 0,5H), 3,92 - 3,90 (m, 2H), 2,38 (s, 3H), 1,12 (t, 3H)</p> | |
| 266 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-5-(5-фтор-2-метилфенил)-6-(метоксиметил)-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,44 мин. (B); MS: масса/заряд = 464,3 (M+1) |
| 267 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-6-(2-метоксиэтил)-5-(2-метилпиразол-3-ил)-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,14 мин. (B); MS: масса/заряд = 450,1 (M+1) |
| 268 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-5-(2,2-дифтор-1,3-бензодиоксол-4-ил)-1-этил-6-(метоксиметил)-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,53 мин. (B); MS: масса/заряд = 512,2 (M+1) |

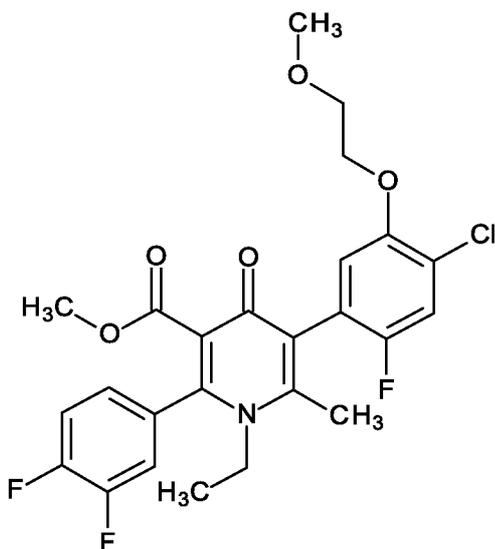
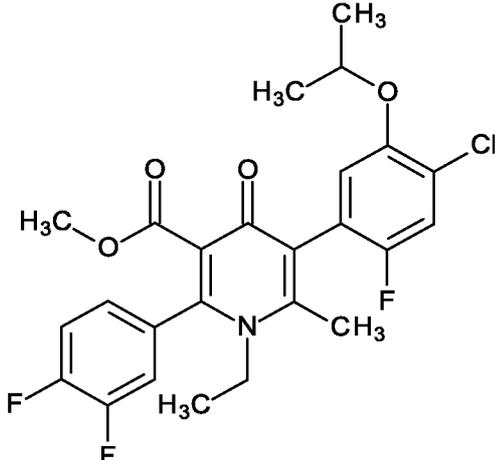
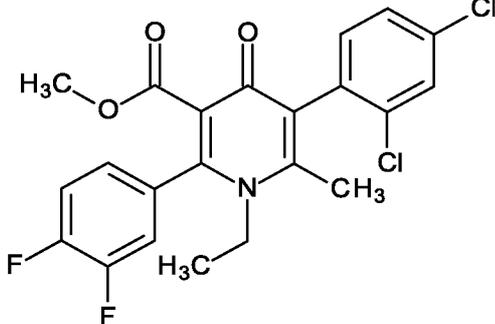
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ Н ЯМР | LC/MS |
|--------------|---|--|--|
| 269 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-5-(2,5-диметилфенил)-1-этил-6-(метоксиметил)-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,56 мин. (B); MS: масса/заряд = 460,3 (M+1) |
| 270 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-5-(2,5-диметилфенил)-1-этил-6-(2-метоксиэтил)-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,53 мин. (B); MS: масса/заряд = 474,3 (M+1) |
| 271 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-6-(метоксиметил)-4-оксо-5-(3-феноксифенил)пиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,70 мин. (B); MS: масса/заряд = 524,3 (M+1) |
| 272 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-6-(метоксиметил)-5-(1-метил-2-оксо-4-пиридил)-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 1,75 мин. (B); MS: масса/заряд = 462,9 (M+1) |

| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|---|---|---|
| 273 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-1-этил-6-(2-метоксиэтил)-5-(1-метил-2-оксо-4-пиридил)-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 1,74 мин. (B); MS: масса/заряд = 477,3 (M+1) |
| 274 | 2-(3,4-Дихлорфенил)-5-[4-(диэтилсульфамонил)фенил]-1-этил-6-(метоксиметил)-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,44 мин. (B); MS: масса/заряд = 567,3 (M+1) |
| 275 | 5-(5-Хлор-2-фторфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-(метоксиметил)-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  | R _t = 2,49 мин. (B); MS: масса/заряд = 484,2 (M+1) |
| 276 | Этил-2-(3,4-дихлорфенил)-5-(2,4-дифторфенил)-1,6-диметил-4-оксопиридин-3-карбоксилат |  <p data-bbox="571 1809 1273 1899">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ = 7,82 (m, 2H), 7,49 (m, 1H), 7,24 (m, 2H), 7,14 (m, 1H), 3,87 (m, 2H), 3,33 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 0,84(t, 3H)</p> | |

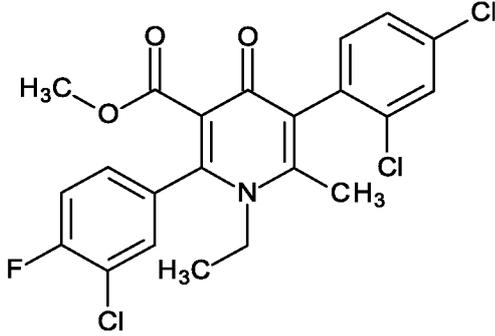
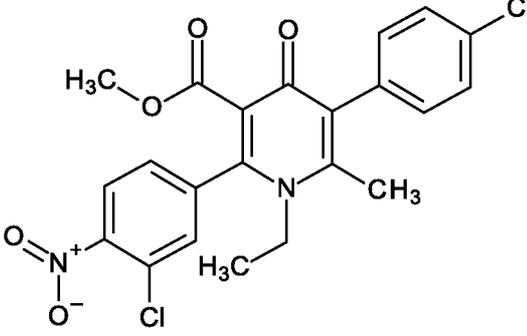
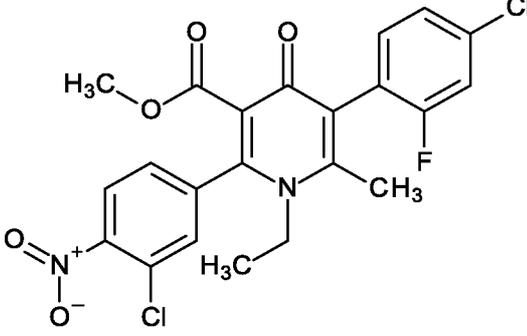
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|---|---|-------|
| 277 | Этил-5-(2,4-дихлорфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1,6-диметил-4-оксопиридин-3-карбоксилат |  <p data-bbox="566 672 1268 824">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ = 7,96 (d, 0,5H), 7,83 - 7,78 (m, 1,5H), 7,58 - 7,56 (dd, 0,5H), 7,50 - 7,42 (m, 1,5H), 6,96 - 6,90 (m, 1H), 3,93 - 3,76 (m, 4H), 3,37 (s, 3H), 2,26 (s, 3H), 1,27 - 1,19 (m, 1H), 1,09 (t, 3H), 0,59 - 0,56 (m, 2H), 0,35 - 0,33 (m, 2H)</p> | |
| 278 | Метил-5-(4-хлор-2-фтор-5-изопропоксифенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилат |  <p data-bbox="566 1321 1268 1417">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ = 7,83 (m, 1H), 7,77 (d, 1H), 7,50 (m, 2H), 7,42 (dd, 1H), 7,24 (m, 1H), 3,86 (m, 2H), 3,33 (s, 3H), 2,20 (s, 3H), 0,85 (t, 3H)</p> | |
| 279 | Метил-5-[4-хлор-2-фтор-5-(2-метоксиэтокси)фенил]-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилат |  <p data-bbox="566 1993 1268 2022">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ = 7,77 (m, 3H), 7,84 (m, 2H),</p> | |

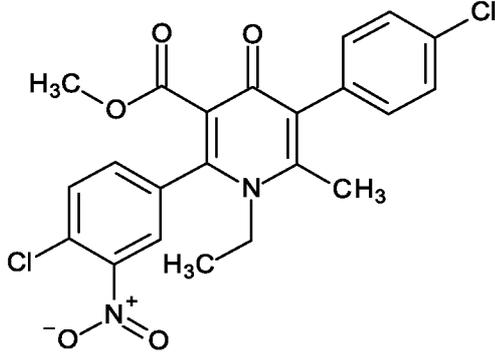
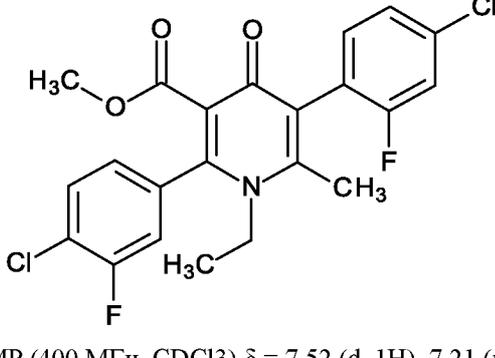
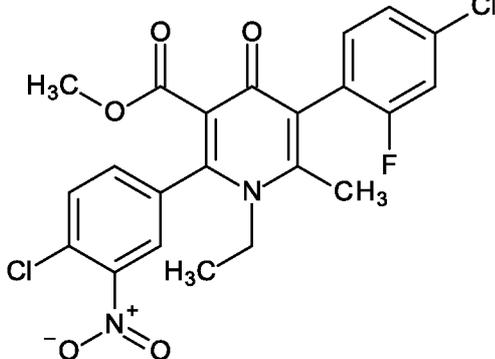
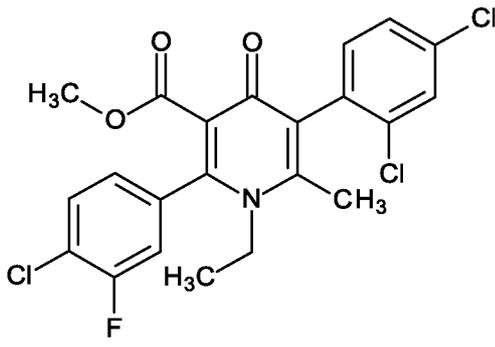
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|--|---|-------|
| 280 | Метил-5-[4-хлор-5-(циклопропилметокси)-2-фторфенил]-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилат |  <p data-bbox="566 817 1273 943">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ = 7,98 (d, 0,5H), 7,83 - 7,79 (m, 1,5H), 7,59 - 7,56 (dd, 0,5H), 7,50 - 7,43 (m, 1,5H), 7,02 - 6,95 (m, 1H), 4,63 - 4,57 (m, 1H), 3,85 - 3,74 (m, 2H), 3,38 (s, 3H), 2,28 (s, 3H), 1,29 - 1,27 (m, 6H), 1,09 (t, 3H)</p> | |
| 281 | Этил-5-(4-хлор-2-фторфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1,6-диметил-4-оксопиридин-3-карбоксилат |  <p data-bbox="566 1366 1273 1489">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ = 7,98 (d, 0,5H), 7,83 - 7,82 (m, 1,5H), 7,59 - 7,43 (m, 2H), 7,02 - 6,95 (m, 1H), 4,20 - 4,09 (m, 2H), 3,85 - 3,67 (m, 4H), 3,66 (s, 3H), 3,33 (s, 3H), 2,28 (s, 3H), 1,09 (t, 3H)</p> | |
| 282 | Метил-5-(4-хлор-2-фторфенил)-2-(5,6-дихлор-3-пиридил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилат |  <p data-bbox="566 1859 1273 1944">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ = 8,65 (dd, 1H), 8,59 (m, 1H), 7,54 (m, 1H), 7,44 (m, 1H), 7,28 (m, 1H), 3,80 - 3,75 (q, 2H), 3,36 (s, 3H), 2,26 (s, 3H), 1,12 (t, 3H)</p> | |

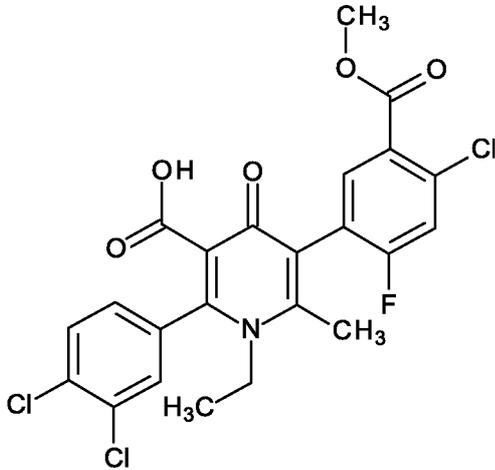
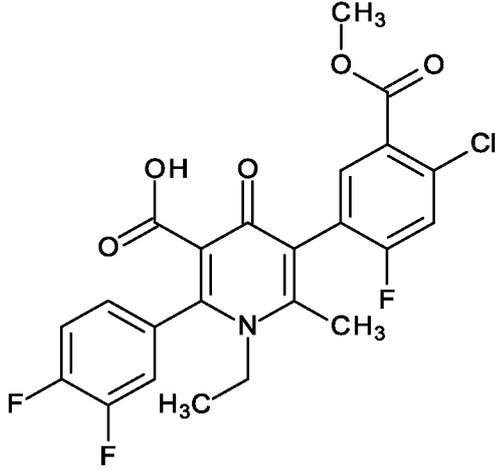
| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|--|--|-------|
| 283 | 5-[4-(1-Цианопропил)-2-фторфенил]-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  <p data-bbox="569 656 1270 779">1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,62 (dd, 1H), 7,42 (dd, 1H), 7,33 - 7,27 (m, 1H), 7,25 - 7,21 (m, 1H), 7,20 - 7,13 (m, 2H), 3,96 (q, 2H), 2,43 (d, 3H), 1,85 - 1,78 (m, 2H), 1,53 - 1,47 (m, 2H), 1,26 (t, 3H)</p> | |
| 284 | Метил-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксо-5-пиридин-1-ий-2-илпиридин-3-карбоксилат; 2,2,2-трифторацетат |  <p data-bbox="569 1149 1270 1267">1H ЯМР (400МГц, хлороформ) δ = 9,18 (brs, 1H), 8,95 (d, 1H), 8,42 (td, 1H), 7,98 (d, 1H), 7,85 (t, 1H), 7,62 (d, 1H), 7,57 (d, 1H), 7,32 (dd, 1H), 3,91 (q, 2H), 3,52 (s, 3H), 2,39 (s, 3H), 1,23 (t, 3H)</p> | |
| 285 | Метил-5-[4-хлор-5-(циклопропилметокси)-2-фторфенил]-2-(3,4-дифторфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилат |  <p data-bbox="569 1798 1270 1924">1 H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ = 7,85 (d, 0,5H), 7,67 - 7,59 (m, 1,5H), 7,50 - 7,28 (m, 2H), 6,96 - 6,90 (m, 1H), 3,93 - 3,76 (m, 4H), 3,37 (s, 3H), 2,26 (s, 3H), 1,27 - 1,19 (m, 1H), 1,09 (t, 3H), 0,59 - 0,56 (m, 2H), 0,35 - 0,33 (m, 2H)</p> | |

| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|---|--|-------|
| 286 | Метил-5-[4-хлор-2-фтор-5-(2-метоксиэтокси)фенил]-2-(3,4-дифторфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилат |  <p data-bbox="571 817 1268 981">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ = 7,85 - 7,80 (m, 0,5H), 7,68 - 7,58 (m, 1,5H), 7,51 - 7,48 (dd, 1H), 7,44 - 7,41 (m, 0,5H), 7,32 - 7,29 (m, 0,5H), 7,01 - 6,95 (m, 1H), 4,21 - 4,11 (m, 2H), 3,84 - 3,83 (m, 2H), 3,66 (t, 2H), 3,37 (s, 3H), 3,31 (s, 3H), 2,27 (s, 3H), 1,10 (t, 3H)</p> | |
| 287 | Метил-5-(4-хлор-2-фтор-5-изопропоксифенил)-2-(3,4-дифторфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилат |  <p data-bbox="571 1467 1268 1601">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ = 7,85 - 7,80 (m, 0,5H), 7,68 - 7,58 (m, 1,5H), 7,50 - 7,42 (m, 1,5H), 7,32 - 7,30 (m, 0,5H), 7,02 - 6,96 (m, 1H), 4,63 - 4,57 (m, 1H), 3,81 - 3,78 (m, 2H), 3,37 (s, 3H), 2,28 (s, 3H), 1,29 - 1,27 (m, 6H), 1,08 (t, 3H)</p> | |
| 288 | Метил-5-(2,4-дихлорфенил)-2-(3,4-дифторфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилат |  <p data-bbox="571 1960 1268 2027">1H ЯМР (400 МГц, DMSO) δ = 7,84 - 7,79 (m, 0,5H), 7,74 - 7,69 (m, 1,5H), 7,65 - 7,58 (m, 1H), 7,50 - 7,47 (dd, 1H), 7,43 -</p> | |

| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|--|---|-------|
| 289 | Метил-5-(4-хлор-2-фторфенил)-2-(3,4-дифторфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилат | <p>7,33 (m, 1H), 7,27 - 7,22 (m, 1H), 3,82 - 3,77 (m, 2H), 3,37 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 1,09 (t, 3H)</p> <p>¹H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ = 7,85 - 7,79 (m, 0,5H), 7,75 - 7,69 (m, 0,5H), 7,65 - 7,58 (m, 1H), 7,52 - 7,49 (m, 1H), 7,43 - 7,41 (m, 0,5H), 7,37 - 7,34 (m, 1,5H), 7,30 - 7,23 (m, 1H), 3,80 - 3,78 (m, 2H), 3,37 (s, 3H), 2,25 (s, 3H), 1,09 (t, 3H)</p> | |
| 290 | Метил-2-(3-хлор-4-фторфенил)-5-(4-хлор-2-фторфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилат | <p>¹H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ = 7,95 - 7,93 (dd, 1H), 7,85 - 7,61 (t, 1,5H), 7,59 - 7,51 (m, 0,5H), 7,34 - 7,24 (m, 2H), 7,18 - 7,13 (m, 1H), 3,79 (d, 2H), 3,37 (s, 3H), 2,25 (s, 3H), 1,09 (t, 3H)</p> | |
| 291 | Метил-2-(3-хлор-4-фторфенил)-5-(4-хлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилат | <p>¹H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ = 7,85 - 7,83 (q, 1H), 7,61 - 7,57 (t, 1H), 7,55 - 7,51 (m, 1H), 7,47 (d, 2H), 7,20 (d, 2H), 3,80 - 3,75 (q, 2H), 3,36 (s, 3H), 2,26 (s, 3H), 1,09 (t, 3H)</p> | |

| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|---|--|-------|
| 292 | Метил-2-(3-хлор-4-фторфенил)-5-(2,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилат |  <p data-bbox="574 616 1268 739">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ = 7,93 - 7,91 (dd, 0,5H), 7,83 (d, 0,5H), 7,74 (t, 1H), 7,62 - 7,57 (m, 1,5H), 7,50 - 7,48 (dd, 1,5H), 7,27 - 7,22 (m, 1H), 3,82 - 3,77 (q, 2H), 3,37 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 1,08 (t, 3H)</p> | |
| 293 | Метил-2-(3-хлор-4-нитрофенил)-5-(4-хлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилат |  <p data-bbox="574 1108 1268 1198">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ = 8,23 (d, 1H), 8,08 (d, 1H), 7,78 - 7,76 (dd, 1H), 7,48 (d, 2H), 7,21 (d, 2H), 3,80 - 3,75 (q, 2H), 3,38 (s, 3H), 2,27 (s, 3H), 1,11 (t, 3H)</p> | |
| 294 | Метил-5-(4-хлор-2-фторфенил)-2-(3-хлор-4-нитрофенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилат |  <p data-bbox="574 1568 1268 1680">1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ = 8,23 (dd, 1H), 8,17 - 8,07 (dd, 1H), 8,85 - 7,74 (dd, 1H), 7,53 - 7,49 (m, 1H), 7,38 - 7,35 (m, 1H), 7,30 - 7,23 (m, 1H), 3,80 - 3,78 (q, 2H), 3,39 (s, 3H), 2,26 (s, 3H), 1,11 (t, 3H)</p> | |

| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|---|--|-------|
| 295 | Метил-2-(4-хлор-3-нитрофенил)-5-(4-хлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилат |  <p data-bbox="590 638 1244 728">1H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ = 7,99 (d, 1H), 7,71 (d, 1H), 7,62 (t, 1H), 7,41 (d, 2H), 7,17 (d, 2H), 3,83 (q, 2H), 3,58 (s, 3H), 2,32 (s, 3H), 1,12(t, 3H)</p> | |
| 296 | Метил-5-(4-хлор-2-фторфенил)-2-(4-хлор-3-фторфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилат |  <p data-bbox="590 1097 1244 1187">1H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ = 7,52 (d, 1H), 7,21 (m, 1H), 7,19 (m, 1H), 7,16 (m, 3H), 3,84 (q, 2H), 3,56 (s, 3H), 2,30 (d, 3H), 1,18 (t, 3H)</p> | |
| 297 | Метил-5-(4-хлор-2-фторфенил)-2-(4-хлор-3-нитрофенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилат |  <p data-bbox="590 1590 1244 1668">1H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ = 7,99 (dd, 1H), 7,72 (dd, 1H), 7,65 - 7,60 (m, 1H), 7,22 - 7,16 (m, 3H), 3,82 (q, 2H), 3,58 (s, 3H), 2,32 (d, 3H), 1,21 (t, 3H)</p> | |
| 298 | Метил-2-(4-хлор-3-фторфенил)-5-(2,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоксилат |  | |

| Соединение № | Название Соединения | Структура и данные ¹ H ЯМР | LC/MS |
|--------------|--|---|-------|
| | | ¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ = 7,56 (m, 1H), 7,49 (d, 1H), 7,30 (m, 2H), 7,21 (m, 2H), 3,81 (q, 2H), 3,55 (s, 3H), 2,21 (s, 3H), 1,17 (t, 3H) | |
| 299 | 5-(4-Хлор-2-фтор-5-метоксикарбонилфенил)-2-(3,4-дихлорфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  ¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ = 7,93 - 7,92 (d, 0,5H), 7,87 - 7,76 (m, 3,5H), 7,57 - 7,54 (dd, 0,5H), 7,43 - 7,40 (dd, 0,5H), 3,93 - 3,87 (m, 5H), 2,39 (s, 3H), 1,12 (t, 3H) | |
| 300 | 5-(4-Хлор-2-фтор-5-метоксикарбонилфенил)-2-(3,4-дифторфенил)-1-этил-6-метил-4-оксопиридин-3-карбоновая кислота |  ¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ = 7,87 - 7,78 (m, 2,5H), 7,64 - 7,58 (1,5H), 7,40 - 7,39 (m, 0,5H), 7,27 - 7,26 (m, 0,5H), 3,91 - 3,89 (q, 2H), 3,87 (s, 3H), 2,39 (s, 3H), 1,13 (t, 3H) | |

Биологические примеры

- 5 Семена различных испытуемых видов высевали в стандартную почву в горшках (*Amaranthus retroflexus* (AMARE), *Solanum nigrum* (SOLNI), *Setaria faberi* (SETFA), *Lolium perenne* (LOLPE), *Echinochloa crus-galli* (ECHCG), *Ipomoea hederacea* (IPOHE), *Abutilon theophrasti* (ABUTH), *Zea mays* (ZEAMX), *Amaranthus palmeri* (AMAPA). Через 8 дней культивирования в контролируемых тепличных условиях (при 24°C /16°C, день/ночь; 14 часов света; 65 % влажность) растения опрыскивают водным раствором для опрыскивания, полученным из состава с технически активным ингредиентом в

растворе ацетон / вода (50:50), содержащем 0,5% Tween 20 (полиоксиэтиленсорбитан монолаурат, CAS RN 9005-64-5). Соединения применяют из расчета 1000 г/га, если не указано иное. Затем испытуемые растения выращивают в теплице в контролируемых условиях в теплице (при 24°C/16°C, день/ночь; 14 часов света; 65% влажность) и поливают дважды в день. Через 13 дней испытание оценивают по повреждению, выраженному в процентах, нанесенному растению. Значения биологической активности показаны в следующих таблицах по пятибальной шкале (5 = 81-100%; 4 = 61-80%; 3 = 41-60%; 2 = 21-40%; 1 = 0-20%).

ТАБЛИЦА В1. Испытание при внесении после появления всходов

| Соед. № | AMARE | SOLNI | ABUTH | SETFA | ECHCG | ZEAMX | IPONE | LOLPE | AMAPA |
|---------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|
| 1 | 5 | 5 | - | 5 | 5 | - | 4 | 3 | - |
| 2 | 3 | - | - | 4 | 2 | - | 2 | 1 | - |
| 3 | 5 | - | - | 5 | 5 | - | 4 | 4 | - |
| 4 | 3 | - | - | 2 | 1 | - | 2 | 1 | - |
| 5 | 3 | 2 | - | 5 | 5 | - | 3 | 1 | - |
| 6 | 4 | 3 | - | 4 | 4 | - | 1 | 4 | - |
| 7 | 5 | 2 | - | 4 | 4 | - | 2 | 1 | - |
| 8 | 5 | 5 | - | 5 | 4 | - | 4 | 3 | - |
| 9 | 5 | 3 | - | 5 | 5 | - | 3 | 1 | - |
| 10 | 5 | 5 | - | 5 | 4 | - | 4 | 3 | - |
| 11 | 4 | 5 | - | 4 | 4 | - | 4 | 2 | - |
| 12 | 5 | - | - | 5 | 4 | - | 4 | 3 | - |
| 13 | 4 | 3 | - | 4 | 4 | - | 4 | 4 | - |
| 14 | 4 | 3 | - | 4 | 4 | - | 4 | 4 | - |
| 15 | 5 | 4 | - | 5 | 4 | - | 2 | 1 | - |
| 16 | 4 | 4 | - | 5 | 5 | - | 4 | 1 | - |
| 17 | 4 | 3 | - | 4 | 4 | - | 4 | 4 | - |
| 18 | 5 | 5 | - | 5 | 4 | - | 5 | 2 | - |
| 19 | 4 | 5 | - | 4 | 5 | - | 4 | 3 | - |
| 20 | 4 | 3 | - | 4 | 3 | - | 2 | 2 | - |
| 21 | 3 | 4 | - | 4 | 3 | - | 3 | 3 | - |
| 22 | 5 | 4 | - | 4 | 2 | - | 3 | 2 | - |
| 23 | 3 | 1 | - | 4 | 3 | - | 3 | 1 | - |
| 24 | 4 | 5 | - | 4 | 3 | - | 4 | 4 | - |
| 25 | 3 | 2 | - | 4 | 4 | - | 2 | 1 | - |
| 26 | 5 | 2 | - | 5 | 4 | - | 4 | 1 | - |
| 27 | 3 | 3 | - | 3 | 3 | - | 2 | 1 | - |
| 28 | 2 | 3 | - | 3 | 2 | - | 4 | 2 | - |
| 29 | 5 | 3 | - | 3 | 1 | - | 2 | 2 | - |
| 30 | 4 | 3 | - | 3 | 2 | - | 3 | 2 | - |
| 31 | 3 | 4 | - | 3 | 1 | - | 2 | 2 | - |

| Соед. № | AMARE | SOLNI | ABUTH | SETFA | ECHCG | ZEAMX | IPOHE | LOLPE | AMAPA |
|------------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|
| 32 | 1 | 3 | - | 3 | 4 | - | 1 | 1 | - |
| 33 | 3 | 3 | - | 1 | 2 | - | 3 | 2 | - |
| 34 | 4 | 4 | - | 2 | 2 | - | 1 | 1 | - |
| 35 | 1 | 1 | - | 2 | 2 | - | 1 | 1 | - |
| 36 | 1 | 2 | - | 4 | 5 | - | 1 | 1 | - |
| 37 | 1 | 4 | - | 1 | 1 | - | 3 | 1 | - |
| 38 | 1 | 1 | - | 1 | 1 | - | 1 | 1 | - |
| 39 | 1 | 1 | - | 1 | 1 | - | 1 | 1 | - |
| 40 | 1 | 2 | - | 1 | 1 | - | 1 | 1 | - |
| 53 | 3 | - | 4 | 4 | 3 | 2 | 2 | - | - |
| 55 | 1 | - | 1 | 1 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 56 | 1 | - | 1 | 1 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 57 | 4 | - | 3 | 4 | 3 | 2 | 2 | - | - |
| 58 | 1 | - | 1 | 1 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 59 | 3 | - | 3 | 4 | 3 | 3 | 3 | - | - |
| 60 | 2 | - | 2 | 4 | 3 | 1 | 2 | - | - |
| 61 | 1 | - | 2 | 3 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 62 | 1 | - | 2 | 1 | 1 | 1 | 2 | - | - |
| 63 | 3 | - | 3 | 3 | 4 | 3 | 3 | - | - |
| 64 | 1 | - | 1 | 1 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 65 | 1 | - | 1 | 1 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 66 | 1 | - | 3 | 3 | 2 | 1 | 2 | - | - |
| 67 | 1 | - | 2 | 1 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 68 | 1 | - | 3 | 3 | 2 | 1 | 3 | - | - |
| 69 | 2 | - | 2 | 3 | 1 | 1 | 3 | - | - |
| 70 | 1 | - | 2 | 3 | 2 | 2 | 1 | - | - |
| 71 | 1 | - | 2 | 1 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 72 | 1 | - | 1 | 1 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 73 | 2 | - | 3 | 4 | 3 | 2 | 3 | - | - |
| 74 | 1 | - | 3 | 3 | 3 | 2 | 2 | - | - |
| 75 | 1 | - | 2 | 1 | 1 | 1 | 2 | - | - |
| 76 | 1 | - | 3 | 3 | 2 | 1 | 2 | - | - |
| 78 | 1 | - | 2 | 3 | 2 | 1 | 1 | - | - |
| 79 | 1 | - | 2 | 2 | 1 | 1 | 2 | - | - |
| 80 | 3 | - | 3 | 3 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 81 | 2 | - | 3 | 3 | 3 | 1 | 2 | - | - |
| 82 | 1 | - | 2 | 1 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 83 | 1 | - | 2 | 2 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 84 | 2 | - | 3 | 3 | 1 | 1 | 3 | - | - |
| 85 | 1 | - | 3 | 3 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 86 | 4 | - | 4 | 4 | 3 | 1 | 3 | - | - |
| 87 | 2 | - | 3 | 3 | 2 | 1 | 2 | - | - |
| 88 | 2 | - | 2 | 2 | 2 | 1 | 1 | - | - |

| Соед. № | AMARE | SOLNI | ABUTH | SETFA | ECHCG | ZEAMX | IPOHE | LOLPE | AMAPA |
|------------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|
| 89 | 1 | - | 3 | 1 | 1 | 1 | 3 | - | - |
| 90 | 1 | - | 1 | 2 | 1 | 1 | 2 | - | - |
| 91 | 3 | - | 3 | 4 | 4 | 2 | 3 | - | - |
| 92 | 1 | - | 2 | 1 | 1 | 1 | 3 | - | - |
| 93 | 1 | - | 2 | 2 | 3 | 1 | 2 | - | - |
| 94 | 1 | - | 1 | 1 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 95 | 3 | - | 3 | 3 | 3 | 2 | 2 | - | - |
| 96 | 1 | - | 4 | 3 | 2 | 2 | 3 | - | - |
| 98 | 1 | - | 2 | 1 | 1 | 1 | 2 | - | - |
| 99 | 3 | - | 3 | 4 | 4 | 2 | 2 | - | - |
| 100 | 2 | - | 3 | 3 | 1 | 3 | 1 | - | - |
| 101 | 3 | - | 3 | 3 | 3 | 2 | 2 | - | - |
| 102 | 3 | - | 3 | 4 | 3 | 1 | 3 | - | - |
| 103 | 1 | - | 2 | 1 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 104 | 3 | - | 3 | 4 | 3 | 1 | 1 | - | - |
| 105 | 2 | - | 2 | 4 | 3 | 2 | 1 | - | - |
| 106 | 3 | - | 3 | 1 | 1 | 1 | 2 | - | - |
| 107 | 4 | - | 3 | 2 | 2 | 2 | 3 | - | - |
| 108 | 2 | - | 2 | 3 | 2 | 2 | 2 | - | - |
| 109 | 1 | - | 3 | 3 | 2 | 1 | 4 | - | - |
| 110 | 1 | - | 1 | 1 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 111 | 2 | - | 4 | 4 | 3 | 2 | 2 | - | - |
| 112 | 2 | - | 3 | 4 | 3 | 1 | 2 | - | - |
| 113 | 3 | - | 4 | 4 | 3 | 2 | 2 | - | - |
| 114 | 1 | - | 1 | 1 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 126 | 5 | 5 | - | 5 | 4 | - | 4 | 2 | - |
| 127 | 1 | 1 | - | 1 | 0 | - | 1 | 1 | - |
| 128 | 3 | - | 4 | 4 | 3 | 3 | 2 | - | - |
| 129 | 3 | - | 3 | 3 | 2 | 2 | 3 | - | - |
| 130 | 3 | - | 3 | 4 | 3 | 2 | 3 | - | - |
| 131 | 1 | - | 1 | 3 | 0 | 2 | 1 | - | - |
| 132 | 5 | - | 3 | 0 | 0 | 1 | 4 | - | - |
| 133 | 4 | - | 2 | 1 | - | 1 | 3 | - | - |
| 134 | 3 | - | 3 | 4 | 4 | 3 | 3 | - | - |
| 135 | 2 | - | 1 | 0 | 0 | 0 | 1 | - | - |
| 136 | 3 | - | 3 | 4 | 3 | 1 | 2 | - | - |
| 137 | 3 | - | 3 | 3 | 4 | 2 | 3 | - | - |
| 138 | 1 | - | 3 | 3 | 2 | 0 | 1 | - | - |
| 139 | 3 | - | 4 | 3 | 2 | 2 | 1 | - | - |
| 140 | 1 | - | - | 4 | - | 1 | 3 | - | - |
| 141 | 0 | - | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | - | - |
| 142 | 0 | - | 1 | 2 | 3 | 1 | 2 | - | - |
| 143 | 2 | - | 4 | 4 | 4 | 4 | 4 | - | - |

| Соед. № | AMARE | SOLNI | ABUTH | SETFA | ECHCG | ZEAMX | IPOHE | LOLPE | AMAPA |
|---------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|
| 144 | 2 | - | 2 | 3 | 2 | 2 | 2 | - | - |
| 145 | 1 | - | - | 3 | - | 1 | 2 | - | - |
| 146 | 2 | - | 3 | 4 | 4 | 3 | 4 | - | - |
| 147 | 0 | - | 2 | 2 | 2 | 2 | 2 | - | - |
| 149 | 1 | - | 1 | 0 | 0 | 1 | 2 | - | - |
| 150 | 0 | - | 0 | 1 | 1 | 1 | 2 | - | - |
| 151 | 0 | - | 3 | 4 | 3 | 2 | 3 | - | - |
| 152 | 0 | - | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | - | - |
| 153 | 5 | - | 5 | 5 | 5 | 5 | 5 | - | - |
| 154 | 4 | - | 4 | 4 | 4 | 3 | 4 | - | - |
| 155 | 3 | - | 4 | 4 | 4 | 4 | 4 | - | - |
| 156 | 3 | - | 4 | 4 | 4 | 4 | 4 | - | - |
| 157 | 1 | - | 4 | 4 | 4 | 4 | 4 | - | - |
| 158 | 4 | - | - | 1 | - | 1 | 2 | - | 5 |
| 163 | 1 | - | - | 0 | 0 | 0 | 0 | - | 2 |
| 164 | 1 | - | 1 | 1 | 0 | 1 | 1 | - | - |
| 165 | 0 | - | 2 | 1 | 0 | 1 | 2 | - | - |
| 166 | 2 | - | 3 | 3 | 2 | 1 | 1 | - | - |
| 167 | 0 | - | 4 | 2 | 1 | 1 | 3 | - | - |
| 168 | 0 | - | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | - | - |
| 169 | 1 | - | - | 0 | - | 1 | 0 | - | - |
| 170 | 5 | - | - | 1 | - | 2 | 3 | - | - |
| 171 | 3 | - | - | 3 | - | 2 | 4 | - | - |
| 172 | 2 | - | - | 4 | - | 2 | 4 | - | - |
| 173 | 3 | - | - | 2 | 1 | 2 | 3 | - | - |
| 174 | 2 | - | - | 3 | 2 | 1 | 4 | - | - |
| 175 | 1 | - | - | 3 | 2 | 1 | 3 | - | - |
| 176 | 2 | - | - | 1 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 177 | 4 | - | - | 4 | - | 3 | 3 | - | - |
| 178 | 1 | - | - | 0 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 179 | 2 | - | - | 3 | 2 | 1 | 3 | - | - |
| 180 | 0 | - | 0 | 0 | 0 | 0 | 2 | - | - |
| 181 | 3 | - | - | 3 | - | 1 | 2 | - | - |
| 183 | 3 | - | - | 2 | - | 3 | 3 | - | - |
| 184 | 4 | - | - | 5 | - | 3 | 3 | - | - |
| 185 | 3 | - | - | 3 | - | 1 | 2 | - | - |
| 186 | 1 | - | - | 3 | - | 2 | 2 | - | - |
| 187 | 3 | - | - | 2 | - | 2 | 3 | - | - |
| 188 | 0 | - | - | 0 | - | 1 | 1 | - | - |
| 189 | 2 | - | - | 2 | - | 1 | 1 | - | - |
| 190 | 1 | - | - | 2 | - | 1 | 1 | - | - |
| 192 | 2 | - | 4 | 4 | - | 2 | 2 | - | - |
| 193 | 5 | - | - | 4 | - | 2 | 3 | - | - |

| Соед. № | AMARE | SOLNI | ABUTH | SETFA | ECHCG | ZEAMX | IPOHE | LOLPE | AMAPA |
|---------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|
| 194 | 0 | - | - | 2 | - | 1 | 0 | - | - |
| 195 | 4 | - | - | 2 | - | 2 | 3 | - | - |
| 196 | 3 | - | - | 3 | - | 2 | 3 | - | - |
| 197 | 1 | - | - | 1 | - | 1 | 2 | - | - |
| 198 | 2 | - | - | 2 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 200 | 1 | - | - | 3 | - | 2 | 3 | - | - |
| 201 | 2 | - | 4 | 3 | - | 2 | 1 | - | - |
| 202 | 0 | - | 0 | 0 | - | 1 | 1 | - | - |
| 203 | 0 | - | 0 | 0 | - | 1 | 0 | - | - |
| 204 | 5 | - | 5 | 3 | - | 1 | 2 | - | - |
| 205 | 1 | - | 0 | 0 | - | 0 | 1 | - | - |
| 206 | 4 | - | - | 4 | 2 | 1 | 2 | - | 4 |
| 207 | 3 | - | - | 4 | 4 | 3 | 4 | - | 3 |
| 208 | 4 | - | - | 5 | 3 | 4 | 2 | - | 4 |
| 209 | 5 | - | - | 5 | 5 | 4 | 4 | - | 5 |
| 210 | 5 | - | - | 4 | 4 | 3 | 3 | - | 4 |
| 211 | 2 | - | - | 1 | 1 | 1 | 1 | - | 3 |
| 212 | 1 | - | - | 0 | 0 | 0 | 0 | - | 1 |
| 213 | - | - | - | 0 | 0 | 1 | 1 | - | 3 |
| 214 | 2 | - | - | 1 | 0 | 1 | 0 | - | 2 |
| 215 | 4 | - | - | 3 | 3 | 3 | 1 | - | 4 |
| 217 | 0 | - | - | 2 | 1 | 0 | 3 | - | - |
| 218 | 3 | - | - | 2 | 1 | 1 | 0 | - | 3 |
| 219 | 3 | - | - | 1 | 1 | 0 | 3 | - | 3 |
| 222 | 3 | - | - | 3 | - | 1 | 3 | - | 5 |
| 223 | 5 | - | - | 3 | - | 1 | 1 | - | 5 |
| 224 | 5 | - | - | 5 | - | 3 | 2 | - | 5 |
| 225 | 4 | - | - | 1 | - | 1 | 1 | - | 5 |
| 228 | 4 | - | - | 3 | - | 2 | 3 | - | 5 |
| 229 | 5 | - | - | 1 | - | 1 | 3 | - | 5 |
| 231 | 5 | - | - | 3 | - | 1 | 3 | - | 5 |
| 234 | 4 | - | - | 4 | - | 3 | 4 | - | 5 |
| 235 | 3 | - | - | 2 | - | 1 | 3 | - | 4 |
| 236 | 5 | - | - | 2 | - | 2 | 5 | - | 5 |
| 237 | 1 | - | - | 3 | - | 1 | 2 | - | 4 |
| 238 | 3 | - | - | 1 | - | 1 | 1 | - | 4 |
| 239 | 4 | - | - | 4 | - | 2 | 2 | - | 3 |
| 240 | 3 | - | - | 4 | - | 1 | 4 | - | 4 |
| 241 | 5 | - | - | 4 | - | 3 | 3 | - | 5 |
| 242 | 5 | - | - | 5 | 5 | 4 | 4 | - | 5 |
| 244 | 5 | - | - | 5 | 5 | 5 | 3 | - | 5 |
| 245 | 5 | - | - | 5 | 5 | 3 | 4 | - | 5 |
| 246 | 5 | - | - | 3 | 4 | 3 | 2 | - | 5 |

| Соед. № | AMARE | SOLNI | ABUTH | SETFA | ECHCG | ZEAMX | ИРОНЕ | LOLPE | АМАРА |
|---------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|
| 251 | 4 | - | - | 0 | 1 | 1 | 0 | - | 3 |
| 252 | 4 | - | - | 4 | 5 | 2 | 2 | - | 5 |
| 253 | 5 | - | - | 5 | 5 | 3 | 3 | - | 5 |
| 258 | 4 | | | 5 | 5 | 5 | 3 | - | 5 |
| 260 | 4 | - | - | 4 | 4 | 3 | 3 | - | 4 |
| 261 | 5 | - | - | 4 | 4 | 3 | 2 | - | 4 |
| 262 | 5 | - | - | 5 | 4 | 4 | 2 | - | 5 |
| 282 | 4 | - | - | 1 | 4 | 3 | 2 | - | 4 |

ТАБЛИЦА В2. Испытание при внесении до появления всходов

| Соед. № | AMARE | SOLNI | ABUTH | SETFA | ECHCG | ZEAMX | ИРОНЕ | LOLPE | АМАРА |
|---------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|
| 1 | 1 | 5 | - | 5 | 5 | - | 4 | 4 | - |
| 2 | 3 | - | - | 1 | 1 | - | - | 1 | - |
| 3 | 5 | - | - | 5 | 4 | - | 4 | 3 | - |
| 4 | 1 | - | - | 1 | 1 | - | 1 | 1 | - |
| 5 | 4 | 4 | - | 4 | 4 | - | 4 | 4 | - |
| 6 | 4 | 3 | - | 5 | 4 | - | 1 | 4 | - |
| 7 | - | 1 | - | 2 | 2 | - | 1 | 1 | - |
| 8 | 3 | 3 | - | 4 | 2 | - | 1 | 3 | - |
| 9 | 5 | 3 | - | 4 | 5 | - | 1 | 1 | - |
| 10 | 5 | 4 | - | 4 | 3 | - | 2 | 1, | - |
| 11 | 5 | 5 | - | 5 | 5 | - | 2 | 1 | - |
| 12 | 5 | - | - | 5 | 4 | - | 1 | 1 | - |
| 13 | 4 | 4 | - | 5 | 5 | - | 4 | 2 | - |
| 14 | 2 | 2 | - | 5 | 4 | - | 3 | 1 | - |
| 15 | 5 | 3 | - | 5 | 1 | - | 1 | 1 | - |
| 16 | 1 | 1 | - | 3 | 4 | - | 2 | 1 | - |
| 17 | 1 | 3 | - | 5 | 3 | - | 1 | 3 | - |
| 18 | 1 | 2 | - | 4 | 2 | - | 1 | 1 | - |
| 19 | 1 | 1 | - | 1 | 1 | - | 1 | 1 | - |
| 20 | 1 | 2 | - | 4 | 2 | - | 1 | 3 | - |
| 21 | 1 | 1 | - | 3 | 2 | - | 1 | 1 | - |
| 22 | 2 | 2 | - | 3 | 1 | - | 1 | 2 | - |
| 23 | 1 | 1 | - | 5 | 1 | - | 1 | 1 | - |
| 24 | 1 | 5 | - | 1 | 2 | - | 4 | 2 | - |
| 25 | 1 | 1 | - | 3 | 1 | - | 1 | 1 | - |
| 26 | 1 | 1 | - | 1 | 1 | - | 1 | 1 | - |
| 27 | 1 | 1 | - | 1 | 1 | - | 1 | 1 | - |
| 28 | 1 | 2 | - | 1 | 1 | - | 3 | 1 | - |
| 29 | 3 | 1 | - | 3 | 1 | - | 1 | 1 | - |
| 30 | 1 | 2 | - | 4 | 3 | - | 2 | 2 | - |
| 31 | 1 | 4 | - | 4 | 1 | - | 1 | 1 | - |

| Соед. № | AMARE | SOLNI | ABUTH | SETFA | ECHCG | ZEAMX | IPOHE | LOLPE | AMAPA |
|------------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|
| 32 | 1 | 1 | - | 4 | 4 | - | 1 | 1 | - |
| 33 | 1 | 1 | - | 1 | 1 | - | 2 | 1 | - |
| 34 | 3 | 2 | - | 3 | 1 | - | 1 | 2 | - |
| 35 | 1 | 1 | - | 1 | 1 | - | 1 | 1 | - |
| 36 | 1 | 3 | - | 5 | 5 | - | 1 | 1 | - |
| 37 | 1 | 1 | - | 1 | 1 | - | 1 | 1 | - |
| 38 | 1 | 1 | - | 1 | 1 | - | 1 | 1 | - |
| 39 | 1 | 1 | - | 1 | 1 | - | 1 | 1 | - |
| 40 | 1 | 1 | - | 1 | 1 | - | 1 | 1 | - |
| 53 | 1 | - | 3 | 4 | 3 | 1 | 3 | - | - |
| 55 | 1 | - | 1 | 1 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 56 | 1 | - | 1 | 1 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 57 | 3 | - | 1 | 4 | 3 | 2 | 2 | - | - |
| 58 | 1 | - | 1 | 1 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 59 | 1 | - | 3 | 4 | 2 | 1 | 3 | - | - |
| 60 | 2 | - | 3 | 4 | 2 | 1 | 2 | - | - |
| 61 | 1 | - | 2 | 4 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 62 | 1 | - | 1 | 2 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 63 | 4 | - | 2 | 3 | 1 | 1 | 2 | - | - |
| 64 | 2 | - | 1 | 1 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 65 | 1 | - | 1 | 1 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 66 | 1 | - | 1 | 4 | 2 | 1 | 1 | - | - |
| 67 | 1 | - | 1 | 1 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 68 | 1 | - | 1 | 5 | 1 | 1 | 2 | - | - |
| 69 | 1 | - | 2 | 4 | 1 | 2 | 4 | - | - |
| 70 | 1 | - | 1 | 3 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 71 | 2 | - | 1 | 2 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 72 | 1 | - | 1 | 1 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 73 | 1 | - | 2 | 4 | 2 | 1 | 2 | - | - |
| 74 | 1 | - | 2 | 4 | 3 | 1 | 1 | - | - |
| 75 | 1 | - | 1 | 1 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 76 | 1 | - | 2 | 3 | 1 | 1 | 2 | - | - |
| 78 | 2 | - | 1 | 4 | 3 | 1 | 2 | - | - |
| 79 | 3 | - | 3 | 5 | 1 | 2 | 2 | - | - |
| 80 | 1 | - | 1 | 4 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 81 | 1 | - | 1 | 4 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 82 | 2 | - | 1 | 2 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 83 | 1 | - | 1 | 1 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 84 | 1 | - | 3 | 4 | 1 | 1 | 3 | - | - |
| 85 | 1 | - | 2 | 4 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 86 | 4 | - | 2 | 5 | 3 | 1 | 1 | - | - |
| 87 | 1 | - | 1 | 4 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 88 | 1 | - | 1 | 4 | 1 | 1 | 1 | - | - |

| Соед. № | AMARE | SOLNI | ABUTH | SETFA | ECHCG | ZEAMX | IPOHE | LOLPE | AMAPA |
|------------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|
| 89 | 1 | - | 1 | 4 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 90 | 1 | - | 1 | 3 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 91 | 2 | - | 2 | 4 | 4 | 1 | 3 | - | - |
| 92 | 1 | - | 1 | 1 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 93 | 1 | - | 1 | 4 | 3 | 1 | 1 | - | - |
| 94 | 1 | - | 1 | 1 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 95 | 1 | - | 1 | 4 | 2 | 1 | 1 | - | - |
| 96 | 1 | - | 1 | 2 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 98 | 2 | - | 1 | 3 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 99 | 2 | - | 2 | 4 | 3 | 2 | 1 | - | - |
| 100 | 1 | - | 1 | 4 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 101 | 2 | - | 2 | 4 | 2 | 2 | 1 | - | - |
| 102 | 2 | - | 3 | 4 | 2 | 1 | 3 | - | - |
| 103 | 1 | - | 1 | 2 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 104 | 4 | - | 2 | 4 | 2 | 1 | 1 | - | - |
| 105 | 3 | - | 1 | 4 | 2 | 1 | 1 | - | - |
| 106 | 1 | - | 2 | 1 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 107 | 4 | - | 1 | 5 | 4 | 1 | 1 | - | - |
| 108 | 1 | - | 1 | 3 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 109 | 1 | - | 1 | 4 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 110 | 1 | - | 1 | 1 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 111 | 1 | - | 2 | 5 | 4 | 3 | 1 | - | - |
| 112 | 1 | - | 2 | 4 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 113 | 1 | - | 3 | 4 | 1 | 2 | 2 | - | - |
| 114 | 1 | - | 1 | 1 | 1 | 1 | 1 | - | - |
| 126 | 5 | 4 | - | 4 | 2 | - | 3 | 0 | - |
| 127 | 0 | 0 | - | 2 | 0 | - | 0 | 1 | - |
| 128 | 4 | - | 3 | 5 | 2 | 2 | 1 | - | - |
| 129 | 5 | - | 2 | 5 | 2 | 1 | 2 | - | - |
| 130 | 3 | - | 3 | 5 | 4 | 3 | 3 | - | - |
| 131 | 0 | - | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | - | - |
| 132 | 5 | - | 4 | 0 | 0 | 0 | 2 | - | - |
| 133 | 2 | - | 3 | 5 | 4 | 2 | 2 | - | - |
| 134 | 1 | - | 1 | 0 | 0 | 0 | 0 | - | - |
| 135 | 1 | - | 3 | 5 | 2 | 0 | 3 | - | - |
| 136 | 2 | - | 3 | 5 | 3 | 1 | 2 | - | - |
| 137 | 5 | - | 0 | 1 | 0 | 0 | 0 | - | - |
| 138 | 5 | - | 3 | 5 | 3 | 1 | 1 | - | - |
| 139 | 0 | - | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | - | - |
| 140 | 1 | - | 1 | 2 | 2 | 0 | 1 | - | - |
| 141 | 0 | - | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | - | - |
| 142 | 0 | - | 0 | 1 | 1 | 0 | 0 | - | - |
| 143 | 1 | - | 3 | 5 | 5 | 3 | 1 | - | - |

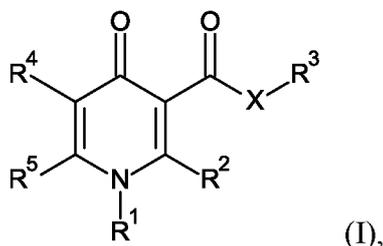
| Соед. № | AMARE | SOLNI | ABUTH | SETFA | ECHCG | ZEAMX | IPOHE | LOLPE | AMAPA |
|------------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|
| 144 | 1 | - | 1 | 4 | 4 | 2 | 2 | - | - |
| 145 | 1 | - | 1 | 3 | 2 | 0 | 0 | - | - |
| 146 | 1 | - | 1 | 4 | 4 | 1 | 0 | - | - |
| 147 | 0 | - | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | - | - |
| 149 | 0 | - | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | - | - |
| 150 | 0 | - | 0 | 0 | 0 | 1 | 0 | - | - |
| 151 | 1 | - | 1 | 4 | 4 | 2 | 5 | - | - |
| 152 | 0 | - | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | - | - |
| 153 | 5 | - | 5 | 5 | 5 | 4 | 4 | - | - |
| 154 | 1 | - | 3 | 4 | 5 | 2 | 3 | - | - |
| 155 | 1 | - | 2 | 5 | 5 | 1 | 1 | - | - |
| 156 | 1 | - | 2 | 4 | 5 | 0 | 1 | - | - |
| 157 | 0 | - | 4 | 5 | 4 | 3 | 2 | - | - |
| 158 | 0 | - | - | 0 | 0 | 0 | 0 | - | 3 |
| 163 | 1 | - | - | 0 | 0 | 1 | 0 | - | 1 |
| 164 | 0 | - | - | 0 | 0 | 0 | 0 | - | - |
| 165 | 1 | - | 1 | 0 | 0 | 0 | 1 | - | - |
| 166 | 1 | - | 1 | 0 | 0 | 0 | 1 | - | - |
| 167 | 1 | - | 3 | 2 | 0 | 3 | 1 | - | - |
| 168 | 0 | - | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | - | - |
| 169 | 0 | - | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | - | - |
| 170 | 1 | - | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | - | - |
| 171 | 0 | - | 0 | 0 | 1 | 0 | 1 | - | - |
| 172 | 1 | - | 1 | 3 | 3 | 0 | 1 | - | - |
| 173 | 0 | - | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | - | - |
| 174 | 1 | - | 1 | 2 | 3 | 1 | 1 | - | - |
| 175 | 0 | - | 0 | 2 | 1 | 1 | 3 | - | - |
| 176 | 0 | - | 0 | 0 | - | 0 | 0 | - | - |
| 177 | 1 | - | 3 | 2 | 1 | 0 | 3 | - | - |
| 178 | 0 | - | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | - | - |
| 179 | 1 | - | 3 | 1 | 1 | 0 | 3 | - | - |
| 180 | 0 | - | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | - | - |
| 181 | 1 | - | 4 | 5 | 4 | 2 | 4 | - | - |
| 183 | 0 | - | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | - | - |
| 184 | 1 | - | 1 | 1 | 1 | 0 | 0 | - | - |
| 185 | 0 | - | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | - | - |
| 186 | 1 | - | 3 | 2 | 1 | 0 | 1 | - | - |
| 187 | 1 | - | 3 | 2 | 1 | 1 | 2 | - | - |
| 188 | 0 | - | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | - | - |
| 189 | 1 | - | 3 | 2 | 2 | 0 | 1 | - | - |
| 190 | 1 | - | 0 | 2 | 2 | 2 | 1 | - | - |
| 192 | 1 | - | 2 | 2 | 2 | 0 | 1 | - | - |
| 193 | 2 | - | 2 | 2 | 1 | 1 | 0 | - | - |

| Соед. № | AMARE | SOLNI | ABUTH | SETFA | ECHCG | ZEAMX | IPOHE | LOLPE | AMAPA |
|------------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|
| 194 | 0 | - | 0 | 0 | 0 | 2 | 0 | - | - |
| 195 | 2 | - | 0 | 1 | 2 | 0 | 0 | - | - |
| 196 | 1 | - | 0 | 1 | 2 | 0 | 1 | - | - |
| 197 | 0 | - | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | - | - |
| 198 | 0 | - | 0 | 0 | 0 | 0 | 1 | - | - |
| 200 | 0 | - | 3 | 2 | 3 | 0 | 2 | - | - |
| 201 | 1 | - | 2 | 3 | 3 | 0 | 0 | - | - |
| 202 | 0 | - | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | - | - |
| 203 | 0 | - | - | 0 | 1 | 0 | 0 | - | - |
| 204 | 5 | - | 2 | 0 | 0 | 0 | 0 | - | - |
| 205 | 0 | - | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | - | - |
| 206 | 2 | - | - | 5 | 2 | 0 | 3 | - | 4 |
| 207 | 3 | - | - | 5 | 2 | 1 | 3 | - | 3 |
| 208 | 1 | - | - | 2 | 1 | 0 | 2 | - | 5 |
| 209 | 5 | - | - | 4 | 4 | 0 | 1 | - | 5 |
| 210 | 3 | - | - | 2 | 1 | 0 | 0 | - | 4 |
| 211 | 1 | - | - | 0 | 1 | 0 | 0 | - | 4 |
| 212 | 0 | - | - | 3 | 2 | 0 | 0 | - | 1 |
| 213 | 0 | - | - | 0 | 0 | 0 | 0 | - | 0 |
| 214 | 0 | - | - | 0 | 0 | 0 | 0 | - | 0 |
| 215 | 4 | - | - | 4 | 2 | 0 | 1 | - | 3 |
| 217 | 0 | - | 3 | 2 | 1 | 1 | 3 | - | - |
| 218 | 0 | - | - | 0 | 0 | 0 | 0 | - | 0 |
| 219 | 0 | - | - | 1 | 0 | 0 | 0 | - | 1 |
| 222 | 1 | - | - | 1 | 1 | 1 | 1 | - | 1 |
| 223 | 1 | - | - | 3 | 1 | 1 | 0 | - | 3 |
| 224 | 3 | - | - | 5 | 5 | 2 | 2 | - | 4 |
| 225 | 0 | - | - | 0 | 1 | 0 | 0 | - | 0 |
| 228 | 2 | - | - | 5 | 5 | 2 | 3 | - | 4 |
| 229 | 4 | - | - | 1 | 0 | 0 | 1 | - | 4 |
| 231 | 3 | - | - | 4 | 2 | 0 | 0 | - | 4 |
| 234 | 2 | - | - | 5 | 5 | 2 | 4 | - | 3 |
| 235 | 0 | - | - | 0 | 0 | 0 | 0 | - | 3 |
| 236 | 1 | - | - | 4 | 3 | 1 | 4 | - | 2 |
| 237 | 0 | - | - | 1 | 2 | 0 | 0 | - | 1 |
| 238 | 0 | - | - | 0 | 0 | 0 | 0 | - | 0 |
| 239 | 1 | - | - | 5 | 5 | 0 | 1 | - | 1 |
| 240 | 0 | - | - | 5 | 3 | 0 | 1 | - | 0 |
| 241 | 3 | - | - | 5 | 5 | 1 | 3 | - | 2 |
| 242 | 4 | - | - | 5 | 5 | 2 | 4 | - | 5 |
| 244 | 5 | - | - | 5 | 5 | 0 | 3 | - | 5 |
| 245 | 5 | - | - | 5 | 5 | 0 | 2 | - | 5 |
| 246 | 5 | - | - | 2 | 4 | 0 | 0 | - | 5 |

| Соед. № | AMARE | SOLNI | ABUTH | SETFA | ECHCG | ZEAMX | IPOHE | LOLPE | AMAPA |
|--------------------|--------------|--------------|--------------|--------------|--------------|--------------|--------------|--------------|--------------|
| 251 | 1 | - | - | 0 | 0 | 0 | 0 | - | 2 |
| 252 | 3 | - | - | 4 | 5 | 0 | 3 | - | 5 |
| 253 | 5 | - | - | 5 | 5 | 1 | 4 | - | 5 |
| 258 | 5 | - | - | 5 | 5 | 1 | 1 | - | 5 |
| 260 | 4 | - | - | 4 | 5 | 1 | 3 | - | 4 |
| 261 | 4 | - | - | 4 | 4 | 1 | 4 | - | 5 |
| 262 | 5 | - | - | 5 | 5 | 2 | 3 | - | 5 |
| 282 | 3 | - | - | 1 | 1 | - | 0 | - | 4 |

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Соединение формулы (I):



5 где

X представляет собой O, NR⁶ или S;

R¹ представляет собой C₁-C₆алкил;

10 R² представляет собой фенил или гетероарил, где гетероарильный фрагмент представляет собой 5- или 6-членное ароматическое кольцо, которое содержит 1, 2, 3 или 4 гетероатома, по отдельности выбранных из N, O и S, и где каждый фенильный и гетероарильный фрагменты могут быть необязательно замещены 1, 2, 3 или 4 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R⁷;

15 R³ представляет собой водород, C₁-C₆алкил, N,N-ди(C₁-C₃алкил)амино, C₁-C₆галогеналкил, C₃-C₆циклоалкил, C₃-C₆циклоалкилC₁-C₆алкил, C₁-C₆алкоксиC₁-C₆алкил, C₂-C₆алкенил, C₂-C₆алкинил, фенил или фенилC₁-C₃алкил, где фенильные фрагменты могут быть необязательно замещены 1, 2, 3 или 4 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R⁸;

20 R⁴ представляет собой C₃-C₆циклоалкенил, фенил, фенилC₁-C₂алкил, фенилC₁-C₂алкенил, гетероциклил, где гетероциклильный фрагмент представляет собой 4-, 5- или 6-членное неароматическое моноциклическое кольцо, содержащее 1, 2 или 3 гетероатома, по отдельности выбранных из N, O и S, или гетероарил, где гетероарильный фрагмент представляет собой 5- или 6-членное ароматическое моноциклическое кольцо, содержащее 1, 2 или 3 гетероатома, по отдельности выбранных из N, O и S, и где каждый фенильный, гетероциклильный и гетероарильный фрагменты могут быть необязательно замещены 1, 2, 3 или 4 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R⁹, или

R⁴ представляет собой 6–10-членную аннелированную кольцевую систему, необязательно содержащую 1, 2 или 3 гетероатома, по отдельности выбранных из N, O и S, где аннелированная кольцевая система необязательно замещена 1 или 2 группами,

представленными R^{12} , и где аннелированная кольцевая система необязательно связана с остальной частью молекулы посредством C_1 - C_2 алкиленового линкера;

R^5 представляет собой галоген, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_4 галогеналкил, C_1 - C_4 галогеналкокси или C_1 - C_4 алкокси C_1 - C_4 алкил;

5 R^6 представляет собой водород, C_1 - C_3 алкил или C_1 - C_6 алкокси;

R^7 представляет собой циано, нитро, галоген, C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_6 галогеналкил, C_1 - C_6 галогеналкокси, C_1 - C_6 алкокси C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 алкилсульфанил, C_1 - C_6 алкилсульфинил, C_1 - C_6 алкилсульфонил, C_1 - C_6 алкилсульфонамидо, C_1 - C_6 алкилкарбонил, C_1 - C_6 алкоксикарбонил, C_1 - C_6 алкиламинокарбонил или фенил, где
10 каждый фенильный фрагмент может быть необязательно замещен 1, 2, или 3 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R^{10} ;

R^8 представляет собой галоген, циано, C_1 - C_3 алкил или C_1 - C_3 алкокси;

R^9 представляет собой циано, нитро, галоген, оксо, C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_6 галогеналкил, C_1 - C_6 галогеналкокси, C_1 - C_6 алкокси C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 алкокси C_1 -
15 C_6 алкокси, C_2 - C_6 алкенил, C_2 - C_6 алкинил, C_2 - C_6 алкенилокси, C_2 - C_6 алкинилокси, C_1 - C_6 алкилсульфанил, C_1 - C_6 алкилсульфинил, C_1 - C_6 алкилсульфонил, C_1 - C_6 алкилсульфонамидо, C_1 - C_6 алкилкарбонил, C_1 - C_6 алкоксикарбонил, C_1 - C_6 алкиламинокарбонил, C_3 - C_6 циклоалкил, C_3 - C_6 циклоалкил C_1 - C_6 алкокси, N,N-ди(C_1 -
20 C_4 алкил)аминосульфанил, C_3 - C_6 циклоалкиламинокарбонил, N,N-ди(C_1 - C_4 алкил)аминокарбонил, фенокси или бензилокси, где каждый циклоалкильный или фенильный фрагмент может быть необязательно замещен 1 или 2 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R^{12} , или

любые две смежные группы R^9 вместе с атомами углерода, к которым они присоединены, могут образовывать 5- или 6-членное гетероциклическое кольцо,
25 содержащее 1 или 2 гетероатома, выбранных из O и N, и где гетероциклическое кольцо может быть необязательно замещено 1, 2, 3 или 4 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R^{11} ;

R^{10} представляет собой галоген, C_1 - C_3 алкил или C_1 - C_3 алкокси;

R^{11} представляет собой галоген, C_1 - C_3 алкил или C_1 - C_3 алкокси;

30 R^{12} представляет собой циано, галоген, C_1 - C_3 алкил или C_1 - C_3 алкокси; или его соль или N-оксид.

2. Соединение по п. 1, где R^1 представляет собой C_1 - C_4 алкил.

3. Соединение по п. 1 или п. 2, где R^2 представляет собой фенил или пиридил, где каждый фенильный и пиридинильный фрагменты могут быть необязательно замещены 1 или 2 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R^7 .
- 5 4. Соединение по любому из пп. 1–3, где R^3 представляет собой водород, C_1 - C_4 алкил или N,N -ди(C_1 - C_3 алкил)амино.
- 10 5. Соединение по любому из пп. 1–4, где R^4 представляет собой C_4 - C_6 циклоалкил, фенил, фенил C_1 - C_2 алкил, гетероцикл, где гетероциклильный фрагмент представляет собой 5- или 6-членное неароматическое моноциклическое кольцо, содержащее 1 или 2 гетероатома, по отдельности выбранных из N, O и S, или гетероарил, где гетероарильный фрагмент представляет собой 5- или 6-членное ароматическое моноциклическое кольцо, содержащее 1 или 2 гетероатома, по
15 отдельности выбранных из N, O и S, и где каждый фенильный, гетероциклильный и гетероарильный фрагменты могут быть необязательно замещены 1, 2 или 3 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R^9 .
- 20 6. Соединение по любому из пп. 1–5, где R^4 представляет собой циклопентенил, фенил, стирил, гетероцикл, где гетероциклильный фрагмент представляет собой 6-членное неароматическое моноциклическое кольцо, содержащее единственный атом азота, или гетероарил, где гетероарильный фрагмент представляет собой 5- или 6-членное ароматическое моноциклическое кольцо, содержащее 1 или 2 гетероатома, по
25 отдельности выбранных из N, O и S, и где каждый фенильный, гетероциклильный и гетероарильный фрагменты могут быть необязательно замещены 1 или 2 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R^9 .
- 30 7. Соединение по любому из пп. 1–6, где R^4 представляет собой фенил или гетероарил, где гетероарильный фрагмент представляет собой 5- или 6-членное ароматическое кольцо, которое содержит 1 или 2 гетероатома, по отдельности выбранных из N, O и S, и где каждый фенильный, гетероциклильный и гетероарильный фрагменты могут быть необязательно замещены 1 или 2 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R^9 .

8. Соединение по любому из пп. 1–7, где R^5 представляет собой C_1 - C_3 алкил или C_1 - C_2 алкокси- C_1 - C_2 алкил.
9. Соединение по любому из пп. 1–7, где R^9 представляет собой циано, нитро, галоген, оксо, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_4 галогеналкил, C_1 - C_4 галогеналкокси, C_1 - C_4 алкокси- C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 алкокси- C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_4 алкилсульфанил, C_1 - C_4 алкилсульфонил, C_1 - C_4 алкилсульфонамидо, C_1 - C_4 алкилкарбонил, C_1 - C_4 алкоксикарбонил, C_3 - C_4 циклоалкил, C_3 - C_4 циклоалкил- C_1 - C_3 алкокси, N,N -ди(C_1 - C_3 алкил)аминосульфанил, C_3 - C_4 циклоалкиламинокарбонил, N,N -ди(C_1 - C_3 алкил)аминокарбонил, фенокси или бензилокси, где каждый циклоалкильный или фенильный фрагмент может быть необязательно замещен 1 или 2 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R^{12} ; или любые две смежные группы R^9 вместе с атомами углерода, к которым они присоединены, могут образовывать 5- или 6-членное гетероциклическое кольцо, содержащее 1 или 2 гетероатома, выбранных из O и N, и где гетероциклическое кольцо может быть необязательно замещено 1 или 2 группами, которые могут быть одинаковыми или разными, представленными R^{11} .
10. Соединение по любому из пп. 1–9, где R^9 представляет собой циано, нитро, хлор, фтор, оксо, метил, трет-бутил, метокси, этокси, изопропокси, дифторметил, трифторметил, трифторметокси, 2,2,2-трифторэтокси, метоксиметил, метоксиэтокси, метилсульфанил, метилсульфонил, этилсульфонил, ацетил, циклопропилметокси, этилкарбамоил, циклопропилкарбамоил, диметилкарбамоил, диэтилсульфамоил, фенокси, бензилокси; или любые две смежные группы R^9 вместе с атомами углерода, к которым они присоединены, могут образовывать 5-членное гетероциклическое кольцо, содержащее два атома кислорода, и где гетероциклическое кольцо может быть необязательно замещено 1 или 2 группами фтора.
11. Гербицидная композиция, содержащая соединение по любому из предыдущих пунктов и приемлемое с точки зрения сельского хозяйства вспомогательное средство для составления.
12. Гербицидная композиция по п. 11, дополнительно содержащая по меньшей мере один дополнительный пестицид.

13. Гербицидная композиция по п. 12, где дополнительный пестицид представляет собой гербицид или антидот гербицида.
- 5 14. Способ контроля сорняков в месте произрастания, включающий применение по отношению к месту произрастания достаточного для контроля сорняков количества композиции по любому из пп. 11–13.
- 10 15. Применение соединения формулы (I) по любому из пп. 1–10 в качестве гербицида.