

(19)



**Евразийское
патентное
ведомство**

(21) **202391999** (13) **A1**

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОЙ ЗАЯВКЕ

(43) Дата публикации заявки
2023.10.31

(22) Дата подачи заявки
2020.07.17

(51) Int. Cl. **C07D 237/16** (2006.01)
A01N 43/58 (2006.01)
C07D 401/10 (2006.01)
C07D 403/10 (2006.01)
C07D 409/10 (2006.01)
C07D 413/10 (2006.01)
C07D 417/10 (2006.01)

(54) ЗАМЕЩЕННЫЕ ПИРИДАЗИНОНЫ В КАЧЕСТВЕ ГЕРБИЦИДОВ

(31) **1910290.4**

(32) **2019.07.18**

(33) **GB**

(62) **202290300; 2020.07.17**

(71) Заявитель:
**СИНГЕНТА КРОП ПРОТЕКШН АГ
(CH)**

(72) Изобретатель:

**Лин Кеннет Брюс, Сиден Питер
Тимоги, Мэтьюс Кристофер Джон,
Шэнахен Стивен Эдвард, Кициу
Кристиана, Финни Джон (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) Настоящее изобретение относится к гербицидным замещенным фенилпиридазиндионам и замещенным фенилпиридазиновым производным формулы (I), а также к способам и промежуточным соединениям, применяемым для получения таких производных. Настоящее изобретение дополнительно распространяется на гербицидные композиции, содержащие такие производные, а также на применение таких соединений и композиций в обеспечении контроля роста нежелательных растений, в частности, на применение в обеспечении контроля сорняков, таких как широколиственные двудольные сорняки, в сельскохозяйственных культурах полезных растений.

A1

202391999

202391999

A1

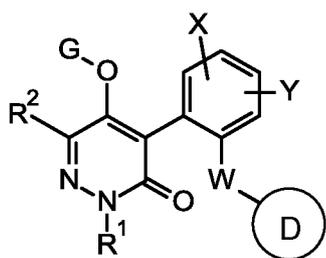
ЗАМЕЩЕННЫЕ ПИРИДАЗИНОНЫ В КАЧЕСТВЕ ГЕРБИЦИДОВ

5 Настоящее изобретение относится к гербицидным замещенным фенилпиридазиндионам и замещенным фенилпиридазиновым производным формулы (I), а также к способам и промежуточным соединениям, применяемым для
10 получения таких производных. Настоящее изобретение дополнительно распространяется на гербицидные композиции, содержащие такие производные, а также на применение таких соединений и композиций в обеспечении контроля роста
15 нежелательных растений, в частности, на применение в обеспечении контроля сорняков, таких как широколиственные двудольные сорняки, в сельскохозяйственных культурах полезных растений.

Гербицидные пиридазины известны из WO2009/086041. Кроме того,
15 гербицидные 5/6-членные гетероцикл-замещенные пиридазины известны из WO 2011/045271. При этом в WO2013/160126 описаны индолилпиридазиновые производные, которые проявляют гербицидную активность.

Настоящее изобретение основано на открытии того, что замещенные
20 фенилпиридазиндионы и замещенные фенилпиридазиновые производные формулы (I) проявляют неожиданно хорошую гербицидную активность.

Таким образом, в первом аспекте предусмотрено соединение формулы (I),



(I), или его соль или N-оксид, где

R^1 выбран из группы, состоящей из C_1 - C_4 алкила, C_3 - C_6 циклоалкила, C_3 - C_6 алкокси, C_1 -
25 C_2 алкокси- C_1 - C_2 алкила, C_2 - C_4 алкенила, C_1 - C_4 галогеналкила, циано- C_1 - C_4 алкила, C_2 -
 C_4 галогеналкенила, C_2 - C_4 алкинила и C_2 - C_4 галогеналкинила;

R^2 выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, циано, C_1 - C_6 алкила, C_1 -
 C_6 галогеналкила, C_1 - C_6 галогеналкокси, C_1 - C_3 галогеналкокси- C_1 - C_3 алкил-, C_1 - C_6 алкокси,
 C_1 - C_3 алкокси- C_1 - C_3 алкил-, C_1 - C_3 алкокси- C_1 - C_3 алкокси- C_1 - C_3 алкил-, C_3 - C_6 циклоалкила,
 C_2 - C_6 алкенила, C_2 - C_6 галогеналкенила, C_2 - C_6 алкинила, C_1 - C_6 гидроксиалкил-, C_1 -

С₆алкилкарбонил-, -S(O)_mC₁-С₆алкила, amino, С₁-С₆алкиламино, С₁-С₆диалкиламино, -C(C₁-С₃алкил)=N-O-C₁-С₃алкила и С₂-С₆галогеналкинила;

G представляет собой водород или C(O)R³;

5 R³ выбран из группы, состоящей из С₁-С₆алкила, С₂-С₆алкенила, С₂-С₆алкинила, С₁-С₆алкил-S-, С₁-С₆алкокси, -NR⁴R⁵ и фенила, необязательно замещенного одним или несколькими R⁶;

каждый из R⁴ и R⁵ независимо выбран из группы, состоящей из водорода, С₁-С₆алкила, С₁-С₆алкокси и С₃-С₆циклоалкила, или R⁴ и R⁵ вместе могут образовывать морфолинильное кольцо; и

10 каждый из R^{4a} и R^{5a} независимо выбран из группы, состоящей из С₁-С₆алкокси и С₃-С₆циклоалкила, или R^{4a} и R^{5a} вместе могут образовывать морфолинильное кольцо; и

R⁶ выбран из группы, состоящей из галогена, циано, нитро, С₁-С₃алкила, С₁-С₃галогеналкила, С₁-С₃алкокси и С₁-С₃галогеналкокси;

15 каждый из X и Y независимо представляет собой водород, С₁-С₃алкил, циклопропил, С₁-С₃алкокси, С₁-С₃галогеналкил, С₁-С₃галогеналкокси или галоген;

D представляет собой замещенное моноциклическое гетероарильное кольцо, содержащее 1, 2 или 3 гетероатома, независимо выбранные из кислорода, азота и серы, при этом замещенное по меньшей мере одному атому углерода в кольце с помощью

20 R⁸ и/или по меньшей мере одному атому азота в кольце с помощью R⁹;

по меньшей мере один R⁸ выбран из группы, состоящей из С₁-С₆галогеналкилкарбонил-, С₃-С₆циклоалкилкарбонил-, -S(O)_m-С₁-С₆галогеналкила, -S(O)_m-С₃-С₆циклоалкила, -O-S(O)₂С₁-С₃алкила, -С₁-С₃алкил-S(O)_m-С₁-С₆алкила, -С₁-С₃алкил-S(O)_m-С₁-С₆галогеналкила, -С₁-С₃алкил-S(O)_m-С₃-С₆циклоалкила, циано-С₁-С₆-

25 алкил-, -NR^{4a}R^{5a}, -C(S)NR⁴R⁵, -S(O)₂NHC(O)С₁-С₃алкила, -S(O)₂NR⁴R⁵, -C(O)OH, -C(O)OC₁-С₆алкила, -C(O)NHS-(O)₂С₁-С₆алкила, -C(O)NR⁴R⁵, -NR⁴C(O)NR⁴R⁵, С₁-С₆алкилкарбонил(С₁-С₆алкил)амино-, С₁-С₆галогеналкилкарбониламино-, С₁-С₆галогеналкилкарбонил(С₁-С₆алкил)амино-, С₁-С₆алкилсульфониламино-, С₁-С₆алкилсульфонил(С₁-С₆алкил)амино-, С₁-С₆галогеналкилсульфониламино-, С₁-С₆галогеналкилсульфонил(С₁-С₆алкил)амино-, С₃-С₆циклоалкилсульфониламино-, С₃-С₆циклоалкилсульфонил(С₁-С₆алкил)амино-, гидроксiamiно-, гидрокси(С₁-С₆алкил)амино-, С₁-С₆алкоксиамино-, С₁-С₆алкокси(С₁-С₆алкил)амино-, С₁-С₆галогеналкоксиамино-, С₁-С₆галогеналкокси(С₁-С₆алкил)амино и кольцевой системы, выбранной из группы, состоящей из фенильного кольца, 5-6-членного гетероарильного

30

кольца и 3-6-членного гетероциклического кольца, при этом указанная кольцевая система замещена с помощью 0-5 R^{16} ;

по меньшей мере один R^9 выбран из группы, состоящей из C_5 - C_6 алкила, C_5 - C_6 галогеналкила, C_3 - C_6 -циклоалкила, C_1 - C_3 алкокси- C_3 алкил-, C_3 алкокси- C_1 - C_2 алкил-,

5 C_1 - C_3 галогеналкокси- C_1 - C_3 алкил-, C_1 - C_3 алкокси- C_1 - C_3 алкокси- C_1 - C_3 алкил-, C_1 - C_6 гидроксиалкил-, $-C_1$ - C_3 алкил- $S(O)_m$ - C_1 - C_6 алкила, $-C_1$ - C_3 алкил- $S(O)_m$ - C_1 -

C_6 галогеналкила, $-C_1$ - C_3 алкил- $S(O)_m$ - C_3 - C_6 циклоалкила, циано- C_1 - C_6 -алкил- и

кольцевой системы, выбранной из группы, состоящей из фенильного кольца, 5-6-членного гетероарильного кольца и 3-6-членного гетероциклического кольца, при этом

10 указанная кольцевая система замещена с помощью 0-5 R^{16} ;

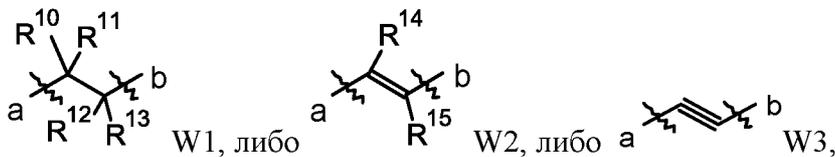
m представляет собой целое число, равное 0, 1 или 2;

каждый R^{16} независимо представляет собой галоген, циано, C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 галогеналкил, C_1 - C_6 алкокси или C_1 - C_6 галогеналкокси;

или D представляет собой фенильное кольцо, замещенное по меньшей мере одним R^8 ;

15 и

W представляет собой либо



где

"a" обозначает точку присоединения к

20 фенилпиридазиндионового/фенилпиридазинового фрагменту,

"b" обозначает точку присоединения к кольцу D ,

каждый из R^{10} , R^{12} , R^{14} и R^{15} независимо представляет собой водород, C_1 - C_3 алкил или C_1 - C_3 галогеналкил;

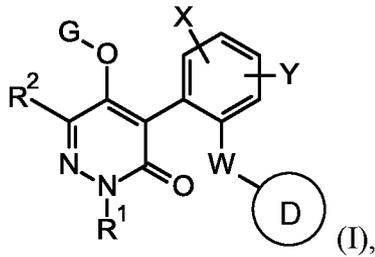
25 или R^{10} и R^{12} вместе с атомами углерода, к которым они присоединены, образуют C_3 - C_6 карбоциклическое кольцо; и

каждый из R^{11} и R^{13} независимо представляет собой водород, галоген, C_1 - C_3 алкил или C_1 - C_3 галогеналкил;

при условии, что если один из R^{11} или R^{13} представляет собой галоген, C_1 - C_3 алкил или

30 C_1 - C_3 галогеналкил, то другой представляет собой водород.

Во втором аспекте предусмотрено соединение формулы (I),



или его соль или N-оксид, где

R^1 выбран из группы, состоящей из C_1 - C_4 алкила, C_3 - C_6 циклоалкила, C_3 - C_6 алкокси, C_1 - C_2 алкокси- C_1 - C_2 алкила, C_2 - C_4 алкенила, C_1 - C_4 галогеналкила, циано- C_1 - C_4 алкила, C_2 - C_4 галогеналкенила, C_2 - C_4 алкинила и C_2 - C_4 галогеналкинила;

R^2 выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, циано, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 галогеналкила, C_1 - C_6 галогеналкокси, C_1 - C_3 галогеналкокси- C_1 - C_3 алкил-, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_3 алкокси- C_1 - C_3 алкила, C_1 - C_3 алкокси- C_1 - C_3 алкокси- C_1 - C_3 алкил-, C_3 - C_6 циклоалкила, C_2 - C_6 алкенила, C_2 - C_6 галогеналкенила, C_2 - C_6 алкинила, C_1 - C_6 гидроксиалкил-, C_1 - C_6 алкилкарбонил-, $-S(O)_m C_1$ - C_6 алкила, $-NR^4 R^5$, $-C(C_1-C_3алкил)=N-O-C_1-C_3алкила$ и C_2 - C_6 галогеналкинила;

G представляет собой водород или $C(O)R^3$;

R^3 выбран из группы, состоящей из C_1 - C_6 алкила, C_2 - C_6 алкенила, C_2 - C_6 алкинила, C_1 - C_6 алкил-S-, C_1 - C_6 алкокси, $-NR^4 R^5$ и фенила, необязательно замещенного одним или несколькими R^6 ;

каждый из R^4 и R^5 независимо выбран из группы, состоящей из водорода, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 алкокси и C_3 - C_6 циклоалкила, или R^4 и R^5 вместе могут образовывать морфолинильное кольцо; и

R^6 выбран из группы, состоящей из галогена, циано, нитро, C_1 - C_3 алкила, C_1 - C_3 галогеналкила, C_1 - C_3 алкокси и C_1 - C_3 галогеналкокси;

X представляет собой циклопропил (предпочтительно X находится в *орто*-положении относительно пиридазинонового/пиридазиндионового фрагмента);

Y представляет собой водород, C_1 - C_3 алкил, циклопропил, C_1 - C_3 алкокси, C_1 - C_3 галогеналкил, C_1 - C_3 галогеналкокси или галоген (Y находится в *орто*-положении (3-положении) относительно фрагмента -W-D);

D представляет собой замещенное или незамещенное моноциклическое гетероарильное кольцо, содержащее 1, 2 или 3 гетероатома, независимо выбранные из кислорода, азота и серы, и при этом, если D является замещенным, то он замещен по меньшей мере

одному атому углерода в кольце с помощью R^8 и/или по атому азота в кольце с помощью R^9 ;

каждый R^8 независимо представляет собой кислород, гидроксил, галоген, циано, C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 галогеналкил, C_3 - C_6 -циклоалкил, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_6 галогеналкокси, C_1 - C_3 алкокси- C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_3 галогеналкокси- C_1 - C_3 алкил-, C_1 - C_3 алкокси- C_1 - C_3 алкокси- C_1 - C_3 алкил-, C_2 - C_6 алкенил, C_2 - C_6 галогеналкенил, C_2 - C_6 алкинил, C_2 - C_6 галогеналкинил, C_1 - C_6 гидроксиалкил-, C_1 - C_6 алкилкарбонил-, C_1 - C_6 галогеналкилкарбонил-, C_3 - C_6 циклоалкилкарбонил-, $-S(O)_m$ - C_1 - C_6 галогеналкил, $-S(O)_m$ - C_3 - C_6 циклоалкил, $-O$ - $S(O)_2$ - C_1 - C_3 алкил, $-C_1$ - C_3 алкил- $S(O)_m$ - C_1 - C_6 алкил, $-C_1$ - C_3 алкил- $S(O)_m$ - C_1 - C_6 галогеналкил, $-C_1$ - C_3 алкил- $S(O)_m$ - C_3 - C_6 циклоалкил, циано- C_1 - C_6 -алкил-, NR^4R^5 , $-C(S)NR^4R^5$, $-S(O)_2NHC(O)C_1$ - C_3 алкил-, $-S(O)_2NR^4R^5$, $-C(O)OH$, $-C(O)OC_1$ - C_6 алкил, $-C(O)NHS-(O)_2C_1$ - C_6 алкил, $-C(O)NR^4R^5$, $-NR^4C(O)NR^4R^5$, C_1 - C_6 алкилкарбонил(C_1 - C_6 алкил)амино-, C_1 - C_6 галогеналкилкарбониламино-, C_1 - C_6 галогеналкилкарбонил(C_1 - C_6 алкил)амино-, C_1 - C_6 алкилсульфониламино-, C_1 - C_6 алкилсульфонил(C_1 - C_6 алкил)амино-, C_1 - C_6 галогеналкилсульфониламино-, C_1 - C_6 галогеналкилсульфонил(C_1 - C_6 алкил)амино-, C_3 - C_6 циклоалкилсульфониламино-, C_3 - C_6 циклоалкилсульфонил(C_1 - C_6 алкил)амино-, гидроксиамино-, гидроксид(C_1 - C_6 алкил)амино, C_1 - C_6 алкоксиамино, C_1 - C_6 алкокси(C_1 - C_6 алкил)амино, C_1 - C_6 галогеналкоксиамино, C_1 - C_6 галогеналкокси(C_1 - C_6 алкил)амино или кольцевую систему, выбранную из группы, состоящей из фенильного кольца, 5-6-членного гетероарильного кольца и 3-6-членного гетероциклического кольца, при этом указанная кольцевая система замещена с помощью 0-5 R^{16} ;

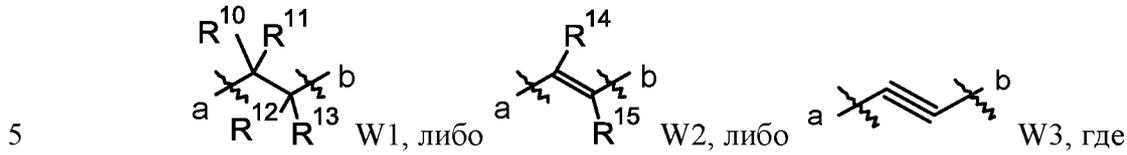
m представляет собой целое число, равное 0, 1 или 2 (предпочтительно 0 или 2); и

каждый R^9 независимо представляет собой C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 галогеналкил, C_3 - C_6 -циклоалкил, C_1 - C_3 алкокси- C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_3 галогеналкокси- C_1 - C_3 алкил-, C_1 - C_3 алкокси- C_1 - C_3 алкокси- C_1 - C_3 алкил-, C_1 - C_6 гидроксиалкил-, $-C_1$ - C_3 алкил- $S(O)_m$ - C_1 - C_6 алкил, $-C_1$ - C_3 алкил- $S(O)_m$ - C_1 - C_6 галогеналкил, $-C_1$ - C_3 алкил- $S(O)_m$ - C_3 - C_6 циклоалкил, циано- C_1 - C_6 -алкил- или кольцевую систему, выбранную из группы, состоящей из фенильного кольца, 5-6-членного гетероарильного кольца и 3-6-членного гетероциклического кольца, при этом указанная кольцевая система замещена с помощью 0-5 R^{16} ;

каждый R^{16} независимо представляет собой галоген, циано, C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 галогеналкил, C_1 - C_6 алкокси или C_1 - C_6 галогеналкокси;

или D представляет собой замещенное или незамещенное фенильное кольцо, и при этом, если указанное фенильное кольцо является замещенным, то оно замещено с помощью 1-5 R⁸;

и W представляет собой либо



"a" обозначает точку присоединения к фенилпиридазиндионовому/фенилпиридазиновому фрагменту,

"b" обозначает точку присоединения к кольцу D,

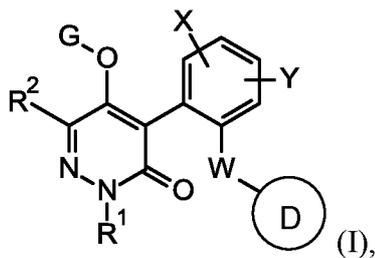
каждый из R¹⁰, R¹², R¹⁴ и R¹⁵ независимо представляет собой водород, C₁-C₃алкил или C₁-C₃галогеналкил;

или R¹⁰ и R¹² вместе с атомами углерода, к которым они присоединены, образуют C₃-C₆карбоциклическое кольцо; и

каждый из R¹¹ и R¹³ независимо представляет собой водород, галоген, C₁-C₃алкил или C₁-C₃галогеналкил;

15 при условии, что если один из R¹¹ или R¹³ представляет собой галоген, C₁-C₃алкил или C₁-C₃галогеналкил, то другой представляет собой водород.

В третьем аспекте предусмотрено соединение формулы (I),



20 или его соль или N-оксид, где

R¹ выбран из группы, состоящей из C₁-C₄алкила, C₃-C₆циклоалкила, C₃-C₆алкокси, C₁-C₂алкокси-C₁-C₂алкила, C₂-C₄алкенила, C₁-C₄галогеналкила, циано-C₁-C₄алкила, C₂-C₄галогеналкенила, C₂-C₄алкинила и C₂-C₄галогеналкинила;

25 R² выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, циано, C₁-C₆алкила, C₁-C₆галогеналкила, C₁-C₆галогеналкокси, C₁-C₃галогеналкокси-C₁-C₃алкил-, C₁-C₆алкокси, C₁-C₃алкокси-C₁-C₃алкила, C₁-C₃алкокси-C₁-C₃алкокси-C₁-C₃алкил-, C₃-C₆циклоалкила, C₂-C₆алкенила, C₂-C₆галогеналкенила, C₂-C₆алкинила, C₁-C₆гидроксиалкил-, C₁-

С₆алкилкарбонил-, -S(O)_mC₁-С₆алкила, -NR⁴R⁵, -C(C₁-С₃алкил)=N-O-C₁-С₃алкила и С₂-С₆галогеналкинила;

G представляет собой водород или C(O)R³;

5 R³ выбран из группы, состоящей из С₁-С₆алкила, С₂-С₆алкенила, С₂-С₆алкинила, С₁-С₆алкил-S-, С₁-С₆алкокси, -NR⁴R⁵ и фенила, необязательно замещенного одним или несколькими R⁶;

каждый из R⁴ и R⁵ независимо выбран из группы, состоящей из водорода, С₁-С₆алкила, С₁-С₆алкокси и С₃-С₆циклоалкила, или R⁴ и R⁵ вместе могут образовывать морфолинильное кольцо; и

10 R⁶ выбран из группы, состоящей из галогена, циано, нитро, С₁-С₃алкила, С₁-С₃галогеналкила, С₁-С₃алкокси и С₁-С₃галогеналкокси;

X представляет собой водород, С₁-С₃алкил, циклопропил, С₁-С₃алкокси, С₁-С₃галогеналкил, С₁-С₃галогеналкокси или галоген (предпочтительно X находится в *орто*-положении относительно пиридазинового/пиридазиндионового фрагмента);

15 Y представляет собой циклопропил (предпочтительно Y находится в *орто*-положении относительно фрагмента -W-D);

D представляет собой замещенное или незамещенное моноциклическое гетероарильное кольцо, содержащее 1, 2 или 3 гетероатома, независимо выбранные из кислорода, азота и серы, и при этом, если D является замещенным, то он замещен по меньшей мере
20 одному атому углерода в кольце с помощью R⁸ и/или по атому азота в кольце с помощью R⁹;

каждый R⁸ независимо представляет собой кислород, гидроксил, галоген, циано, С₁-С₆алкил, С₁-С₆галогеналкил, С₃-С₆циклоалкил, С₁-С₆алкокси, С₁-С₆галогеналкокси, С₁-С₃алкокси-С₁-С₃алкил, С₁-С₃галогеналкокси-С₁-С₃алкил-, С₁-С₃алкокси-С₁-С₃алкокси-
25 С₁-С₃алкил-, С₂-С₆алкенил, С₂-С₆галогеналкенил, С₂-С₆алкинил, С₂-С₆галогеналкинил, С₁-С₆гидроксиалкил-, С₁-С₆алкилкарбонил-, С₁-С₆галогеналкилкарбонил-, С₃-С₆циклоалкилкарбонил-, -S(O)_m-С₁-С₆галогеналкил, -S(O)_m-С₃-С₆циклоалкил, -O-S(O)₂С₁-С₃алкил, -С₁-С₃алкил-S(O)_m-С₁-С₆алкил, -С₁-С₃алкил-S(O)_m-С₁-С₆галогеналкил, -С₁-С₃алкил-S(O)_m-С₃-С₆циклоалкил, циано-С₁-С₆-алкил-, NR⁴R⁵, -C(S)NR⁴R⁵, -
30 S(O)₂NHC(O)С₁-С₃алкил, -S(O)₂NR⁴R⁵, -C(O)OH, -C(O)OC₁-С₆алкил, -C(O)NHS-(O)₂С₁-С₆алкил, -C(O)NR⁴R⁵, -NR⁴C(O)NR⁴R⁵, С₁-С₆алкилкарбонил(С₁-С₆алкил)амино-, С₁-С₆галогеналкилкарбониламино-, С₁-С₆галогеналкилкарбонил(С₁-С₆алкил)амино-, С₁-С₆алкилсульфониламино-, С₁-С₆алкилсульфонил(С₁-С₆алкил)амино-, С₁-С₆галогеналкилсульфониламино-, С₁-С₆галогеналкилсульфонил(С₁-С₆алкил)амино-, С₃-

С₆циклоалкилсульфониламино-, С₃-С₆циклоалкилсульфонил(С₁-С₆алкил)амино-, гидроксиамино-, гидрокси(С₁-С₆алкил)амино, С₁-С₆алкоксиамино, С₁-С₆алкокси(С₁-С₆алкил)амино, С₁-С₆галогеналкоксиамино, С₁-С₆галогеналкокси(С₁-С₆алкил)амино или кольцевую систему, выбранную из группы, состоящей из фенильного кольца, 5-6-членного гетероарильного кольца и 3-6-членного гетероциклического кольца, при этом указанная кольцевая система замещена с помощью 0-5 R¹⁶;

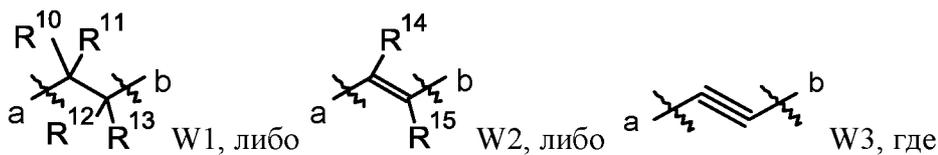
m представляет собой целое число, равное 0, 1 или 2; и

каждый R⁹ независимо представляет собой С₁-С₆алкил, С₁-С₆галогеналкил, С₃-С₆циклоалкил, С₁-С₃алкокси-С₁-С₃алкил, С₁-С₃галогеналкокси-С₁-С₃алкил-, С₁-С₃алкокси-С₁-С₃алкокси-С₁-С₃алкил-, С₁-С₆гидроксиалкил-, -С₁-С₃алкил-S(O)_m-С₁-С₆алкил, -С₁-С₃алкил-S(O)_m-С₁-С₆галогеналкил, -С₁-С₃алкил-S(O)_m-С₃-С₆циклоалкил, циано-С₁-С₆-алкил- или кольцевую систему, выбранную из группы, состоящей из фенильного кольца, 5-6-членного гетероарильного кольца и 3-6-членного гетероциклического кольца, при этом указанная кольцевая система замещена с помощью 0-5 R¹⁶;

каждый R¹⁶ независимо представляет собой галоген, циано, С₁-С₆алкил, С₁-С₆галогеналкил, С₁-С₆алкокси или С₁-С₆галогеналкокси;

или D представляет собой замещенное или незамещенное фенильное кольцо, и при этом, если указанное фенильное кольцо является замещенным, то оно замещено с помощью 1-5 R⁸; и

W представляет собой либо



"a" обозначает точку присоединения к фенилпиридазиндионовому/фенилпиридазиновому фрагменту,

"b" обозначает точку присоединения к кольцу D,

каждый из R¹⁰, R¹², R¹⁴ и R¹⁵ независимо представляет собой водород, С₁-С₃алкил или С₁-С₃галогеналкил;

или R¹⁰ и R¹² вместе с атомами углерода, к которым они присоединены, образуют С₃-С₆карбоциклическое кольцо;

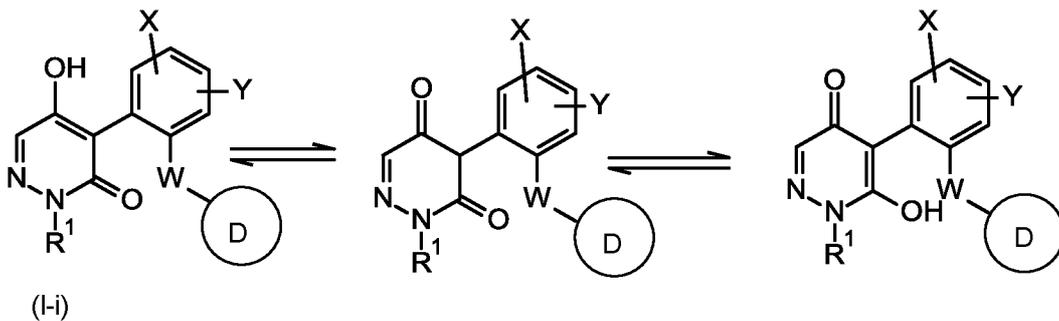
каждый из R¹¹ и R¹³ независимо представляет собой водород, галоген, С₁-С₃алкил или С₁-С₃галогеналкил;

при условии, что если один из R^{11} или R^{13} представляет собой галоген, C_1 - C_3 алкил или C_1 - C_3 галогеналкил, то другой представляет собой водород.

Соединения формулы (I) могут содержать асимметричные центры и могут быть представлены в виде отдельного энантиомера, пар энантиомеров в любой пропорции или, при наличии более одного асимметричного центра, содержать диастереоизомеры во всех возможных соотношениях. Как правило, один из энантиомеров характеризуется повышенной биологической активностью по сравнению с другими вариантами.

Аналогично, в случае дизамещенных алкенов, они могут быть представлены в E- или Z-форме или в виде смесей обоих в любой пропорции.

Более того, соединения формулы (I) могут находиться в состоянии равновесия с альтернативными таутомерными формами. Например, соединение формулы (I-i), т. е. соединение формулы (I), где R^2 представляет собой водород, и G представляет собой водород, может быть изображено в по меньшей мере трех таутомерных формах:



Следует понимать, что все таутомерные формы (отдельный таутомер или их смеси), рацемические смеси и отдельные изомеры охватываются объемом настоящего изобретения.

Каждый алкильный фрагмент либо сам по себе, либо как часть большей группы (такой как алкокси, алкилтио, алкоксикарбонил, алкилкарбонил, алкиламинокарбонил или диалкиламинокарбонил и т. д.) может быть с прямой цепью или разветвленным. Как правило, алкил представляет собой, например, метил, этил, *n*-пропил, изопропил, *n*-бутил, *втор*-бутил, изобутил, *трет*-бутил, *n*-пентил, неопентил или *n*-гексил. Алкильные группы обычно представляют собой C_1 - C_6 алкильные группы (за исключением случаев, когда уже определены более узко), но предпочтительно представляют собой C_1 - C_4 алкильные или C_1 - C_3 алкильные группы и более предпочтительно представляют собой C_1 - C_2 алкильные группы (такие как метил).

Алкенильные и алкинильные фрагменты могут быть в форме прямых или разветвленных цепей, и алкенильные фрагменты, если необходимо, могут быть либо в

(*E*)-, либо в (*Z*)-конфигурации. Алкенильные или алкинильные фрагменты, как правило, представляют собой C₂-C₄алкенил или C₂-C₄алкинил, более конкретно винил, аллил, этинил, пропаргил или проп-1-инил. Алкенильные и алкинильные фрагменты могут содержать одну или несколько двойных и/или тройных связей в любой комбинации; но предпочтительно они содержат только одну двойную связь (для алкенила) или только одну тройную связь (для алкинила).

Предпочтительно термин "циклоалкил" относится к циклопропилу, циклобутилу, циклопентилу или циклогексилу.

В контексте настоящего описания термин "арил" предпочтительно означает фенил. Термин "гетероарил", применяемый в данном документе, означает ароматическую кольцевую систему, содержащую по меньшей мере один гетероатом в кольце и состоящую из единственного кольца. Одинарные кольца предпочтительно будут содержать 1, 2 или 3 гетероатома в кольце, независимо выбранные из азота, кислорода и серы. Как правило, "гетероарил" представляет собой фурил, тиенил, пирролил, пиразолил, имидазолил, 1,2,3-триазолил, 1,2,4-триазолил, оксазолил, изоксазолил, тиазолил, изотиазолил, 1,2,4-оксадиазолил, 1,3,4-оксадиазолил, 1,2,5-оксадиазолил, 1,2,3-тиадиазолил, 1,2,4-тиадиазолил, 1,3,4-тиадиазолил, 1,2,5-тиадиазолил, пиридил, пиримидинил, пиридазинил, пиазинил, 1,2,3-триазинил, 1,2,4-триазинил или 1,3,5-триазинил.

Гетероциклические группы и гетероциклические кольца (либо сами по себе, либо как часть большей группы, такой как гетероциклический-алкил-) представляют собой кольцевые системы, содержащие по меньшей мере один гетероатом, и могут находиться в моно- или бициклической форме. Гетероциклические группы предпочтительно будут содержать до двух гетероатомов, которые предпочтительно будут выбраны из азота, кислорода и серы. Примеры гетероциклических групп включают оксетанил, тиетанил, азетидинил и 7-окса-бицикло[2.2.1]гепт-2-ил. Гетероциклические группы, содержащие один атом кислорода в качестве гетероатома, являются наиболее предпочтительными. Гетероциклические группы предпочтительно представляют собой 3-8-членные, более предпочтительно 3-6-членные моноциклические кольца и могут быть полностью или частично насыщенными.

Галоген (или галогено) охватывает фтор, хлор, бром или йод. То же самое, соответственно, применимо к галогену в контексте других определений, таких как галогеналкил или галогенфенил.

Галогеналкильными группами с длиной цепи от 1 до 6 атомов углерода являются, например, фторметил, дифторметил, трифторметил, хлорметил, дихлорметил, трихлорметил, 2,2,2-трифторэтил, 2-фторэтил, 2-хлорэтил, пентафторэтил, 1,1-дифтор-2,2,2-трихлорэтил, 2,2,3,3-тетрафторэтил и 2,2,2-трихлорэтил, гептафтор-*n*-пропил и перфтор-*n*-гексил.

Алкоксигруппы предпочтительно характеризуются длиной цепи от 1 до 6 атомов углерода. Алкокси представляет собой, например, метокси, этокси, пропокси, изопропокси, *n*-бутокси, изобутокси, втор-бутокси или трет-бутокси или изомер пентилокси или гексилокси, предпочтительно метокси и этокси. Также следует понимать, что при одном и том же атоме углерода могут присутствовать два алкокси-заместителя.

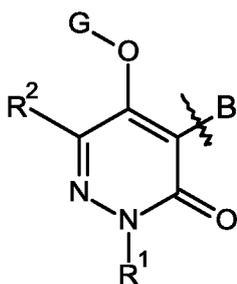
Галогеналкокси представляет собой, например, фторметокси, дифторметокси, трифторметокси, 2,2,2-трифторэтокси, 1,1,2,2-тетрафторэтокси, 2-фторэтокси, 2-хлорэтокси, 2,2-дифторэтокси или 2,2,2-трихлорэтокси, предпочтительно дифторметокси, 2-хлорэтокси или трифторметокси.

C_1 - C_6 алкил-S- (алкилтио) представляет собой, например, метилтио, этилтио, пропилтио, изопропилтио, *n*-бутилтио, изобутилтио, втор-бутилтио или трет-бутилтио, предпочтительно метилтио или этилтио.

C_1 - C_6 алкил-S(O)- (алкилсульфинил) представляет собой, например, метилсульфинил, этилсульфинил, пропилсульфинил, изопропилсульфинил, *n*-бутилсульфинил, изобутилсульфинил, втор-бутилсульфинил или трет-бутилсульфинил, предпочтительно метилсульфинил или этилсульфинил.

C_1 - C_6 алкил-S(O)₂- (алкилсульфонил) представляет собой, например, метилсульфонил, этилсульфонил, пропилсульфонил, изопропилсульфонил, *n*-бутилсульфонил, изобутилсульфонил, втор-бутилсульфонил или трет-бутилсульфонил, предпочтительно метилсульфонил или этилсульфонил.

Группа Q



((Q)) упоминается в данном документе как пиридазиндиононовый/пиридазиноновый фрагмент, где B обозначает точку

присоединения к остальной части молекулы (т. е. к необязательно замещенному фрагменту фенил-W-D).

Настоящее изобретение также включает приемлемые с точки зрения сельского хозяйства соли, которые могут образовывать соединения формулы (I) с аминами (например, аммиаком, диметиламином и триэтиламином), основаниями щелочных металлов и щелочно-земельных металлов или четвертичными аммониевыми основаниями. Среди гидроксидов, оксидов, алкоксидов, и гидрокарбонатов, и карбонатов щелочных металлов и щелочно-земельных металлов, применяемых в качестве солеобразователей, следует уделить внимание гидроксидам, алкоксидам, оксидам и карбонатам лития, натрия, калия, магния и кальция, но особенно гидроксидам, алкоксидам, оксидам и карбонатам натрия, магния и кальция. Также можно применять соответствующую триметилсульфониевую соль. Соединения формулы (I) в соответствии с настоящим изобретением также включают гидраты, которые могут быть образованы в ходе солеобразования.

Предпочтительные значения R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^{4a} , R^{5a} , R^6 , R^8 , R^9 , R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{14} , R^{15} , R^{16} , W, D, Dp, G, X, Y, и m изложены ниже, и соединение формулы (I) в соответствии с настоящим изобретением может содержать любую комбинацию указанных значений. Специалисту в данной области техники будет понятно, что значения для любой указанной группы вариантов осуществления можно комбинировать со значениями для любой другой группы вариантов осуществления, если такие комбинации не являются взаимно исключающими.

Предпочтительно R^1 выбран из группы, состоящей из метила, этила, пропила (в частности, n- или циклопропила), пропаргила или C_1 галогеналкила. Более предпочтительно R^1 представляет собой метил, этил, циклопропил, пропаргил или C_1 фторалкил. Еще более предпочтительно R^1 представляет собой метил, этил, циклопропил или пропаргил. Наиболее предпочтительно R^1 представляет собой метил.

Предпочтительно R^2 выбран из группы, состоящей из водорода, галогена, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 галогеналкила, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_3 алкокси- C_1 - C_3 алкил-, C_3 - C_6 циклоалкила, C_2 - C_6 алкенила, C_2 - C_6 галогеналкенила, C_2 - C_6 алкинила и C_2 - C_6 галогеналкинила. Более предпочтительно R^2 выбран из группы, состоящей из хлора, фтора, метила, этила, циклопропила, трифторметила и метоксиметила, еще более предпочтительно хлора, циклопропила, трифторметила или метила, наиболее предпочтительно хлора или метила. В одной группе вариантов осуществления настоящего изобретения R^2 представляет собой водород. В дополнительной группе

вариантов осуществления R^2 представляет собой циклопропил, в третьей группе вариантов осуществления R^2 представляет собой метил, в четвертой группе вариантов осуществления R^2 представляет собой трифторметил и в пятой группе вариантов осуществления R^2 представляет собой хлор.

5 Как описано в данном документе, G может представлять собой водород или $-C(O)-R^3$, и R^3 выбран из группы, состоящей из C_1-C_6 алкила, C_2-C_6 алкенила, C_2-C_6 алкинила, C_1-C_6 алкил-S-, C_1-C_6 алкокси, $-NR^4R^5$ и фенила, необязательно замещенного одним или несколькими R^6 .

10 Как определено в данном документе, R^4 и R^5 независимо выбраны из группы, состоящей из водорода, C_1-C_6 алкила, C_1-C_6 алкокси и C_3-C_6 циклоалкила, или они вместе могут образовывать морфолинильное кольцо. В контексте заместителя G (и, таким образом, также R^3) каждый из R^4 и R^5 предпочтительно независимо выбран из группы, состоящей из метила, этила, пропила, метокси, этокси и пропокси, и они могут называться R^{34} и R^{35} соответственно. В контексте других заместителей (например, R^2 ,
15 R^8) каждый из R^4 и R^5 предпочтительно независимо представляет собой водород, C_1-C_3 алкил, C_1-C_3 алкокси или C_3-C_6 циклоалкил, и они могут называться R^{84} и R^{85} соответственно. Если в большем фрагменте содержится более чем один R^4 , например в группе $-NR^4C(O)NR^4R^5$, специалисту в данной области будет понятно, что каждый R^4 определяется независимо, и, поэтому, в таком фрагменте две группы R^4 могут быть
20 либо одинаковыми, либо же они могут отличаться друг от друга.

R^6 выбран из группы, состоящей из галогена, циано, нитро, C_1-C_3 алкила, C_1-C_3 галогеналкила, C_1-C_3 алкокси и C_1-C_3 галогеналкокси. Предпочтительно R^6 выбран из группы, состоящей из галогена, C_1-C_3 алкила и C_1-C_3 галогеналкила.

25 Предпочтительно R^3 представляет собой C_1-C_4 алкил, C_2-C_3 алкенил, C_2-C_3 алкинил, $-C_1-C_4$ алкокси, $-NR^4R^5$, где R^4 и R^5 вместе образуют морфолинильное кольцо, или фенил. Более предпочтительно R^3 представляет собой изопропил, трет-бутил, метил, этил, пропаргил, метокси, этокси или *трет*-бутокси. Более предпочтительно R^3 представляет собой изопропил, трет-бутил, метил, этил, пропаргил или метокси.

30 В одной группе вариантов осуществления G представляет собой водород или $-C(O)-R^3$, где R^3 представляет собой C_1-C_4 алкил, C_2-C_3 алкенил, C_2-C_3 алкинил или $-C_1-C_4$ алкокси. В дополнительной группе вариантов осуществления G представляет собой водород или $-C(O)-R^3$, где R^3 представляет собой изопропил, *трет*-бутил, метил, этил,

пропаргил или метокси. Однако особенно предпочтительно, чтобы G представлял собой водород или $-C(O)-R^3$, где R^3 представляет собой изопропил.

Если Y представляет собой циклопропил, то X предпочтительно представляет собой водород, циклопропил, галоген или C_1 галогеналкил, более предпочтительно водород, фтор, хлор, бром или C_1 фторалкил, и еще более предпочтительно водород, фтор, хлор или трифторметил. Наиболее предпочтительно, если Y представляет собой циклопропил, X представляет собой фтор. В одной группе вариантов осуществления предпочтительно, чтобы X находился в *орто*-положении (6-положение) относительно пиридазинового/пиридазиндионового фрагмента (группа Q). Особенно предпочтительно, чтобы X представлял собой фтор, хлор или C_1 галогеналкил (в частности, C_1 фторалкил) и находился в *орто*-положении (6-положение) относительно пиридазинового/пиридазиндионового фрагмента (группа Q). Наиболее предпочтительно X представляет собой фтор и находится в *орто*-положении (6-положение) относительно пиридазинового/пиридазиндионового фрагмента (группа Q).

Если X представляет собой циклопропил, то Y предпочтительно представляет собой водород, C_1 - C_3 алкил, циклопропил, C_1 - C_3 галогеналкил или галоген и более предпочтительно Y представляет собой водород, хлор, фтор или бром в таких вариантах осуществления. Наиболее предпочтительно, если X представляет собой циклопропил, Y представляет собой хлор.

В одной группе вариантов осуществления предпочтительно, чтобы Y находился в *орто*-положении (3-положение) относительно фрагмента -W-D. В дополнительной группе вариантов осуществления Y находится в *пара*-положении относительно пиридазинового/пиридазиндионового фрагмента (группа Q).

Особенно предпочтительно, чтобы Y находился в *орто*-положении (3-положение) относительно фрагмента -W-D и представлял собой галоген, в частности, хлор или фтор; более предпочтительно хлор.

Как описано в данном документе, D представляет собой замещенное или незамещенное фенильное кольцо (Dp) или представляет собой замещенное или незамещенное 5- или 6-членное моноциклическое гетероарильное кольцо, содержащее 1, 2 или 3 гетероатома, независимо выбранные из кислорода, азота и серы, и при этом, если D представляет собой замещенное гетероарильное кольцо или замещенное фенильное кольцо, то он замещен по меньшей мере одному атому углерода в кольце с помощью R^8 и/или, в случае гетероарильного кольца, по атому азота в кольце с

помощью R^9 . Если D представляет собой замещенное или незамещенное 5- или 6-членное моноциклическое гетероарильное кольцо, то он предпочтительно представляет собой замещенное (как описано в данном документе) или незамещенное фурильное, тиенильное, пирролильное, пиразолильное, имидазолильное, 1,2,3-триазолильное, 1,2,4-триазолильное, оксазолильное, изоксазолильное, тиазолильное, изотиазолильное, 1,2,4-оксадиазолильное, 1,3,4-оксадиазолильное, 1,2,5-оксадиазолильное, 1,2,3-тиадиазолильное, 1,2,4-тиадиазолильное, 1,3,4-тиадиазолильное, 1,2,5-тиадиазолильное, пиридилное, пиридонильное, пиримидинильное, пиридазинильное, пиразинильное, 1,2,3-триазинильное, 1,2,4-триазинильное или 1,3,5-триазинильное кольцо.

В таких вариантах осуществления D предпочтительно представляет собой замещенное (как описано в данном документе) или незамещенное пиридилное, пиразолильное, тиазолильное, пиримидинильное, тиенильное, триазолильное или оксадиазолильное кольцо и более предпочтительно пиридилное кольцо.

В одной группе вариантов осуществления D представляет собой замещенное (как описано в данном документе) или незамещенное пиразолильное, имидазолильное, оксазолильное, изоксазолильное, тиазолильное, изотиазолильное, пиридилное, пиридонильное, пиримидинильное, пиридазинильное или пиразинильное кольцо.

В дополнительной группе таких вариантов осуществления D представляет собой замещенное (как описано в данном документе) или незамещенное оксазолильное, тиазолильное или пиридилное кольцо. В некоторых вариантах осуществления D представляет собой замещенное или незамещенное пиридилное кольцо или замещенное или незамещенное тиазолильное кольцо.

Замещение D с помощью R^8 будет зависеть от присутствия или отсутствия циклопропила в положении X и/или Y. Однако, в целом, если D представляет собой замещенное 5- или 6-членное гетероарильное кольцо, то он предпочтительно замещен с помощью 1 или 2 R^8 и/или 1 R^9 , более предпочтительно 1 или 2 R^8 . Если D представляет собой 5-членное замещенное гетероарильное кольцо, то он наиболее предпочтительно замещен с помощью 1 R^8 . Если D представляет собой замещенное фенильное кольцо, то он предпочтительно замещен с помощью 1 или 2 R^8 , более предпочтительно 1 R^8 .

Если по меньшей мере один из X и Y представляет собой циклопропил, и D является замещенным, то каждый R^8 может быть независимо выбран из водорода, кислорода, гидроксила, галогена, циано, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 галогеналкила, C_3 - C_6 -циклоалкила, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_6 галогеналкокси, C_1 - C_3 алкокси- C_1 - C_3 алкила, C_1 -

C_3 галогеналкокси- C_1 - C_3 алкил-, C_1 - C_3 алкокси- C_1 - C_3 алкокси- C_1 - C_3 алкил-, C_2 - C_6 алкенила, C_2 - C_6 галогеналкенила, C_2 - C_6 алкинила, C_2 - C_6 галогеналкинила, C_1 - C_6 гидроксиалкил-, C_1 - C_6 алкилкарбонил-, C_1 - C_6 галогеналкилкарбонил-, C_3 - C_6 циклоалкилкарбонил-, $-S(O)_m$ - C_1 - C_6 галогеналкила, $-S(O)_m$ - C_3 - C_6 циклоалкила, $-O-S(O)_2C_1$ - C_3 алкила, $-C_1$ - C_3 алкил- $S(O)_m$ - C_1 - C_6 алкила, $-C_1$ - C_3 алкил- $S(O)_m$ - C_3 - C_6 циклоалкила, циано- C_1 - C_6 -алкил-, NR^4R^5 , $-C(S)NR^4R^5$, $-S(O)_2NHC(O)C_1$ - C_3 алкила, $-S(O)_2NR^4R^5$, $-C(O)OH$, $-C(O)OC_1$ - C_6 алкила, $-C(O)NHS-(O)_2C_1$ - C_6 алкила, $-C(O)NR^4R^5$, $-NR^4C(O)NR^4R^5$, C_1 - C_6 алкилкарбонил(C_1 - C_6 алкил)амино-, C_1 - C_6 галогеналкилкарбониламино-, C_1 - C_6 галогеналкилкарбонил(C_1 - C_6 алкил)амино-, $-NR^4C(O)NR^4R^5$, C_1 - C_6 алкилсульфониламино-, C_1 - C_6 алкилсульфонил(C_1 - C_6 алкил)амино-, C_1 - C_6 галогеналкилсульфониламино-, C_1 - C_6 галогеналкилсульфонил(C_1 - C_6 алкил)амино-, C_3 - C_6 циклоалкилсульфониламино-, C_3 - C_6 циклоалкилсульфонил(C_1 - C_6 алкил)амино-, гидроксиамино-, гидрокс(C_1 - C_6 алкил)амино, C_1 - C_6 алкоксиамино, C_1 - C_6 алкокси(C_1 - C_6 алкил)амино, C_1 - C_6 галогеналкоксиамино, C_1 - C_6 галогеналкокси(C_1 - C_6 алкил)амино или кольцевой системы, выбранной из группы, состоящей из фенильного кольца, 5-6-членного гетероарильного кольца и 3-6-членного гетероциклического кольца, при этом указанная кольцевая система замещена с помощью 0-5 R^{16} ;

m представляет собой целое число, равное 0, 1 или 2 (предпочтительно 0 или 2); и каждый R^9 независимо представляет собой водород, C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 галогеналкил, C_3 - C_6 циклоалкил, C_1 - C_3 алкокси- C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_3 галогеналкокси- C_1 - C_3 алкил-, C_1 - C_3 алкокси- C_1 - C_3 алкокси- C_1 - C_3 алкил-, C_1 - C_6 гидроксиалкил-, $-C_1$ - C_3 алкил- $S(O)_m$ - C_1 - C_6 алкил, $-C_1$ - C_3 алкил- $S(O)_m$ - C_1 - C_6 галогеналкил, $-C_1$ - C_3 алкил- $S(O)_m$ - C_3 - C_6 циклоалкил, циано- C_1 - C_6 -алкил- или кольцевую систему, выбранную из группы, состоящей из фенильного кольца, 5-6-членного гетероарильного кольца и 3-6-членного гетероциклического кольца, при этом указанная кольцевая система замещена с помощью 0-5 R^{16} ;

каждый R^{16} независимо представляет собой галоген, циано, C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 галогеналкил, C_1 - C_6 алкокси или C_1 - C_6 галогеналкокси.

Если оба из X и Y являются отличными от циклопропила, и D представляет собой фенильное кольцо, D будет замещен по меньшей мере одним R^8 , выбранным из группы, состоящей из C_1 - C_6 галогеналкилкарбонил-, C_3 - C_6 циклоалкилкарбонил-, $-S(O)_m$ - C_1 - C_6 галогеналкила, $-S(O)_m$ - C_3 - C_6 циклоалкила, $-O-S(O)_2C_1$ - C_3 алкила, $-C_1$ - C_3 алкил- $S(O)_m$ - C_1 - C_6 алкила, $-C_1$ - C_3 алкил- $S(O)_m$ - C_1 - C_6 галогеналкила, $-C_1$ - C_3 алкил- $S(O)_m$ - C_3 - C_6 циклоалкила, циано- C_1 - C_6 -алкил-, $-NR^{4a}R^{5a}$, $-C(S)NR^4R^5$, $-S(O)_2NHC(O)C_1$ -

C_3 алкила, $-S(O)_2NR^4R^5$, $-C(O)OH$, $-C(O)OC_1-C_6$ алкила, $-C(O)NHS-(O)_2C_1-C_6$ алкила, $-C(O)NR^4R^5$, $-NR^4C(O)NR^4R^5$, C_1-C_6 алкилкарбонил(C_1-C_6 алкил)амино-, C_1-C_6 галогеналкилкарбониламино-, C_1-C_6 галогеналкилкарбонил(C_1-C_6 алкил)амино-, C_1-C_6 алкилсульфониламино-, C_1-C_6 алкилсульфонил(C_1-C_6 алкил)амино-, C_1-C_6 галогеналкилсульфониламино-, C_1-C_6 галогеналкилсульфонил(C_1-C_6 алкил)амино-, C_3-C_6 циклоалкилсульфониламино-, C_3-C_6 циклоалкилсульфонил(C_1-C_6 алкил)амино-, гидроксiamiно-, гидрокси(C_1-C_6 алкил)амино, C_1-C_6 алкоксиамино, C_1-C_6 алкокси(C_1-C_6 алкил)амино, C_1-C_6 галогеналкоксиамино, C_1-C_6 галогеналкокси(C_1-C_6 алкил)амино или кольцевой системы, выбранной из группы, состоящей из фенильного кольца, 5-6-членного гетероарильного кольца и 3-6-членного гетероциклического кольца, при этом указанная кольцевая система замещена с помощью 0-5 R^{16} ; где m , R^4 , R^5 и R^{16} являются такими, как определено в данном документе.

Как определено в данном документе, в контексте, где оба из X и Y отличаются от циклопропила, каждый из R^{4a} и R^{5a} независимо выбран из группы, состоящей из C_1-C_6 алкокси и C_3-C_6 циклоалкила, или R^4 и R^5 вместе могут образовывать морфолинильное кольцо.

Любой дополнительный заместитель R^8 может быть выбран из группы, состоящей из кислорода, гидроксила, галогена, циано, C_1-C_6 алкила, C_1-C_6 галогеналкила, C_3-C_6 циклоалкила, C_1-C_6 алкокси, C_1-C_6 галогеналкокси, C_1-C_3 алкокси- C_1-C_3 алкила, C_1-C_3 галогеналкокси- C_1-C_3 алкил-, C_1-C_3 алкокси- C_1-C_3 алкокси- C_1-C_3 алкил-, C_2-C_6 алкенила, C_2-C_6 галогеналкенила, C_2-C_6 алкинила, C_2-C_6 галогеналкинила, C_1-C_6 гидроксиалкил-, C_1-C_6 алкилкарбонил-, C_1-C_6 галогеналкилкарбонил-, C_3-C_6 циклоалкилкарбонил-, $-S(O)_m-C_1-C_6$ галогеналкила, $-S(O)_m-C_3-C_6$ циклоалкила, $-O-S(O)_2C_1-C_3$ алкила, $-C_1-C_3$ алкил- $S(O)_m-C_1-C_6$ алкила, $-C_1-C_3$ алкил- $S(O)_m-C_1-C_6$ галогеналкила, $-C_1-C_3$ алкил- $S(O)_m-C_3-C_6$ циклоалкила, циано- C_1-C_6 -алкил-, NR^4R^5 , $-C(S)NR^4R^5$, $-S(O)_2NHC(O)C_1-C_3$ алкила, $-S(O)_2NR^4R^5$, $-C(O)OH$, $-C(O)OC_1-C_6$ алкила, $-C(O)NHS-(O)_2C_1-C_6$ алкила, $-C(O)NR^4R^5$, $-NR^4C(O)NR^4R^5$, C_1-C_6 алкилкарбонил(C_1-C_6 алкил)амино-, C_1-C_6 галогеналкилкарбониламино-, C_1-C_6 галогеналкилкарбонил(C_1-C_6 алкил)амино-, $-NR^4C(O)NR^4R^5$, C_1-C_6 алкилсульфониламино-, C_1-C_6 алкилсульфонил(C_1-C_6 алкил)амино-, C_1-C_6 галогеналкилсульфониламино-, C_1-C_6 галогеналкилсульфонил(C_1-C_6 алкил)амино-, C_3-C_6 циклоалкилсульфониламино-, C_3-C_6 циклоалкилсульфонил(C_1-C_6 алкил)амино-, гидроксiamiно-, гидрокси(C_1-C_6 алкил)амино, C_1-C_6 алкоксиамино, C_1-C_6 алкокси(C_1-C_6 алкил)амино, C_1-C_6 галогеналкоксиамино, C_1-C_6 галогеналкокси(C_1-C_6 алкил)амино или кольцевой

системы, выбранной из группы, состоящей из фенильного кольца, 5-6-членного гетероарильного кольца и 3-6-членного гетероциклического кольца, при этом указанная кольцевая система замещена с помощью 0-5 R^{16} ; где m , R^4 , R^5 и R^{16} являются такими, как определено в данном документе.

5 Если оба из X и Y являются отличными от циклопропила, и D представляет собой моноциклическое гетероарильное кольцо, то D будет либо замещен по атому углерода в кольце по меньшей мере одним R^8 , выбранным из группы, состоящей из C_1 - C_6 галогеналкилкарбонил-, C_3 - C_6 циклоалкилкарбонил-, $-S(O)_m$ - C_1 - C_6 галогеналкила, $-S(O)_m$ - C_3 - C_6 циклоалкила, $-O-S(O)_2$ - C_1 - C_3 алкила, $-C_1$ - C_3 алкил- $S(O)_m$ - C_1 - C_6 алкила, $-C_1$ - C_3 алкил- $S(O)_m$ - C_1 - C_6 галогеналкила, $-C_1$ - C_3 алкил- $S(O)_m$ - C_3 - C_6 циклоалкила, циано- C_1 - C_6 -алкил-, $NR^{4a}R^{5a}$, $-C(S)NR^4R^5$, $-S(O)_2NHC(O)C_1$ - C_3 алкила, $-S(O)_2NR^4R^5$, $-C(O)OH$, $-C(O)OC_1$ - C_6 алкила, $-C(O)NHS-(O)_2C_1$ - C_6 алкила, $-C(O)NR^4R^5$, $-NR^4C(O)NR^4R^5$, C_1 - C_6 алкилкарбонил(C_1 - C_6 алкил)амино-, C_1 - C_6 галогеналкилкарбониламино-, C_1 - C_6 галогеналкилкарбонил(C_1 - C_6 алкил)амино-, C_1 - C_6 алкилсульфониламино-, C_1 - C_6 алкилсульфонил(C_1 - C_6 алкил)амино-, C_1 - C_6 галогеналкилсульфониламино-, C_1 - C_6 галогеналкилсульфонил(C_1 - C_6 алкил)амино-, C_3 - C_6 циклоалкилсульфониламино-, C_3 - C_6 циклоалкилсульфонил(C_1 - C_6 алкил)амино-, гидроксиамино-, гидрокси(C_1 - C_6 алкил)амино, C_1 - C_6 алкоксиамино, C_1 - C_6 алкокси(C_1 - C_6 алкил)амино, C_1 - C_6 галогеналкоксиамино, C_1 - C_6 галогеналкокси(C_1 - C_6 алкил)амино и кольцевой системы, выбранной из группы, состоящей из фенильного кольца, 5-6-членного гетероарильного кольца и 3-6-членного гетероциклического кольца, при этом указанная кольцевая система замещена с помощью 0-5 R^{16} ; и/или D будет замещен по атому азота в кольце по меньшей мере одним R^9 , выбранным из группы, состоящей из C_5 - C_6 алкила, C_5 - C_6 галогеналкила, C_3 - C_6 циклоалкила, C_1 - C_3 алкокси- C_3 алкил-, C_3 алкокси- C_1 - C_2 алкил-, C_1 - C_3 галогеналкокси- C_1 - C_3 алкил-, C_1 - C_3 алкокси- C_1 - C_3 алкокси- C_1 - C_3 алкил-, C_1 - C_6 гидроксиалкил-, $-C_1$ - C_3 алкил- $S(O)_m$ - C_1 - C_6 алкила, $-C_1$ - C_3 алкил- $S(O)_m$ - C_1 - C_6 галогеналкила, $-C_1$ - C_3 алкил- $S(O)_m$ - C_3 - C_6 циклоалкила, циано- C_1 - C_6 -алкил- и кольцевой системы, выбранной из группы, состоящей из фенильного кольца, 5-6-членного гетероарильного кольца и 3-6-членного гетероциклического кольца, при этом указанная кольцевая система замещена с помощью 0-5 R^{16} ; где m , R^4 , R^5 , R^{4a} , R^{5a} и R^{16} являются такими, как определено в данном документе.

В таких вариантах осуществления, где оба из X и Y являются отличными от циклопропила, любые дополнительные заместители R^8 при атоме углерода в кольце могут быть выбраны из группы, состоящей из группы, состоящей из кислорода,

гидроксила, галогена, циано, C₁-C₆алкила, C₁-C₆галогеналкила, C₃-C₆-циклоалкила, C₁-C₆алкокси, C₁-C₆галогеналкокси, C₁-C₃алкокси-C₁-C₃алкила, C₁-C₃галогеналкокси-C₁-C₃алкил-, C₁-C₃алкокси-C₁-C₃алкокси-C₁-C₃алкил-, C₂-C₆алкенила, C₂-C₆галогеналкенила, C₂-C₆алкинила, C₂-C₆галогеналкинила, C₁-C₆гидроксиалкил-, C₁-C₆алкилкарбонил-, C₁-C₆галогеналкилкарбонил-, C₃-C₆циклоалкилкарбонил-, -S(O)_m-C₁-C₆галогеналкила, -S(O)_m-C₃-C₆циклоалкила, -O-S(O)₂C₁-C₃алкила, -C₁-C₃алкил-S(O)_m-C₁-C₆алкила, -C₁-C₃алкил-S(O)_m-C₃-C₆циклоалкила, циано-C₁-C₆-алкил-, -NR⁴R⁵, -C(S)NR⁴R⁵, -S(O)₂NHC(O)C₁-C₃алкила, -S(O)₂NR⁴R⁵, -C(O)OH, -C(O)OC₁-C₆алкила, -C(O)NHS-(O)₂C₁-C₆алкила, -C(O)NR⁴R⁵, -NR⁴C(O)NR⁴R⁵, C₁-C₆алкилкарбонил(C₁-C₆алкил)амино-, C₁-C₆галогеналкилкарбониламино-, C₁-C₆галогеналкилкарбонил(C₁-C₆алкил)амино-, C₁-C₆алкилсульфониламино-, C₁-C₆алкилсульфонил(C₁-C₆алкил)амино-, C₁-C₆галогеналкилсульфониламино-, C₁-C₆галогеналкилсульфонил(C₁-C₆алкил)амино-, C₃-C₆циклоалкилсульфониламино-, C₃-C₆циклоалкилсульфонил(C₁-C₆алкил)амино-, гидроксиамино-, гидрокси(C₁-C₆алкил)амино, C₁-C₆алкоксиамино, C₁-C₆алкокси(C₁-C₆алкил)амино, C₁-C₆галогеналкоксиамино, C₁-C₆галогеналкокси(C₁-C₆алкил)амино или кольцевой системы, выбранной из группы, состоящей из фенильного кольца, 5-6-членного гетероарильного кольца и 3-6-членного гетероциклического кольца, при этом указанная кольцевая система замещена с помощью 0-5 R¹⁶; где m, R⁴, R⁵ и R¹⁶ являются такими, как определено в данном документе, и/или любые дополнительные заместители R⁹ при атоме азота в кольце могут быть выбраны из группы, состоящей из C₁-C₆алкила, C₁-C₆галогеналкила, C₃-C₆-циклоалкила, C₁-C₃алкокси-C₁-C₃алкила, C₁-C₃галогеналкокси-C₁-C₃алкил-, C₁-C₃алкокси-C₁-C₃алкокси-C₁-C₃алкил-, C₁-C₆гидроксиалкил-, -C₁-C₃алкил-S(O)_m-C₁-C₆алкила, -C₁-C₃алкил-S(O)_m-C₁-C₆галогеналкила, -C₁-C₃алкил-S(O)_m-C₃-C₆циклоалкила, циано-C₁-C₆-алкил- и кольцевой системы, выбранной из группы, состоящей из фенильного кольца, 5-6-членного гетероарильного кольца и 3-6-членного гетероциклического кольца, при этом указанная кольцевая система замещена с помощью 0-5 R¹⁶; где m, R⁴, R⁵ и R¹⁶ являются такими, как определено в данном документе.

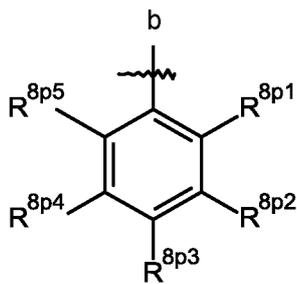
В вариантах осуществления, где по меньшей мере один из X и Y представляет собой циклопропил, каждый R⁸ предпочтительно независимо представляет собой оксо, C₁-C₄алкил, C₁-C₄галогеналкил, галоген, циано, amino, -NHC(O)CH₃, гидроксил, C₁-C₄алкокси или C₁-C₄алкилтио. Более предпочтительно каждый R⁸ независимо представляет собой оксо, C₁-C₄алкил, C₁-C₄галогеналкил, галоген, циано, гидроксил,

C₁-C₄алкокси или C₁-C₄алкилтио, наиболее предпочтительно каждый R⁸ независимо представляет собой галоген или C₁-C₄галогеналкил.

В вариантах осуществления, где по меньшей мере один из X и Y представляет собой циклопропил, каждый R⁹ предпочтительно независимо представляет собой C₁-C₄алкил, C₁-C₄галогеналкил, гидроксил, C₁-C₄алкокси или C₁-C₄алкилтио.

В конкретных вариантах осуществления, где по меньшей мере один из X и Y представляет собой циклопропил, и D представляет собой замещенное или незамещенное 5- или 6-членное моноциклическое гетероарильное кольцо, как описано выше, D выбран из группы, состоящей из 4-хлор-3-пиридила, 4-трифторметилпиридила, 3-пиридила и 2-хлортиазо-5-ила, 2-хлор-3-пиридила, 3-хлор-4-пиридила, 1-метил-3-(трифторметил)-пирозол-4-ила, тиазол-2-ила, тиазол-5-ила, пиримидин-5-ила, 4-(*мет*-бутокси)фенила, 2-хлор-4-пиридила, 2-метил-4-пиридила, 2-трифторметил-4-пиридила, 4-пиридила, 2-амино-4-пиридила, тиофен-3-ила, 1-метилпирозол-4-ила, 2-метилтриазол-4-ила, 5-метил-1,3,4-оксадиазол-2-ила, 5-метил-3-пиридила, 5-метил-2-пиридила, 6-метил-2-пиридила, 3-метил-2-пиридила, 6-хлор-3-пиридила, 3-трифторметил-3-пиридила, 4-метил-2-пиридила, 2-ацетамидотиазол-5-ила, 2-фтор-4-пиридила и 2-трифторметил-3-пиридила. В подгруппе этих вариантов осуществления D выбран из группы, состоящей из 4-хлор-3-пиридила, 4-трифторметилпиридила, 3-пиридила и 2-хлортиазо-5-ила, 2-хлор-3-пиридила, 3-хлор-4-пиридила, 1-метил-3-(трифторметил)-пирозол-4-ила, тиазол-2-ила, тиазол-5-ила, пиримидин-5-ила, 4-(*мет*-бутокси)фенила, 2-хлор-4-пиридила, 2-метил-4-пиридила, 2-трифторметил-4-пиридила, 4-пиридила, тиофен-3-ила, 5-метил-3-пиридила, 5-метил-2-пиридила, 6-метил-2-пиридила, 3-трифторметил-3-пиридила, 2-фтор-4-пиридила и 2-трифторметил-3-пиридила. В дополнительной подгруппе этих вариантов осуществления D выбран из группы, состоящей из 4-хлор-3-пиридила, 4-трифторметилпиридила, 3-пиридила, 2-фтор-4-пиридила и 2-хлортиазо-5-ила (предпочтительно 2-фтор-4-пиридил).

Если D представляет собой фенильное кольцо D_p и является замещенным, то он может быть замещен с помощью 1-5 R⁸ и, таким образом, может быть представлен следующей структурой:



(Dp), где по меньшей мере один из R^{8p1} , R^{8p2} , R^{8p3} , R^{8p4} и

R^{8p5} является отличным от водорода. Специалист в данной области поймет, что если по меньшей мере один из R^{8p1} , R^{8p2} , R^{8p3} , R^{8p4} и R^{8p5} не представляет собой водород, то любое оставшееся положение при фенильном кольце может быть незамещенным или, в качестве альтернативы, нести дополнительный заместитель R^8 , положение которого при фенильном кольце обозначено надстрочным числом p. Если Dp является незамещенным, то R^{8p1} , R^{8p2} , R^{8p3} , R^{8p4} и R^{8p5} будут отсутствовать.

Как указано выше, замещение D с помощью R^8 будет зависеть от присутствия или отсутствия циклопропила в положении X и/или Y. Таким образом, в Dp, где по меньшей мере один из X и Y представляет собой циклопропил, предпочтительно, чтобы один или несколько из R^{8p1} , R^{8p2} , R^{8p3} , R^{8p4} и R^{8p5} независимо были выбраны из группы, состоящей из циано, amino, C_1 - C_3 диалкиламино, гидроксильной, C_1 - C_3 алкила, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_3 галогеналкила, C_1 - C_3 галогеналкокси и галогена, и b представляет собой точку присоединения к остальной части молекулы.

В одной такой группе вариантов осуществления каждый из одного или нескольких из R^{8p1} , R^{8p2} , R^{8p3} , R^{8p4} и R^{8p5} независимо выбран из циано, C_1 - C_3 алкила, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_3 галогеналкила, C_1 - C_3 галогеналкокси или галогена. Предпочтительно один или несколько из R^{8p1} , R^{8p2} , R^{8p3} , R^{8p4} и R^{8p5} независимо выбраны из циано, галогена (в частности, хлора или фтора), метила, метокси и трифторметила.

В еще одной группе вариантов осуществления каждый из R^{8p1} , R^{8p2} , R^{8p4} и R^{8p5} отсутствует, и R^{8p3} представляет собой циано, C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_3 галогеналкил, C_1 - C_3 галогеналкокси или галоген. Предпочтительно в этой группе вариантов осуществления R^{8p3} представляет собой галоген, более предпочтительно хлор.

В дополнительной группе вариантов осуществления каждый из R^{8p1} , R^{8p4} и R^{8p5} отсутствует, и каждый из R^{8p2} и R^{8p3} независимо представляет собой циано, C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_3 галогеналкил, C_1 - C_3 галогеналкокси или галоген. В этой группе вариантов осуществления особенно предпочтительно, чтобы каждый из R^{8p2} и R^{8p3}

независимо представлял собой галоген, и более предпочтительно, чтобы оба из R^{8p2} и R^{8p3} представляли собой хлор.

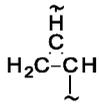
В одной особенно предпочтительной группе вариантов осуществления, где по меньшей мере один из X и/или Y представляет собой циклопропил, D представляет собой незамещенное фенильное кольцо.

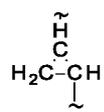
В дополнительных вариантах осуществления, особенно предпочтительной группе вариантов осуществления, где по меньшей мере один из X и/или Y представляет собой циклопропил, D выбран из группы, состоящей из 4-хлорфенила, 4-трифторметилфенила, 4-цианофенила, 4-фторфенила, 3,4-дифторфенила, 2-трифторметилфенила и 4-толила.

W выполняет функцию линкерного фрагмента, связывающего кольцо D с остальной частью молекулы (т. е. с фенилпиридазиновым/фенилпиридазиндионовым фрагментом). Соединения формулы (I), где линкер представляет собой W1, обладают гербицидной активностью, при этом соединения формулы (I), где линкер представляет собой W2, могут не только обладать гербицидной активностью, но также являться пригодными промежуточными соединениями в получении соединений формулы (I), содержащих W1-линкеры. Таким образом, в первой группе вариантов осуществления W представляет собой W1, тогда как во второй группе вариантов осуществления W представляет собой W2. В третьей группе вариантов осуществления W представляет собой $-C\equiv C-$.

Предпочтительно каждый из R^{10} , R^{11} , R^{12} и R^{13} независимо выбран из водорода или C_1 - C_3 алкила. В одной группе вариантов осуществления все из R^{10} , R^{11} , R^{12} и R^{13} представляют собой водород.

Предпочтительно каждый из R^{14} и R^{15} независимо выбран из водорода или C_1 - C_3 алкила. В одной группе вариантов осуществления оба из R^{14} и R^{15} представляют собой водород.

Конкретные примеры W включают $-CH_2-CH_2-$, и $-CH=CH-$, *цис*  и *транс*



, и $-C\equiv C-$. В более предпочтительных вариантах осуществления W представляет собой либо $-CH_2-CH_2-$, либо $-CH=CH-$ (в частности, (*E*) $-CH=CH-$), еще более предпочтительно $-CH_2-CH_2-$.

В одной предпочтительной группе вариантов осуществления (где оба из X и Y являются отличными от циклопропила) в соединении формулы (I):

R¹ представляет собой метил, этил, циклопропил, пропаргил или C₁фторалкил;

5 R² представляет собой хлор, циклопропил, трифторметил или метил;

G представляет собой водород или -C(O)-R³, где R³ представляет собой изопропил, трет-бутил, метил, этил, пропаргил, метокси, этокси или *трет*-бутокс;

X представляет собой фтор, хлор или C₁галогеналкил и находится в *орто*-положении относительно пиридазинового/пиридазиндионового фрагмента;

10 Y представляет собой водород, хлор, фтор или бром и находится в *орто*-положении относительно фрагмента -W-D;

D представляет собой фенильное кольцо, замещенное по меньшей мере одним R⁸, выбранным из группы, состоящей из C₁-C₆галогеналкилкарбонил-, C₃-C₆циклоалкилкарбонил-, -S(O)_m-C₁-C₆галогеналкила, -S(O)_m-C₃-C₆циклоалкила, -O-

15 S(O)₂C₁-C₃алкила, -C₁-C₃алкил-S(O)_m-C₁-C₆алкила, -C₁-C₃алкил-S(O)_m-C₁-C₆галогеналкила, -C₁-C₃алкил-S(O)_m-C₃-C₆циклоалкила, циано-C₁-C₆-алкил-, -NR^{4a}R^{5a}, -C(S)NR⁴R⁵, -S(O)₂NHC(O)C₁-C₃алкила, -S(O)₂NR⁴R⁵, -C(O)OH, -C(O)OC₁-C₆алкила, -C(O)NHS-(O)₂C₁-C₆алкила, -C(O)NR⁴R⁵, -NR⁴C(O)NR⁴R⁵, C₁-C₆алкилкарбонил(C₁-C₆алкил)амино-, C₁-C₆галогеналкилкарбониламино-, C₁-C₆галогеналкилкарбонил(C₁-C₆алкил)амино-, C₁-C₆алкилсульфониламино-, C₁-C₆алкилсульфонил(C₁-C₆алкил)амино-, C₁-C₆галогеналкилсульфониламино-, C₁-C₆галогеналкилсульфонил(C₁-C₆алкил)амино-, C₃-C₆циклоалкилсульфониламино-, C₃-C₆циклоалкилсульфонил(C₁-C₆алкил)амино-, гидроксiamiно-, гидроксид(C₁-C₆алкил)амино, C₁-C₆алкоксиамино, C₁-C₆алкоксид(C₁-C₆алкил)амино, C₁-C₆галогеналкоксиамино и C₁-C₆галогеналкоксид(C₁-C₆алкил)амино или кольцевой системы, выбранной из группы, состоящей из фенильного кольца, 5-6-членного гетероарильного кольца и 3-6-членного гетероциклического кольца, при этом указанная кольцевая система замещена с помощью 0-5 R¹⁶; и

20 любой дополнительный заместитель R⁸ может быть выбран из группы, состоящей из гидроксид, галогена, циано, C₁-C₆алкила, C₁-C₆галогеналкила, C₃-C₆циклоалкила, C₁-C₆алкокси, C₂-C₆алкенила и C₂-C₆алкинила;

25 каждый из R⁴ и R⁵ независимо представляет собой водород, C₁-C₃алкил, C₁-C₃алкокси или C₃-C₆циклоалкил;

m представляет собой целое число, равное 0, 1 или 2 (предпочтительно 0 или 2);

каждый из R⁴ и R⁵ независимо представляет собой водород, C₁-C₃алкил, C₁-C₃алкокси или C₃-C₆циклоалкил;

m представляет собой целое число, равное 0, 1 или 2 (предпочтительно 0 или 2);

каждый из R^{4a} и R^{5a} независимо выбран из группы, состоящей из C_1 - C_6 алкокси и C_3 - C_6 циклоалкила, или R^{4a} и R^{5a} вместе могут образовывать морфолинильное кольцо; и каждый R^{16} независимо представляет собой галоген, циано, C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 галогеналкил, C_1 - C_6 алкокси или C_1 - C_6 галогеналкокси;

5 W представляет собой W1; и

все из R10, R11, R12 и R13 представляют собой водород.

В более предпочтительной группе вариантов осуществления (где оба из X и Y являются отличными от циклопропила) в соединении формулы (I):

10 R^1 представляет собой метил;

R^2 представляет собой метил;

G представляет собой водород или $-C(O)-R^3$, где R^3 представляет собой изопропил, трет-бутил, метил, этил, пропаргил, метокси, этокси или *трет*-бутокс;

15 X представляет собой фтор и находится в *орто*-положении относительно пиридазинового/пиридазиндионового фрагмента;

Y представляет собой хлор и находится в *орто*-положении относительно фрагмента -W-D;

20 D представляет собой фенильное кольцо, замещенное с помощью 1 или 2 R^8 , где по меньшей мере один R^8 выбран из группы, состоящей из C_1 - C_6 галогеналкилкарбонил-, C_3 - C_6 циклоалкилкарбонил-, $-S(O)_m-C_1$ - C_6 галогеналкила, $-S(O)_m-C_3$ - C_6 циклоалкила, $-O-S(O)_2C_1$ - C_3 алкила, $-C_1$ - C_3 алкил- $S(O)_m-C_1$ - C_6 алкила, $-C_1$ - C_3 алкил- $S(O)_m-C_1$ - C_6 галогеналкила, $-C_1$ - C_3 алкил- $S(O)_m-C_3$ - C_6 циклоалкила, $-S(O)_2NHC(O)C_1$ - C_3 алкила, $-S(O)_2NR^4R^5$, $-C(O)OH$, $-C(O)OC_1$ - C_6 алкила, $-C(O)NHS-(O)_2C_1$ - C_6 алкила, $-C(O)NR^4R^5$, $-NR^4C(O)NR^4R^5$, C_1 - C_6 алкилкарбонил(C_1 - C_6 алкил)амино-, C_1 -

25 C_6 галогеналкилкарбониламино- и C_1 - C_6 галогеналкилкарбонил(C_1 - C_6 алкил)амино- или кольцевой системы, выбранной из группы, состоящей из фенильного кольца, 5-6-членного гетероарильного кольца и 3-6-членного гетероциклического кольца, при этом указанная кольцевая система замещена с помощью 0-5 R^{16} ; и

30 любой дополнительный заместитель R^8 может быть выбран из группы, состоящей из галогена, C_1 - C_6 алкила и C_1 - C_6 галогеналкила;

каждый из R^4 и R^5 независимо представляет собой водород, C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_3 алкокси или C_3 - C_6 циклоалкил;

m равняется 0 или 2 (предпочтительно 0);

каждый R^{16} независимо представляет собой галоген, циано, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_3 галогеналкил или C_1 - C_4 алкокси;

W представляет собой W1; и

все из R^{10} , R^{11} , R^{12} и R^{13} представляют собой водород.

5

В еще более предпочтительной группе вариантов осуществления (где оба из X и Y являются отличными от циклопропила) в соединении формулы (I):

R^1 представляет собой метил;

R^2 представляет собой метил;

10 G представляет собой водород или $-C(O)-R^3$, где R^3 представляет собой изопропил, трет-бутил, метил, этил, пропаргил или метокси;

X представляет собой фтор и находится в *орто*-положении относительно пиридазинового/пиридазиндионового фрагмента;

Y представляет собой хлор и находится в *орто*-положении относительно фрагмента -
15 W-D;

D представляет собой фенильное кольцо, замещенное одним R^8 , выбранным из группы, состоящей из $-C_1$ - C_3 алкил- $S(O)_m$ - C_1 - C_6 алкила, $-S(O)_2NHC(O)C_1$ - C_3 алкила, $-S(O)_2NR^4R^5$, $-C(O)OH$, $-C(O)OC_1$ - C_6 алкила и $-C(O)NR^4R^5$ или кольцевой системы, выбранной из
20 группы, состоящей из фенила, морфолинила, тетрагидрофуранила, фурила, тиенила, пирролила, пиразолила, имидазолила, 1,2,3-триазолила, 1,2,4-триазолила, тетразолила, оксазолила, изоксазолила, тиазолила, изотиазолила, 1,2,4-оксадиазолила, 1,3,4-оксадиазолила, 1,2,5-оксадиазолила, 1,2,3-тиадиазолила, 1,2,4-тиадиазолила, 1,3,4-тиадиазолила, 1,2,5-тиадиазолила, пиридила, пиридонила, пиримидинила, пиридазинила, пиразинила, 1,2,3-триазинила, 1,2,4-триазинила или 1,3,5-
25 триазинильного кольца, при этом указанная кольцевая система замещена с помощью 0-2 R^{16} ,

каждый из R^4 и R^5 независимо представляет собой водород или C_1 - C_3 алкил;

m равняется 0 или 2 (предпочтительно 0);

каждый R^{16} независимо представляет собой галоген или C_1 - C_4 алкил (предпочтительно
30 метил);

W представляет собой W1; и

все из R^{10} , R^{11} , R^{12} и R^{13} представляют собой водород.

Во все еще более предпочтительной группе вариантов осуществления (где оба из X и Y являются отличными от циклопропила) в соединении формулы (I):

R¹ представляет собой метил;

R² представляет собой метил;

5 G представляет собой водород или -C(O)-R³, где R³ представляет собой изопропил;

X представляет собой фтор и находится в *орто*-положении относительно пиридазинового/пиридазиндионового фрагмента;

Y представляет собой хлор и находится в *орто*-положении относительно фрагмента -W-D;

10 D представляет собой фенильное кольцо, замещенное одним R⁸, выбранным из группы, состоящей из метилсульфанилметила, изопропилсульфанилметила, сульфамоида, метилсульфамоида и карбамоида или кольцевой системы, выбранной из группы, состоящей из фенила, морфолинила, тетрагидрофуранила, фурила, тиенила, пирролила, пиразолила, 1,2,4-триазолила, оксазолила и тиазолильного кольца, при этом указанная

15 кольцевая система замещена с помощью 0-2 R¹⁶;

каждый R¹⁶ представляет собой метил;

W представляет собой W1; и

все из R¹⁰, R¹¹, R¹² и R¹³ представляют собой водород.

20 В альтернативной предпочтительной группе вариантов осуществления (где оба из X и Y являются отличными от циклопропила) в соединении формулы (I):

R¹ представляет собой метил, этил, циклопропил, пропаргил или C₁фторалкил;

R² представляет собой хлор, циклопропил, трифторметил или метил;

25 G представляет собой водород или -C(O)-R³, где R³ представляет собой изопропил, трет-бутил, метил, этил, пропаргил, метокси, этокси или *трет*-бутоксид;

X представляет собой фтор, хлор или C₁галогеналкил и находится в *орто*-положении относительно пиридазинового/пиридазиндионового фрагмента;

Y представляет собой водород, хлор, фтор или бром и находится в *орто*-положении относительно фрагмента -W-D;

30 D представляет собой 5- или 6-членное моноциклическое гетероарильное кольцо, содержащее 1, 2 или 3 гетероатома, независимо выбранные из кислорода, азота и серы, либо замещенное по атому углерода в кольце по меньшей мере одним R⁸, выбранным из группы, состоящей из C₁-C₆галогеналкилкарбонил-, C₃-C₆циклоалкилкарбонил-, -S(O)_m-C₁-C₆галогеналкила, -S(O)_m-C₃-C₆циклоалкила, -O-S(O)₂-C₁-C₃алкила, -C₁-

C_3 алкил- $S(O)_m$ - C_1 - C_6 алкила, $-C_1$ - C_3 алкил- $S(O)_m$ - C_1 - C_6 галогеналкила, $-C_1$ - C_3 алкил- $S(O)_m$ - C_3 - C_6 циклоалкила, циано- C_1 - C_6 -алкил-, $NR^{4a}R^{5a}$, $-C(S)NR^4R^5$, $-S(O)_2NHC(O)C_1$ - C_3 алкила, $-S(O)_2NR^4R^5$, $-C(O)OH$, $-C(O)OC_1$ - C_6 алкила, $-C(O)NHS-(O)_2C_1$ - C_6 алкила, $-C(O)NR^4R^5$, $-NR^4C(O)NR^4R^5$, C_1 - C_6 алкилкарбонил(C_1 - C_6 алкил)амино-, C_1 - C_6 галогеналкилкарбониламино-, C_1 - C_6 галогеналкилкарбонил(C_1 - C_6 алкил)амино-, C_1 - C_6 алкилсульфониламино-, C_1 - C_6 алкилсульфонил(C_1 - C_6 алкил)амино-, C_1 - C_6 галогеналкилсульфониламино-, C_1 - C_6 галогеналкилсульфонил(C_1 - C_6 алкил)амино-, C_3 - C_6 циклоалкилсульфониламино-, C_3 - C_6 циклоалкилсульфонил(C_1 - C_6 алкил)амино-, гидроксiamiно-, гидрокс(C_1 - C_6 алкил)амино, C_1 - C_6 алкоксиамино, C_1 - C_6 алкокси(C_1 - C_6 алкил)амино, C_1 - C_6 галогеналкоксиамино, C_1 - C_6 галогеналкокси(C_1 - C_6 алкил)амино и кольцевой системы, выбранной из группы, состоящей из фенильного кольца, 5-6-членного гетероарильного кольца и 3-6-членного гетероциклического кольца, при этом указанная кольцевая система замещена с помощью 0-5 R^{16} ; и

любой дополнительный заместитель R^8 может быть выбран из группы, состоящей из гидроксila, галогена, циано, C_1 - C_6 алкила, C_1 - C_6 галогеналкила, C_3 - C_6 циклоалкила, C_1 - C_6 алкокси, C_2 - C_6 алкенила и C_2 - C_6 алкинила; и/или D будет замещен по атому азота в кольце по меньшей мере одним R^9 , выбранным из группы, состоящей из C_5 - C_6 алкила, C_5 - C_6 галогеналкила, C_3 - C_6 циклоалкила, C_1 - C_3 алкокси- C_3 алкил-, C_3 алкокси- C_1 - C_2 алкил-, C_1 - C_3 галогеналкокси- C_1 - C_3 алкил-, C_1 - C_3 алкокси- C_1 - C_3 алкокси- C_1 - C_3 алкил-, C_1 - C_6 гидроксиалкил-, $-C_1$ - C_3 алкил- $S(O)_m$ - C_1 - C_6 алкила, $-C_1$ - C_3 алкил- $S(O)_m$ - C_1 - C_6 галогеналкила, $-C_1$ - C_3 алкил- $S(O)_m$ - C_3 - C_6 циклоалкила, циано- C_1 - C_6 -алкил- и кольцевой системы, выбранной из группы, состоящей из фенильного кольца, 5-6-членного гетероарильного кольца и 3-6-членного гетероциклического кольца, при этом указанная кольцевая система замещена с помощью 0-5 R^{16} ;

каждый из R^4 и R^5 независимо представляет собой водород, C_1 - C_3 алкил, C_1 - C_3 алкокси или C_3 - C_6 циклоалкил;

m представляет собой целое число, равное 0, 1 или 2 (предпочтительно 0 или 2);

каждый из R^{4a} и R^{5a} независимо выбран из группы, состоящей из C_1 - C_6 алкокси и C_3 - C_6 циклоалкила, или R^{4a} и R^{5a} вместе могут образовывать морфолинильное кольцо; и

каждый R^{16} независимо представляет собой галоген, циано, C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 галогеналкил, C_1 - C_6 алкокси или C_1 - C_6 галогеналкокси;

W представляет собой W1; и

все из R^{10} , R^{11} , R^{12} и R^{13} представляют собой водород.

В альтернативной более предпочтительной группе вариантов осуществления (где оба из X и Y являются отличными от циклопропила) в соединении формулы (I):

R¹ представляет собой метил;

R² представляет собой метил;

5 G представляет собой водород или -C(O)-R³, где R³ представляет собой изопропил, трет-бутил, метил, этил, пропаргил, метокси, этокси или *трет*-бутоксид;

X представляет собой фтор и находится в *орто*-положении относительно пиридазинонового/пиридазиндионового фрагмента;

10 Y представляет собой хлор и находится в *орто*-положении относительно фрагмента -W-D;

D представляет собой 5- или 6-членное моноциклическое гетероарильное кольцо, содержащее 1, 2 или 3 гетероатома, независимо выбранные из кислорода, азота и серы, либо замещенное по атому углерода в кольце с помощью 1 или 2 R⁸, где по меньшей мере один R⁸ выбран из группы, состоящей из C₁-C₆галогеналкилкарбонил-, C₃-

15 C₆циклоалкилкарбонил-, -S(O)_m-C₁-C₆галогеналкила, -S(O)_m-C₃-C₆циклоалкила, -O-S(O)₂C₁-C₃алкила, -C₁-C₃алкил-S(O)_m-C₁-C₆алкила, -C₁-C₃алкил-S(O)_m-C₁-C₆галогеналкила, -C₁-C₃алкил-S(O)_m-C₃-C₆циклоалкила, -S(O)₂NHC(O)C₁-C₃алкила, -S(O)₂NR⁴R⁵, -C(O)OH, -C(O)OC₁-C₆алкила, -C(O)NHS-(O)₂C₁-C₆алкила, -C(O)NR⁴R⁵, -NR⁴C(O)NR⁴R⁵, C₁-C₆алкилкарбонил(C₁-C₆алкил)амино-, C₁-

20 C₆галогеналкилкарбониламино- и C₁-C₆галогеналкилкарбонил(C₁-C₆алкил)амино- или кольцевой системы, выбранной из группы, состоящей из фенильного кольца, 5-6-членного гетероарильного кольца и 3-6-членного гетероциклического кольца, при этом указанная кольцевая система замещена с помощью 0-5 R¹⁶; и

25 любой дополнительный заместитель R⁸ может быть выбран из группы, состоящей из галогена, C₁-C₆алкила и C₁-C₆галогеналкила; и/или D будет замещен по атому азота в кольце одним R⁹, выбранным из группы, состоящей из C₅-C₆алкила, C₅-C₆галогеналкила, C₃-C₆циклоалкила, -C₁-C₃алкил-S(O)_m-C₁-C₆алкила, -C₁-C₃алкил-S(O)_m-C₁-C₆галогеналкила, -C₁-C₃алкил-S(O)_m-C₃-C₆циклоалкила и кольцевой системы, выбранной из группы, состоящей из фенильного кольца, 5-6-членного гетероарильного

30 кольца и 3-6-членного гетероциклического кольца, при этом указанная кольцевая система замещена с помощью 0-5 R¹⁶;

каждый из R⁴ и R⁵ независимо представляет собой водород, C₁-C₃алкил, C₁-C₃алкокси или C₃-C₆циклоалкил;

m равняется 0 или 2 (предпочтительно 0);

каждый R^{16} независимо представляет собой галоген, циано, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_3 галогеналкил или C_1 - C_4 алкокси;

W представляет собой W1; и

все из R10, R11, R12 и R13 представляют собой водород.

5

В альтернативной еще более предпочтительной группе вариантов осуществления (где оба из X и Y являются отличными от циклопропила) в соединении формулы (I):

R^1 представляет собой метил;

R^2 представляет собой метил;

10 G представляет собой водород или $-C(O)-R^3$, где R^3 представляет собой изопропил, трет-бутил, метил, этил, пропаргил или метокси;

X представляет собой фтор и находится в *орто*-положении относительно пиридазинового/пиридазиндионового фрагмента;

Y представляет собой хлор и находится в *орто*-положении относительно фрагмента -
15 W-D;

D представляет собой 5- или 6-членное моноциклическое гетероарильное кольцо, содержащее 1, 2 или 3 атома азота, либо замещенное по атому углерода в кольце одним R^8 , выбранным из группы, состоящей из $-C_1$ - C_3 алкил- $S(O)_m$ - C_1 - C_6 алкила, $-S(O)_2NHC(O)C_1$ - C_3 алкила, $-S(O)_2NR^4R^5$, $-C(O)OH$, $-C(O)OC_1$ - C_6 алкила и $-C(O)NR^4R^5$

20 или кольцевой системы, выбранной из группы, состоящей из фенила, морфолина, тетрагидрофурана, фурила, тиенила, пиррола, пиразола, имидазола, 1,2,3-триазола, 1,2,4-триазола, тетразола, оксазола, изоксазола, тиазола, изотиазола, 1,2,4-оксадиазола, 1,3,4-оксадиазола, 1,2,5-оксадиазола, 1,2,3-тиадиазола, 1,2,4-тиадиазола, 1,3,4-тиадиазола, 1,2,5-тиадиазола, пиридила,

25 пиридонила, пиримидинила, пиридазинила, пиразинила, 1,2,3-триазинила, 1,2,4-триазинила или 1,3,5-триазинильного кольца, при этом указанная кольцевая система замещена с помощью 0-2 R^{16} ; и/или D будет замещен по атому азота в кольце одним R^9 , выбранным из группы, состоящей из C_5 - C_6 алкила, C_3 - C_6 -циклоалкила и кольцевой системы, выбранной из группы, состоящей из фенильного кольца, 5-6-членного гетероарильного кольца и 3-6-членного гетероциклического кольца, при этом указанная
30 кольцевая система замещена с помощью 0-2 R^{16} ;

каждый из R^4 и R^5 независимо представляет собой водород или C_1 - C_3 алкил;

m равняется 0 или 2 (предпочтительно 0);

каждый R^{16} независимо представляет собой галоген или C_1 - C_4 алкил (предпочтительно метил);

W представляет собой W1; и

все из R10, R11, R12 и R13 представляют собой водород.

5

В альтернативной все еще более предпочтительной группе вариантов осуществления (где оба из X и Y являются отличными от циклопропила) в соединении формулы (I):

R^1 представляет собой метил;

R^2 представляет собой метил;

10 G представляет собой водород или $-C(O)-R^3$, где R^3 представляет собой изопропил;

X представляет собой фтор и находится в *орто*-положении относительно пиридазинового/пиридазиндионового фрагмента;

Y представляет собой хлор и находится в *орто*-положении относительно фрагмента - W-D;

15 D представляет собой пиразолил или пиридил, либо замещенный по атому углерода в кольце одним R^8 , выбранным из группы, состоящей из метилсульфанилметила, изопропилсульфанилметила, сульфоамила, метилсульфоамила и карбамоила или кольцевой системы, выбранной из группы, состоящей из фенила, морфолина, тетрагидрофуридила, фуридила, тиенила, пирролила, пиразолила, 1,2,4-триазолила, оксазолила и тиазолильного кольца, при этом указанная кольцевая система замещена с

20 помощью 0-2 R^{16} ; и/или D будет замещен по атому азота в кольце одним R^9 , выбранным из циклопропила или фенила;

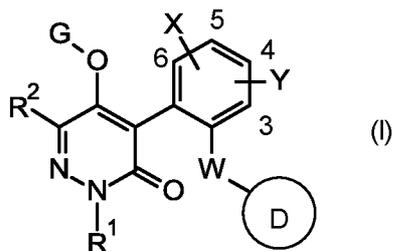
каждый R^{16} представляет собой метил;

W представляет собой W1; и

25 все из R^{11} , R^{12} , и R^{13} представляют собой водород.

В таблицах A-1, A-2, A-3, A-4, B-1, B-2, B-3, B-4, C-1, C-2, C-3 и C-4 ниже проиллюстрированы конкретные примеры соединений формулы (I) по настоящему изобретению.

30 **Гербицидные соединения по настоящему изобретению.** Система нумерации, применяемая для описания положений X и Y в соединении формулы (I), показанной ниже, показана исключительно для ясности.



В таблице А-1 приведено 672 соединения от А-1.001 до А-1.672 формулы (I), где G представляет собой -H, W представляет собой -CH₂-CH₂-, и R¹, R², X, Y, D являются такими, как определено для соединений №№ 1.001 – 1.672 соответственно в таблице 1

5

Таблица 1. Определения заместителей R¹, R², X, Y и D

№ соед.	R ¹	R ²	X	Y	D
1.001	-Me	-Me	6-F	3-F	4-Оксазол-5-илфенил-
1.002	-Me	-Me	6-F	3-F	4-Ацетаминофенил-
1.003	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(Диметилсульфамоил)фенил-
1.004	-Me	-Me	6-F	3-F	4-трет-Бутилфенил-
1.005	-Me	-Me	6-F	3-F	4-Бифенил-
1.006	-Me	-Me	6-F	3-F	4-[Этил(метил)карбамоил]-3-фтор-фенил-
1.007	-Me	-Me	6-F	3-F	2-Цианофенил-
1.008	-Me	-Me	6-F	3-F	3-Цианофенил-
1.009	-Me	-Me	6-F	3-F	4-Амино-3-метилфенил-
1.010	-Me	-Me	6-F	3-F	4-Метилсульфонилфенил-
1.011	-Me	-Me	6-F	3-F	4-Диметиламинофенил-
1.012	-Me	-Me	6-F	3-F	4-Метиламинофенил-
1.013	-Me	-Me	6-F	3-F	4-трет-Бутоксифенил-
1.014	-Me	-Me	6-F	3-F	4-Цианофенил-
1.015	-Me	-Me	6-F	3-F	4-Гидроксифенил-
1.016	-Me	-Me	6-F	3-F	4-Циклопропилфенил-
1.017	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(Метилсульфанил)фенил-
1.018	-Me	-Me	6-F	3-F	4-Карбоксифенил-
1.019	-Me	-Me	6-F	3-F	4-Метоксикарбонилфенил-
1.020	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(трет-Бутоксикарбониламино)-3-фтор-фенил-
1.021	-Me	-Me	6-F	3-F	2-(Метилсульфанил)-4-пиридил-
1.022	-Me	-Me	6-F	3-F	2-Ацетамино-4-пиридил-
1.023	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-Оксазол-5-илфенил-
1.024	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-Ацетаминофенил-
1.025	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(Диметилсульфамоил)фенил-
1.026	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-трет-Бутилфенил-
1.027	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-Бифенил-
1.028	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-[Этил(метил)карбамоил]-3-фтор-фенил-

№ соед.	R ¹	R ²	X	Y	D
1.029	-Me	-Me	6-F	3-Cl	2-Цианофенил-
1.030	-Me	-Me	6-F	3-Cl	3-Цианофенил-
1.031	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-Амино-3-метилфенил-
1.032	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-Метилсульфонилфенил-
1.033	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-Диметиламинофенил-
1.034	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-Метиламинофенил-
1.035	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-трет-Бутоксифенил-
1.036	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-Цианофенил-
1.037	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-Гидроксифенил-
1.038	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-Циклопропилфенил-
1.039	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(Метилсульфанил)фенил-
1.040	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-Карбоксифенил-
1.041	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-Метоксикарбонилфенил-
1.042	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(трет-Бутоксикарбониламино)-3-фтор-фенил-
1.043	-Me	-Me	6-F	3-Cl	2-(Метилсульфанил)-4-пиридил-
1.044	-Me	-Me	6-F	3-Cl	2-Ацетамидо-4-пиридил-
1.045	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-Оксазол-5-илфенил-
1.046	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-Ацетамидофенил-
1.047	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(Диметилсульфамоил)фенил-
1.048	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-трет-Бутилфенил-
1.049	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-Бифенил-
1.050	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-[Этил(метил)карбамоил]-3-фтор-фенил-
1.051	-Me	-Me	6-Cl	3-F	2-Цианофенил-
1.052	-Me	-Me	6-Cl	3-F	3-Цианофенил-
1.053	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-Амино-3-метилфенил-
1.054	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-Метилсульфонилфенил-
1.055	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-Диметиламинофенил-
1.056	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-Метиламинофенил-
1.057	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-трет-Бутоксифенил-
1.058	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-Цианофенил-
1.059	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-Гидроксифенил-
1.060	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-Циклопропилфенил-
1.061	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(Метилсульфанил)фенил-
1.062	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-Карбоксифенил-
1.063	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-Метоксикарбонилфенил-
1.064	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(трет-Бутоксикарбониламино)-3-фтор-фенил-
1.065	-Me	-Me	6-Cl	3-F	2-(Метилсульфанил)-4-пиридил-
1.066	-Me	-Me	6-Cl	3-F	2-Ацетамидо-4-пиридил-
1.067	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Оксазол-5-илфенил-
1.068	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Ацетамидофенил-
1.069	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(Диметилсульфамоил)фенил-
1.070	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-трет-Бутилфенил-
1.071	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Бифенил-
1.072	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-[Этил(метил)карбамоил]-3-фтор-

№ соед.	R ¹	R ²	X	Y	D
					фенил-
1.073	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	2-Цианофенил-
1.074	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	3-Цианофенил-
1.075	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Амино-3-метилфенил-
1.076	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Метилсульфонилфенил-
1.077	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Диметиламинофенил-
1.078	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Метиламинофенил-
1.079	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-трет-Бутоксифенил-
1.080	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Цианофенил-
1.081	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Гидроксифенил-
1.082	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Циклопропилфенил-
1.083	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(Метилсульфанил)фенил-
1.084	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Карбоксифенил-
1.085	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Метоксикарбонилфенил-
1.086	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(трет-Бутоксикарбониламино)-3-фтор-фенил-
1.087	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	2-(Метилсульфанил)-4-пиридил-
1.088	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	2-Ацетамидо-4-пиридил-
1.089	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-Оксазол-5-илфенил-
1.090	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-Ацетамидофенил-
1.091	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(Диметилсульфамоил)фенил-
1.092	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-трет-Бутилфенил-
1.093	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-Бифенил-
1.094	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-[Этил(метил)карбамоил]-3-фтор-фенил-
1.095	-Me	-Cl	6-F	3-F	2-Цианофенил-
1.096	-Me	-Cl	6-F	3-F	3-Цианофенил-
1.097	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-Амино-3-метилфенил-
1.098	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-Метилсульфонилфенил-
1.099	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-Диметиламинофенил-
1.100	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-Метиламинофенил-
1.101	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-трет-Бутоксифенил-
1.102	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-Цианофенил-
1.103	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-Гидроксифенил-
1.104	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-Циклопропилфенил-
1.105	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(Метилсульфанил)фенил-
1.106	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-Карбоксифенил-
1.107	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-Метоксикарбонилфенил-
1.108	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(трет-Бутоксикарбониламино)-3-фтор-фенил-
1.109	-Me	-Cl	6-F	3-F	2-(Метилсульфанил)-4-пиридил-
1.110	-Me	-Cl	6-F	3-F	2-Ацетамидо-4-пиридил-
1.111	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-Оксазол-5-илфенил-
1.112	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-Ацетамидофенил-
1.113	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(Диметилсульфамоил)фенил-
1.114	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-трет-Бутилфенил-
1.115	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-Бифенил-

№ соед.	R ¹	R ²	X	Y	D
1.116	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-[Этил(метил)карбамоил]-3-фтор-фенил-
1.117	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	2-Цианофенил-
1.118	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	3-Цианофенил-
1.119	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-Амино-3-метилфенил-
1.120	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-Метилсульфонилфенил-
1.121	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-Диметиламинофенил-
1.122	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-Метиламинофенил-
1.123	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-трет-Бутоксифенил-
1.124	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-Цианофенил-
1.125	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-Гидроксифенил-
1.126	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-Циклопропилфенил-
1.127	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(Метилсульфанил)фенил-
1.128	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-Карбоксифенил-
1.129	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-Метоксикарбонилфенил-
1.130	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(трет-Бутоксикарбониламино)-3-фтор-фенил-
1.131	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	2-(Метилсульфанил)-4-пиридил-
1.132	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	2-Ацетамидо-4-пиридил-
1.133	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-Оксазол-5-илфенил-
1.134	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-Ацетамидофенил-
1.135	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(Диметилсульфамоил)фенил-
1.136	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-трет-Бутилфенил-
1.137	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-Бифенил-
1.138	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-[Этил(метил)карбамоил]-3-фтор-фенил-
1.139	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	2-Цианофенил-
1.140	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	3-Цианофенил-
1.141	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-Амино-3-метилфенил-
1.142	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-Метилсульфонилфенил-
1.143	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-Диметиламинофенил-
1.144	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-Метиламинофенил-
1.145	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-трет-Бутоксифенил-
1.146	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-Цианофенил-
1.147	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-Гидроксифенил-
1.148	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-Циклопропилфенил-
1.149	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(Метилсульфанил)фенил-
1.150	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-Карбоксифенил-
1.151	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-Метоксикарбонилфенил-
1.152	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(трет-Бутоксикарбониламино)-3-фтор-фенил-
1.153	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	2-(Метилсульфанил)-4-пиридил-
1.154	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	2-Ацетамидо-4-пиридил-
1.155	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Оксазол-5-илфенил-
1.156	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Ацетамидофенил-
1.157	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(Диметилсульфамоил)фенил-
1.158	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-трет-Бутилфенил-

№ соед.	R ¹	R ²	X	Y	D
1.159	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Бифенил-
1.160	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-[Этил(метил)карбамоил]-3-фтор- фенил-
1.161	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	2-Цианофенил-
1.162	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	3-Цианофенил-
1.163	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Амино-3-метилфенил-
1.164	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Метилсульфонилфенил-
1.165	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Диметиламинофенил-
1.166	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Метиламинофенил-
1.167	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-трет-Бутоксифенил-
1.168	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Цианофенил-
1.169	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Гидроксифенил-
1.170	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Циклопропилфенил-
1.171	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(Метилсульфанил)фенил-
1.172	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Карбоксифенил-
1.173	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Метоксикарбонилфенил-
1.174	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(трет-Бутоксикарбониламино)-3- фтор-фенил-
1.175	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	2-(Метилсульфанил)-4-пиридил-
1.176	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	2-Ацетамидо-4-пиридил-
1.177	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-Оксазол-5-илфенил-
1.178	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-Ацетамидофенил-
1.179	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(Диметилсульфамоил)фенил-
1.180	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-трет-Бутилфенил-
1.181	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-Бифенил-
1.182	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-[Этил(метил)карбамоил]-3-фтор- фенил-
1.183	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-F	2-Цианофенил-
1.184	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-F	3-Цианофенил-
1.185	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-Амино-3-метилфенил-
1.186	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-Метилсульфонилфенил-
1.187	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-Диметиламинофенил-
1.188	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-Метиламинофенил-
1.189	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-трет-Бутоксифенил-
1.190	-CH ₂ -	-Me	6-F	3-F	4-Цианофенил-

№ соед.	R ¹	R ²	X	Y	D
	C≡CH				
1.191	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-Гидроксифенил-
1.192	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-Циклопропилфенил-
1.193	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(Метилсульфанил)фенил-
1.194	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-Карбоксифенил-
1.195	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-Метоксикарбонилфенил-
1.196	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(трет-Бутоксикарбониламино)-3- фтор-фенил-
1.197	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-F	2-(Метилсульфанил)-4-пиридил-
1.198	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-F	2-Ацетамидо-4-пиридил-
1.199	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-Оксазол-5-илфенил-
1.200	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-Ацетамидофенил-
1.201	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(Диметилсульфамоил)фенил-
1.202	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-трет-Бутилфенил-
1.203	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-Бифенил-
1.204	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-[Этил(метил)карбамоил]-3-фтор- фенил-
1.205	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	2-Цианофенил-
1.206	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	3-Цианофенил-
1.207	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-Амино-3-метилфенил-
1.208	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-Метилсульфонилфенил-
1.209	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-Диметиламинофенил-
1.210	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-Метиламинофенил-
1.211	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-трет-Бутоксифенил-
1.212	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-Цианофенил-
1.213	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-Гидроксифенил-

№ соед.	R ¹	R ²	X	Y	D
1.214	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-Циклопропилфенил-
1.215	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(Метилсульфанил)фенил-
1.216	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-Карбоксифенил-
1.217	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-Метоксикарбонилфенил-
1.218	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(трет-Бутоксикарбониламино)-3- фтор-фенил-
1.219	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	2-(Метилсульфанил)-4-пиридил-
1.220	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	2-Ацетамино-4-пиридил-
1.221	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-Оксазол-5-илфенил-
1.222	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-Ацетаминофенил-
1.223	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(Диметилсульфамоил)фенил-
1.224	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-трет-Бутилфенил-
1.225	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-Бифенил-
1.226	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-[Этил(метил)карбамоил]-3-фтор- фенил-
1.227	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	2-Цианофенил-
1.228	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	3-Цианофенил-
1.229	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-Амино-3-метилфенил-
1.230	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-Метилсульфонилфенил-
1.231	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-Диметиламинофенил-
1.232	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-Метиламинофенил-
1.233	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-трет-Бутоксифенил-
1.234	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-Цианофенил-
1.235	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-Гидроксифенил-
1.236	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-Циклопропилфенил-
1.237	-CH ₂ -	-Me	6-Cl	3-F	4-(Метилсульфанил)фенил-

№ соед.	R ¹	R ²	X	Y	D
	C≡CH				
1.238	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-Карбоксифенил-
1.239	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-Метоксикарбонилфенил-
1.240	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(трет-Бутоксикарбониламино)-3- фтор-фенил-
1.241	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	2-(Метилсульфанил)-4-пиридил-
1.242	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	2-Ацетамидо-4-пиридил-
1.243	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Оксазол-5-илфенил-
1.244	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Ацетамидофенил-
1.245	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(Диметилсульфамоил)фенил-
1.246	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-трет-Бутилфенил-
1.247	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Бифенил-
1.248	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-[Этил(метил)карбамоил]-3-фтор- фенил-
1.249	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	2-Цианофенил-
1.250	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	3-Цианофенил-
1.251	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Амино-3-метилфенил-
1.252	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Метилсульфонилфенил-
1.253	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Диметиламинофенил-
1.254	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Метиламинофенил-
1.255	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-трет-Бутоксифенил-
1.256	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Цианофенил-
1.257	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Гидроксифенил-
1.258	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Циклопропилфенил-
1.259	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(Метилсульфанил)фенил-
1.260	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Карбоксифенил-

№ соед.	R ¹	R ²	X	Y	D
1.261	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Метоксикарбонилфенил-
1.262	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(трет-Бутоксикарбониламино)-3-фтор-фенил-
1.263	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	2-(Метилсульфанил)-4-пиридил-
1.264	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	2-Ацетамидо-4-пиридил-
1.265	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-Оксазол-5-илфенил-
1.266	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-Ацетамидофенил-
1.267	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(Диметилсульфамоил)фенил-
1.268	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-трет-Бутилфенил-
1.269	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-Бифенил-
1.270	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-[Этил(метил)карбамоил]-3-фтор-фенил-
1.271	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-F	2-Цианофенил-
1.272	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-F	3-Цианофенил-
1.273	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-Амино-3-метилфенил-
1.274	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-Метилсульфонилфенил-
1.275	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-Диметиламинофенил-
1.276	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-Метиламинофенил-
1.277	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-трет-Бутоксифенил-
1.278	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-Цианофенил-
1.279	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-Гидроксифенил-
1.280	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-Циклопропилфенил-
1.281	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(Метилсульфанил)фенил-
1.282	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-Карбоксифенил-
1.283	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-Метоксикарбонилфенил-
1.284	-CH ₂ -	-Cl	6-F	3-F	4-(трет-Бутоксикарбониламино)-3-

№ соед.	R ¹	R ²	X	Y	D
	C≡CH				фтор-фенил-
1.285	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-F	2-(Метилсульфанил)-4-пиридил-
1.286	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-F	2-Ацетамидо-4-пиридил-
1.287	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-Оксазол-5-илфенил-
1.288	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-Ацетамидофенил-
1.289	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(Диметилсульфамоил)фенил-
1.290	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-трет-Бутилфенил-
1.291	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-Бифенил-
1.292	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-[Этил(метил)карбамоил]-3-фтор- фенил-
1.293	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	2-Цианофенил-
1.294	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	3-Цианофенил-
1.295	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-Амино-3-метилфенил-
1.296	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-Метилсульфонилфенил-
1.297	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-Диметиламинофенил-
1.298	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-Метиламинофенил-
1.299	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-трет-Бутоксифенил-
1.300	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-Цианофенил-
1.301	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-Гидроксифенил-
1.302	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-Циклопропилфенил-
1.303	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(Метилсульфанил)фенил-
1.304	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-Карбоксифенил-
1.305	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-Метоксикарбонилфенил-
1.306	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(трет-Бутоксикарбониламино)-3- фтор-фенил-
1.307	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	2-(Метилсульфанил)-4-пиридил-

№ соед.	R ¹	R ²	X	Y	D
1.308	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	2-Ацетамидо-4-пиридил-
1.309	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-Оксазол-5-илфенил-
1.310	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-Ацетамидофенил-
1.311	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(Диметилсульфамоил)фенил-
1.312	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-трет-Бутилфенил-
1.313	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-Бифенил-
1.314	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-[Этил(метил)карбамоил]-3-фтор- фенил-
1.315	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	2-Цианофенил-
1.316	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	3-Цианофенил-
1.317	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-Амино-3-метилфенил-
1.318	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-Метилсульфонилфенил-
1.319	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-Диметиламинофенил-
1.320	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-Метиламинофенил-
1.321	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-трет-Бутоксифенил-
1.322	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-Цианофенил-
1.323	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-Гидроксифенил-
1.324	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-Циклопропилфенил-
1.325	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(Метилсульфанил)фенил-
1.326	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-Карбоксифенил-
1.327	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-Метоксикарбонилфенил-
1.328	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(трет-Бутоксикарбониламино)-3- фтор-фенил-
1.329	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	2-(Метилсульфанил)-4-пиридил-
1.330	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	2-Ацетамидо-4-пиридил-
1.331	-CH ₂ -	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Оксазол-5-илфенил-

№ соед.	R ¹	R ²	X	Y	D
	C≡CH				
1.332	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Ацетиамидофенил-
1.333	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(Диметилсульфамоил)фенил-
1.334	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-трет-Бутилфенил-
1.335	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Бифенил-
1.336	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-[Этил(метил)карбамоил]-3-фтор- фенил-
1.337	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	2-Цианофенил-
1.338	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	3-Цианофенил-
1.339	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Амино-3-метилфенил-
1.340	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Метилсульфонилфенил-
1.341	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Диметиламинофенил-
1.342	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Метиламинофенил-
1.343	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-трет-Бутоксифенил-
1.344	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Цианофенил-
1.345	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Гидроксифенил-
1.346	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Циклопропилфенил-
1.347	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(Метилсульфанил)фенил-
1.348	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Карбоксифенил-
1.349	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Метоксикарбонилфенил-
1.350	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(трет-Бутоксикарбониламино)-3- фтор-фенил-
1.351	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	2-(Метилсульфанил)-4-пиридил-
1.352	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	2-Ацетиамидо-4-пиридил-
1.353	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(1-Метилпиразол-3-ил)фенил-
1.354	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(5-Метилтетразол-1-ил)фенил-
1.355	-Me	-Me	6-F	3-F	4-Морфолинофенил-
1.356	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(3-Метилпиразол-1-ил)фенил-

№ соед.	R ¹	R ²	X	Y	D
1.357	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(3,5-Диметилпиразол-1-ил)фенил-
1.358	-Me	-Me	6-F	3-F	4-Пиразол-1-илфенил-
1.359	-Me	-Me	6-F	3-F	4-Пиррол-1-илфенил-
1.360	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(5-Метилтетрагидрофуран-2-ил)фенил-
1.361	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(5-Метил-2-фурил)фенил-
1.362	-Me	-Me	6-F	3-F	4-Оксазол-2-илфенил-
1.363	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(2-Метилтиазол-4-ил)фенил-
1.364	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(2-Тиенил)фенил-
1.365	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(1,2,4-Триазол-1-ил)фенил-
1.366	-Me	-Me	6-F	3-F	1-Фенил-4-пиразолил-
1.367	-Me	-Me	6-F	3-F	1-Циклопропил-4-пиразолил-
1.368	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(Метилсульфанилметил)фенил-
1.369	-Me	-Me	6-F	3-F	4- (Изопропилсульфанилметил)фенил-
1.370	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(Метилсульфамоил)фенил-
1.371	-Me	-Me	6-F	3-F	4-Сульфоамилфенил-
1.372	-Me	-Me	6-F	3-F	4-Карбамоилфенил-
1.373	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(1-Метилпиразол-3-ил)фенил-
1.374	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(5-Метилтетразол-1-ил)фенил-
1.375	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-Морфолинофенил-
1.376	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(3-Метилпиразол-1-ил)фенил-
1.377	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(3,5-Диметилпиразол-1-ил)фенил-
1.378	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-Пиразол-1-илфенил-
1.379	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-Пиррол-1-илфенил-
1.380	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(5-Метилтетрагидрофуран-2-ил)фенил-
1.381	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(5-Метил-2-фурил)фенил-
1.382	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-Оксазол-2-илфенил-
1.383	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(2-Метилтиазол-4-ил)фенил-
1.384	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(2-Тиенил)фенил-
1.385	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(1,2,4-Триазол-1-ил)фенил-
1.386	-Me	-Me	6-F	3-Cl	1-Фенил-4-пиразолил-
1.387	-Me	-Me	6-F	3-Cl	1-Циклопропил-4-пиразолил-
1.388	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(Метилсульфанилметил)фенил-
1.389	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4- (Изопропилсульфанилметил)фенил-
1.390	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(Метилсульфамоил)фенил-
1.391	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-Сульфоамилфенил-
1.392	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-Карбамоилфенил-
1.393	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(1-Метилпиразол-3-ил)фенил-
1.394	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(5-Метилтетразол-1-ил)фенил-
1.395	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-Морфолинофенил-
1.396	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(3-Метилпиразол-1-ил)фенил-
1.397	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(3,5-Диметилпиразол-1-ил)фенил-
1.398	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-Пиразол-1-илфенил-
1.399	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-Пиррол-1-илфенил-

№ соед.	R ¹	R ²	X	Y	D
1.400	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(5-Метилтетрагидрофуран-2-ил)фенил-
1.401	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(5-Метил-2-фурил)фенил-
1.402	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-Оксазол-2-илфенил-
1.403	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(2-Метилтиазол-4-ил)фенил-
1.404	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(2-Тиенил)фенил-
1.405	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(1,2,4-Триазол-1-ил)фенил-
1.406	-Me	-Me	6-Cl	3-F	1-Фенил-4-пиразолил-
1.407	-Me	-Me	6-Cl	3-F	1-Циклопропил-4-пиразолил-
1.408	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(Метилсульфанилметил)фенил-
1.409	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4- (Изопропилсульфанилметил)фенил-
1.410	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(Метилсульфамоил)фенил-
1.411	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-Сульфамоилфенил-
1.412	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-Карбамоилфенил-
1.413	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(1-Метилпиразол-3-ил)фенил-
1.414	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(5-Метилтетразол-1-ил)фенил-
1.415	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Морфолинофенил-
1.416	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(3-Метилпиразол-1-ил)фенил-
1.417	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(3,5-Диметилпиразол-1-ил)фенил-
1.418	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Пиразол-1-илфенил-
1.419	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Пиррол-1-илфенил-
1.420	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(5-Метилтетрагидрофуран-2-ил)фенил-
1.421	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(5-Метил-2-фурил)фенил-
1.422	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Оксазол-2-илфенил-
1.423	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(2-Метилтиазол-4-ил)фенил-
1.424	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(2-Тиенил)фенил-
1.425	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(1,2,4-Триазол-1-ил)фенил-
1.426	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	1-Фенил-4-пиразолил-
1.427	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	1-Циклопропил-4-пиразолил-
1.428	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(Метилсульфанилметил)фенил-
1.429	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4- (Изопропилсульфанилметил)фенил-
1.430	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(Метилсульфамоил)фенил-
1.431	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Сульфамоилфенил-
1.432	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Карбамоилфенил-
1.433	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(1-Метилпиразол-3-ил)фенил-
1.434	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(5-Метилтетразол-1-ил)фенил-
1.435	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-Морфолинофенил-
1.436	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(3-Метилпиразол-1-ил)фенил-
1.437	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(3,5-Диметилпиразол-1-ил)фенил-
1.438	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-Пиразол-1-илфенил-
1.439	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-Пиррол-1-илфенил-
1.440	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(5-Метилтетрагидрофуран-2-ил)фенил-
1.441	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(5-Метил-2-фурил)фенил-

№ соед.	R ¹	R ²	X	Y	D
1.442	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-Оксазол-2-илфенил-
1.443	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(2-Метилтиазол-4-ил)фенил-
1.444	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(2-Тиенил)фенил-
1.445	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(1,2,4-Триазол-1-ил)фенил-
1.446	-Me	-Cl	6-F	3-F	1-Фенил-4-пиразолил-
1.447	-Me	-Cl	6-F	3-F	1-Циклопропил-4-пиразолил-
1.448	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(Метилсульфанилметил)фенил-
1.449	-Me	-Cl	6-F	3-F	4- (Изопропилсульфанилметил)фенил-
1.450	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(Метилсульфамоил)фенил-
1.451	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-Сульфамоилфенил-
1.452	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-Карбамоилфенил-
1.453	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(1-Метилпиразол-3-ил)фенил-
1.454	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(5-Метилтетразол-1-ил)фенил-
1.455	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-Морфолинофенил-
1.456	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(3-Метилпиразол-1-ил)фенил-
1.457	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(3,5-Диметилпиразол-1-ил)фенил-
1.458	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-Пиразол-1-илфенил-
1.459	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-Пиррол-1-илфенил-
1.460	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(5-Метилтетрагидрофуран-2- ил)фенил-
1.461	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(5-Метил-2-фурил)фенил-
1.462	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-Оксазол-2-илфенил-
1.463	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(2-Метилтиазол-4-ил)фенил-
1.464	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(2-Тиенил)фенил-
1.465	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(1,2,4-Триазол-1-ил)фенил-
1.466	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	1-Фенил-4-пиразолил-
1.467	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	1-Циклопропил-4-пиразолил-
1.468	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(Метилсульфанилметил)фенил-
1.469	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4- (Изопропилсульфанилметил)фенил-
1.470	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(Метилсульфамоил)фенил-
1.471	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-Сульфамоилфенил-
1.472	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-Карбамоилфенил-
1.473	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(1-Метилпиразол-3-ил)фенил-
1.474	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(5-Метилтетразол-1-ил)фенил-
1.475	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-Морфолинофенил-
1.476	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(3-Метилпиразол-1-ил)фенил-
1.477	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(3,5-Диметилпиразол-1-ил)фенил-
1.478	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-Пиразол-1-илфенил-
1.479	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-Пиррол-1-илфенил-
1.480	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(5-Метилтетрагидрофуран-2- ил)фенил-
1.481	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(5-Метил-2-фурил)фенил-
1.482	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-Оксазол-2-илфенил-
1.483	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(2-Метилтиазол-4-ил)фенил-
1.484	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(2-Тиенил)фенил-

№ соед.	R ¹	R ²	X	Y	D
1.485	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(1,2,4-Триазол-1-ил)фенил-
1.486	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	1-Фенил-4-пиразолил-
1.487	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	1-Циклопропил-4-пиразолил-
1.488	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(Метилсульфанилметил)фенил-
1.489	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4- (Изопропилсульфанилметил)фенил-
1.490	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(Метилсульфамойл)фенил-
1.491	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-Сульфамойлфенил-
1.492	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-Карбамоилфенил-
1.493	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(1-Метилпиразол-3-ил)фенил-
1.494	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(5-Метилтетразол-1-ил)фенил-
1.495	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Морфолинофенил-
1.496	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(3-Метилпиразол-1-ил)фенил-
1.497	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(3,5-Диметилпиразол-1-ил)фенил-
1.498	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Пиразол-1-илфенил-
1.499	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Пиррол-1-илфенил-
1.500	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(5-Метилтетрагидрофуран-2-ил)фенил-
1.501	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(5-Метил-2-фурил)фенил-
1.502	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Оксазол-2-илфенил-
1.503	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(2-Метилтиазол-4-ил)фенил-
1.504	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(2-Тиенил)фенил-
1.505	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(1,2,4-Триазол-1-ил)фенил-
1.506	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	1-Фенил-4-пиразолил-
1.507	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	1-Циклопропил-4-пиразолил-
1.508	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(Метилсульфанилметил)фенил-
1.509	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4- (Изопропилсульфанилметил)фенил-
1.510	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(Метилсульфамойл)фенил-
1.511	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Сульфамойлфенил-
1.512	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Карбамоилфенил-
1.513	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(1-Метилпиразол-3-ил)фенил-
1.514	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(5-Метилтетразол-1-ил)фенил-
1.515	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-Морфолинофенил-
1.516	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(3-Метилпиразол-1-ил)фенил-
1.517	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(3,5-Диметилпиразол-1-ил)фенил-
1.518	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-Пиразол-1-илфенил-
1.519	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-Пиррол-1-илфенил-
1.520	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(5-Метилтетрагидрофуран-2-ил)фенил-

№ соед.	R ¹	R ²	X	Y	D
1.521	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(5-Метил-2-фурил)фенил-
1.522	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-Оксазол-2-илфенил-
1.523	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(2-Метилтиазол-4-ил)фенил-
1.524	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(2-Тиенил)фенил-
1.525	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(1,2,4-Триазол-1-ил)фенил-
1.526	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-F	1-Фенил-4-пиразолил-
1.527	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-F	1-Циклопропил-4-пиразолил-
1.528	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(Метилсульфанилметил)фенил-
1.529	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-F	4- (Изопропилсульфанилметил)фенил-
1.530	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(Метилсульфамоил)фенил-
1.531	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-Сульфамоилфенил-
1.532	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-Карбамоилфенил-
1.533	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(1-Метилпиразол-3-ил)фенил-
1.534	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(5-Метилтетразол-1-ил)фенил-
1.535	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-Морфолинофенил-
1.536	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(3-Метилпиразол-1-ил)фенил-
1.537	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(3,5-Диметилпиразол-1-ил)фенил-
1.538	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-Пиразол-1-илфенил-
1.539	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-Пиррол-1-илфенил-
1.540	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(5-Метилтетрагидрофуран-2- ил)фенил-
1.541	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(5-Метил-2-фурил)фенил-
1.542	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-Оксазол-2-илфенил-
1.543	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(2-Метилтиазол-4-ил)фенил-
1.544	-CH ₂ -	-Me	6-F	3-Cl	4-(2-Тиенил)фенил-

№ соед.	R ¹	R ²	X	Y	D
	C≡CH				
1.545	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(1,2,4-Триазол-1-ил)фенил-
1.546	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	1-Фенил-4-пиразолил-
1.547	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	1-Циклопропил-4-пиразолил-
1.548	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(Метилсульфанилметил)фенил-
1.549	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4- (Изопропилсульфанилметил)фенил-
1.550	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(Метилсульфамоил)фенил-
1.551	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-Сульфамоилфенил-
1.552	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-Карбамоилфенил-
1.553	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(1-Метилпиразол-3-ил)фенил-
1.554	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(5-Метилтетразол-1-ил)фенил-
1.555	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-Морфолинофенил-
1.556	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(3-Метилпиразол-1-ил)фенил-
1.557	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(3,5-Диметилпиразол-1-ил)фенил-
1.558	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-Пиразол-1-илфенил-
1.559	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-Пиррол-1-илфенил-
1.560	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(5-Метилтетрагидрофуран-2- ил)фенил-
1.561	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(5-Метил-2-фурил)фенил-
1.562	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-Оксазол-2-илфенил-
1.563	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(2-Метилтиазол-4-ил)фенил-
1.564	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(2-Тиенил)фенил-
1.565	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(1,2,4-Триазол-1-ил)фенил-
1.566	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	1-Фенил-4-пиразолил-
1.567	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	1-Циклопропил-4-пиразолил-

№ соед.	R ¹	R ²	X	Y	D
1.568	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(Метилсульфанилметил)фенил-
1.569	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4- (Изопропилсульфанилметил)фенил-
1.570	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(Метилсульфамоил)фенил-
1.571	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-Сульфоамилфенил-
1.572	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-Карбамоилфенил-
1.573	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(1-Метилпиразол-3-ил)фенил-
1.574	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(5-Метилтетразол-1-ил)фенил-
1.575	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Морфолинофенил-
1.576	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(3-Метилпиразол-1-ил)фенил-
1.577	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(3,5-Диметилпиразол-1-ил)фенил-
1.578	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Пиразол-1-илфенил-
1.579	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Пиррол-1-илфенил-
1.580	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(5-Метилтетрагидрофуран-2- ил)фенил-
1.581	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(5-Метил-2-фурил)фенил-
1.582	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Оксазол-2-илфенил-
1.583	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(2-Метилтиазол-4-ил)фенил-
1.584	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(2-Тиенил)фенил-
1.585	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(1,2,4-Триазол-1-ил)фенил-
1.586	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	1-Фенил-4-пиразолил-
1.587	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	1-Циклопропил-4-пиразолил-
1.588	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(Метилсульфанилметил)фенил-
1.589	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4- (Изопропилсульфанилметил)фенил-
1.590	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(Метилсульфамоил)фенил-
1.591	-CH ₂ -	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Сульфоамилфенил-

№ соед.	R ¹	R ²	X	Y	D
	C≡CH				
1.592	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Карбамоилфенил-
1.593	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(1-Метилпиразол-3-ил)фенил-
1.594	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(5-Метилтетразол-1-ил)фенил-
1.595	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-Морфолинофенил-
1.596	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(3-Метилпиразол-1-ил)фенил-
1.597	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(3,5-Диметилпиразол-1-ил)фенил-
1.598	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-Пиразол-1-илфенил-
1.599	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-Пиррол-1-илфенил-
1.600	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(5-Метилтетрагидрофуран-2-ил)фенил-
1.601	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(5-Метил-2-фурил)фенил-
1.602	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-Оксазол-2-илфенил-
1.603	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(2-Метилтиазол-4-ил)фенил-
1.604	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(2-Тиенил)фенил-
1.605	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(1,2,4-Триазол-1-ил)фенил-
1.606	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-F	1-Фенил-4-пиразолил-
1.607	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-F	1-Циклопропил-4-пиразолил-
1.608	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(Метилсульфанилметил)фенил-
1.609	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4- (Изопропилсульфанилметил)фенил-
1.610	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(Метилсульфамоил)фенил-
1.611	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-Сульфоамилфенил-
1.612	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-Карбамоилфенил-
1.613	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(1-Метилпиразол-3-ил)фенил-
1.614	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(5-Метилтетразол-1-ил)фенил-

№ соед.	R ¹	R ²	X	Y	D
1.615	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-Морфолинофенил-
1.616	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(3-Метилпиразол-1-ил)фенил-
1.617	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(3,5-Диметилпиразол-1-ил)фенил-
1.618	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-Пиразол-1-илфенил-
1.619	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-Пиррол-1-илфенил-
1.620	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(5-Метилтетрагидрофуран-2-ил)фенил-
1.621	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(5-Метил-2-фурил)фенил-
1.622	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-Оксазол-2-илфенил-
1.623	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(2-Метилтиазол-4-ил)фенил-
1.624	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(2-Тиенил)фенил-
1.625	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(1,2,4-Триазол-1-ил)фенил-
1.626	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	1-Фенил-4-пиразолил-
1.627	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	1-Циклопропил-4-пиразолил-
1.628	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(Метилсульфанилметил)фенил-
1.629	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4- (Изопропилсульфанилметил)фенил-
1.630	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(Метилсульфамойл)фенил-
1.631	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-Сульфамойлфенил-
1.632	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-Карбамоилфенил-
1.633	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(1-Метилпиразол-3-ил)фенил-
1.634	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(5-Метилтетразол-1-ил)фенил-
1.635	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-Морфолинофенил-
1.636	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(3-Метилпиразол-1-ил)фенил-
1.637	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(3,5-Диметилпиразол-1-ил)фенил-
1.638	-CH ₂ -	-Cl	6-Cl	3-F	4-Пиразол-1-илфенил-

№ соед.	R ¹	R ²	X	Y	D
	C≡CH				
1.639	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-Пиррол-1-илфенил-
1.640	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(5-Метилтетрагидрофуран-2-ил)фенил-
1.641	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(5-Метил-2-фурил)фенил-
1.642	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-Оксазол-2-илфенил-
1.643	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(2-Метилтиазол-4-ил)фенил-
1.644	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(2-Тиенил)фенил-
1.645	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(1,2,4-Триазол-1-ил)фенил-
1.646	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	1-Фенил-4-пиразолил-
1.647	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	1-Циклопропил-4-пиразолил-
1.648	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(Метилсульфанилметил)фенил-
1.649	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4- (Изопропилсульфанилметил)фенил-
1.650	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(Метилсульфамоил)фенил-
1.651	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-Сульфамоилфенил-
1.652	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-Карбамоилфенил-
1.653	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(1-Метилпиразол-3-ил)фенил-
1.654	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(5-Метилтетразол-1-ил)фенил-
1.655	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Морфолинофенил-
1.656	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(3-Метилпиразол-1-ил)фенил-
1.657	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(3,5-Диметилпиразол-1-ил)фенил-
1.658	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Пиразол-1-илфенил-
1.659	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Пиррол-1-илфенил-
1.660	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(5-Метилтетрагидрофуран-2-ил)фенил-
1.661	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(5-Метил-2-фурил)фенил-

№ соед.	R ¹	R ²	X	Y	D
1.662	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Оксазол-2-илфенил-
1.663	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(2-Метилтиазол-4-ил)фенил-
1.664	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(2-Тиенил)фенил-
1.665	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(1,2,4-Триазол-1-ил)фенил-
1.666	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	1-Фенил-4-пиразолил-
1.667	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	1-Циклопропил-4-пиразолил-
1.668	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(Метилсульфанилметил)фенил-
1.669	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4- (Изопропилсульфанилметил)фенил-
1.670	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(Метилсульфамоил)фенил-
1.671	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Сульфоамилфенил-
1.672	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Карбамоилфенил-

В **таблице А-2** приведено 672 соединения от А-2.001 до А-2.672 формулы (I), где G представляет собой -H, W представляет собой (E)-CH=CH-, и R¹, R², X, Y, D являются такими, как определено для соединений №№ 1.001 – 1.672 соответственно в таблице 1 выше.

5

В **таблице А-3** приведено 672 соединения от А-3.001 до А-3.672 формулы (I), где G представляет собой -(C=O)iPr, W представляет собой -CH₂-CH₂- и R¹, R², X, Y, D являются такими, как определено для соединений №№ 1.001 – 1.672 соответственно в таблице 1 выше.

10 В **таблице А-4** приведено 672 соединения от А-4.001 до А-4.672 формулы (I), где G представляет собой -(C=O)iPr, W представляет собой (E)-CH=CH-, и R¹, R², X, Y, D являются такими, как определено для соединений №№ 1.001 – 1.672 соответственно в таблице 1 выше.

15 В **таблице В-1** приведено 744 соединения от В-1.001 до В-1.744 формулы (I), где G представляет собой -H, W представляет собой -CH₂-CH₂-, X представляет собой 6-

циклопропил, и R¹, R², Y, D являются такими, как определено для соединений №№ 2.001 – 2.744 соответственно в таблице 2 ниже.

Таблица 2. Определения заместителей R¹, R², Y и D

№ соединения	R ¹	R ²	Y	D
2.001	-Me	-Me	3-F	-Ph
2.002	-Me	-Me	3-F	1-Метил-3-(трифторметил)пиразол-4-ил-
2.003	-Me	-Me	3-F	1-Метил-пиразол-4-ил-
2.004	-Me	-Me	3-F	2-(Метилсульфанил)-4-пиридил-
2.005	-Me	-Me	3-F	2-Ацетамидо-4-пиридил-
2.006	-Me	-Me	3-F	2-Ацетамидотиазол-5-ил-
2.007	-Me	-Me	3-F	2-Амино-4-пиридил-
2.008	-Me	-Me	3-F	2-Хлор-3-пиридил-
2.009	-Me	-Me	3-F	2-Хлор-4-пиридил-
2.010	-Me	-Me	3-F	2-Хлортиазол-5-ил-
2.011	-Me	-Me	3-F	2-Цианофенил-
2.012	-Me	-Me	3-F	2-Циано-фенил-
2.013	-Me	-Me	3-F	2-Фтор-4-пиридил-
2.014	-Me	-Me	3-F	2-Метил-4-пиридил-
2.015	-Me	-Me	3-F	2-Метил-триазол-4-ил-
2.016	-Me	-Me	3-F	2-Толил-
2.017	-Me	-Me	3-F	2-Трифторметил-4-пиридил-
2.018	-Me	-Me	3-F	2-Трифторметил-фенил-
2.019	-Me	-Me	3-F	3,4-Дифтор-фенил-
2.020	-Me	-Me	3-F	3,5-Дифтор-фенил-
2.021	-Me	-Me	3-F	3-Хлор-4-фтор-фенил-
2.022	-Me	-Me	3-F	3-Хлор-4-пиридил-
2.023	-Me	-Me	3-F	3-Цианофенил-
2.024	-Me	-Me	3-F	3-Циано-фенил-
2.025	-Me	-Me	3-F	3-Метил-2-пиридил-
2.026	-Me	-Me	3-F	3-Метил-4-амино-фенил-
2.027	-Me	-Me	3-F	3-Пиридил-
2.028	-Me	-Me	3-F	3-Толил-
2.029	-Me	-Me	3-F	3-Трифторметил-3-пиридил-
2.030	-Me	-Me	3-F	3-Трифторметил-фенил-
2.031	-Me	-Me	3-F	4-(Диметиламино)-фенил-
2.032	-Me	-Me	3-F	4-(Диметилсульфамойл)фенил-
2.033	-Me	-Me	3-F	4-(Метиламино)-фенил-
2.034	-Me	-Me	3-F	4-(Метилсульфанил)фенил-
2.035	-Me	-Me	3-F	4-(трет-Бутокси)-фенил-
2.036	-Me	-Me	3-F	4-(трет-Бутоксикарбониламино)-3-фтор-фенил-
2.037	-Me	-Me	3-F	4-(Трифторметокси)-фенил-
2.038	-Me	-Me	3-F	4-[Этил(метил)карбамоил]-3-фтор-фенил-

№ соединения	R ¹	R ²	Y	D
2.039	-Me	-Me	3-F	4-Ацетамидофенил-
2.040	-Me	-Me	3-F	4-Амино-3-метилфенил-
2.041	-Me	-Me	3-F	4-Амино-фенил-
2.042	-Me	-Me	3-F	4-Бифенил-
2.043	-Me	-Me	3-F	4-Карбоксифенил-
2.044	-Me	-Me	3-F	4-Хлор-3-пиридил-
2.045	-Me	-Me	3-F	4-Хлор-фенил-
2.046	-Me	-Me	3-F	4-Цианофенил-
2.047	-Me	-Me	3-F	4-Циано-фенил-
2.048	-Me	-Me	3-F	4-Циклопропилфенил-
2.049	-Me	-Me	3-F	4-Циклопропил-фенил-
2.050	-Me	-Me	3-F	4-Диметиламинофенил-
2.051	-Me	-Me	3-F	4-Фтор-фенил-
2.052	-Me	-Me	3-F	4-Гидроксифенил-
2.053	-Me	-Me	3-F	4-Гидрокси-фенил-
2.054	-Me	-Me	3-F	4-Метоксикарбонилфенил-
2.055	-Me	-Me	3-F	4-Метил-2-пиридил-
2.056	-Me	-Me	3-F	4-Метиламинофенил-
2.057	-Me	-Me	3-F	4-Метилсульфонилфенил-
2.058	-Me	-Me	3-F	4-Оксазол-5-илфенил-
2.059	-Me	-Me	3-F	4-Пиридил-
2.060	-Me	-Me	3-F	4-трет-Бутоксифенил-
2.061	-Me	-Me	3-F	4-трет-Бутилфенил-
2.062	-Me	-Me	3-F	4-Толил-
2.063	-Me	-Me	3-F	4-Трифторметил-3-пиридил-
2.064	-Me	-Me	3-F	4-Трифторметил-фенил-
2.065	-Me	-Me	3-F	5-Метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил-
2.066	-Me	-Me	3-F	5-Метил-2-пиридил-
2.067	-Me	-Me	3-F	5-Метил-3-пиридил-
2.068	-Me	-Me	3-F	6-Хлор-3-пиридил-
2.069	-Me	-Me	3-F	6-Метил-2-пиридил-
2.070	-Me	-Me	3-F	Пиримидин-5-ил-
2.071	-Me	-Me	3-F	Тиазол-2-ил-
2.072	-Me	-Me	3-F	Тиазол-5-ил-
2.073	-Me	-Me	3-F	Тиофен-3-ил-
2.074	-Me	-Me	3-Cl	-Ph
2.075	-Me	-Me	3-Cl	1-Метил-3-(трифторметил)пиразол-4-ил-
2.076	-Me	-Me	3-Cl	1-Метил-пиразол-4-ил-
2.077	-Me	-Me	3-Cl	2-(Метилсульфанил)-4-пиридил-
2.078	-Me	-Me	3-Cl	2-Ацетамидо-4-пиридил-
2.079	-Me	-Me	3-Cl	2-Ацетамидотиазол-5-ил-
2.080	-Me	-Me	3-Cl	2-Амино-4-пиридил-
2.081	-Me	-Me	3-Cl	2-Хлор-3-пиридил-
2.082	-Me	-Me	3-Cl	2-Хлор-4-пиридил-
2.083	-Me	-Me	3-Cl	2-Хлортиазол-5-ил-

№ соединения	R ¹	R ²	Y	D
2.084	-Me	-Me	3-Cl	2-Цианофенил-
2.085	-Me	-Me	3-Cl	2-Циано-фенил-
2.086	-Me	-Me	3-Cl	2-Фтор-4-пиридил-
2.087	-Me	-Me	3-Cl	2-Метил-4-пиридил-
2.088	-Me	-Me	3-Cl	2-Метил-триазол-4-ил-
2.089	-Me	-Me	3-Cl	2-Толил-
2.090	-Me	-Me	3-Cl	2-Трифторметил-4-пиридил-
2.091	-Me	-Me	3-Cl	2-Трифторметил-фенил-
2.092	-Me	-Me	3-Cl	3,4-Дифтор-фенил-
2.093	-Me	-Me	3-Cl	3,5-Дифтор-фенил-
2.094	-Me	-Me	3-Cl	3-Хлор-4-фтор-фенил-
2.095	-Me	-Me	3-Cl	3-Хлор-4-пиридил-
2.096	-Me	-Me	3-Cl	3-Цианофенил-
2.097	-Me	-Me	3-Cl	3-Циано-фенил-
2.098	-Me	-Me	3-Cl	3-Метил-2-пиридил-
2.099	-Me	-Me	3-Cl	3-Метил-4-амино-фенил-
2.100	-Me	-Me	3-Cl	3-Пиридил-
2.101	-Me	-Me	3-Cl	3-Толил-
2.102	-Me	-Me	3-Cl	3-Трифторметил-3-пиридил-
2.103	-Me	-Me	3-Cl	3-Трифторметил-фенил-
2.104	-Me	-Me	3-Cl	4-(Диметиламино)-фенил-
2.105	-Me	-Me	3-Cl	4-(Диметилсульфамоил)фенил-
2.106	-Me	-Me	3-Cl	4-(Метиламино)-фенил-
2.107	-Me	-Me	3-Cl	4-(Метилсульфанил)фенил-
2.108	-Me	-Me	3-Cl	4-(трет-Бутокси)-фенил-
2.109	-Me	-Me	3-Cl	4-(трет-Бутоксикарбониламино)-3-фтор-фенил-
2.110	-Me	-Me	3-Cl	4-(Трифторметокси)-фенил-
2.111	-Me	-Me	3-Cl	4-[Этил(метил)карбамоил]-3-фтор-фенил-
2.112	-Me	-Me	3-Cl	4-Ацетидамофенил-
2.113	-Me	-Me	3-Cl	4-Амино-3-метилфенил-
2.114	-Me	-Me	3-Cl	4-Амино-фенил-
2.115	-Me	-Me	3-Cl	4-Бифенил-
2.116	-Me	-Me	3-Cl	4-Карбоксифенил-
2.117	-Me	-Me	3-Cl	4-Хлор-3-пиридил-
2.118	-Me	-Me	3-Cl	4-Хлор-фенил-
2.119	-Me	-Me	3-Cl	4-Цианофенил-
2.120	-Me	-Me	3-Cl	4-Циано-фенил-
2.121	-Me	-Me	3-Cl	4-Циклопропилфенил-
2.122	-Me	-Me	3-Cl	4-Циклопропил-фенил-
2.123	-Me	-Me	3-Cl	4-Диметиламинофенил-
2.124	-Me	-Me	3-Cl	4-Фтор-фенил-
2.125	-Me	-Me	3-Cl	4-Гидроксифенил-
2.126	-Me	-Me	3-Cl	4-Гидрокси-фенил-
2.127	-Me	-Me	3-Cl	4-Метоксикарбонилфенил-
2.128	-Me	-Me	3-Cl	4-Метил-2-пиридил-

№ соединения	R ¹	R ²	Y	D
2.129	-Me	-Me	3-Cl	4-Метиламинофенил-
2.130	-Me	-Me	3-Cl	4-Метилсульфонилфенил-
2.131	-Me	-Me	3-Cl	4-Оксазол-5-илфенил-
2.132	-Me	-Me	3-Cl	4-Пиридил-
2.133	-Me	-Me	3-Cl	4-трет-Бутоксифенил-
2.134	-Me	-Me	3-Cl	4-трет-Бутилфенил-
2.135	-Me	-Me	3-Cl	4-Толил-
2.136	-Me	-Me	3-Cl	4-Трифторметил-3-пиридил-
2.137	-Me	-Me	3-Cl	4-Трифторметил-фенил-
2.138	-Me	-Me	3-Cl	5-Метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил-
2.139	-Me	-Me	3-Cl	5-Метил-2-пиридил-
2.140	-Me	-Me	3-Cl	5-Метил-3-пиридил-
2.141	-Me	-Me	3-Cl	6-Хлор-3-пиридил-
2.142	-Me	-Me	3-Cl	6-Метил-2-пиридил-
2.143	-Me	-Me	3-Cl	Пиримидин-5-ил-
2.144	-Me	-Me	3-Cl	Тиазол-2-ил-
2.145	-Me	-Me	3-Cl	Тиазол-5-ил-
2.146	-Me	-Me	3-Cl	Тиофен-3-ил-
2.147	-Me	-Cl	3-F	-Ph
2.148	-Me	-Cl	3-F	1-Метил-3-(трифторметил)пиразол-4-ил-
2.149	-Me	-Cl	3-F	1-Метил-пиразол-4-ил-
2.150	-Me	-Cl	3-F	2-(Метилсульфанил)-4-пиридил-
2.151	-Me	-Cl	3-F	2-Ацетамидо-4-пиридил-
2.152	-Me	-Cl	3-F	2-Ацетамидотиазол-5-ил-
2.153	-Me	-Cl	3-F	2-Амино-4-пиридил-
2.154	-Me	-Cl	3-F	2-Хлор-3-пиридил-
2.155	-Me	-Cl	3-F	2-Хлор-4-пиридил-
2.156	-Me	-Cl	3-F	2-Хлортиазол-5-ил-
2.157	-Me	-Cl	3-F	2-Цианофенил-
2.158	-Me	-Cl	3-F	2-Циано-фенил-
2.159	-Me	-Cl	3-F	2-Фтор-4-пиридил-
2.160	-Me	-Cl	3-F	2-Метил-4-пиридил-
2.161	-Me	-Cl	3-F	2-Метил-триазол-4-ил-
2.162	-Me	-Cl	3-F	2-Толил-
2.163	-Me	-Cl	3-F	2-Трифторметил-4-пиридил-
2.164	-Me	-Cl	3-F	2-Трифторметил-фенил-
2.165	-Me	-Cl	3-F	3,4-Дифтор-фенил-
2.166	-Me	-Cl	3-F	3,5-Дифтор-фенил-
2.167	-Me	-Cl	3-F	3-Хлор-4-фтор-фенил-
2.168	-Me	-Cl	3-F	3-Хлор-4-пиридил-
2.169	-Me	-Cl	3-F	3-Цианофенил-
2.170	-Me	-Cl	3-F	3-Циано-фенил-
2.171	-Me	-Cl	3-F	3-Метил-2-пиридил-
2.172	-Me	-Cl	3-F	3-Метил-4-амино-фенил-
2.173	-Me	-Cl	3-F	3-Пиридил-

№ соединения	R ¹	R ²	Y	D
2.174	-Me	-Cl	3-F	3-Толил-
2.175	-Me	-Cl	3-F	3-Трифторметил-3-пиридил-
2.176	-Me	-Cl	3-F	3-Трифторметил-фенил-
2.177	-Me	-Cl	3-F	4-(Диметиламино)-фенил-
2.178	-Me	-Cl	3-F	4-(Диметилсульфамоил)фенил-
2.179	-Me	-Cl	3-F	4-(Метиламино)-фенил-
2.180	-Me	-Cl	3-F	4-(Метилсульфанил)фенил-
2.181	-Me	-Cl	3-F	4-(трет-Бутокси)-фенил-
2.182	-Me	-Cl	3-F	4-(трет-Бутоксикарбониламино)-3-фтор-фенил-
2.183	-Me	-Cl	3-F	4-(Трифторметокси)-фенил-
2.184	-Me	-Cl	3-F	4-[Этил(метил)карбамоил]-3-фтор-фенил-
2.185	-Me	-Cl	3-F	4-Ацетидамофенил-
2.186	-Me	-Cl	3-F	4-Амино-3-метилфенил-
2.187	-Me	-Cl	3-F	4-Амино-фенил-
2.188	-Me	-Cl	3-F	4-Бифенил-
2.189	-Me	-Cl	3-F	4-Карбоксифенил-
2.190	-Me	-Cl	3-F	4-Хлор-3-пиридил-
2.191	-Me	-Cl	3-F	4-Хлор-фенил-
2.192	-Me	-Cl	3-F	4-Цианофенил-
2.193	-Me	-Cl	3-F	4-Циано-фенил-
2.194	-Me	-Cl	3-F	4-Циклопропилфенил-
2.195	-Me	-Cl	3-F	4-Циклопропил-фенил-
2.196	-Me	-Cl	3-F	4-Диметиламинофенил-
2.197	-Me	-Cl	3-F	4-Фтор-фенил-
2.198	-Me	-Cl	3-F	4-Гидроксифенил-
2.199	-Me	-Cl	3-F	4-Гидрокси-фенил-
2.200	-Me	-Cl	3-F	4-Метоксикарбонилфенил-
2.201	-Me	-Cl	3-F	4-Метил-2-пиридил-
2.202	-Me	-Cl	3-F	4-Метиламинофенил-
2.203	-Me	-Cl	3-F	4-Метилсульфонилфенил-
2.204	-Me	-Cl	3-F	4-Оксазол-5-илфенил-
2.205	-Me	-Cl	3-F	4-Пиридил-
2.206	-Me	-Cl	3-F	4-трет-Бутоксифенил-
2.207	-Me	-Cl	3-F	4-трет-Бутилфенил-
2.208	-Me	-Cl	3-F	4-Толил-
2.209	-Me	-Cl	3-F	4-Трифторметил-3-пиридил-
2.210	-Me	-Cl	3-F	4-Трифторметил-фенил-
2.211	-Me	-Cl	3-F	5-Метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил-
2.212	-Me	-Cl	3-F	5-Метил-2-пиридил-
2.213	-Me	-Cl	3-F	5-Метил-3-пиридил-
2.214	-Me	-Cl	3-F	6-Хлор-3-пиридил-
2.215	-Me	-Cl	3-F	6-Метил-2-пиридил-
2.216	-Me	-Cl	3-F	Пиримидин-5-ил-
2.217	-Me	-Cl	3-F	Тиазол-2-ил-
2.218	-Me	-Cl	3-F	Тиазол-5-ил-

№ соединения	R ¹	R ²	Y	D
2.219	-Me	-Cl	3-F	Тиофен-3-ил-
2.220	-Me	-Cl	3-Cl	-Ph
2.221	-Me	-Cl	3-Cl	1-Метил-3-(трифторметил)пиразол-4-ил-
2.222	-Me	-Cl	3-Cl	1-Метил-пиразол-4-ил-
2.223	-Me	-Cl	3-Cl	2-(Метилсульфанил)-4-пиридил-
2.224	-Me	-Cl	3-Cl	2-Ацетамидо-4-пиридил-
2.225	-Me	-Cl	3-Cl	2-Ацетамидотиазол-5-ил-
2.226	-Me	-Cl	3-Cl	2-Амино-4-пиридил-
2.227	-Me	-Cl	3-Cl	2-Хлор-3-пиридил-
2.228	-Me	-Cl	3-Cl	2-Хлор-4-пиридил-
2.229	-Me	-Cl	3-Cl	2-Хлортиазол-5-ил-
2.230	-Me	-Cl	3-Cl	2-Цианофенил-
2.231	-Me	-Cl	3-Cl	2-Циано-фенил-
2.232	-Me	-Cl	3-Cl	2-Фтор-4-пиридил-
2.233	-Me	-Cl	3-Cl	2-Метил-4-пиридил-
2.234	-Me	-Cl	3-Cl	2-Метил-триазол-4-ил-
2.235	-Me	-Cl	3-Cl	2-Толил-
2.236	-Me	-Cl	3-Cl	2-Трифторметил-4-пиридил-
2.237	-Me	-Cl	3-Cl	2-Трифторметил-фенил-
2.238	-Me	-Cl	3-Cl	3,4-Дифтор-фенил-
2.239	-Me	-Cl	3-Cl	3,5-Дифтор-фенил-
2.240	-Me	-Cl	3-Cl	3-Хлор-4-фтор-фенил-
2.241	-Me	-Cl	3-Cl	3-Хлор-4-пиридил-
2.242	-Me	-Cl	3-Cl	3-Цианофенил-
2.243	-Me	-Cl	3-Cl	3-Циано-фенил-
2.244	-Me	-Cl	3-Cl	3-Метил-2-пиридил-
2.245	-Me	-Cl	3-Cl	3-Метил-4-амино-фенил-
2.246	-Me	-Cl	3-Cl	3-Пиридил-
2.247	-Me	-Cl	3-Cl	3-Толил-
2.248	-Me	-Cl	3-Cl	3-Трифторметил-3-пиридил-
2.249	-Me	-Cl	3-Cl	3-Трифторметил-фенил-
2.250	-Me	-Cl	3-Cl	4-(Диметиламино)-фенил-
2.251	-Me	-Cl	3-Cl	4-(Диметилсульфамоил)фенил-
2.252	-Me	-Cl	3-Cl	4-(Метиламино)-фенил-
2.253	-Me	-Cl	3-Cl	4-(Метилсульфанил)фенил-
2.254	-Me	-Cl	3-Cl	4-(трет-Бутокси)-фенил-
2.255	-Me	-Cl	3-Cl	4-(трет-Бутоксикарбониламино)-3-фтор-фенил-
2.256	-Me	-Cl	3-Cl	4-(Трифторметокси)-фенил-
2.257	-Me	-Cl	3-Cl	4-[Этил(метил)карбамоил]-3-фтор-фенил-
2.258	-Me	-Cl	3-Cl	4-Ацетамидофенил-
2.259	-Me	-Cl	3-Cl	4-Амино-3-метилфенил-
2.260	-Me	-Cl	3-Cl	4-Амино-фенил-
2.261	-Me	-Cl	3-Cl	4-Бифенил-
2.262	-Me	-Cl	3-Cl	4-Карбоксифенил-

№ соединения	R ¹	R ²	Y	D
2.263	-Me	-Cl	3-Cl	4-Хлор-3-пиридил-
2.264	-Me	-Cl	3-Cl	4-Хлор-фенил-
2.265	-Me	-Cl	3-Cl	4-Цианофенил-
2.266	-Me	-Cl	3-Cl	4-Циано-фенил-
2.267	-Me	-Cl	3-Cl	4-Циклопропилфенил-
2.268	-Me	-Cl	3-Cl	4-Циклопропил-фенил-
2.269	-Me	-Cl	3-Cl	4-Диметиламинофенил-
2.270	-Me	-Cl	3-Cl	4-Фтор-фенил-
2.271	-Me	-Cl	3-Cl	4-Гидроксифенил-
2.272	-Me	-Cl	3-Cl	4-Гидрокси-фенил-
2.273	-Me	-Cl	3-Cl	4-Метоксикарбонилфенил-
2.274	-Me	-Cl	3-Cl	4-Метил-2-пиридил-
2.275	-Me	-Cl	3-Cl	4-Метиламинофенил-
2.276	-Me	-Cl	3-Cl	4-Метилсульфонилфенил-
2.277	-Me	-Cl	3-Cl	4-Оксазол-5-илфенил-
2.278	-Me	-Cl	3-Cl	4-Пиридил-
2.279	-Me	-Cl	3-Cl	4-трет-Бутоксифенил-
2.280	-Me	-Cl	3-Cl	4-трет-Бутилфенил-
2.281	-Me	-Cl	3-Cl	4-Толил-
2.282	-Me	-Cl	3-Cl	4-Трифторметил-3-пиридил-
2.283	-Me	-Cl	3-Cl	4-Трифторметил-фенил-
2.284	-Me	-Cl	3-Cl	5-Метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил-
2.285	-Me	-Cl	3-Cl	5-Метил-2-пиридил-
2.286	-Me	-Cl	3-Cl	5-Метил-3-пиридил-
2.287	-Me	-Cl	3-Cl	6-Хлор-3-пиридил-
2.288	-Me	-Cl	3-Cl	6-Метил-2-пиридил-
2.289	-Me	-Cl	3-Cl	Пиримидин-5-ил-
2.290	-Me	-Cl	3-Cl	Тиазол-2-ил-
2.291	-Me	-Cl	3-Cl	Тиазол-5-ил-
2.292	-Me	-Cl	3-Cl	Тиофен-3-ил-
2.293	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	-Ph
2.294	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	1-Метил-3-(трифторметил)пиразол-4-ил-
2.295	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	1-Метил-пиразол-4-ил-
2.296	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	2-(Метилсульфанил)-4-пиридил-
2.297	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	2-Ацетамидо-4-пиридил-
2.298	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	2-Ацетамидотиазол-5-ил-
2.299	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	2-Амино-4-пиридил-
2.300	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	2-Хлор-3-пиридил-
2.301	-CH ₂ -	-Me	3-F	2-Хлор-4-пиридил-

№ соединения	R ¹	R ²	Y	D
	C≡CH			
2.302	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	2-Хлортиазол-5-ил-
2.303	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	2-Цианофенил-
2.304	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	2-Циано-фенил-
2.305	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	2-Фтор-4-пиридил-
2.306	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	2-Метил-4-пиридил-
2.307	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	2-Метил-триазол-4-ил-
2.308	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	2-Толил-
2.309	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	2-Трифторметил-4-пиридил-
2.310	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	2-Трифторметил-фенил-
2.311	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	3,4-Дифтор-фенил-
2.312	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	3,5-Дифтор-фенил-
2.313	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	3-Хлор-4-фтор-фенил-
2.314	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	3-Хлор-4-пиридил-
2.315	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	3-Цианофенил-
2.316	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	3-Циано-фенил-
2.317	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	3-Метил-2-пиридил-
2.318	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	3-Метил-4-амино-фенил-
2.319	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	3-Пиридил-
2.320	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	3-Толил-
2.321	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	3-Трифторметил-3-пиридил-
2.322	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	3-Трифторметил-фенил-
2.323	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-(Диметиламино)-фенил-
2.324	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-(Диметилсульфамоил)фенил-

№ соединения	R ¹	R ²	Y	D
2.325	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-(Метиламино)-фенил-
2.326	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-(Метилсульфанил)фенил-
2.327	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-(трет-Бутокси)-фенил-
2.328	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-(трет-Бутоксикарбониламино)-3-фтор-фенил-
2.329	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-(Трифторметокси)-фенил-
2.330	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-[Этил(метил)карбамоил]-3-фтор-фенил-
2.331	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-Ацетидамофенил-
2.332	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-Амино-3-метилфенил-
2.333	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-Амино-фенил-
2.334	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-Бифенил-
2.335	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-Карбоксифенил-
2.336	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-Хлор-3-пиридил-
2.337	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-Хлор-фенил-
2.338	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-Цианофенил-
2.339	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-Циано-фенил-
2.340	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-Циклопропилфенил-
2.341	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-Циклопропил-фенил-
2.342	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-Диметиламинофенил-
2.343	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-Фтор-фенил-
2.344	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-Гидроксифенил-
2.345	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-Гидрокси-фенил-
2.346	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-Метоксикарбонилфенил-
2.347	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-Метил-2-пиридил-
2.348	-CH ₂ -	-Me	3-F	4-Метиламинофенил-

№ соединения	R ¹	R ²	Y	D
	C≡CH			
2.349	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-Метилсульфонилфенил-
2.350	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-Оксазол-5-илфенил-
2.351	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-Пиридил-
2.352	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-трет-Бутоксифенил-
2.353	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-трет-Бутилфенил-
2.354	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-Толил-
2.355	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-Трифторметил-3-пиридил-
2.356	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-Трифторметил-фенил-
2.357	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	5-Метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил-
2.358	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	5-Метил-2-пиридил-
2.359	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	5-Метил-3-пиридил-
2.360	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	6-Хлор-3-пиридил-
2.361	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	6-Метил-2-пиридил-
2.362	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	Пиримидин-5-ил-
2.363	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	Тиазол-2-ил-
2.364	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	Тиазол-5-ил-
2.365	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	Тиофен-3-ил-
2.366	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	-Ph
2.367	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	1-Метил-3-(трифторметил)пиразол-4-ил-
2.368	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	1-Метил-пиразол-4-ил-
2.369	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	2-(Метилсульфанил)-4-пиридил-
2.370	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	2-Ацетамидо-4-пиридил-
2.371	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	2-Ацетамидотиазол-5-ил-

№ соединения	R ¹	R ²	Y	D
2.372	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	2-Амино-4-пиридил-
2.373	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	2-Хлор-3-пиридил-
2.374	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	2-Хлор-4-пиридил-
2.375	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	2-Хлортиазол-5-ил-
2.376	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	2-Цианофенил-
2.377	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	2-Циано-фенил-
2.378	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	2-Фтор-4-пиридил-
2.379	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	2-Метил-4-пиридил-
2.380	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	2-Метил-триазол-4-ил-
2.381	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	2-Толил-
2.382	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	2-Трифторметил-4-пиридил-
2.383	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	2-Трифторметил-фенил-
2.384	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	3,4-Дифтор-фенил-
2.385	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	3,5-Дифтор-фенил-
2.386	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	3-Хлор-4-фтор-фенил-
2.387	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	3-Хлор-4-пиридил-
2.388	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	3-Цианофенил-
2.389	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	3-Циано-фенил-
2.390	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	3-Метил-2-пиридил-
2.391	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	3-Метил-4-амино-фенил-
2.392	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	3-Пиридил-
2.393	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	3-Толил-
2.394	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	3-Трифторметил-3-пиридил-
2.395	-CH ₂ -	-Me	3-Cl	3-Трифторметил-фенил-

№ соединения	R ¹	R ²	Y	D
	C≡CH			
2.396	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-(Диметиламино)-фенил-
2.397	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-(Диметилсульфамоил)фенил-
2.398	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-(Метиламино)-фенил-
2.399	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-(Метилсульфанил)фенил-
2.400	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-(трет-Бутокси)-фенил-
2.401	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-(трет-Бутоксикарбониламино)-3-фтор-фенил-
2.402	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-(Трифторметокси)-фенил-
2.403	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-[Этил(метил)карбамоил]-3-фтор-фенил-
2.404	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-Ацетамидофенил-
2.405	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-Амино-3-метилфенил-
2.406	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-Амино-фенил-
2.407	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-Бифенил-
2.408	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-Карбоксифенил-
2.409	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-Хлор-3-пиридил-
2.410	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-Хлор-фенил-
2.411	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-Цианофенил-
2.412	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-Циано-фенил-
2.413	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-Циклопропилфенил-
2.414	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-Циклопропил-фенил-
2.415	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-Диметиламинофенил-
2.416	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-Фтор-фенил-
2.417	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-Гидроксифенил-
2.418	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-Гидрокси-фенил-

№ соединения	R ¹	R ²	Y	D
2.419	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-Метоксикарбонилфенил-
2.420	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-Метил-2-пиридил-
2.421	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-Метиламинофенил-
2.422	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-Метилсульфонилфенил-
2.423	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-Оксазол-5-илфенил-
2.424	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-Пиридил-
2.425	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-трет-Бутоксифенил-
2.426	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-трет-Бутилфенил-
2.427	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-Толил-
2.428	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-Трифторметил-3-пиридил-
2.429	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-Трифторметил-фенил-
2.430	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	5-Метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил-
2.431	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	5-Метил-2-пиридил-
2.432	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	5-Метил-3-пиридил-
2.433	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	6-Хлор-3-пиридил-
2.434	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	6-Метил-2-пиридил-
2.435	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	Пиримидин-5-ил-
2.436	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	Тиазол-2-ил-
2.437	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	Тиазол-5-ил-
2.438	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	Тиофен-3-ил-
2.439	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	-Ph
2.440	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	1-Метил-3-(трифторметил)пиразол-4-ил-
2.441	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	1-Метил-пиразол-4-ил-
2.442	-CH ₂ -	-Cl	3-F	2-(Метилсульфанил)-4-пиридил-

№ соединения	R ¹	R ²	Y	D
	C≡CH			
2.443	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	2-Ацетамидо-4-пиридил-
2.444	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	2-Ацетамидотиазол-5-ил-
2.445	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	2-Амино-4-пиридил-
2.446	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	2-Хлор-3-пиридил-
2.447	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	2-Хлор-4-пиридил-
2.448	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	2-Хлортиазол-5-ил-
2.449	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	2-Цианофенил-
2.450	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	2-Циано-фенил-
2.451	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	2-Фтор-4-пиридил-
2.452	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	2-Метил-4-пиридил-
2.453	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	2-Метил-триазол-4-ил-
2.454	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	2-Толил-
2.455	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	2-Трифторметил-4-пиридил-
2.456	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	2-Трифторметил-фенил-
2.457	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	3,4-Дифтор-фенил-
2.458	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	3,5-Дифтор-фенил-
2.459	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	3-Хлор-4-фтор-фенил-
2.460	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	3-Хлор-4-пиридил-
2.461	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	3-Цианофенил-
2.462	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	3-Циано-фенил-
2.463	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	3-Метил-2-пиридил-
2.464	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	3-Метил-4-амино-фенил-
2.465	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	3-Пиридил-

№ соединения	R ¹	R ²	Y	D
2.466	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	3-Толил-
2.467	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	3-Трифторметил-3-пиридил-
2.468	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	3-Трифторметил-фенил-
2.469	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-(Диметиламино)-фенил-
2.470	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-(Диметилсульфамоил)фенил-
2.471	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-(Метиламино)-фенил-
2.472	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-(Метилсульфанил)фенил-
2.473	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-(трет-Бутокси)-фенил-
2.474	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-(трет-Бутоксикарбониламино)-3-фтор-фенил-
2.475	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-(Трифторметокси)-фенил-
2.476	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-[Этил(метил)карбамоил]-3-фтор-фенил-
2.477	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-Ацетамидофенил-
2.478	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-Амино-3-метилфенил-
2.479	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-Амино-фенил-
2.480	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-Бифенил-
2.481	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-Карбоксифенил-
2.482	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-Хлор-3-пиридил-
2.483	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-Хлор-фенил-
2.484	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-Цианофенил-
2.485	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-Циано-фенил-
2.486	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-Циклопропилфенил-
2.487	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-Циклопропил-фенил-
2.488	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-Диметиламинофенил-
2.489	-CH ₂ -	-Cl	3-F	4-Фтор-фенил-

№ соединения	R ¹	R ²	Y	D
	C≡CH			
2.490	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-Гидроксифенил-
2.491	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-Гидрокси-фенил-
2.492	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-Метоксикарбонилфенил-
2.493	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-Метил-2-пиридил-
2.494	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-Метиламинофенил-
2.495	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-Метилсульфонилфенил-
2.496	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-Оксазол-5-илфенил-
2.497	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-Пиридил-
2.498	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-трет-Бутоксифенил-
2.499	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-трет-Бутилфенил-
2.500	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-Толил-
2.501	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-Трифторметил-3-пиридил-
2.502	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-Трифторметил-фенил-
2.503	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	5-Метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил-
2.504	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	5-Метил-2-пиридил-
2.505	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	5-Метил-3-пиридил-
2.506	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	6-Хлор-3-пиридил-
2.507	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	6-Метил-2-пиридил-
2.508	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	Пиримидин-5-ил-
2.509	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	Тиазол-2-ил-
2.510	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	Тиазол-5-ил-
2.511	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	Тиофен-3-ил-
2.512	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	-Ph

№ соединения	R ¹	R ²	Y	D
2.513	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	1-Метил-3-(трифторметил)пиразол-4-ил-
2.514	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	1-Метил-пиразол-4-ил-
2.515	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	2-(Метилсульфанил)-4-пиридил-
2.516	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	2-Ацетамидо-4-пиридил-
2.517	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	2-Ацетамидотиазол-5-ил-
2.518	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	2-Амино-4-пиридил-
2.519	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	2-Хлор-3-пиридил-
2.520	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	2-Хлор-4-пиридил-
2.521	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	2-Хлортиазол-5-ил-
2.522	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	2-Цианофенил-
2.523	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	2-Циано-фенил-
2.524	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	2-Фтор-4-пиридил-
2.525	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	2-Метил-4-пиридил-
2.526	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	2-Метил-триазол-4-ил-
2.527	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	2-Толил-
2.528	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	2-Трифторметил-4-пиридил-
2.529	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	2-Трифторметил-фенил-
2.530	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	3,4-Дифтор-фенил-
2.531	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	3,5-Дифтор-фенил-
2.532	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	3-Хлор-4-фтор-фенил-
2.533	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	3-Хлор-4-пиридил-
2.534	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	3-Цианофенил-
2.535	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	3-Циано-фенил-
2.536	-CH ₂ -	-Cl	3-Cl	3-Метил-2-пиридил-

№ соединения	R ¹	R ²	Y	D
	C≡CH			
2.537	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	3-Метил-4-амино-фенил-
2.538	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	3-Пиридил-
2.539	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	3-Толил-
2.540	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	3-Трифторметил-3-пиридил-
2.541	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	3-Трифторметил-фенил-
2.542	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(Диметиламино)-фенил-
2.543	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(Диметилсульфамоил)фенил-
2.544	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(Метиламино)-фенил-
2.545	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(Метилсульфанил)фенил-
2.546	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(трет-Бутокси)-фенил-
2.547	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(трет-Бутоксикарбониламино)-3-фтор-фенил-
2.548	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(Трифторметокси)-фенил-
2.549	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-[Этил(метил)карбамоил]-3-фтор-фенил-
2.550	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Ацетамидофенил-
2.551	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Амино-3-метилфенил-
2.552	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Амино-фенил-
2.553	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Бифенил-
2.554	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Карбоксифенил-
2.555	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Хлор-3-пиридил-
2.556	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Хлор-фенил-
2.557	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Цианофенил-
2.558	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Циано-фенил-
2.559	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Циклопропилфенил-

№ соединения	R ¹	R ²	Y	D
2.560	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Циклопропил-фенил-
2.561	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Диметиламинофенил-
2.562	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Фтор-фенил-
2.563	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Гидроксифенил-
2.564	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Гидрокси-фенил-
2.565	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Метоксикарбонилфенил-
2.566	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Метил-2-пиридил-
2.567	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Метиламинофенил-
2.568	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Метилсульфонилфенил-
2.569	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Оксазол-5-илфенил-
2.570	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Пиридил-
2.571	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-трет-Бутоксифенил-
2.572	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-трет-Бутилфенил-
2.573	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Толил-
2.574	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Трифторметил-3-пиридил-
2.575	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Трифторметил-фенил-
2.576	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	5-Метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил-
2.577	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	5-Метил-2-пиридил-
2.578	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	5-Метил-3-пиридил-
2.579	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	6-Хлор-3-пиридил-
2.580	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	6-Метил-2-пиридил-
2.581	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	Пиримидин-5-ил-
2.582	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	Тиазол-2-ил-
2.583	-CH ₂ -	-Cl	3-Cl	Тиазол-5-ил-

№ соединения	R ¹	R ²	Y	D
	C≡CH			
2.584	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	Тиофен-3-ил-
2.585	-Me	-Me	3-F	4-(1-Метилпиразол-3-ил)фенил-
2.586	-Me	-Me	3-F	4-(5-Метилтетразол-1-ил)фенил-
2.587	-Me	-Me	3-F	4-Морфолинофенил-
2.588	-Me	-Me	3-F	4-(3-Метилпиразол-1-ил)фенил-
2.589	-Me	-Me	3-F	4-(3,5-Диметилпиразол-1-ил)фенил-
2.590	-Me	-Me	3-F	4-Пиразол-1-илфенил-
2.591	-Me	-Me	3-F	4-Пиррол-1-илфенил-
2.592	-Me	-Me	3-F	4-(5-Метилтетрагидрофуран-2-ил)фенил-
2.593	-Me	-Me	3-F	4-(5-Метил-2-фурил)фенил-
2.594	-Me	-Me	3-F	4-Оксазол-2-илфенил-
2.595	-Me	-Me	3-F	4-(2-Метилтиазол-4-ил)фенил-
2.596	-Me	-Me	3-F	4-(2-Тиенил)фенил-
2.597	-Me	-Me	3-F	4-(1,2,4-Триазол-1-ил)фенил-
2.598	-Me	-Me	3-F	1-Фенил-4-пиразолил-
2.599	-Me	-Me	3-F	1-Циклопропил-4-пиразолил-
2.600	-Me	-Me	3-F	4-(Метилсульфанилметил)фенил-
2.601	-Me	-Me	3-F	4- (Изопропилсульфанилметил)фенил-
2.602	-Me	-Me	3-F	4-(Метилсульфамоил)фенил-
2.603	-Me	-Me	3-F	4-Сульфамоилфенил-
2.604	-Me	-Me	3-F	4-Карбамоилфенил-
2.605	-Me	-Me	3-Cl	4-(1-Метилпиразол-3-ил)фенил-
2.606	-Me	-Me	3-Cl	4-(5-Метилтетразол-1-ил)фенил-
2.607	-Me	-Me	3-Cl	4-Морфолинофенил-
2.608	-Me	-Me	3-Cl	4-(3-Метилпиразол-1-ил)фенил-
2.609	-Me	-Me	3-Cl	4-(3,5-Диметилпиразол-1-ил)фенил-
2.610	-Me	-Me	3-Cl	4-Пиразол-1-илфенил-
2.611	-Me	-Me	3-Cl	4-Пиррол-1-илфенил-
2.612	-Me	-Me	3-Cl	4-(5-Метилтетрагидрофуран-2-ил)фенил-
2.613	-Me	-Me	3-Cl	4-(5-Метил-2-фурил)фенил-
2.614	-Me	-Me	3-Cl	4-Оксазол-2-илфенил-
2.615	-Me	-Me	3-Cl	4-(2-Метилтиазол-4-ил)фенил-
2.616	-Me	-Me	3-Cl	4-(2-Тиенил)фенил-
2.617	-Me	-Me	3-Cl	4-(1,2,4-Триазол-1-ил)фенил-
2.618	-Me	-Me	3-Cl	1-Фенил-4-пиразолил-
2.619	-Me	-Me	3-Cl	1-Циклопропил-4-пиразолил-
2.620	-Me	-Me	3-Cl	4-(Метилсульфанилметил)фенил-
2.621	-Me	-Me	3-Cl	4- (Изопропилсульфанилметил)фенил-
2.622	-Me	-Me	3-Cl	4-(Метилсульфамоил)фенил-
2.623	-Me	-Me	3-Cl	4-Сульфамоилфенил-
2.624	-Me	-Me	3-Cl	4-Карбамоилфенил-

№ соединения	R ¹	R ²	Y	D
2.625	-Me	-Cl	3-F	4-(1-Метилпиразол-3-ил)фенил-
2.626	-Me	-Cl	3-F	4-(5-Метилтетразол-1-ил)фенил-
2.627	-Me	-Cl	3-F	4-Морфолинофенил-
2.628	-Me	-Cl	3-F	4-(3-Метилпиразол-1-ил)фенил-
2.629	-Me	-Cl	3-F	4-(3,5-Диметилпиразол-1-ил)фенил-
2.630	-Me	-Cl	3-F	4-Пиразол-1-илфенил-
2.631	-Me	-Cl	3-F	4-Пиррол-1-илфенил-
2.632	-Me	-Cl	3-F	4-(5-Метилтетрагидрофуран-2-ил)фенил-
2.633	-Me	-Cl	3-F	4-(5-Метил-2-фурил)фенил-
2.634	-Me	-Cl	3-F	4-Оксазол-2-илфенил-
2.635	-Me	-Cl	3-F	4-(2-Метилтиазол-4-ил)фенил-
2.636	-Me	-Cl	3-F	4-(2-Тиенил)фенил-
2.637	-Me	-Cl	3-F	4-(1,2,4-Триазол-1-ил)фенил-
2.638	-Me	-Cl	3-F	1-Фенил-4-пиразолил-
2.639	-Me	-Cl	3-F	1-Циклопропил-4-пиразолил-
2.640	-Me	-Cl	3-F	4-(Метилсульфанилметил)фенил-
2.641	-Me	-Cl	3-F	4-(Изопропилсульфанилметил)фенил-
2.642	-Me	-Cl	3-F	4-(Метилсульфамоил)фенил-
2.643	-Me	-Cl	3-F	4-Сульфамоилфенил-
2.644	-Me	-Cl	3-F	4-Карбамоилфенил-
2.645	-Me	-Cl	3-Cl	4-(1-Метилпиразол-3-ил)фенил-
2.646	-Me	-Cl	3-Cl	4-(5-Метилтетразол-1-ил)фенил-
2.647	-Me	-Cl	3-Cl	4-Морфолинофенил-
2.648	-Me	-Cl	3-Cl	4-(3-Метилпиразол-1-ил)фенил-
2.649	-Me	-Cl	3-Cl	4-(3,5-Диметилпиразол-1-ил)фенил-
2.650	-Me	-Cl	3-Cl	4-Пиразол-1-илфенил-
2.651	-Me	-Cl	3-Cl	4-Пиррол-1-илфенил-
2.652	-Me	-Cl	3-Cl	4-(5-Метилтетрагидрофуран-2-ил)фенил-
2.653	-Me	-Cl	3-Cl	4-(5-Метил-2-фурил)фенил-
2.654	-Me	-Cl	3-Cl	4-Оксазол-2-илфенил-
2.655	-Me	-Cl	3-Cl	4-(2-Метилтиазол-4-ил)фенил-
2.656	-Me	-Cl	3-Cl	4-(2-Тиенил)фенил-
2.657	-Me	-Cl	3-Cl	4-(1,2,4-Триазол-1-ил)фенил-
2.658	-Me	-Cl	3-Cl	1-Фенил-4-пиразолил-
2.659	-Me	-Cl	3-Cl	1-Циклопропил-4-пиразолил-
2.660	-Me	-Cl	3-Cl	4-(Метилсульфанилметил)фенил-
2.661	-Me	-Cl	3-Cl	4-(Изопропилсульфанилметил)фенил-
2.662	-Me	-Cl	3-Cl	4-(Метилсульфамоил)фенил-
2.663	-Me	-Cl	3-Cl	4-Сульфамоилфенил-
2.664	-Me	-Cl	3-Cl	4-Карбамоилфенил-
2.665	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-(1-Метилпиразол-3-ил)фенил-
2.666	-CH ₂ -	-Me	3-F	4-(5-Метилтетразол-1-ил)фенил-

№ соединения	R ¹	R ²	Y	D
	C≡CH			
2.667	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-Морфолинофенил-
2.668	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-(3-Метилпиразол-1-ил)фенил-
2.669	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-(3,5-Диметилпиразол-1-ил)фенил-
2.670	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-Пиразол-1-илфенил-
2.671	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-Пиррол-1-илфенил-
2.672	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-(5-Метилтетрагидрофуран-2-ил)фенил-
2.673	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-(5-Метил-2-фурил)фенил-
2.674	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-Оксазол-2-илфенил-
2.675	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-(2-Метилтиазол-4-ил)фенил-
2.676	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-(2-Тиенил)фенил-
2.677	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-(1,2,4-Триазол-1-ил)фенил-
2.678	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	1-Фенил-4-пиразолил-
2.679	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	1-Циклопропил-4-пиразолил-
2.680	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-(Метилсульфанилметил)фенил-
2.681	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-(Изопропилсульфанилметил)фенил-
2.682	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-(Метилсульфамоил)фенил-
2.683	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-Сульфамоилфенил-
2.684	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-F	4-Карбамоилфенил-
2.685	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-(1-Метилпиразол-3-ил)фенил-
2.686	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-(5-Метилтетразол-1-ил)фенил-
2.687	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-Морфолинофенил-
2.688	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-(3-Метилпиразол-1-ил)фенил-
2.689	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-(3,5-Диметилпиразол-1-ил)фенил-

№ соединения	R ¹	R ²	Y	D
2.690	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-Пиразол-1-илфенил-
2.691	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-Пиррол-1-илфенил-
2.692	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-(5-Метилтетрагидрофуран-2-ил)фенил-
2.693	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-(5-Метил-2-фурил)фенил-
2.694	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-Оксазол-2-илфенил-
2.695	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-(2-Метилтиазол-4-ил)фенил-
2.696	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-(2-Тиенил)фенил-
2.697	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-(1,2,4-Триазол-1-ил)фенил-
2.698	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	1-Фенил-4-пиразолил-
2.699	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	1-Циклопропил-4-пиразолил-
2.700	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-(Метилсульфанилметил)фенил-
2.701	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-(Изопропилсульфанилметил)фенил-
2.702	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-(Метилсульфамоил)фенил-
2.703	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-Сульфамоилфенил-
2.704	-CH ₂ - C≡CH	-Me	3-Cl	4-Карбамоилфенил-
2.705	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-(1-Метилпиразол-3-ил)фенил-
2.706	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-(5-Метилтетразол-1-ил)фенил-
2.707	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-Морфолинофенил-
2.708	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-(3-Метилпиразол-1-ил)фенил-
2.709	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-(3,5-Диметилпиразол-1-ил)фенил-
2.710	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-Пиразол-1-илфенил-
2.711	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-Пиррол-1-илфенил-
2.712	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-(5-Метилтетрагидрофуран-2-ил)фенил-
2.713	-CH ₂ -	-Cl	3-F	4-(5-Метил-2-фурил)фенил-

№ соединения	R ¹	R ²	Y	D
	C≡CH			
2.714	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-Оксазол-2-илфенил-
2.715	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-(2-Метилтиазол-4-ил)фенил-
2.716	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-(2-Тиенил)фенил-
2.717	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-(1,2,4-Триазол-1-ил)фенил-
2.718	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	1-Фенил-4-пиразолил-
2.719	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	1-Циклопропил-4-пиразолил-
2.720	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-(Метилсульфанилметил)фенил-
2.721	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4- (Изопропилсульфанилметил)фенил-
2.722	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-(Метилсульфамоил)фенил-
2.723	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-Сульфоамилфенил-
2.724	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-F	4-Карбамоилфенил-
2.725	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(1-Метилпиразол-3-ил)фенил-
2.726	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(5-Метилтетразол-1-ил)фенил-
2.727	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Морфолинофенил-
2.728	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(3-Метилпиразол-1-ил)фенил-
2.729	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(3,5-Диметилпиразол-1-ил)фенил-
2.730	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Пиразол-1-илфенил-
2.731	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Пиррол-1-илфенил-
2.732	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(5-Метилтетрагидрофуран-2-ил)фенил-
2.733	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(5-Метил-2-фурил)фенил-
2.734	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Оксазол-2-илфенил-
2.735	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(2-Метилтиазол-4-ил)фенил-
2.736	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(2-Тиенил)фенил-

№ соединения	R ¹	R ²	Y	D
2.737	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(1,2,4-Триазол-1-ил)фенил-
2.738	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	1-Фенил-4-пиразолил-
2.739	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	1-Циклопропил-4-пиразолил-
2.740	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(Метилсульфанилметил)фенил-
2.741	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4- (Изопропилсульфанилметил)фенил-
2.742	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(Метилсульфамоил)фенил-
2.743	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Сульфоамилфенил-
2.744	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Карбамоилфенил-

В таблице В-2 приведено 744 соединения от В-2.001 до В-2.744 формулы (I), где G представляет собой -H, W представляет собой (E)-CH=CH-, X представляет собой 6-циклопропил, и R¹, R², Y, D являются такими, как определено для соединений №№ 2.001 – 2.744 соответственно в таблице 2 выше.

В таблице В-3 приведено 744 соединения от В-3.001 до В-3.744 формулы (I), где G представляет собой -(C=O)_iPr, W представляет собой -CH₂-CH₂-, X представляет собой 6-циклопропил, и R¹, R², Y, D являются такими, как определено для соединений №№ 2.001 – 2.744 соответственно в таблице 2 выше.

10 В таблице В-4 приведено 744 соединения от В-4.001 до В-4.744 формулы (I), где G представляет собой -(C=O)_iPr, W представляет собой (E)-CH=CH-, X представляет собой 6-циклопропил, и R¹, R², Y, D являются такими, как определено для соединений №№ 2.001 – 2.744 соответственно в таблице 2 выше.

15 В таблице С-1 приведено 744 соединения от С-1.001 до С-1.744 формулы (I), где G представляет собой -H, W представляет собой -CH₂-CH₂-, Y представляет собой 3-циклопропил, и R¹, R², X и D являются такими, как определено для соединений №№ 3.001 – 3.744 соответственно в таблице 3 ниже.

Таблица 3. Определения заместителей R¹, R², X и D

№ соединения	R ¹	R ²	X	D
3.001	-Me	-Me	6-F	-Ph
3.002	-Me	-Me	6-F	1-Метил-3-(трифторметил)пиразол-4-ил-
3.003	-Me	-Me	6-F	1-Метил-пиразол-4-ил-
3.004	-Me	-Me	6-F	2-(Метилсульфанил)-4-пиридил-
3.005	-Me	-Me	6-F	2-Ацетамидо-4-пиридил-
3.006	-Me	-Me	6-F	2-Ацетамидотиазол-5-ил-
3.007	-Me	-Me	6-F	2-Амино-4-пиридил-
3.008	-Me	-Me	6-F	2-Хлор-3-пиридил-
3.009	-Me	-Me	6-F	2-Хлор-4-пиридил-
3.010	-Me	-Me	6-F	2-Хлортиазол-5-ил-
3.011	-Me	-Me	6-F	2-Цианофенил-
3.012	-Me	-Me	6-F	2-Циано-фенил-
3.013	-Me	-Me	6-F	2-Фтор-4-пиридил-
3.014	-Me	-Me	6-F	2-Метил-4-пиридил-
3.015	-Me	-Me	6-F	2-Метил-триазол-4-ил-
3.016	-Me	-Me	6-F	2-Толил-
3.017	-Me	-Me	6-F	2-Трифторметил-4-пиридил-
3.018	-Me	-Me	6-F	2-Трифторметил-фенил-
3.019	-Me	-Me	6-F	3,4-Дифтор-фенил-
3.020	-Me	-Me	6-F	3,5-Дифтор-фенил-
3.021	-Me	-Me	6-F	3-Хлор-4-фтор-фенил-
3.022	-Me	-Me	6-F	3-Хлор-4-пиридил-
3.023	-Me	-Me	6-F	3-Цианофенил-
3.024	-Me	-Me	6-F	3-Циано-фенил-
3.025	-Me	-Me	6-F	3-Метил-2-пиридил-
3.026	-Me	-Me	6-F	3-Метил-4-амино-фенил-
3.027	-Me	-Me	6-F	3-Пиридил-
3.028	-Me	-Me	6-F	3-Толил-
3.029	-Me	-Me	6-F	3-Трифторметил-3-пиридил-
3.030	-Me	-Me	6-F	3-Трифторметил-фенил-
3.031	-Me	-Me	6-F	4-(Диметиламино)-фенил-
3.032	-Me	-Me	6-F	4-(Диметилсульфамоил)фенил-
3.033	-Me	-Me	6-F	4-(Метиламино)-фенил-
3.034	-Me	-Me	6-F	4-(Метилсульфанил)фенил-
3.035	-Me	-Me	6-F	4-(трет-Бутокси)-фенил-
3.036	-Me	-Me	6-F	4-(трет-Бутоксикарбониламино)-3-фтор-фенил-
3.037	-Me	-Me	6-F	4-(Трифторметокси)-фенил-
3.038	-Me	-Me	6-F	4-[Этил(метил)карбамоил]-3-фтор-фенил-
3.039	-Me	-Me	6-F	4-Ацетамидофенил-
3.040	-Me	-Me	6-F	4-Амино-3-метилфенил-
3.041	-Me	-Me	6-F	4-Амино-фенил-
3.042	-Me	-Me	6-F	4-Бифенил-

№ соединения	R ¹	R ²	X	D
3.043	-Me	-Me	6-F	4-Карбоксифенил-
3.044	-Me	-Me	6-F	4-Хлор-3-пиридил-
3.045	-Me	-Me	6-F	4-Хлор-фенил-
3.046	-Me	-Me	6-F	4-Цианофенил-
3.047	-Me	-Me	6-F	4-Циано-фенил-
3.048	-Me	-Me	6-F	4-Циклопропилфенил-
3.049	-Me	-Me	6-F	4-Циклопропил-фенил-
3.050	-Me	-Me	6-F	4-Диметиламинофенил-
3.051	-Me	-Me	6-F	4-Фтор-фенил-
3.052	-Me	-Me	6-F	4-Гидроксифенил-
3.053	-Me	-Me	6-F	4-Гидрокси-фенил-
3.054	-Me	-Me	6-F	4-Метоксикарбонилфенил-
3.055	-Me	-Me	6-F	4-Метил-2-пиридил-
3.056	-Me	-Me	6-F	4-Метиламинофенил-
3.057	-Me	-Me	6-F	4-Метилсульфонилфенил-
3.058	-Me	-Me	6-F	4-Оксазол-5-илфенил-
3.059	-Me	-Me	6-F	4-Пиридил-
3.060	-Me	-Me	6-F	4-трет-Бутоксифенил-
3.061	-Me	-Me	6-F	4-трет-Бутилфенил-
3.062	-Me	-Me	6-F	4-Толил-
3.063	-Me	-Me	6-F	4-Трифторметил-3-пиридил-
3.064	-Me	-Me	6-F	4-Трифторметил-фенил-
3.065	-Me	-Me	6-F	5-Метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил-
3.066	-Me	-Me	6-F	5-Метил-2-пиридил-
3.067	-Me	-Me	6-F	5-Метил-3-пиридил-
3.068	-Me	-Me	6-F	6-Хлор-3-пиридил-
3.069	-Me	-Me	6-F	6-Метил-2-пиридил-
3.070	-Me	-Me	6-F	Пиримидин-5-ил-
3.071	-Me	-Me	6-F	Тиазол-2-ил-
3.072	-Me	-Me	6-F	Тиазол-5-ил-
3.073	-Me	-Me	6-F	Тиофен-3-ил-
3.074	-Me	-Me	6-Cl	-Ph
3.075	-Me	-Me	6-Cl	1-Метил-3-(трифторметил)пиразол-4-ил-
3.076	-Me	-Me	6-Cl	1-Метил-пиразол-4-ил-
3.077	-Me	-Me	6-Cl	2-(Метилсульфанил)-4-пиридил-
3.078	-Me	-Me	6-Cl	2-Ацетамидо-4-пиридил-
3.079	-Me	-Me	6-Cl	2-Ацетамидотиазол-5-ил-
3.080	-Me	-Me	6-Cl	2-Амино-4-пиридил-
3.081	-Me	-Me	6-Cl	2-Хлор-3-пиридил-
3.082	-Me	-Me	6-Cl	2-Хлор-4-пиридил-
3.083	-Me	-Me	6-Cl	2-Хлортиазол-5-ил-
3.084	-Me	-Me	6-Cl	2-Цианофенил-
3.085	-Me	-Me	6-Cl	2-Циано-фенил-
3.086	-Me	-Me	6-Cl	2-Фтор-4-пиридил-
3.087	-Me	-Me	6-Cl	2-Метил-4-пиридил-

№ соединения	R ¹	R ²	X	D
3.088	-Me	-Me	6-Cl	2-Метил-триазол-4-ил-
3.089	-Me	-Me	6-Cl	2-Толил-
3.090	-Me	-Me	6-Cl	2-Трифторметил-4-пиридил-
3.091	-Me	-Me	6-Cl	2-Трифторметил-фенил-
3.092	-Me	-Me	6-Cl	3,4-Дифтор-фенил-
3.093	-Me	-Me	6-Cl	3,5-Дифтор-фенил-
3.094	-Me	-Me	6-Cl	3-Хлор-4-фтор-фенил-
3.095	-Me	-Me	6-Cl	3-Хлор-4-пиридил-
3.096	-Me	-Me	6-Cl	3-Цианофенил-
3.097	-Me	-Me	6-Cl	3-Циано-фенил-
3.098	-Me	-Me	6-Cl	3-Метил-2-пиридил-
3.099	-Me	-Me	6-Cl	3-Метил-4-амино-фенил-
3.100	-Me	-Me	6-Cl	3-Пиридил-
3.101	-Me	-Me	6-Cl	3-Толил-
3.102	-Me	-Me	6-Cl	3-Трифторметил-3-пиридил-
3.103	-Me	-Me	6-Cl	3-Трифторметил-фенил-
3.104	-Me	-Me	6-Cl	4-(Диметиламино)-фенил-
3.105	-Me	-Me	6-Cl	4-(Диметилсульфамоил)фенил-
3.106	-Me	-Me	6-Cl	4-(Метиламино)-фенил-
3.107	-Me	-Me	6-Cl	4-(Метилсульфанил)фенил-
3.108	-Me	-Me	6-Cl	4-(трет-Бутокси)-фенил-
3.109	-Me	-Me	6-Cl	4-(трет-Бутоксикарбониламино)-3-фтор-фенил-
3.110	-Me	-Me	6-Cl	4-(Трифторметокси)-фенил-
3.111	-Me	-Me	6-Cl	4-[Этил(метил)карбамоил]-3-фтор-фенил-
3.112	-Me	-Me	6-Cl	4-Ацетамидофенил-
3.113	-Me	-Me	6-Cl	4-Амино-3-метилфенил-
3.114	-Me	-Me	6-Cl	4-Амино-фенил-
3.115	-Me	-Me	6-Cl	4-Бифенил-
3.116	-Me	-Me	6-Cl	4-Карбоксифенил-
3.117	-Me	-Me	6-Cl	4-Хлор-3-пиридил-
3.118	-Me	-Me	6-Cl	4-Хлор-фенил-
3.119	-Me	-Me	6-Cl	4-Цианофенил-
3.120	-Me	-Me	6-Cl	4-Циано-фенил-
3.121	-Me	-Me	6-Cl	4-Циклопропилфенил-
3.122	-Me	-Me	6-Cl	4-Циклопропил-фенил-
3.123	-Me	-Me	6-Cl	4-Диметиламинофенил-
3.124	-Me	-Me	6-Cl	4-Фтор-фенил-
3.125	-Me	-Me	6-Cl	4-Гидроксифенил-
3.126	-Me	-Me	6-Cl	4-Гидрокси-фенил-
3.127	-Me	-Me	6-Cl	4-Метоксикарбонилфенил-
3.128	-Me	-Me	6-Cl	4-Метил-2-пиридил-
3.129	-Me	-Me	6-Cl	4-Метиламинофенил-
3.130	-Me	-Me	6-Cl	4-Метилсульфонилфенил-
3.131	-Me	-Me	6-Cl	4-Оксазол-5-илфенил-
3.132	-Me	-Me	6-Cl	4-Пиридил-

№ соединения	R ¹	R ²	X	D
3.133	-Me	-Me	6-Cl	4-трет-Бутоксифенил-
3.134	-Me	-Me	6-Cl	4-трет-Бутилфенил-
3.135	-Me	-Me	6-Cl	4-Толил-
3.136	-Me	-Me	6-Cl	4-Трифторметил-3-пиридил-
3.137	-Me	-Me	6-Cl	4-Трифторметил-фенил-
3.138	-Me	-Me	6-Cl	5-Метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил-
3.139	-Me	-Me	6-Cl	5-Метил-2-пиридил-
3.140	-Me	-Me	6-Cl	5-Метил-3-пиридил-
3.141	-Me	-Me	6-Cl	6-Хлор-3-пиридил-
3.142	-Me	-Me	6-Cl	6-Метил-2-пиридил-
3.143	-Me	-Me	6-Cl	Пиримидин-5-ил-
3.144	-Me	-Me	6-Cl	Тиазол-2-ил-
3.145	-Me	-Me	6-Cl	Тиазол-5-ил-
3.146	-Me	-Me	6-Cl	Тиофен-3-ил-
3.147	-Me	-Cl	6-F	-Ph
3.148	-Me	-Cl	6-F	1-Метил-3-(трифторметил)пиразол-4-ил-
3.149	-Me	-Cl	6-F	1-Метил-пиразол-4-ил-
3.150	-Me	-Cl	6-F	2-(Метилсульфанил)-4-пиридил-
3.151	-Me	-Cl	6-F	2-Ацетамидо-4-пиридил-
3.152	-Me	-Cl	6-F	2-Ацетамидотиазол-5-ил-
3.153	-Me	-Cl	6-F	2-Амино-4-пиридил-
3.154	-Me	-Cl	6-F	2-Хлор-3-пиридил-
3.155	-Me	-Cl	6-F	2-Хлор-4-пиридил-
3.156	-Me	-Cl	6-F	2-Хлортиазол-5-ил-
3.157	-Me	-Cl	6-F	2-Цианофенил-
3.158	-Me	-Cl	6-F	2-Циано-фенил-
3.159	-Me	-Cl	6-F	2-Фтор-4-пиридил-
3.160	-Me	-Cl	6-F	2-Метил-4-пиридил-
3.161	-Me	-Cl	6-F	2-Метил-триазол-4-ил-
3.162	-Me	-Cl	6-F	2-Толил-
3.163	-Me	-Cl	6-F	2-Трифторметил-4-пиридил-
3.164	-Me	-Cl	6-F	2-Трифторметил-фенил-
3.165	-Me	-Cl	6-F	3,4-Дифтор-фенил-
3.166	-Me	-Cl	6-F	3,5-Дифтор-фенил-
3.167	-Me	-Cl	6-F	3-Хлор-4-фтор-фенил-
3.168	-Me	-Cl	6-F	3-Хлор-4-пиридил-
3.169	-Me	-Cl	6-F	3-Цианофенил-
3.170	-Me	-Cl	6-F	3-Циано-фенил-
3.171	-Me	-Cl	6-F	3-Метил-2-пиридил-
3.172	-Me	-Cl	6-F	3-Метил-4-амино-фенил-
3.173	-Me	-Cl	6-F	3-Пиридил-
3.174	-Me	-Cl	6-F	3-Толил-
3.175	-Me	-Cl	6-F	3-Трифторметил-3-пиридил-
3.176	-Me	-Cl	6-F	3-Трифторметил-фенил-
3.177	-Me	-Cl	6-F	4-(Диметиламино)-фенил-

№ соединения	R ¹	R ²	X	D
3.178	-Me	-Cl	6-F	4-(Диметилсульфамоил)фенил-
3.179	-Me	-Cl	6-F	4-(Метиламино)-фенил-
3.180	-Me	-Cl	6-F	4-(Метилсульфанил)фенил-
3.181	-Me	-Cl	6-F	4-(трет-Бутокси)-фенил-
3.182	-Me	-Cl	6-F	4-(трет-Бутоксикарбониламино)-3-фтор-фенил-
3.183	-Me	-Cl	6-F	4-(Трифторметокси)-фенил-
3.184	-Me	-Cl	6-F	4-[Этил(метил)карбамоил]-3-фтор-фенил-
3.185	-Me	-Cl	6-F	4-Ацетамидофенил-
3.186	-Me	-Cl	6-F	4-Амино-3-метилфенил-
3.187	-Me	-Cl	6-F	4-Амино-фенил-
3.188	-Me	-Cl	6-F	4-Бифенил-
3.189	-Me	-Cl	6-F	4-Карбоксифенил-
3.190	-Me	-Cl	6-F	4-Хлор-3-пиридил-
3.191	-Me	-Cl	6-F	4-Хлор-фенил-
3.192	-Me	-Cl	6-F	4-Цианофенил-
3.193	-Me	-Cl	6-F	4-Циано-фенил-
3.194	-Me	-Cl	6-F	4-Циклопропилфенил-
3.195	-Me	-Cl	6-F	4-Циклопропил-фенил-
3.196	-Me	-Cl	6-F	4-Диметиламинофенил-
3.197	-Me	-Cl	6-F	4-Фтор-фенил-
3.198	-Me	-Cl	6-F	4-Гидроксифенил-
3.199	-Me	-Cl	6-F	4-Гидрокси-фенил-
3.200	-Me	-Cl	6-F	4-Метоксикарбонилфенил-
3.201	-Me	-Cl	6-F	4-Метил-2-пиридил-
3.202	-Me	-Cl	6-F	4-Метиламинофенил-
3.203	-Me	-Cl	6-F	4-Метилсульфонилфенил-
3.204	-Me	-Cl	6-F	4-Оксазол-5-илфенил-
3.205	-Me	-Cl	6-F	4-Пиридил-
3.206	-Me	-Cl	6-F	4-трет-Бутоксифенил-
3.207	-Me	-Cl	6-F	4-трет-Бутилфенил-
3.208	-Me	-Cl	6-F	4-Толил-
3.209	-Me	-Cl	6-F	4-Трифторметил-3-пиридил-
3.210	-Me	-Cl	6-F	4-Трифторметил-фенил-
3.211	-Me	-Cl	6-F	5-Метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил-
3.212	-Me	-Cl	6-F	5-Метил-2-пиридил-
3.213	-Me	-Cl	6-F	5-Метил-3-пиридил-
3.214	-Me	-Cl	6-F	6-Хлор-3-пиридил-
3.215	-Me	-Cl	6-F	6-Метил-2-пиридил-
3.216	-Me	-Cl	6-F	Пиримидин-5-ил-
3.217	-Me	-Cl	6-F	Тиазол-2-ил-
3.218	-Me	-Cl	6-F	Тиазол-5-ил-
3.219	-Me	-Cl	6-F	Тиофен-3-ил-
3.220	-Me	-Cl	6-Cl	-Ph
3.221	-Me	-Cl	6-Cl	1-Метил-3-(трифторметил)пиразол-4-ил-

№ соединения	R ¹	R ²	X	D
3.222	-Me	-Cl	6-Cl	1-Метил-пиразол-4-ил-
3.223	-Me	-Cl	6-Cl	2-(Метилсульфанил)-4-пиридил-
3.224	-Me	-Cl	6-Cl	2-Ацетамидо-4-пиридил-
3.225	-Me	-Cl	6-Cl	2-Ацетамидотиазол-5-ил-
3.226	-Me	-Cl	6-Cl	2-Амино-4-пиридил-
3.227	-Me	-Cl	6-Cl	2-Хлор-3-пиридил-
3.228	-Me	-Cl	6-Cl	2-Хлор-4-пиридил-
3.229	-Me	-Cl	6-Cl	2-Хлортиазол-5-ил-
3.230	-Me	-Cl	6-Cl	2-Цианофенил-
3.231	-Me	-Cl	6-Cl	2-Циано-фенил-
3.232	-Me	-Cl	6-Cl	2-Фтор-4-пиридил-
3.233	-Me	-Cl	6-Cl	2-Метил-4-пиридил-
3.234	-Me	-Cl	6-Cl	2-Метил-триазол-4-ил-
3.235	-Me	-Cl	6-Cl	2-Толил-
3.236	-Me	-Cl	6-Cl	2-Трифторметил-4-пиридил-
3.237	-Me	-Cl	6-Cl	2-Трифторметил-фенил-
3.238	-Me	-Cl	6-Cl	3,4-Дифтор-фенил-
3.239	-Me	-Cl	6-Cl	3,5-Дифтор-фенил-
3.240	-Me	-Cl	6-Cl	3-Хлор-4-фтор-фенил-
3.241	-Me	-Cl	6-Cl	3-Хлор-4-пиридил-
3.242	-Me	-Cl	6-Cl	3-Цианофенил-
3.243	-Me	-Cl	6-Cl	3-Циано-фенил-
3.244	-Me	-Cl	6-Cl	3-Метил-2-пиридил-
3.245	-Me	-Cl	6-Cl	3-Метил-4-амино-фенил-
3.246	-Me	-Cl	6-Cl	3-Пиридил-
3.247	-Me	-Cl	6-Cl	3-Толил-
3.248	-Me	-Cl	6-Cl	3-Трифторметил-3-пиридил-
3.249	-Me	-Cl	6-Cl	3-Трифторметил-фенил-
3.250	-Me	-Cl	6-Cl	4-(Диметиламино)-фенил-
3.251	-Me	-Cl	6-Cl	4-(Диметилсульфамойл)фенил-
3.252	-Me	-Cl	6-Cl	4-(Метиламино)-фенил-
3.253	-Me	-Cl	6-Cl	4-(Метилсульфанил)фенил-
3.254	-Me	-Cl	6-Cl	4-(трет-Бутокси)-фенил-
3.255	-Me	-Cl	6-Cl	4-(трет-Бутоксикарбониламино)-3-фтор-фенил-
3.256	-Me	-Cl	6-Cl	4-(Трифторметокси)-фенил-
3.257	-Me	-Cl	6-Cl	4-[Этил(метил)карбамоил]-3-фтор-фенил-
3.258	-Me	-Cl	6-Cl	4-Ацетамидофенил-
3.259	-Me	-Cl	6-Cl	4-Амино-3-метилфенил-
3.260	-Me	-Cl	6-Cl	4-Амино-фенил-
3.261	-Me	-Cl	6-Cl	4-Бифенил-
3.262	-Me	-Cl	6-Cl	4-Карбоксифенил-
3.263	-Me	-Cl	6-Cl	4-Хлор-3-пиридил-
3.264	-Me	-Cl	6-Cl	4-Хлор-фенил-
3.265	-Me	-Cl	6-Cl	4-Цианофенил-
3.266	-Me	-Cl	6-Cl	4-Циано-фенил-

№ соединения	R ¹	R ²	X	D
3.267	-Me	-Cl	6-Cl	4-Циклопропилфенил-
3.268	-Me	-Cl	6-Cl	4-Циклопропил-фенил-
3.269	-Me	-Cl	6-Cl	4-Диметиламинофенил-
3.270	-Me	-Cl	6-Cl	4-Фтор-фенил-
3.271	-Me	-Cl	6-Cl	4-Гидроксифенил-
3.272	-Me	-Cl	6-Cl	4-Гидрокси-фенил-
3.273	-Me	-Cl	6-Cl	4-Метоксикарбонилфенил-
3.274	-Me	-Cl	6-Cl	4-Метил-2-пиридил-
3.275	-Me	-Cl	6-Cl	4-Метиламинофенил-
3.276	-Me	-Cl	6-Cl	4-Метилсульфонилфенил-
3.277	-Me	-Cl	6-Cl	4-Оксазол-5-илфенил-
3.278	-Me	-Cl	6-Cl	4-Пиридил-
3.279	-Me	-Cl	6-Cl	4-трет-Бутоксифенил-
3.280	-Me	-Cl	6-Cl	4-трет-Бутилфенил-
3.281	-Me	-Cl	6-Cl	4-Толил-
3.282	-Me	-Cl	6-Cl	4-Трифторметил-3-пиридил-
3.283	-Me	-Cl	6-Cl	4-Трифторметил-фенил-
3.284	-Me	-Cl	6-Cl	5-Метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил-
3.285	-Me	-Cl	6-Cl	5-Метил-2-пиридил-
3.286	-Me	-Cl	6-Cl	5-Метил-3-пиридил-
3.287	-Me	-Cl	6-Cl	6-Хлор-3-пиридил-
3.288	-Me	-Cl	6-Cl	6-Метил-2-пиридил-
3.289	-Me	-Cl	6-Cl	Пиримидин-5-ил-
3.290	-Me	-Cl	6-Cl	Тиазол-2-ил-
3.291	-Me	-Cl	6-Cl	Тиазол-5-ил-
3.292	-Me	-Cl	6-Cl	Тиофен-3-ил-
3.293	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	-Ph
3.294	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	1-Метил-3-(трифторметил)пиразол-4-ил-
3.295	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	1-Метил-пиразол-4-ил-
3.296	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	2-(Метилсульфанил)-4-пиридил-
3.297	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	2-Ацетамидо-4-пиридил-
3.298	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	2-Ацетамидотиазол-5-ил-
3.299	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	2-Амино-4-пиридил-
3.300	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	2-Хлор-3-пиридил-
3.301	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	2-Хлор-4-пиридил-
3.302	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	2-Хлортиазол-5-ил-
3.303	-CH ₂ -	-Me	6-F	2-Цианофенил-

№ соединения	R ¹	R ²	X	D
	C≡CH			
3.304	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	2-Циано-фенил-
3.305	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	2-Фтор-4-пиридил-
3.306	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	2-Метил-4-пиридил-
3.307	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	2-Метил-триазол-4-ил-
3.308	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	2-Толил-
3.309	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	2-Трифторметил-4-пиридил-
3.310	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	2-Трифторметил-фенил-
3.311	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3,4-Дифтор-фенил-
3.312	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3,5-Дифтор-фенил-
3.313	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Хлор-4-фтор-фенил-
3.314	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Хлор-4-пиридил-
3.315	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Цианофенил-
3.316	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Циано-фенил-
3.317	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Метил-2-пиридил-
3.318	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Метил-4-амино-фенил-
3.319	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Пиридил-
3.320	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Толил-
3.321	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Трифторметил-3-пиридил-
3.322	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	3-Трифторметил-фенил-
3.323	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-(Диметиламино)-фенил-
3.324	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-(Диметилсульфамоил)фенил-
3.325	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-(Метиламино)-фенил-
3.326	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-(Метилсульфанил)фенил-

№ соединения	R ¹	R ²	X	D
3.327	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-(трет-Бутокси)-фенил-
3.328	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-(трет-Бутоксикарбониламино)-3-фтор-фенил-
3.329	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-(Трифторметокси)-фенил-
3.330	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-[Этил(метил)карбамоил]-3-фтор-фенил-
3.331	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-Ацетидамофенил-
3.332	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-Амино-3-метилфенил-
3.333	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-Амино-фенил-
3.334	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-Бифенил-
3.335	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-Карбоксифенил-
3.336	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-Хлор-3-пиридил-
3.337	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-Хлор-фенил-
3.338	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-Цианофенил-
3.339	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-Циано-фенил-
3.340	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-Циклопропилфенил-
3.341	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-Циклопропил-фенил-
3.342	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-Диметиламинофенил-
3.343	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-Фтор-фенил-
3.344	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-Гидроксифенил-
3.345	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-Гидрокси-фенил-
3.346	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-Метоксикарбонилфенил-
3.347	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-Метил-2-пиридил-
3.348	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-Метиламинофенил-
3.349	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-Метилсульфонилфенил-
3.350	-CH ₂ -	-Me	6-F	4-Оксазол-5-илфенил-

№ соединения	R ¹	R ²	X	D
	C≡CH			
3.351	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-Пиридил-
3.352	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-трет-Бутоксифенил-
3.353	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-трет-Бутилфенил-
3.354	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-Толил-
3.355	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-Трифторметил-3-пиридил-
3.356	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-Трифторметил-фенил-
3.357	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	5-Метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил-
3.358	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	5-Метил-2-пиридил-
3.359	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	5-Метил-3-пиридил-
3.360	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	6-Хлор-3-пиридил-
3.361	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	6-Метил-2-пиридил-
3.362	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	Пиримидин-5-ил-
3.363	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	Тиазол-2-ил-
3.364	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	Тиазол-5-ил-
3.365	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	Тиофен-3-ил-
3.366	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	-Ph
3.367	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	1-Метил-3-(трифторметил)пиразол-4-ил-
3.368	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	1-Метил-пиразол-4-ил-
3.369	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	2-(Метилсульфанил)-4-пиридил-
3.370	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	2-Ацетамидо-4-пиридил-
3.371	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	2-Ацетамидотиазол-5-ил-
3.372	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	2-Амино-4-пиридил-
3.373	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	2-Хлор-3-пиридил-

№ соединения	R ¹	R ²	X	D
3.374	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	2-Хлор-4-пиридил-
3.375	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	2-Хлортиазол-5-ил-
3.376	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	2-Цианофенил-
3.377	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	2-Циано-фенил-
3.378	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	2-Фтор-4-пиридил-
3.379	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	2-Метил-4-пиридил-
3.380	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	2-Метил-триазол-4-ил-
3.381	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	2-Толил-
3.382	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	2-Трифторметил-4-пиридил-
3.383	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	2-Трифторметил-фенил-
3.384	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3,4-Дифтор-фенил-
3.385	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3,5-Дифтор-фенил-
3.386	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Хлор-4-фтор-фенил-
3.387	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Хлор-4-пиридил-
3.388	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Цианофенил-
3.389	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Циано-фенил-
3.390	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Метил-2-пиридил-
3.391	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Метил-4-амино-фенил-
3.392	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Пиридил-
3.393	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Толил-
3.394	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Трифторметил-3-пиридил-
3.395	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	3-Трифторметил-фенил-
3.396	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-(Диметиламино)-фенил-
3.397	-CH ₂ -	-Me	6-Cl	4-(Диметилсульфамоил)фенил-

№ соединения	R ¹	R ²	X	D
	C≡CH			
3.398	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-(Метиламино)-фенил-
3.399	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-(Метилсульфанил)фенил-
3.400	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-(трет-Бутокси)-фенил-
3.401	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-(трет-Бутоксикарбониламино)-3-фтор-фенил-
3.402	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-(Трифторметокси)-фенил-
3.403	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-[Этил(метил)карбамоил]-3-фтор-фенил-
3.404	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-Ацетиамидофенил-
3.405	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-Амино-3-метилфенил-
3.406	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-Амино-фенил-
3.407	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-Бифенил-
3.408	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-Карбоксифенил-
3.409	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-Хлор-3-пиридил-
3.410	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-Хлор-фенил-
3.411	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-Цианофенил-
3.412	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-Циано-фенил-
3.413	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-Циклопропилфенил-
3.414	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-Циклопропил-фенил-
3.415	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-Диметиламинофенил-
3.416	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-Фтор-фенил-
3.417	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-Гидроксифенил-
3.418	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-Гидрокси-фенил-
3.419	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-Метоксикарбонилфенил-
3.420	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-Метил-2-пиридил-

№ соединения	R ¹	R ²	X	D
3.421	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-Метиламинофенил-
3.422	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-Метилсульфонилфенил-
3.423	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-Оксазол-5-илфенил-
3.424	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-Пиридил-
3.425	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-трет-Бутоксифенил-
3.426	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-трет-Бутилфенил-
3.427	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-Толил-
3.428	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-Трифторметил-3-пиридил-
3.429	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-Трифторметил-фенил-
3.430	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	5-Метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил-
3.431	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	5-Метил-2-пиридил-
3.432	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	5-Метил-3-пиридил-
3.433	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	6-Хлор-3-пиридил-
3.434	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	6-Метил-2-пиридил-
3.435	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	Пиримидин-5-ил-
3.436	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	Тиазол-2-ил-
3.437	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	Тиазол-5-ил-
3.438	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	Тиофен-3-ил-
3.439	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	-Ph
3.440	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	1-Метил-3-(трифторметил)пиразол-4-ил-
3.441	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	1-Метил-пиразол-4-ил-
3.442	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	2-(Метилсульфанил)-4-пиридил-
3.443	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	2-Ацетамидо-4-пиридил-
3.444	-CH ₂ -	-Cl	6-F	2-Ацетамидотиазол-5-ил-

№ соединения	R ¹	R ²	X	D
	C≡CH			
3.445	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	2-Амино-4-пиридил-
3.446	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	2-Хлор-3-пиридил-
3.447	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	2-Хлор-4-пиридил-
3.448	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	2-Хлортиазол-5-ил-
3.449	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	2-Цианофенил-
3.450	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	2-Циано-фенил-
3.451	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	2-Фтор-4-пиридил-
3.452	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	2-Метил-4-пиридил-
3.453	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	2-Метил-триазол-4-ил-
3.454	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	2-Толил-
3.455	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	2-Трифторметил-4-пиридил-
3.456	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	2-Трифторметил-фенил-
3.457	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3,4-Дифтор-фенил-
3.458	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3,5-Дифтор-фенил-
3.459	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Хлор-4-фтор-фенил-
3.460	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Хлор-4-пиридил-
3.461	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Цианофенил-
3.462	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Циано-фенил-
3.463	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Метил-2-пиридил-
3.464	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Метил-4-амино-фенил-
3.465	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Пиридил-
3.466	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Толил-
3.467	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Трифторметил-3-пиридил-

№ соединения	R ¹	R ²	X	D
3.468	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	3-Трифторметил-фенил-
3.469	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-(Диметиламино)-фенил-
3.470	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-(Диметилсульфамоил)фенил-
3.471	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-(Метиламино)-фенил-
3.472	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-(Метилсульфанил)фенил-
3.473	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-(трет-Бутокси)-фенил-
3.474	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-(трет-Бутоксикарбониламино)-3-фтор-фенил-
3.475	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-(Трифторметокси)-фенил-
3.476	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-[Этил(метил)карбамоил]-3-фтор-фенил-
3.477	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-Ацетидамофенил-
3.478	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-Амино-3-метилфенил-
3.479	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-Амино-фенил-
3.480	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-Бифенил-
3.481	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-Карбоксифенил-
3.482	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-Хлор-3-пиридил-
3.483	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-Хлор-фенил-
3.484	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-Цианофенил-
3.485	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-Циано-фенил-
3.486	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-Циклопропилфенил-
3.487	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-Циклопропил-фенил-
3.488	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-Диметиламинофенил-
3.489	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-Фтор-фенил-
3.490	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-Гидроксифенил-
3.491	-CH ₂ -	-Cl	6-F	4-Гидрокси-фенил-

№ соединения	R ¹	R ²	X	D
	C≡CH			
3.492	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-Метоксикарбонилфенил-
3.493	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-Метил-2-пиридил-
3.494	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-Метиламинофенил-
3.495	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-Метилсульфонилфенил-
3.496	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-Оксазол-5-илфенил-
3.497	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-Пиридил-
3.498	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-трет-Бутоксифенил-
3.499	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-трет-Бутилфенил-
3.500	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-Толил-
3.501	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-Трифторметил-3-пиридил-
3.502	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-Трифторметил-фенил-
3.503	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	5-Метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил-
3.504	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	5-Метил-2-пиридил-
3.505	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	5-Метил-3-пиридил-
3.506	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	6-Хлор-3-пиридил-
3.507	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	6-Метил-2-пиридил-
3.508	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	Пиримидин-5-ил-
3.509	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	Тиазол-2-ил-
3.510	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	Тиазол-5-ил-
3.511	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	Тиофен-3-ил-
3.512	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	-Ph
3.513	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	1-Метил-3-(трифторметил)пиразол-4-ил-
3.514	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	1-Метил-пиразол-4-ил-

№ соединения	R ¹	R ²	X	D
3.515	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	2-(Метилсульфанил)-4-пиридил-
3.516	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	2-Ацетамидо-4-пиридил-
3.517	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	2-Ацетамидотиазол-5-ил-
3.518	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	2-Амино-4-пиридил-
3.519	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	2-Хлор-3-пиридил-
3.520	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	2-Хлор-4-пиридил-
3.521	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	2-Хлортиазол-5-ил-
3.522	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	2-Цианофенил-
3.523	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	2-Циано-фенил-
3.524	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	2-Фтор-4-пиридил-
3.525	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	2-Метил-4-пиридил-
3.526	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	2-Метил-триазол-4-ил-
3.527	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	2-Толил-
3.528	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	2-Трифторметил-4-пиридил-
3.529	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	2-Трифторметил-фенил-
3.530	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3,4-Дифтор-фенил-
3.531	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3,5-Дифтор-фенил-
3.532	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Хлор-4-фтор-фенил-
3.533	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Хлор-4-пиридил-
3.534	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Цианофенил-
3.535	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Циано-фенил-
3.536	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Метил-2-пиридил-
3.537	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Метил-4-амино-фенил-
3.538	-CH ₂ -	-Cl	6-Cl	3-Пиридил-

№ соединения	R ¹	R ²	X	D
	C≡CH			
3.539	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Толил-
3.540	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Трифторметил-3-пиридил-
3.541	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Трифторметил-фенил-
3.542	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(Диметиламино)-фенил-
3.543	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(Диметилсульфамоил)фенил-
3.544	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(Метиламино)-фенил-
3.545	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(Метилсульфанил)фенил-
3.546	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(трет-Бутокси)-фенил-
3.547	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(трет-Бутоксикарбониламино)-3-фтор-фенил-
3.548	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(Трифторметокси)-фенил-
3.549	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-[Этил(метил)карбамоил]-3-фтор-фенил-
3.550	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Ацетамидофенил-
3.551	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Амино-3-метилфенил-
3.552	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Амино-фенил-
3.553	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Бифенил-
3.554	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Карбоксифенил-
3.555	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Хлор-3-пиридил-
3.556	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Хлор-фенил-
3.557	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Цианофенил-
3.558	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Циано-фенил-
3.559	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Циклопропилфенил-
3.560	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Циклопропил-фенил-
3.561	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Диметиламинофенил-

№ соединения	R ¹	R ²	X	D
3.562	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Фтор-фенил-
3.563	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Гидроксифенил-
3.564	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Гидрокси-фенил-
3.565	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Метоксикарбонилфенил-
3.566	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Метил-2-пиридил-
3.567	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Метиламинофенил-
3.568	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Метилсульфонилфенил-
3.569	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Оксазол-5-илфенил-
3.570	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Пиридил-
3.571	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-трет-Бутоксифенил-
3.572	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-трет-Бутилфенил-
3.573	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Толил-
3.574	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Трифторметил-3-пиридил-
3.575	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Трифторметил-фенил-
3.576	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	5-Метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил-
3.577	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	5-Метил-2-пиридил-
3.578	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	5-Метил-3-пиридил-
3.579	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	6-Хлор-3-пиридил-
3.580	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	6-Метил-2-пиридил-
3.581	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	Пиримидин-5-ил-
3.582	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	Тиазол-2-ил-
3.583	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	Тиазол-5-ил-
3.584	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	Тиофен-3-ил-
3.585	-Me	-Me	6-F	4-(1-Метилпиразол-3-ил)фенил-

№ соединения	R ¹	R ²	X	D
3.586	-Me	-Me	6-F	4-(5-Метилтетразол-1-ил)фенил-
3.587	-Me	-Me	6-F	4-Морфолинофенил-
3.588	-Me	-Me	6-F	4-(3-Метилпиразол-1-ил)фенил-
3.589	-Me	-Me	6-F	4-(3,5-Диметилпиразол-1-ил)фенил-
3.590	-Me	-Me	6-F	4-Пиразол-1-илфенил-
3.591	-Me	-Me	6-F	4-Пиррол-1-илфенил-
3.592	-Me	-Me	6-F	4-(5-Метилтетрагидрофуран-2-ил)фенил-
3.593	-Me	-Me	6-F	4-(5-Метил-2-фурил)фенил-
3.594	-Me	-Me	6-F	4-Оксазол-2-илфенил-
3.595	-Me	-Me	6-F	4-(2-Метилтиазол-4-ил)фенил-
3.596	-Me	-Me	6-F	4-(2-Тиенил)фенил-
3.597	-Me	-Me	6-F	4-(1,2,4-Триазол-1-ил)фенил-
3.598	-Me	-Me	6-F	1-Фенил-4-пиразолил-
3.599	-Me	-Me	6-F	1-Циклопропил-4-пиразолил-
3.600	-Me	-Me	6-F	4-(Метилсульфанилметил)фенил-
3.601	-Me	-Me	6-F	4-(Изопропилсульфанилметил)фенил-
3.602	-Me	-Me	6-F	4-(Метилсульфамоил)фенил-
3.603	-Me	-Me	6-F	4-Сульфамоилфенил-
3.604	-Me	-Me	6-F	4-Карбамоилфенил-
3.605	-Me	-Me	6-Cl	4-(1-Метилпиразол-3-ил)фенил-
3.606	-Me	-Me	6-Cl	4-(5-Метилтетразол-1-ил)фенил-
3.607	-Me	-Me	6-Cl	4-Морфолинофенил-
3.608	-Me	-Me	6-Cl	4-(3-Метилпиразол-1-ил)фенил-
3.609	-Me	-Me	6-Cl	4-(3,5-Диметилпиразол-1-ил)фенил-
3.610	-Me	-Me	6-Cl	4-Пиразол-1-илфенил-
3.611	-Me	-Me	6-Cl	4-Пиррол-1-илфенил-
3.612	-Me	-Me	6-Cl	4-(5-Метилтетрагидрофуран-2-ил)фенил-
3.613	-Me	-Me	6-Cl	4-(5-Метил-2-фурил)фенил-
3.614	-Me	-Me	6-Cl	4-Оксазол-2-илфенил-
3.615	-Me	-Me	6-Cl	4-(2-Метилтиазол-4-ил)фенил-
3.616	-Me	-Me	6-Cl	4-(2-Тиенил)фенил-
3.617	-Me	-Me	6-Cl	4-(1,2,4-Триазол-1-ил)фенил-
3.618	-Me	-Me	6-Cl	1-Фенил-4-пиразолил-
3.619	-Me	-Me	6-Cl	1-Циклопропил-4-пиразолил-
3.620	-Me	-Me	6-Cl	4-(Метилсульфанилметил)фенил-
3.621	-Me	-Me	6-Cl	4-(Изопропилсульфанилметил)фенил-
3.622	-Me	-Me	6-Cl	4-(Метилсульфамоил)фенил-
3.623	-Me	-Me	6-Cl	4-Сульфамоилфенил-
3.624	-Me	-Me	6-Cl	4-Карбамоилфенил-
3.625	-Me	-Cl	6-F	4-(1-Метилпиразол-3-ил)фенил-
3.626	-Me	-Cl	6-F	4-(5-Метилтетразол-1-ил)фенил-
3.627	-Me	-Cl	6-F	4-Морфолинофенил-
3.628	-Me	-Cl	6-F	4-(3-Метилпиразол-1-ил)фенил-

№ соединения	R ¹	R ²	X	D
3.629	-Me	-Cl	6-F	4-(3,5-Диметилпиразол-1-ил)фенил-
3.630	-Me	-Cl	6-F	4-Пиразол-1-илфенил-
3.631	-Me	-Cl	6-F	4-Пиррол-1-илфенил-
3.632	-Me	-Cl	6-F	4-(5-Метилтетрагидрофуран-2-ил)фенил-
3.633	-Me	-Cl	6-F	4-(5-Метил-2-фурил)фенил-
3.634	-Me	-Cl	6-F	4-Оксазол-2-илфенил-
3.635	-Me	-Cl	6-F	4-(2-Метилтиазол-4-ил)фенил-
3.636	-Me	-Cl	6-F	4-(2-Тиенил)фенил-
3.637	-Me	-Cl	6-F	4-(1,2,4-Триазол-1-ил)фенил-
3.638	-Me	-Cl	6-F	1-Фенил-4-пиразолил-
3.639	-Me	-Cl	6-F	1-Циклопропил-4-пиразолил-
3.640	-Me	-Cl	6-F	4-(Метилсульфанилметил)фенил-
3.641	-Me	-Cl	6-F	4-(Изопропилсульфанилметил)фенил-
3.642	-Me	-Cl	6-F	4-(Метилсульфамоил)фенил-
3.643	-Me	-Cl	6-F	4-Сульфамоилфенил-
3.644	-Me	-Cl	6-F	4-Карбамоилфенил-
3.645	-Me	-Cl	6-Cl	4-(1-Метилпиразол-3-ил)фенил-
3.646	-Me	-Cl	6-Cl	4-(5-Метилтетразол-1-ил)фенил-
3.647	-Me	-Cl	6-Cl	4-Морфолинофенил-
3.648	-Me	-Cl	6-Cl	4-(3-Метилпиразол-1-ил)фенил-
3.649	-Me	-Cl	6-Cl	4-(3,5-Диметилпиразол-1-ил)фенил-
3.650	-Me	-Cl	6-Cl	4-Пиразол-1-илфенил-
3.651	-Me	-Cl	6-Cl	4-Пиррол-1-илфенил-
3.652	-Me	-Cl	6-Cl	4-(5-Метилтетрагидрофуран-2-ил)фенил-
3.653	-Me	-Cl	6-Cl	4-(5-Метил-2-фурил)фенил-
3.654	-Me	-Cl	6-Cl	4-Оксазол-2-илфенил-
3.655	-Me	-Cl	6-Cl	4-(2-Метилтиазол-4-ил)фенил-
3.656	-Me	-Cl	6-Cl	4-(2-Тиенил)фенил-
3.657	-Me	-Cl	6-Cl	4-(1,2,4-Триазол-1-ил)фенил-
3.658	-Me	-Cl	6-Cl	1-Фенил-4-пиразолил-
3.659	-Me	-Cl	6-Cl	1-Циклопропил-4-пиразолил-
3.660	-Me	-Cl	6-Cl	4-(Метилсульфанилметил)фенил-
3.661	-Me	-Cl	6-Cl	4-(Изопропилсульфанилметил)фенил-
3.662	-Me	-Cl	6-Cl	4-(Метилсульфамоил)фенил-
3.663	-Me	-Cl	6-Cl	4-Сульфамоилфенил-
3.664	-Me	-Cl	6-Cl	4-Карбамоилфенил-
3.665	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-(1-Метилпиразол-3-ил)фенил-
3.666	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-(5-Метилтетразол-1-ил)фенил-
3.667	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-Морфолинофенил-
3.668	-CH ₂ -	-Me	6-F	4-(3-Метилпиразол-1-ил)фенил-

№ соединения	R ¹	R ²	X	D
	C≡CH			
3.669	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-(3,5-Диметилпиразол-1-ил)фенил-
3.670	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-Пиразол-1-илфенил-
3.671	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-Пиррол-1-илфенил-
3.672	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-(5-Метилтетрагидрофуран-2-ил)фенил-
3.673	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-(5-Метил-2-фурил)фенил-
3.674	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-Оксазол-2-илфенил-
3.675	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-(2-Метилтиазол-4-ил)фенил-
3.676	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-(2-Тиенил)фенил-
3.677	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-(1,2,4-Триазол-1-ил)фенил-
3.678	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	1-Фенил-4-пиразолил-
3.679	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	1-Циклопропил-4-пиразолил-
3.680	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-(Метилсульфанилметил)фенил-
3.681	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-(Изопропилсульфанилметил)фенил-
3.682	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-(Метилсульфамоил)фенил-
3.683	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-Сульфоамидфенил-
3.684	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-F	4-Карбамоилфенил-
3.685	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-(1-Метилпиразол-3-ил)фенил-
3.686	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-(5-Метилтетразол-1-ил)фенил-
3.687	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-Морфолинофенил-
3.688	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-(3-Метилпиразол-1-ил)фенил-
3.689	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-(3,5-Диметилпиразол-1-ил)фенил-
3.690	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-Пиразол-1-илфенил-
3.691	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-Пиррол-1-илфенил-

№ соединения	R ¹	R ²	X	D
3.692	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-(5-Метилтетрагидрофуран-2-ил)фенил-
3.693	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-(5-Метил-2-фурил)фенил-
3.694	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-Оксазол-2-илфенил-
3.695	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-(2-Метилтиазол-4-ил)фенил-
3.696	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-(2-Тиенил)фенил-
3.697	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-(1,2,4-Триазол-1-ил)фенил-
3.698	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	1-Фенил-4-пиразолил-
3.699	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	1-Циклопропил-4-пиразолил-
3.700	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-(Метилсульфанилметил)фенил-
3.701	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-(Изопропилсульфанилметил)фенил-
3.702	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-(Метилсульфамоил)фенил-
3.703	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-Сульфамоилфенил-
3.704	-CH ₂ - C≡CH	-Me	6-Cl	4-Карбамоилфенил-
3.705	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-(1-Метилпиразол-3-ил)фенил-
3.706	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-(5-Метилтетразол-1-ил)фенил-
3.707	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-Морфолинофенил-
3.708	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-(3-Метилпиразол-1-ил)фенил-
3.709	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-(3,5-Диметилпиразол-1-ил)фенил-
3.710	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-Пиразол-1-илфенил-
3.711	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-Пиррол-1-илфенил-
3.712	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-(5-Метилтетрагидрофуран-2-ил)фенил-
3.713	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-(5-Метил-2-фурил)фенил-
3.714	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-Оксазол-2-илфенил-
3.715	-CH ₂ -	-Cl	6-F	4-(2-Метилтиазол-4-ил)фенил-

№ соединения	R ¹	R ²	X	D
	C≡CH			
3.716	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-(2-Тиенил)фенил-
3.717	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-(1,2,4-Триазол-1-ил)фенил-
3.718	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	1-Фенил-4-пиразолил-
3.719	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	1-Циклопропил-4-пиразолил-
3.720	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-(Метилсульфанилметил)фенил-
3.721	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4- (Изопропилсульфанилметил)фенил-
3.722	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-(Метилсульфамоил)фенил-
3.723	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-Сульфамоилфенил-
3.724	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-F	4-Карбамоилфенил-
3.725	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(1-Метилпиразол-3-ил)фенил-
3.726	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(5-Метилтетразол-1-ил)фенил-
3.727	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Морфолинофенил-
3.728	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(3-Метилпиразол-1-ил)фенил-
3.729	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(3,5-Диметилпиразол-1-ил)фенил-
3.730	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Пиразол-1-илфенил-
3.731	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Пиррол-1-илфенил-
3.732	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(5-Метилтетрагидрофуран-2-ил)фенил-
3.733	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(5-Метил-2-фурил)фенил-
3.734	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Оксазол-2-илфенил-
3.735	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(2-Метилтиазол-4-ил)фенил-
3.736	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(2-Тиенил)фенил-
3.737	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(1,2,4-Триазол-1-ил)фенил-
3.738	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	1-Фенил-4-пиразолил-

№ соединения	R ¹	R ²	X	D
3.739	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	1-Циклопропил-4-пиразолил-
3.740	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(Метилсульфанилметил)фенил-
3.741	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4- (Изопропилсульфанилметил)фенил-
3.742	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(Метилсульфамоил)фенил-
3.743	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Сульфамоилфенил-
3.744	-CH ₂ - C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Карбамоилфенил-

В **таблице С-2** приведено 744 соединения от С-2.001 до С-2.744 формулы (I), где G представляет собой -H, W представляет собой (E)-CH=CH-, Y представляет собой 3-циклопропил, и R¹, R², X, Y и D являются такими, как определено для соединений №№ 3.001 – 3.744 соответственно в таблице 3 выше.

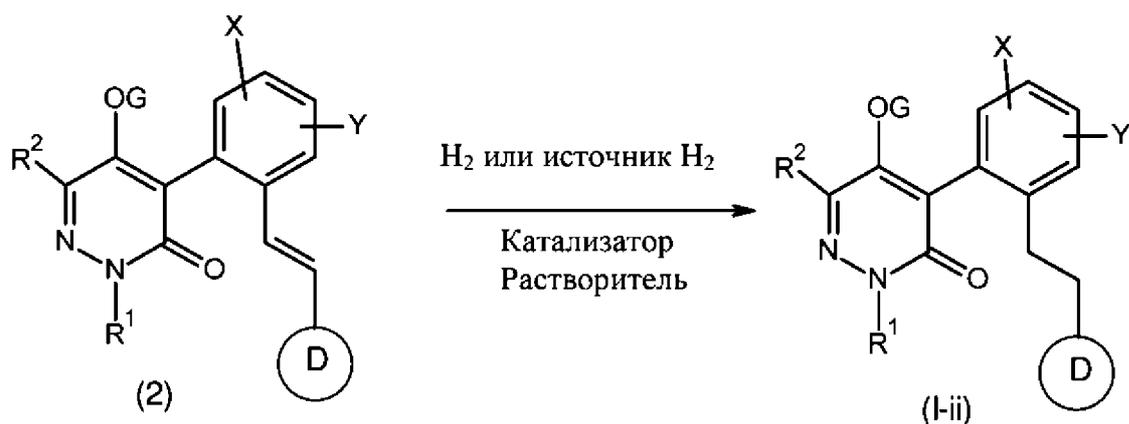
В **таблице С-3** приведено 744 соединения от С-3.001 до С-3.744 формулы (I), где G представляет собой -(C=O)iPr, W представляет собой -CH₂-CH₂-, Y представляет собой 3-циклопропил, и R¹, R², X и D являются такими, как определено для соединений №№ 3.001 – 3.744 соответственно в таблице 3 выше.

В **таблице С-4** приведено 744 соединения от С-4.001 до С-4.744 формулы (I), где G представляет собой -(C=O)iPr, W представляет собой (E)-CH=CH-, Y представляет собой 3-циклопропил, и R¹, R², X и D являются такими, как определено для соединений №№ 3.001 – 3.744 соответственно в таблице 3 выше.

Соединения по настоящему изобретению можно получать согласно следующим схемам, на которых заместители R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁴, R¹⁵, R¹⁶, W, D, Dp, G, X, Y, и m имеют (если явно не указано иное) определения, описанные в данном документе выше.

Некоторые соединения (I-ii) по настоящему изобретению можно получать из соединений (2), как показано на **схеме реакции 1**. Соединения (I-ii) представляют собой соединения формулы (I), в которых W представляет собой -CH₂-CH₂-.

Схема реакции 1



Соединения (I-ii) можно получать путем каталитической гидрогенизации соединений (2) с помощью газообразного водорода в подходящем растворителе [таком как тетрагидрофуран, метанол, этанол, уксусная кислота или этилацетат] в присутствии подходящего катализатора [такого как Pd/C, Pd/CaCO₃, Rh/Al₂CO₃ или губчатый никель] при температуре от -10 до 100°C.

В качестве альтернативы соединения (I-ii) также можно получать путем каталитической трансферной гидрогенизации соединений (2) путем обработки с помощью подходящего источника водорода в подходящем растворителе в присутствии подходящего катализатора при температуре от -10 до 100°C. Примерами подходящих систем являются тетрагидроксидбор в смесях дихлорметан/вода или дихлорметан/метанол в присутствии Pd/C, Pd(OAc)₂ или Pd(OH)₂/C (*J. Am. Chem. Soc.*, **2016**, 138, 6107-6110) или диэтил-1,4-дигидро-2,6-диметил-3,5-пиридиндикарбоксилат в этаноле в присутствии Pd/C (*Tetrahedron Letters*, **2009**, 50, 1026).

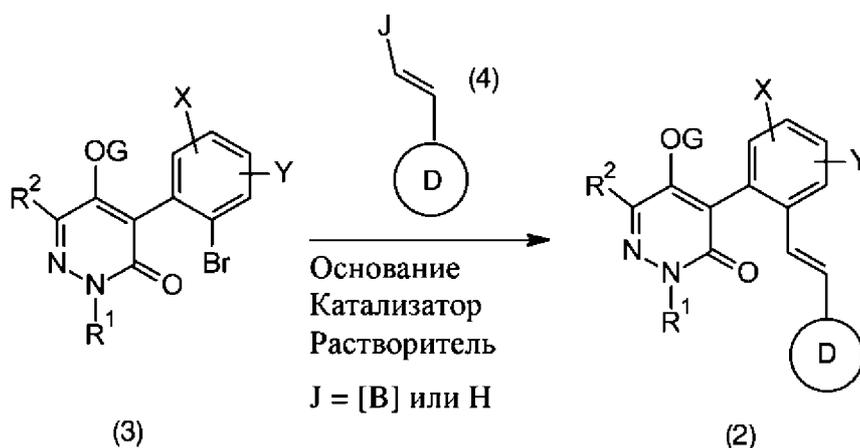
Соединения (2) можно получать из соединений (3) и соединений (4), как показано на **схеме реакции 2**, в соответствии либо с протоколом реакции Сузуки, либо протоколом реакции Хека, описанными ниже. При использовании протокола реакции Сузуки соединения (4) представляют собой борорганические соединения, такие как бороновые кислоты, сложные бороновые эфиры или соли, представляющие собой трифторборат калия. При использовании протокола реакции Хека соединения (4) представляют собой стиролы.

В качестве альтернативы соединения (I-ii) также можно получать путем восстановления с помощью диимида, полученного *in-situ* из подходящего предшественника в подходящем растворителе при температуре от -10 до 200°C. Примеры подходящих реагентов для получения диимида включают замещенные арилсульфонилгидразиды, такие как 2,4,6-триизопропилбензолсульфонилгидразид,

необязательно в присутствии подходящего основания. Примеры подходящих оснований включают триэтиламин, диизопропилэтиламин, карбонат калия и карбонат натрия. Подходящие растворители включают тетрагидрофуран, 1,4-диоксан, этилацетат, ацетонитрил и диметилформамид.

5

Схема реакции 2



Протокол реакции Сузуки

Соединения (2) можно получать путем обработки соединений (3) с помощью соединений (4) в присутствии подходящего основания и подходящего катализатора в подходящем растворителе при температуре от 10 до 150°C. Примеры подходящих оснований включают карбонат калия, фосфат калия, карбонат натрия, бикарбонат натрия и фторид калия. Примеры подходящих катализаторов включают комплекс 1,1'-бис(дифенилфосфино)ферроцен]дихлорпалладия(II) и дихлорметана [PdCl₂(dppf)·DCM], тетракис(трифенилфосфин)палладий(0) [Pd(PPh₃)₄] и каталитическую систему, образованную *in situ* из смеси ацетата палладия(II) и трифенилфосфина. Примеры подходящих растворителей включают воду, 1,4-диоксан, тетрагидрофуран, ацетонитрил и толуол. Многие соединения (4) являются коммерчески доступными [например, *транс*-2-(4-бифенил)винилбороновая кислота] или могут быть получены с помощью известных способов. Примеры соединений (3), характеризующихся особой применимостью в протоколе реакции Сузуки, представляют собой сложные изобутириловые эфиры (3-i), где G представляет собой изобутирил.

Специалисту в данной области техники будет понятно, что условия протокола реакции Сузуки могут обеспечивать расщепление сложноэфирных групп, следовательно, схема реакции 2 также может описывать реакцию, где исходный

25

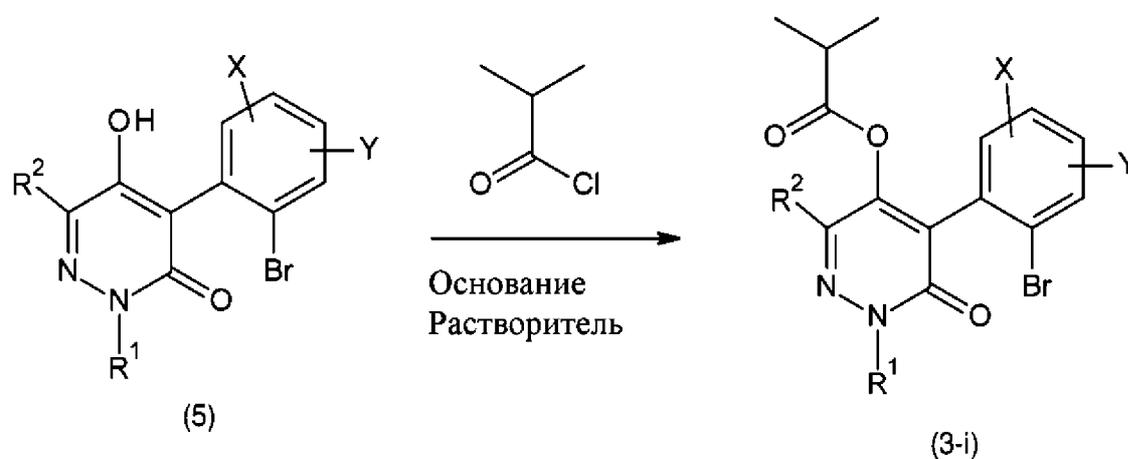
материал (3) содержит сложноэфирный фрагмент [так что G представляет собой ацильную группу], а продукт (2) не содержит [так что G представляет собой водород].

Протокол реакции Хека

Соединения (2) можно получать путем обработки соединений (3) с помощью соединений (4) в присутствии подходящего основания и подходящего катализатора при температуре от 10 до 150°C. Необязательно может быть включен дополнительный растворитель. Примеры подходящих оснований включают триэтиламин, морфолин, *N*-метилморфолин, диизопропилэтиламин и пиридин. Примеры подходящих катализаторов включают тетраакис(трифенилфосфин)палладий(0) [Pd(PPh₃)₄], каталитическую систему, образованную *in-situ* из смеси ацетата палладия(II) и трифенилфосфина, каталитическую систему, образованную *in-situ* из смеси трис(дибензилиденацетон)дипалладия(0) и тетрафторбората три-*tert*-бутилфосфония, и каталитическую систему, образованную *in-situ* из палладиевоциклического предкатализатора, такого как хлор[(три-*tert*-бутилфосфин)-2-(2-аминобифенил)]палладий(II). Примеры необязательного дополнительного растворителя включают 1,4-диоксан, тетрагидрофуран, ацетонитрил и толуол. Многие соединения (4) являются коммерчески доступными [такие как 4-цианостирол] или могут быть получены с помощью известных способов. Примеры соединений (3), характеризующихся особой применимостью в протоколе реакции Хека, представляют собой сложные изобутириловые эфиры (3-*i*), где G представляет собой изобутирил.

Соединения (3-*i*) можно получать из соединений (5), как показано на **схеме реакции 3**.

Схема реакции 3



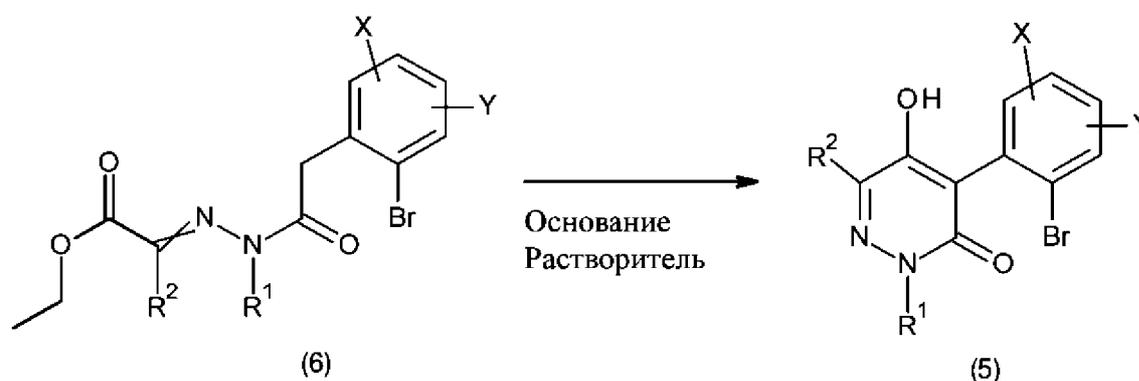
Соединения (3-*i*) можно получать путем обработки соединений (5) с помощью изобутирилхлорида в подходящем растворителе [таком как дихлорметан, ацетонитрил

или толуол] в присутствии подходящего основания [такого как триэтиламин, диизопропилэтиламин или пиридин] при температуре от -10 до 60°C. Необязательно может быть включен катализатор [такой как 4-(диметиламино)пиридин].

5 Соединения (5) можно получать из соединений (6), как показано на **схеме реакции 4**, путем нагревания соединений (6) с основанием (таким как 1,8-диазабицикло[5.4.0]ундец-7-ен, гексаметилдисилазид натрия или гексаметилдисилазид лития) в растворителе [таком как ацетонитрил, *N,N*-диметилформамид или толуол] при температуре от 50 до 200°C. Может применяться традиционное нагревание или нагревание с помощью микроволнового излучения.

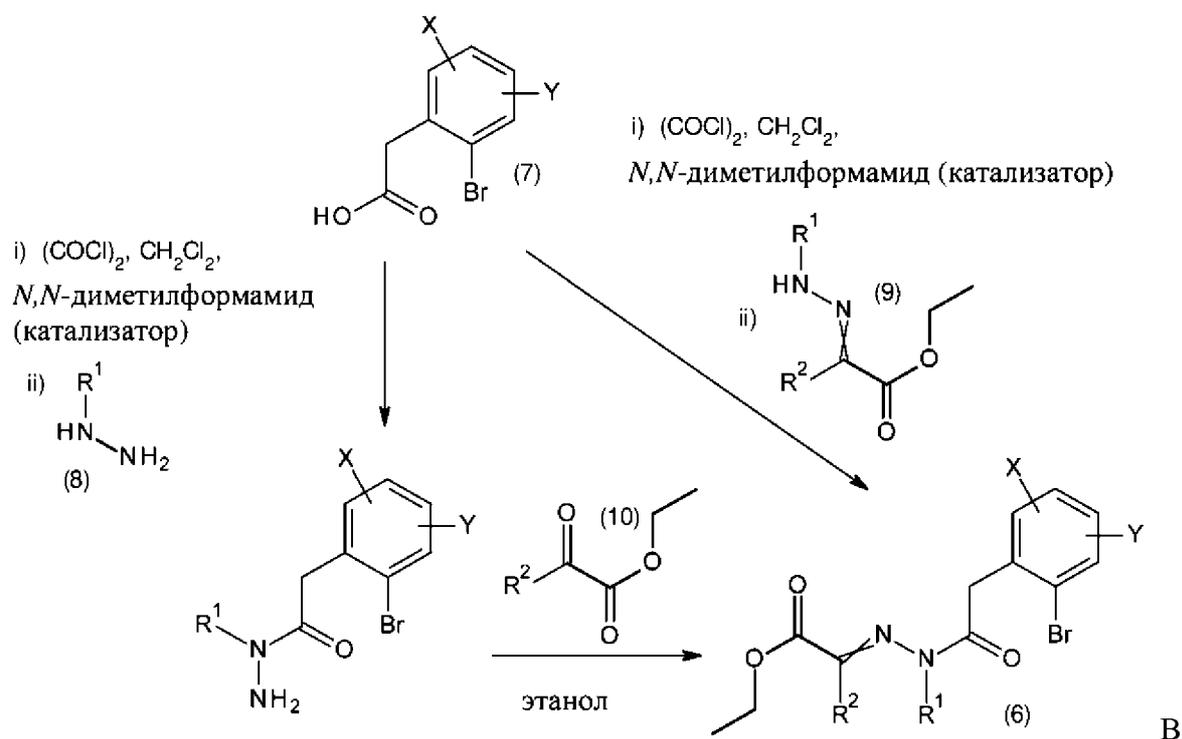
10

Схема реакции 4



15 Соединения (6) можно получать из фенилуксусных кислот (7), как показано на **схеме реакции 5**.

Схема реакции 5

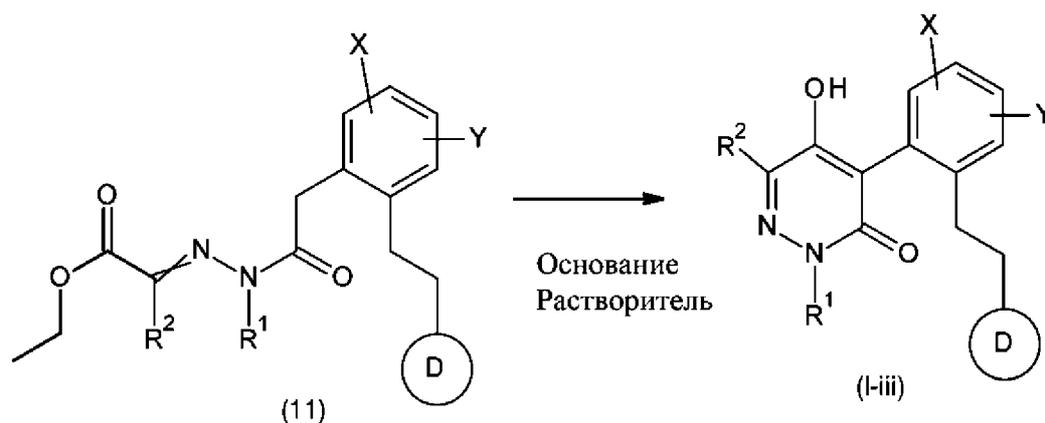


- отношении **схемы реакции 5**, пример гидразина (8) представляет собой метилгидразин, и пример сложных кетозэфиров (10) представляет собой этилпируват.
- 5 Пример гидразона (9) представляет собой этил(2*E/Z*)-2-(метилгидразино)пропаноат, полученный в соответствии со способами, описанными в заявке на патент согласно РСТ WO 2016/008816. Пример фенилуксусной кислоты (7) представляет собой (2-бром-6-фторфенил)уксусную кислоту, которая может быть синтезирована в соответствии со **схемой реакции 10**. Дополнительный пример фенилуксусной кислоты (7) представляет
- 10 собой (2-бром-3-хлор-6-фторфенил)уксусную кислоту, которая может быть синтезирована в соответствии со **схемой реакции 11**.

Некоторые соединения (I-iii) по настоящему изобретению можно получать из соединений (11), как показано на **схеме реакции 6**, или из соединений (I-iv), как

15 показано на **схеме реакции 12**. Соединения (I-iii) представляют собой соединения формулы (I), в которых W представляет собой $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$, и G представляет собой водород.

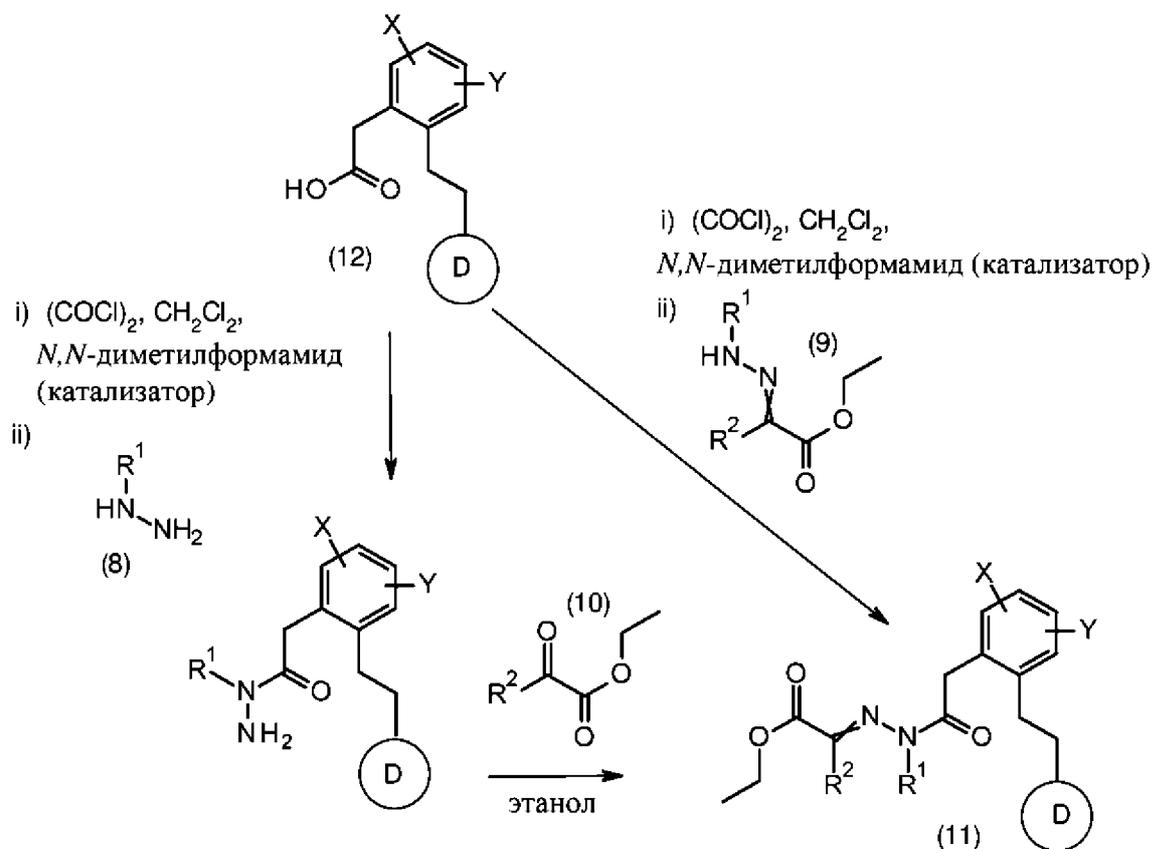
Схема реакции 6



Соединения (I-iii) можно получать путем нагревания соединений (11) с
 5 основанием (таким как 1,8-диазабигидро[5.4.0]ундец-7-ен, гексаметилдисилазид натрия
 или гексаметилдисилазид лития) в растворителе [таким как ацетонитрил, *N,N*-
 диметилформамид или толуол] при температуре от 50 до 200°C. Может применяться
 традиционное нагревание или нагревание с помощью микроволнового излучения.

Соединения (11) можно получать из соединений (12), как показано на **схеме**
 10 **реакции 7** ниже.

Схема реакции 7



Соединения (12) можно получать из соединений (13), как показано на **схеме реакции 8**. Множество соединений (13) являются коммерчески доступными [такие как метил-2-фенилацетат и метил-2-(2-фторфенил)ацетат].

В отношении **схемы реакции 8** фосфораны (15) можно получать согласно **схеме реакции 9**.

Схема реакции 8

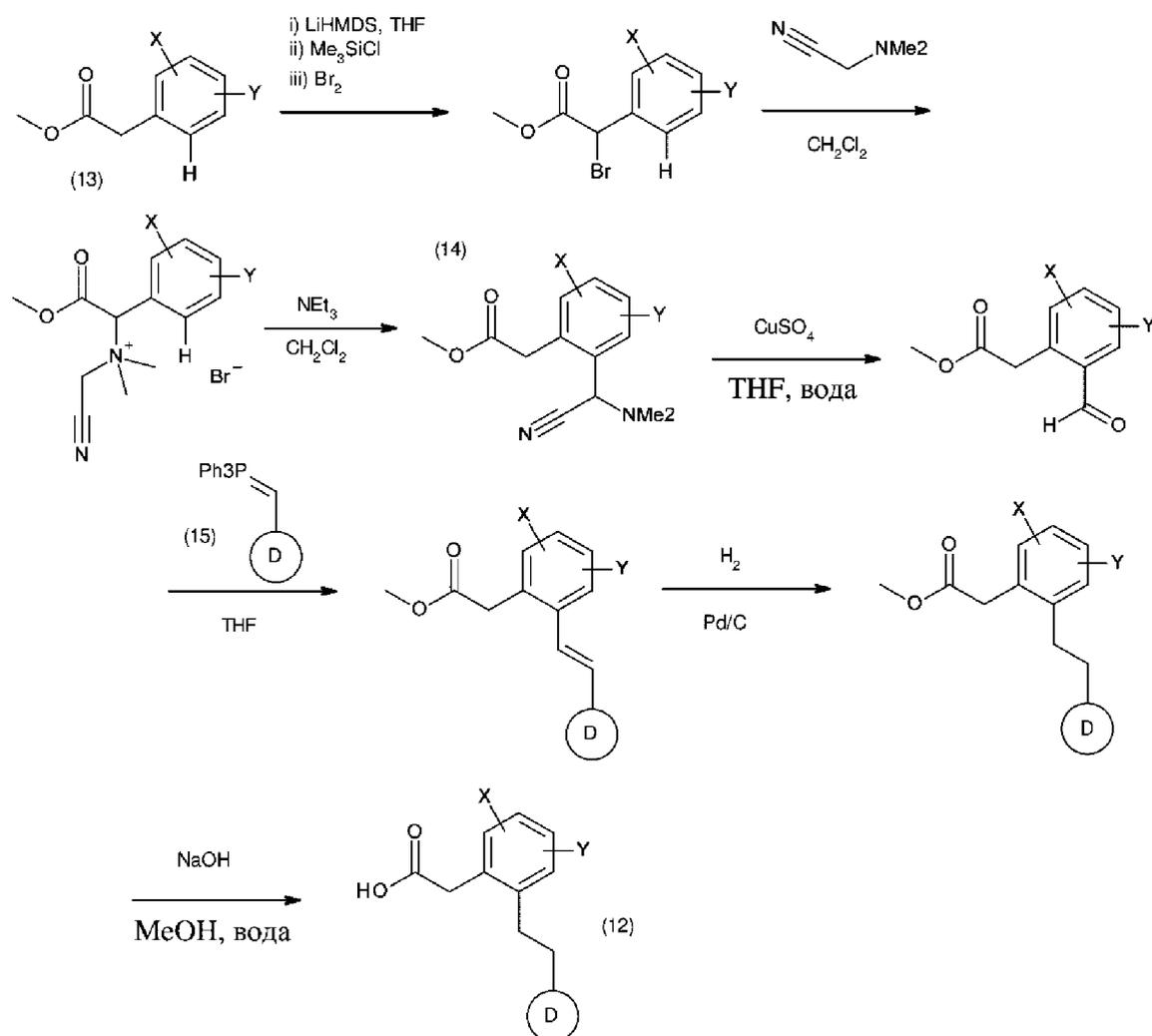
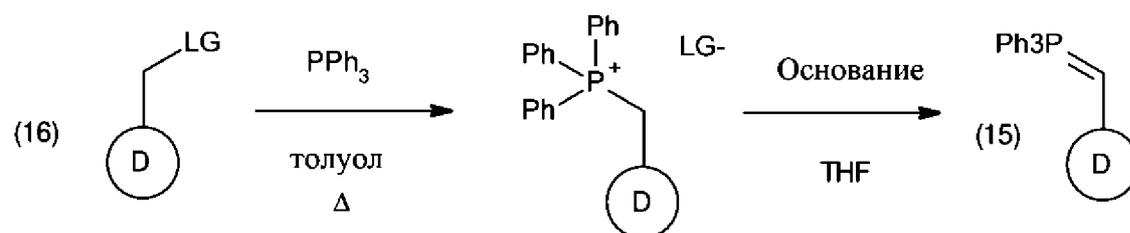


Схема реакции 9



5

В отношении **схемы реакции 9** примеры подходящих оснований представляют собой гидрид натрия, гексаметилдисилазид натрия и *трет*-бутоксид калия. Соединения (16) представляют собой электрофилы, где LG представляет собой уходящую группу [такую как хлорид, бромид, йодид, тозилат или мезилат]. Множество соединений (16) являются коммерчески доступными [такие как 4-хлорбензилбромид или 2-хлор-5-хлорметилтиазол].

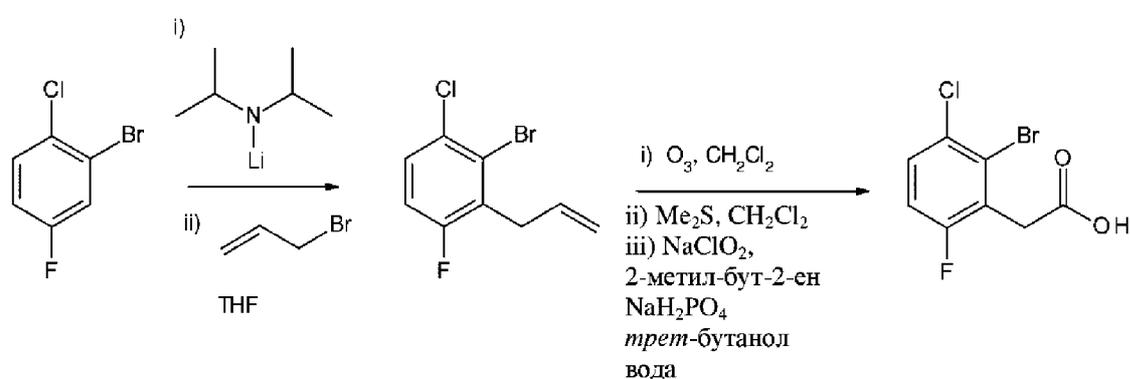
10

Схема реакции 10



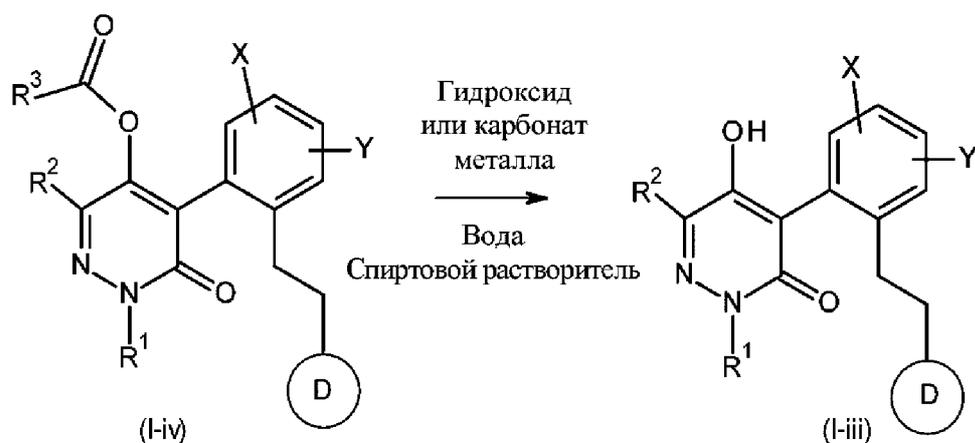
5 В отношении **схемы реакции 10** сложный этиловый эфир (2-бром-6-фторфенил)уксусной кислоты можно получать, как описано в Lundgren *et al.* *JACS* **2016**, *138*, 13826-13829.

Схема реакции 11



10 В отношении **схемы реакции 11** 2-бром-1-хлор-4-фторбензол является коммерчески доступным.

Схема реакции 12

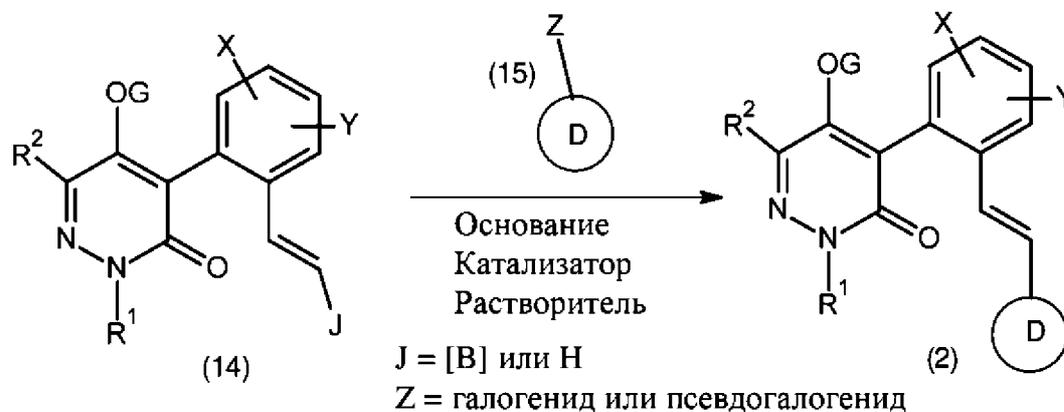


15 Соединения (I-iii) можно получать путем обработки соединений (I-iv) гидроксидом металла [таким как гидроксид натрия, гидроксид лития или гидроксид калия] в смеси воды и подходящего растворителя [такого как метанол, этанол или

тетрагидрофуран]; или путем обработки соединений (I-iv) карбонатом металла [таким как карбонат натрия или карбонат калия] в спиртовом растворителе [таким как метанол или этанол] при температуре от 0°C до 100°C. Соединения (I-iv) представляют собой соединения формулы (I), в которых W представляет собой -CH₂-CH₂- и G представляет собой C(O)R³.

Соединения (2) можно получать из соединений (14) и соединений (15), как показано на **схеме реакции 13** в соответствии либо с протоколом реакции Сузуки, либо протоколом реакции Хека, описанными ниже. При использовании протокола реакции Сузуки соединения (14) представляют собой борорганические соединения, такие как бороновые кислоты, сложные бороновые эфиры или соли, представляющие собой трифторборат калия, и соединения (15) представляют собой галогенидные или псевдогалогенидные соединения, такие как хлориды, бромиды, иодиды или трифлаты. При использовании протокола реакции Хека соединения (14) представляют собой стиролы, и соединения (15) представляют собой галогенидные или псевдогалогенидные соединения, такие как хлориды, бромиды, иодиды или трифлаты.

Схема реакции 13



20 Протокол реакции Сузуки

Соединения (2) можно получать путем обработки соединений (14) с помощью соединений (15) в присутствии подходящего основания и подходящего катализатора в подходящем растворителе при температуре от 10 до 150°C. Примеры подходящих оснований включают карбонат калия, фосфат калия, карбонат натрия, бикарбонат натрия и фторид калия. Примеры подходящих катализаторов включают комплекс 1,1'-бис(дифенилфосфино)ферроцен]дихлорпалладия(II) и дихлорметана [PdCl₂(dppf)·DCM], тетраakis(трифенилфосфин)палладий(0) [Pd(PPh₃)₄] и каталитическую систему,

образованную *in situ* из смеси ацетата палладия(II) и трифенилфосфина. Примеры подходящих растворителей включают воду, 1,4-диоксан, тетрагидрофуран, ацетонитрил и толуол. Многие соединения (15) являются коммерчески доступными или могут быть получены с помощью известных способов. Примеры соединений (14), характеризующихся особой применимостью в протоколе реакции Сузуки, представляют собой сложные изобутириловые эфиры (14-i), где G представляет собой изобутирил.

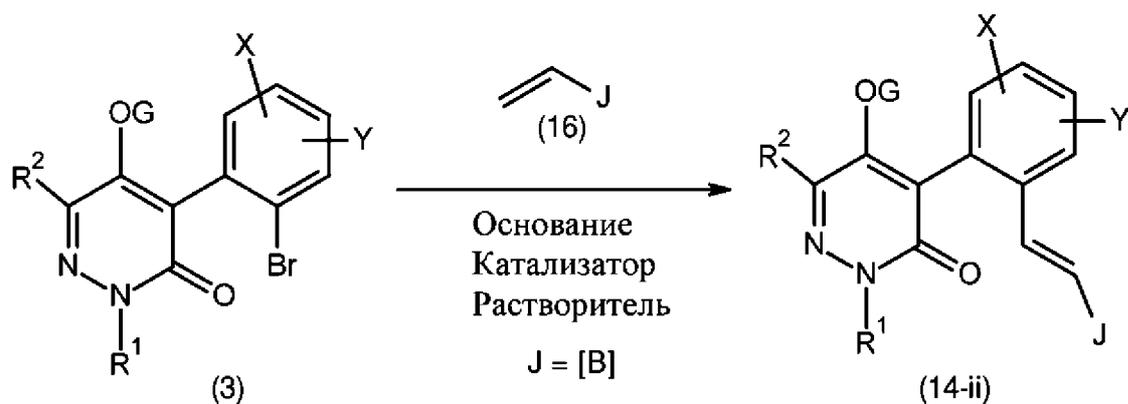
Специалисту в данной области техники будет понятно, что условия протокола реакции Сузуки могут обеспечивать расщепление сложноэфирных групп, следовательно, схема реакции 13 также может описывать реакцию, где исходный материал (14) содержит сложноэфирный фрагмент [так что G представляет собой ацильную группу], а продукт (2) не содержит [так что G представляет собой водород].

Протокол реакции Хека

Соединения (2) можно получать путем обработки соединений (14) с помощью соединений (15) в присутствии подходящего основания и подходящего катализатора при температуре от 10 до 150°C. Необязательно может быть включен дополнительный растворитель. Примеры подходящих оснований включают триэтиламин, морфолин, *N*-метилморфолин, диизопропилэтиламин и пиридин. Примеры подходящих катализаторов включают тетраakis(трифенилфосфин)палладий(0) [Pd(PPh₃)₄], каталитическую систему, образованную *in-situ* из смеси ацетата палладия(II) и трифенилфосфина, каталитическую систему, образованную *in-situ* из смеси трис(добензилиденацетон)дипалладия(0) и тетрафторбората три-*tert*-бутилфосфония, и каталитическую систему, образованную *in-situ* из палладиевоциклического предкатализатора, такого как хлор[(три-*tert*-бутилфосфин)-2-(2-аминобифенил)]палладий(II). Примеры необязательного дополнительного растворителя включают 1,4-диоксан, тетрагидрофуран, ацетонитрил и толуол. Многие соединения (15) являются коммерчески доступными или могут быть получены с помощью известных способов. Примеры соединений (14), характеризующихся особой применимостью в протоколе реакции Хека, представляют собой сложные изобутириловые эфиры (14-i), где G представляет собой изобутирил.

Соединения (14-ii), где J представляет собой борорганическое соединение, такое как сложный бороновый эфир, можно получать из соединений (3) и соединений (16), как показано на **схеме реакции 14**.

Схема реакции 14



5 Соединения (14-ii) можно получать путем обработки соединений (3) с помощью соединений (16) в присутствии подходящего основания и подходящего катализатора при температуре от 10 до 150°C. Необязательно может быть включен дополнительный растворитель. Примеры подходящих оснований включают триэтиламин, морфолин, *N*-метилморфолин, диизопропилэтиламин и пиридин. Примеры подходящих

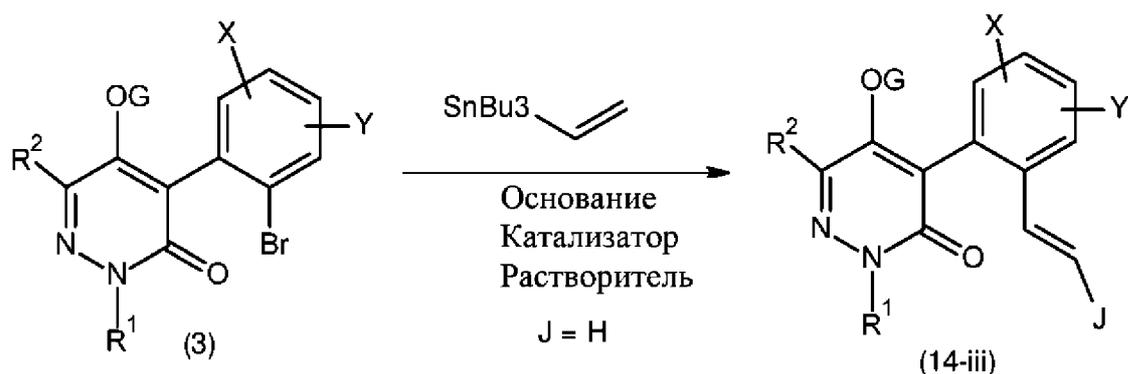
10 катализаторов представляют собой тетракис(трифенилфосфин)палладий(0) [Pd(PPh₃)₄], каталитическую систему, образованную *in-situ* из смеси ацетата палладия(II) и трифенилфосфина, и каталитическую систему, образованную *in-situ* из смеси трис(дибензилиденацетон)дипалладия(0) и тетрафторбората три-*tert*-бутилфосфония. Примеры необязательного дополнительного растворителя включают 1,4-диоксан,

15 тетрагидрофуран, ацетонитрил и толуол. Многие соединения (16) являются коммерчески доступными, например, сложный MIDA-эфир винилбороновой кислоты или сложный пинаколовый эфир винилбороновой кислоты, или могут быть получены с помощью известных способов. Примеры соединений (3), характеризующихся особой

20 применимостью в протоколе реакции Хека, представляют собой сложные изобутириловые эфиры (3-i), где G представляет собой изобутирил.

Соединения (14-iii), где J представляет собой водород, можно получать из соединений (3), как показано на **схеме реакции 15**.

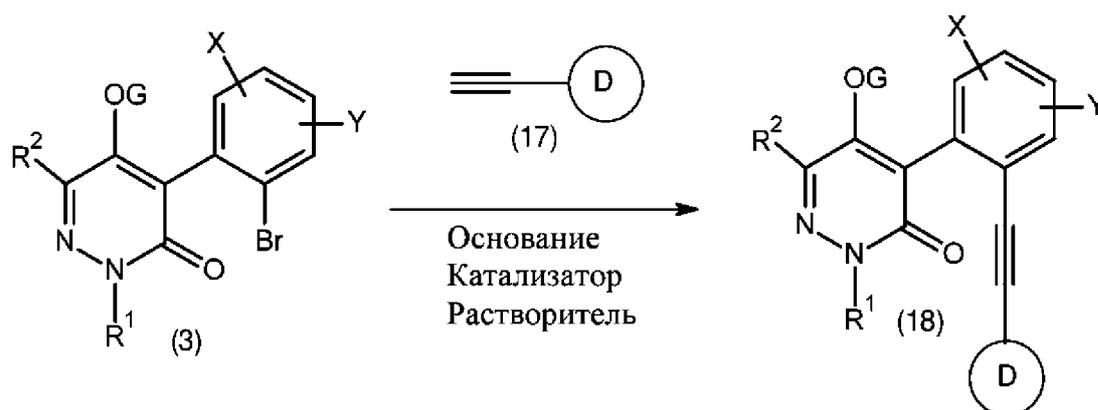
Схема реакции 15



Соединения (14-iii) можно получать путем обработки соединений (3) с помощью трибутил(винил)станнана необязательно в присутствии подходящего основания, в присутствии подходящего катализатора при температуре от 10 до 150°C в подходящем растворителе. Примеры необязательного основания включают триэтиламин, морфолин, *N*-метилморфолин, диизопропилэтиламин и пиридин. Примеры подходящих катализаторов включают комплекс 1,1'-бис(дифенилфосфино)-ферроцен]дихлорпалладия(II) и дихлорметана [PdCl₂(dppf).DCM], тетраakis-(трифенилфосфин)палладий(0) [Pd(PPh₃)₄], каталитическую систему, образованную *in-situ* из смеси ацетата палладия(II) и трифенилфосфина, каталитическую систему, образованную *in-situ* из смеси трис(добензилиденацетон)дипалладия(0) и тетрафторбората три-*tert*-бутилфосфония, и каталитическую систему, образованную *in-situ* из палладиевоциклического предкатализатора, такого как хлор[(три-*tert*-бутилфосфин)-2-(2-аминобифенил)]палладий(II). Примеры подходящих растворителей включают 1,4-диоксан, тетрагидрофуран, ацетонитрил и толуол. Примеры соединений (3), характеризующихся особой применимостью, представляют собой сложные изобутириловые эфиры (3-i), где G представляет собой изобутирил.

Соединения (18) можно получать из соединений (3) посредством реакции Соногаширы, как показано на **схеме реакции 16**.

Схема реакции 16



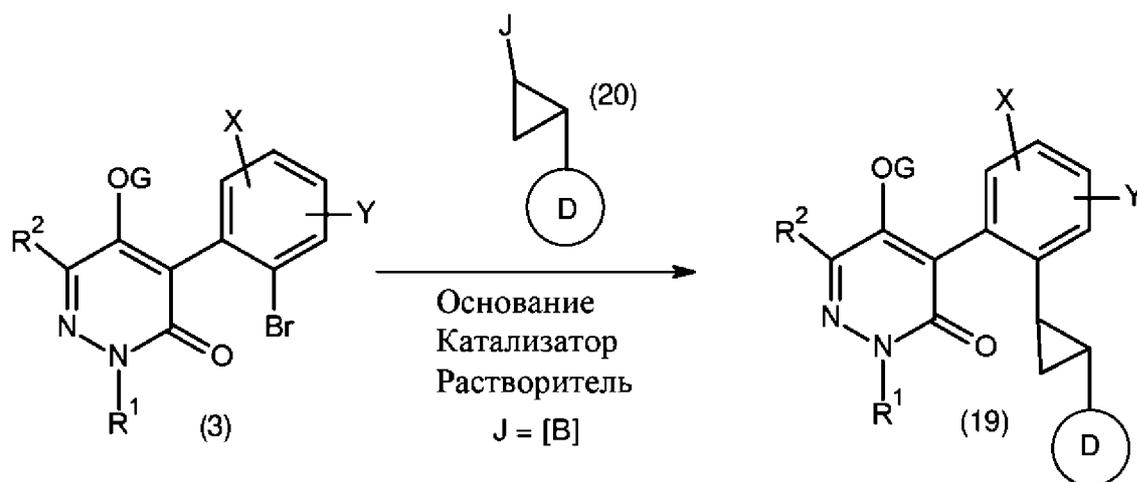
Соединения (18) можно получать путем обработки соединений (3) с помощью соединений (17) в присутствии подходящего основания и подходящего(-их) катализатора(-ов) при температуре от 10 до 150°C. Необязательно может быть добавлен дополнительный растворитель. Примеры подходящих оснований включают триэтиламин, морфолин, *N*-метилморфолин, диизопропиламин, диизопропилэтиламин и пиридин. Примеры подходящих катализаторов включают дихлорид бис(трифенилфосфин)палладия(II) [Pd(PPh₃)Cl₂], каталитическую систему, образованную *in-situ* из смеси ацетата палладия(II) и трифенилфосфина, каталитическую систему, образованную *in-situ* из смеси трис(дибензилиденацетон)дипалладия(0) и тетрафторбората три-*tert*-бутилфосфония, и каталитическую систему, образованную *in-situ* из палладиевоциклического предкатализатора, такого как хлор[(три-*tert*-бутилфосфин)-2-(2-аминобифенил)]палладий(II). Необязательно также могут быть добавлены медьсодержащие катализаторы, такие как иодид меди(I). Примеры подходящих дополнительных растворителей представляют собой 1,4-диоксан, тетрагидрофуран, ацетонитрил, толуол и *N,N*-диметилформаид. Примеры соединений (3), характеризующихся особой применимостью, представляют собой сложные изобутириловые эфиры (3-*i*), где G представляет собой изобутирил.

Специалисту в данной области техники будет понятно, что условия реакции Соногаширы могут обеспечивать расщепление сложноэфирных групп, следовательно, схема реакции 16 также может описывать реакцию, где исходный материал (3) содержит сложноэфирный фрагмент [так что G представляет собой ацильную группу], а продукт (18) не содержит [так что G представляет собой водород].

Соединения (19) можно получать из соединений (3) и соединений (20), как показано на **схеме реакции 17**, посредством реакции Сузуки, где соединение (20) представляет собой подходящие борорганические соединения, такие как борная кислота, сложный боронатный эфир или соль, представляющая собой трифторборат калия.

5

Схема реакции 17



Соединения (19) можно получать путем обработки соединений (3) с помощью соединений (20) в присутствии подходящего основания и подходящего катализатора в подходящем растворителе при температуре от 10 до 150°C. Примеры подходящих оснований включают карбонат калия, фосфат калия, карбонат натрия, бикарбонат натрия и фторид калия. Примеры подходящих катализаторов включают комплекс 1,1'-бис(дифенилфосфино)ферроцен]дихлорпалладия(II) и дихлорметана [PdCl₂(dppf)·DCM], каталитическую систему, образованную *in situ* из смеси трис(добензилиденацетон)дипалладия(0) и тетрафторбората три-*tert*-бутилфосфония, каталитическую систему, образованную *in situ* из смеси трис(добензилиденацетон)дипалладия(0) и трициклогексилфосфина, каталитическую систему, образованную *in situ* из палладиевоциклического предкатализатора, такого как хлор[(три-*tert*-бутилфосфин)-2-(2-аминобифенил)]палладий(II), и каталитическую систему, образованную *in situ* из палладиевоциклического предкатализатора, такого как хлор[(трициклогексилфосфин)-2-(2'-аминобифенил)]палладий(II). Примеры подходящих растворителей включают воду, 1,4-диоксан, тетрагидрофуран, ацетонитрил и толуол. Некоторые соединения (20) являются коммерчески доступными

10

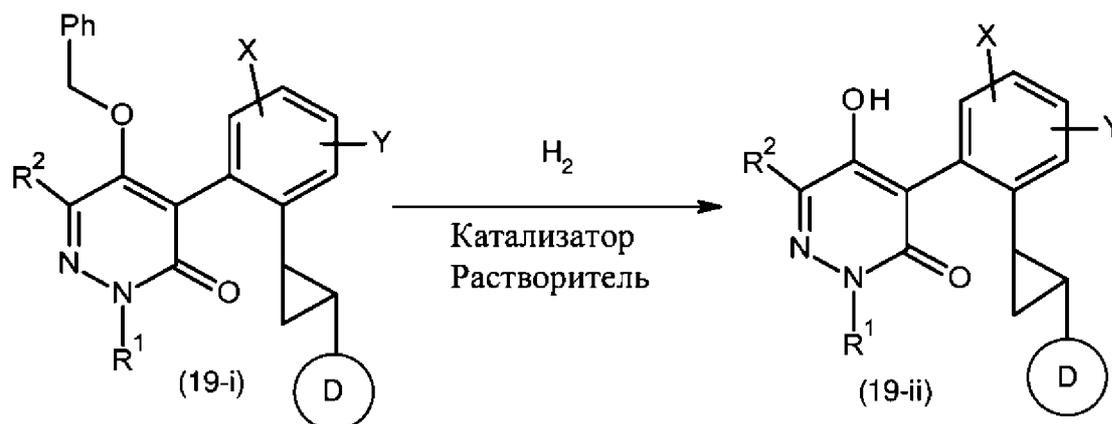
15

20

25

[например, 4,4,5,5-тетраметил-2-(2-фенилциклопропил)-[1,3,2]диоксаборолан] или могут быть получены с помощью известных способов (см., например, способы, описанные в Org. Process Res. Dev. 2012, 16, 87–95). Примеры соединений (3), характеризующихся особой применимостью в реакции Сузуки, представляют собой сложные бензильные эфиры (3-ii), где G представляет собой бензил.

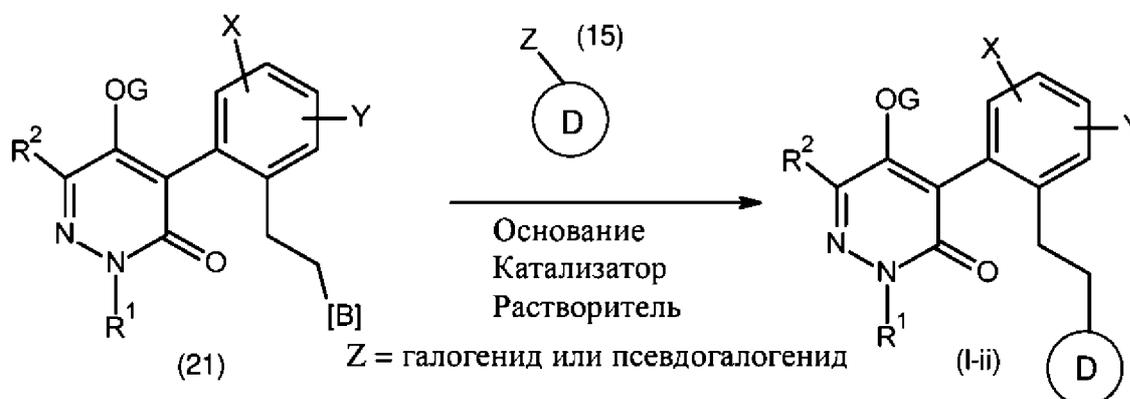
Схема реакции 18



Соединения (19-ii) можно получать путем каталитической гидрогенизации соединений (19-i) с помощью газообразного водорода в подходящем растворителе [таком как тетрагидрофуран, метанол, этанол, уксусная кислота или этилацетат] в присутствии подходящего катализатора [такого как Pd/C, Pd/CaCO₃, Rh/Al₂CO₃ или губчатый никель] при температуре от -10 до 100°C.

Определенные соединения (I-ii) по настоящему изобретению можно получать из соединений (21), как показано на **схеме реакции 19**. Соединения (I-ii) представляют собой соединения формулы (I), в которых W представляет собой -CH₂-CH₂-.

Схема реакции 19



Соединения (I-ii) можно получать путем обработки соединений (21), где [В] может представлять собой триалкилборан, алкилбороновую кислоту, сложный алкилбороновый эфир или трифторборатную соль алкилкалия, с помощью соединений (15) в присутствии подходящего основания и подходящего катализатора в подходящем растворителе при температуре от 10 до 150°C. Примеры подходящих оснований включают карбонат калия, фосфат калия, карбонат натрия, карбонат цезия, бикарбонат натрия и фторид калия. Примеры подходящих катализаторов включают комплекс 1,1'-бис(дифенилфосфино)ферроцен]-дихлорпалладия(II) и дихлорметана [PdCl₂(dppf).DCM], [1,3-бис(2,6-ди-3-пентилфенил)имидазол-2-илиден](3-хлорпиридил)дихлорпалладий(II) [Pd-PEPPSI™-IPent], каталитическую систему, образованную *in-situ* из палладиевоциклического предкатализатора, такого как хлор(2-дициклогексилфосфино-2',6'-диизопропокси-1,1'-бифенил)[2-(2'-амино-1,1'-бифенил)]палладий(II) [RuPhos-Pd-G2], [дициклогексил[2',4',6'-трис(1-метилэтил)[1,1'-бифенил]-2-ил]фосфин](метансульфонато-кО)[2'-(метиламино-кN)[1,1'-бифенил]-2-ил-кС]палладий [XPhos-Pd-G4] и [(4-(N,N-диметиламино)фенил)ди-трет-бутилфосфин](метансульфонато-кО)[2'-(метиламино-кN)[1,1'-бифенил]-2-ил-кС]палладий [APhos-Pd-G4]. Примеры подходящих растворителей включают воду, 1,4-диоксан, тетрагидрофуран, ацетонитрил и толуол. Многие соединения (15) являются коммерчески доступными или могут быть получены с помощью известных способов. Примеры соединений (21), характеризующихся особой применимостью в протоколе реакции Сузуки, представляют собой сложные изобутириловые эфиры (21-i), где G представляет собой изобутирил.

Специалисту в данной области техники будет понятно, что условия протокола реакции Сузуки могут обеспечивать расщепление сложноэфирных групп, следовательно, схема реакции 19 также может описывать реакцию, где исходный материал (21) содержит сложноэфирный фрагмент [так что G представляет собой ацильную группу], а продукт (I-ii) не содержит [так что G представляет собой водород].

Схема реакции 20

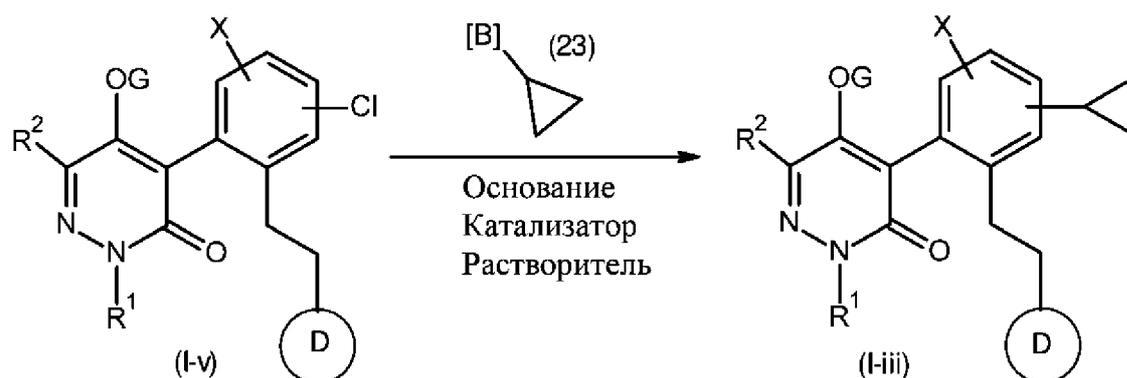


Соединения (21) можно получать путем гидроборирования алкенов (14-iii) с применением подходящего гидроборирующего реагента (22) в подходящем растворителе с необязательным добавлением подходящего катализатора при температуре от 0°C до 100°C. Примеры гидроборирующих реагентов включают боран, дихлорборан, дибромборан, 4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан [пинаколборан], 1,3,2-бензодиоксаборол [катехолборан] или 9-борилбицикло[3.3.1]нонан [9-BBN].

Примеры подходящих растворителей включают тетрагидрофуран, 2-метилтетрагидрофуран, 1,4-диоксан, 2-метокси-2-метил-пропан [MTBE] и диэтиловый эфир. Примеры подходящих катализаторов включают каталитическую систему, образованную *in situ* из дихлорида бис(1,5-циклооктадиен)диридия(I) [[Ir(COD)Cl]₂], и 4-дифенилфосфанилбутил(дифенил)фосфан [DPPB] [*J. Am. Chem. Soc.*, **2004**, *126*, 9200-9201].

Если [B] представляет собой сложный алкилбороновый эфир, то его можно преобразовывать в соответствующую бороновую кислоту путем обработки метилбороновой кислотой [MeB(OH)₂] и трифторуксусной кислотой в подходящем растворителе, таком как дихлорметан [DCM], при значениях температуры от 0 до 40°C [*Org. Lett.*, **2019**, *21*, 3048-3052]. Если [B] представляет собой алкилбороновую кислоту или ее сложный эфир, то их можно преобразовывать в соответствующую трифторборатную соль алкилкалиия путем обработки гидрофторидом калия в подходящем растворителе, таком как метанол или ацетон, при значениях температуры от 0 до 40°C.

Схема реакции 21



Соединения (I-iii), где Y представляет собой циклопропил, можно получать путем обработки соединений (I-v) соединениями (23), где [B] может представлять собой триалкилборан, алкилбороновую кислоту, сложный алкилбороновый эфир или трифторборатную соль алкилкалия, причем соединениями в присутствии подходящего основания и подходящего катализатора в подходящем растворителе при температуре от 10 до 150°C. Соединения (I-v) представляют собой соединения формулы (I), в которых С представляет собой -CH₂-CH₂-, G представляет собой C(O)R³, и Y представляет собой -Cl. Примеры подходящих оснований включают карбонат калия, фосфат калия, карбонат натрия, карбонат цезия, бикарбонат натрия и фторид калия. Примеры подходящих катализаторов включают комплекс 1,1'-бис(дифенилфосфино)ферроцен]-дихлорпалладия(II) и дихлорметана [PdCl₂(dppf).DCM], [1,3-бис(2,6-ди-3-пентилфенил)имидазол-2-илиден](3-хлорпиридил)дихлорпалладий(II) [Pd-PEPPSI™-IPent], каталитическую систему, образованную *in-situ* из палладиевоциклического предкатализатора, такого как хлор(2-дициклогексилфосфино-2',6'-диизопропокси-1,1'-бифенил)[2-(2'-амино-1,1'-бифенил)]палладий(II) [RuPhos-Pd-G2], [дициклогексил[2',4',6'-трис(1-метилэтил)[1,1'-бифенил]-2-ил]фосфин](метансульфонато-кO)[2'-(метиламино-кN)[1,1'-бифенил]-2-ил-кC]палладий [XPhos-Pd-G4] и [(4-(N,N-диметиламино)фенил)ди-трет-бутилфосфин](метансульфонато-кO)[2'-(метиламино-кN)[1,1'-бифенил]-2-ил-кC]палладий [APhos-Pd-G4]. Примеры подходящих растворителей включают воду, 1,4-диоксан, тетрагидрофуран, ацетонитрил и толуол. Примеры соединений (I-v), характеризующихся особой применимостью в протоколе реакции Сузуки, представляют собой сложные изобутириловые эфиры (I-v), где G представляет собой изобутирил.

Специалисту в данной области техники будет понятно, что условия протокола реакции Сузуки могут обеспечивать расщепление сложноэфирных групп, следовательно, схема реакции 21 может описывать реакцию, где исходный материал (I-v) содержит сложноэфирный фрагмент [так что G представляет собой ацильную группу], а продукт (I-iii) не содержит [так что G представляет собой водород].

Соединения формулы (I) согласно настоящему изобретению можно применять сами по себе в качестве гербицидов, но обычно их составляют в гербицидные композиции с применением вспомогательных средств для составления, таких как носители, растворители и поверхностно-активные средства (SFA). Таким образом, настоящее изобретение дополнительно предусматривает гербицидную композицию, содержащую гербицидное соединение по любому из пунктов формулы изобретения и приемлемое с точки зрения сельского хозяйства вспомогательное средство для составления. Композиция может быть представлена в форме концентратов, которые разбавляют перед применением, хотя также можно получать готовые к применению композиции. Конечное разбавление обычно выполняют с использованием воды, но также его можно выполнять с использованием вместо воды или в дополнение к воде, например, жидких удобрений, питательных микроэлементов, биологических организмов, масла или растворителей.

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 можно выбрать из ряда типов составов, многие из которых известны из Руководства по разработке и применению спецификаций FAO по препаратам для защиты растений (Manual on Development and Use of FAO Specifications for Plant Protection Products, 5th Edition, 1999). Таковые включают распыляемые порошки (DP), растворимые порошки (SP), водорастворимые гранулы (SG), диспергируемые в воде гранулы (WG), смачиваемые порошки (WP), гранулы (GR) (с медленным или быстрым высвобождением), растворимые концентраты (SL), смешиваемые с маслом жидкости (OL), жидкости, применяемые в сверхнизком объеме (UL), эмульгируемые концентраты (EC), диспергируемые концентраты (DC), эмульсии (как типа "масло в воде" (EW), так и типа "вода в масле" (EO)), микроэмульсии (ME), суспензионные концентраты (SC), аэрозоли, капсульные суспензии (CS) и составы для обработки семян. Выбранный тип состава в любом случае будет зависеть от

конкретного предусматриваемого назначения, а также физических, химических и биологических свойств соединения формулы (I).

5 Распыляемые порошки (DP) можно получать посредством смешивания соединения формулы (I) с одним или несколькими твердыми разбавителями (например, природными глинами, каолином, пиррофиллитом, бентонитом, глиноземом, монтмориллонитом, кизельгуром, мелом, диатомовыми землями, фосфатами кальция, карбонатами кальция и магния, серой, известью, тонкодисперсными порошками, тальком и другими органическими и неорганическими твердыми носителями) и механического измельчения смеси в мелкий порошок.

10 Растворимые порошки (SP) можно получать путем смешивания соединения формулы (I) с одной или несколькими растворимыми в воде неорганическими солями (такими как бикарбонат натрия, карбонат натрия или сульфат магния) или с одним или несколькими растворимыми в воде органическими твердыми веществами (такими как полисахарид) и необязательно с одним или несколькими смачивающими средствами, 15 одним или несколькими диспергирующими средствами или смесью указанных средств для улучшения диспергируемости/растворимости в воде. Затем смесь измельчают до мелкодисперсного порошка. Подобные композиции можно также гранулировать с образованием водорастворимых гранул (SG).

20 Смачиваемые порошки (WP) можно 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 жидкостях. Затем смесь измельчают до мелкодисперсного порошка. Подобные 25 композиции также можно гранулировать с образованием диспергируемых в воде гранул (WG).

30 Гранулы (GR) могут быть образованы либо посредством гранулирования смеси соединения формулы (I) и одного или нескольких порошкообразных твердых 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 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, простые эфиры, кетоны и сложные эфиры) и средства, способствующие прилипанию (такие как поливинилацетаты, поливиниловые спирты, декстрины, сахара и растительные масла). В гранулы также можно включать одну или несколько других добавок (например, эмульгирующее средство, смачивающее средство или диспергирующее средство).

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

Эмульгируемые концентраты (EC) 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). Подходящие органические растворители для применения в EC включают ароматические углеводороды (такие как алкилбензолы или алкилнафталины, например, 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, фурфуроловый спирт или бутанол), N-алкилпирролидоны (такие как N-метилпирролидон или N-октилпирролидон), диметиламины жирных кислот (такие как диметиламид C₈-C₁₀жирной кислоты) и хлорированные углеводороды. EC-продукт может самопроизвольно образовывать эмульсию при добавлении в воду с получением эмульсии, обладающей достаточной стабильностью, что позволяет наносить ее распылением с помощью соответствующего оборудования.

Получение EW включает получение соединения формулы (I) либо в виде жидкости (если оно не является жидкостью при комнатной температуре, его можно расплавить при допустимой температуре, как правило, ниже 70°C), либо в растворе (посредством растворения его в соответствующем растворителе), а затем эмульгирование полученной жидкости или раствора в воде, содержащей одно или несколько SFA, с высоким усилием 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 растворители, которые характеризуются низкой растворимостью в воде.

5 Микроэмульсии (ME) можно получать путем смешивания воды со смесью одного или нескольких растворителей с одним или несколькими SFA с самопроизвольным образованием термодинамически стабильного изотропного жидкого состава. Соединение формулы (I) изначально присутствует либо в воде, либо в смеси
10 растворитель/SFA. 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
15 является подходящей для разбавления в воде, при этом она либо остается в виде микроэмульсии, либо образует обычную эмульсию типа "масло в воде".

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

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
30 водой жидкости, такой как *n*-пропанол) с получением композиций, предназначенных для применения в не находящихся под давлением насосах для опрыскивания с ручным управлением.

Капсульные суспензии (CS) можно получать аналогично получению составов EW, но с дополнительной стадией полимеризации с получением водной дисперсии

капель масла, в которой каждая капля масла инкапсулируется полимерной оболочкой и содержит соединение формулы (I) и необязательно его носитель или разбавитель. Полимерную оболочку можно получать либо с помощью осуществления реакции межфазной поликонденсации, либо с помощью процедуры коацервации. Композиции могут обеспечивать контролируемое высвобождение соединения формулы (I), и их можно применять для обработки семян. Соединение формулы (I) также может быть составлено в биоразлагаемую полимерную матрицу для обеспечения медленного контролируемого высвобождения соединения.

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 средства (SFA), добавки для опрыскивания на основе масел, например, определенные минеральные масла или природные растительные масла (такие как соевое и рапсовое масло), 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 SFA катионного, анионного, амфотерного или неионогенного типа.

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

Подходящие анионные SFA 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 диизопропил- и триизопропилнафталинсульфонатов 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 и лигносульфонаты.

Подходящие SFA амфотерного типа включают бетаины, пропионаты и глицинаты.

5 Подходящие SFA 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
10 гексита; продукты конденсации указанных неполных сложных эфиров с этиленоксидом; блок-сополимеры (содержащие этиленоксид и пропиленоксид); алканоламида; сложные эфиры с простой структурой (например, сложные эфиры жирной кислоты и полиэтиленгликоля); аминоксиды (например, лаурилдиметиламиноксид) и лецитины.

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

Композиция по настоящему изобретению может дополнительно содержать по меньшей мере один дополнительный пестицид. Например, соединения в соответствии с настоящим изобретением также можно применять в комбинации с другими
20 гербицидами или регуляторами роста растений. В предпочтительном варианте осуществления дополнительным пестицидом является гербицид и/или антидот гербицида. Конкретные примеры таких смесей включают (где "I" представляет собой соединение формулы (I)): I + ацетохлор; I + ацифлуорфен (в том числе ацифлуорфен-натрий); I + аклонифен; I + аметрин; I + амикарбазон; I + аминопиралид; I +
25 аминотриазол; I + атразин; I + бефлубутамид-М; I + бенквитрион; I + бенсульфурон (в том числе бенсульфурон-метил); I + бентазон; I + бициклопирон; I + биланафос; I + биспирибак-натрий; I + бикслозон; I + бромацил; I + бромоксинил; I + бутахлор; I + бутафенацил; I + карфентразон (в том числе карфентразон-этил); I + клорансулам (в том числе клорансулам-метил); I + хлоримурон (в том числе хлоримурон-этил); I +
30 хлортолурун; I + хлорсульфурон; I + цинметилин; I + клацифос; I + клетодим; I + клодинафоп (в том числе клодинафоп-пропаргил); I + кломазон; I + клопиралид; I + циклопиранил; I + циклопириморат; I + циклосульфамурон; I + цигалофоп (в том числе цигалофоп-бутил); I + 2,4-D (в том числе ее холиновую соль и сложный 2-этилгексиловый эфир); I + 2,4-DB; I + десмедифам; I + дикамба (в том числе ее соли с

алюминием, аминопропилом, бис-аминопропилметилом, холином, дихлорпропом, дигликольамином, диметиламином, диметиламмонием, калием и натрием); I + диклосулам; I + дифлуфеникан; I + дифлуфензопир; I + диметахлор; I + диметенамид-Р; I + дикват дибромид; I + диурон; I + эпирифенацил; I + эталфлуралин; I + этофумезат; I + феноксапроп (в том числе феноксапроп-Р-этил); I + феноксасульффон; I + фенквинотрион; I + фентразамид; I + флазасульфурон; I + флорасулам; I + флорпирауксифен (в том числе флорпирауксифен-бензил); I + флуазифоп (в том числе флуазифоп-Р-бутил); I + флукарбазон (в том числе флукарбазон-натрий); I + флуфенацет; I + флуметсулам; I + флумиоксазин; I + флуометурон; I + флупирсульфурон (в том числе флупирсульфурон-метил-натрий); I + флуорокспир (в том числе флуорокспир-метил); I + фомесафен; I + форамсульфурон; I + глюфосинат (в том числе его аммониевую соль); I + глифосат (в том числе его диаммониевые, изопропиламмониевые и калиевые соли); I + галауксифен (в том числе галауксифен-метил); I + галоксифоп (в том числе галоксифоп-метил); I + гексазион; I + гидантоцидин; I + имазамокс; I + имазапик; I + имазапир; I + имазетапир; I + индазифлам; I + йодосульфурон (в том числе йодосульфурон-метил-натрий); I + иофенсульфурон (в том числе иофенсульфурон-натрий); I + иоксинил; I + изопротурон; I + изоксафлютол; I + ланкотрион; I + МСРА; I + МСРВ; I + мекопроп-Р; I + мезосульфурон (в том числе мезосульфурон-метил); I + мезотрион; I + метамитрон; I + метазахлор; I + метиозолин; I + метолахлор; I + метосулам; I + метрибузин; I + метсульфурон; I + напропамид; I + никосульфурон; I + норфлуразон; I + оксадиазон; I + оксасульфурон; I + оксифлуорфен; I + паракват дихлорид; I + пендиметалин; I + пеноксулам; I + фенмедифам; I + пихлорам; I + пиноксаден; I + претилахлор; I + примисульфурон-метил; I + прометрин; I + пропанил; I + пропаквизафоп; I + пропирисульфурон; I + пропизамид; I + просульфокарб; I + просульфурон; I + пираклонил; I + пирафлуфен (в том числе пирафлуфен-этил); I + пирасульфотол; I + пиридат; I + пирифталид; I + пиримисульфан; I + пироксасульффон; I + пироксулам; I + квинкlorак; I + квинмерак; I + квизалофоп (в том числе квизалофоп-Р-этил и квизалофоп-Р-тефурил); I + римсульфурон; I + сафлуфенацил; I + сетоксидим; I + симазин; I + S-металохлор; I + сульфентразон; I + сульфосульфурон; I + тебутиурон; I + тефурилтрион; I + темботрион; I + тербутилазин; I + тербутрин; I + тетфлупиролимет; I + тиенкарбазон; I + тифенсульфурон; I + тиафенацил; I + толпиралат; I + топрамезон; I + тралкоксидим; I + триафамон; I + триаллат; I + триасульфурон; I + трибенурон (в том числе трибенурон-метил); I + трихлопир; I + трифлорисульфурон (в том числе

трифлорсульфурон-натрий); I + трифлудимоксазин; I + трифлуралин; I + трифлосульфурон; I + 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; I + 4-гидрокси-1-метокси-5-метил-3-[4-

5 (трифторметил)-2-пиридил]имидазолидин-2-он; I + 4-гидрокси-1,5-диметил-3-[4-(трифторметил)-2-пиридил]имидазолидин-2-он; I + 5-этоксид-4-гидрокси-1-метил-3-[4-(трифторметил)-2-пиридил]имидазолидин-2-он; I + 4-гидрокси-1-метил-3-[4-(трифторметил)-2-пиридил]имидазолидин-2-он; I + 4-гидрокси-1,5-диметил-3-[1-метил-5-(трифторметил)пиразол-3-ил]имидазолидин-2-он; I + (4R)-1-(5-трет-бутилизоксазол-3-

10 ил)-4-этоксид-5-гидрокси-3-метил-имидазолидин-2-он; I + 3-[2-(3,4-диметоксифенил)-6-метил-3-оксо-пиридазин-4-карбонил]бицикло[3.2.1]октан-2,4-дион; I + 2-[2-(3,4-диметоксифенил)-6-метил-3-оксо-пиридазин-4-карбонил]-5-метил-циклогексан-1,3-дион; I + 2-[2-(3,4-диметоксифенил)-6-метил-3-оксо-пиридазин-4-

15 карбонил]циклогексан-1,3-дион; I + 2-[2-(3,4-диметоксифенил)-6-метил-3-оксо-пиридазин-4-карбонил]-5,5-диметил-циклогексан-1,3-дион; I + 6-[2-(3,4-диметоксифенил)-6-метил-3-оксо-пиридазин-4-карбонил]-2,2,4,4-тетраметил-

циклогексан-1,3,5-трион; I + 2-[2-(3,4-диметоксифенил)-6-метил-3-оксо-пиридазин-4-карбонил]-5-этил-циклогексан-1,3-дион; I + 2-[2-(3,4-диметоксифенил)-6-метил-3-оксо-

20 пиридазин-4-карбонил]-4,4,6,6-тетраметил-циклогексан-1,3-дион; I + 2-[6-циклопропил-2-(3,4-диметоксифенил)-3-оксо-пиридазин-4-карбонил]-5-метил-

циклогексан-1,3-дион; I + 3-[6-циклопропил-2-(3,4-диметоксифенил)-3-оксо-пиридазин-

4-карбонил]бицикло[3.2.1]октан-2,4-дион; I + 2-[6-циклопропил-2-(3,4-

25 диметоксифенил)-3-оксо-пиридазин-4-карбонил]-5,5-диметил-циклогексан-1,3-дион; I + 6-[6-циклопропил-2-(3,4-диметоксифенил)-3-оксо-пиридазин-4-карбонил]-2,2,4,4-

тетраметил-циклогексан-1,3,5-трион; I + 2-[6-циклопропил-2-(3,4-диметоксифенил)-3-

оксо-пиридазин-4-карбонил]циклогексан-1,3-дион; I + 4-[2-(3,4-диметоксифенил)-6-

метил-3-оксо-пиридазин-4-карбонил]-2,2,6,6-тетраметил-тетрагидропиран-3,5-дион; I +

4-[6-циклопропил-2-(3,4-диметоксифенил)-3-оксо-пиридазин-4-карбонил]-2,2,6,6-

30 тетраметил-тетрагидропиран-3,5-дион; I + 4-амино-3-хлор-5-фтор-6-(7-фтор-1H-индол-

6-ил)пиридин-2-карбоновую кислоту (в том числе 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); I + 3-этилсульфанил-N-(1,3,4-оксадиазол-2-ил)-5-

(трифторметил)-[1,2,4]триазоло[4,3-а]пиридин-8-карбоксамид; I + 3-(изопропилсульфанилметил)-N-(5-метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил)-5-(трифторметил)-[1,2,4]триазоло[4,3-а]пиридин-8-карбоксамид; I + 3-(изопропилсульфонилметил)-N-(5-метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил)-5-(трифторметил)-[1,2,4]триазоло[4,3-а]пиридин-8-карбоксамид; I + 3-(этилсульфонилметил)-N-(5-метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил)-5-(трифторметил)-[1,2,4]триазоло[4,3-а]пиридин-8-карбоксамид; I + этил-2-[[3-[[3-хлор-5-фтор-6-[3-метил-2,6-диоксо-4-(трифторметил)пиримидин-1-ил]-2-пиридил]окси]ацетат; I + 6-хлор-4-(2,7-диметил-1-нафтил)-5-гидрокси-2-метил-пиридазин-3-он; I + 1-[2-хлор-6-(5-хлорпиримидин-2-ил)окси-фенил]-4,4,4-трифтор-бутан-1-он и I + 5-[2-хлор-6-(5-хлорпиримидин-2-ил)окси-фенил]-3-(дифторметил)изоксазол.

Компоненты, смешиваемые с соединением формулы (I), также могут находиться в форме сложных эфиров или солей, как упоминается, например, в *The Pesticide Manual, Fourteenth Edition, British Crop Protection Council, 2006*.

Соединение формулы (I) также можно применять в смесях с другими агрохимическими средствами, такими как фунгициды, нематоциды или инсектициды, примеры которых приведены в *The Pesticide Manual*.

Соотношение в смеси соединения формулы (I) и смешиваемого с ним компонента предпочтительно составляет от 1: 100 до 1000:1.

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

Соединения формулы (I) по настоящему изобретению могут также быть объединены с антитоксинами гербицидов. Предпочтительные комбинации (где "I" представляет собой соединение формулы (I)) включают:

I + беноксакор, I + клоквинтосет (в том числе клоквинтосет-мексил), I + ципросульфамид, I + дихлормид, I + фенхлоразол (в том числе фенхлоразол-этил), I + фенклорим, I + флуксофеним, I + фурилазол, I + изоксадифен (в том числе изоксадифен-этил), I + мефенпир (в том числе мефенпир-диэтил), I + меткамифен и I + оксабетринил.

В частности, предпочтительными являются смеси соединения формулы (I) с ципросульфамидом, изоксадифеном (в том числе изоксадифен-этилом), клоквинтосетом (в том числе клоквинтосет-мексилом) и/или N-(2-метоксибензоил)-4-[(метиламинокарбонил)амино]бензолсульфонамидом.

Антидоты соединения формулы (I) также могут находиться в форме сложных эфиров или солей, как упоминается, например, в The Pesticide Manual, 14th Edition (BCPC), 2006. 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, а ссылка на фенхлоразол-этил также относится к фенхлоразолу и т. д.

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

Соединение формулы (I) также можно применять в смесях с другими агрохимическими средствами, такими как фунгициды, нематоциды или инсектициды, примеры которых приведены в The Pesticide Manual.

Соотношение в смеси соединения формулы (I) и смешиваемого с ним компонента предпочтительно составляет от 1: 100 до 1000:1.

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

Настоящее изобретение, кроме того, дополнительно предусматривает способ избирательного контроля сорняков в месте произрастания 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. Обычно растениями, подлежащими контролю, являются нежелательные растения (сорняки). "Место произрастания" означает территорию, на которой растения произрастают или будут произрастать.

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 сельскохозяйственной культурой. Соединения формулы I в соответствии с настоящим изобретением обычно применяют при норме от 10 до 2000 г/га, в частности от 50 до 1000 г/га.

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

5 Полезные растения, по отношению к которым можно применять композицию в соответствии с настоящим изобретением, включают сельскохозяйственные культуры, такие как зерновые, например, ячмень и пшеница, хлопчатник, масличный рапс, подсолнечник, маис, рис, соя, сахарная свекла, сахарный тростник и дерновой покров.

10 Культурные растения могут также включать деревья, такие как плодовые деревья, пальмовые деревья, кокосовые пальмы или другие орехоплодные культуры. Также включены вьющиеся растения, такие как виноград, плодовые кустарники, плодовые растения и овощные культуры.

15 Следует понимать, что сельскохозяйственные культуры также включают те сельскохозяйственные культуры, которым придали толерантность к гербицидам или классам гербицидов (например, ALS-, GS-, EPSPS-, PPO-, ACCаза- и HPPD-ингибиторы) с помощью традиционных способов селекции или с помощью генетической инженерии. Примером сельскохозяйственной культуры, которой придали толерантность к имидазолинонам, например имазамоксу, с помощью традиционных способов селекции, является сурепица (канола) Clearfield®. Примеры сельскохозяйственных культур, 20 которым придали толерантность к гербицидам с помощью способов генетической инженерии, включают, например, устойчивые к глифосату и глюфосинату сорта маиса, коммерчески доступные под товарными знаками RoundupReady® и LibertyLink®. В особенно предпочтительном аспекте культурное растение модифицировали с помощью методик генетической инженерии для сверхэкспрессии 25 гомогентизатсоланезилтрансферазы, как указано, например, в WO 2010/029311.

30 Под сельскохозяйственными культурами также следует понимать те, которым с помощью способов генетической инженерии была придана устойчивость к вредоносным насекомым, например, Bt-маис (устойчивый к мотыльку кукурузному), Bt-хлопчатник (устойчивый к долгоносику хлопковому), а также разновидности Bt-картофеля (устойчивые к колорадскому жуку). Примерами Bt-маиса являются гибриды маиса Bt 176 NK® (Syngenta Seeds). Токсин Bt представляет собой белок, который в природе образуют почвенные бактерии *Bacillus thuringiensis*. Примеры токсинов или трансгенных растений, способных синтезировать такие токсины, описаны в EP-A-451 878, EP-A-374 753, WO 93/07278, WO 95/34656, WO 03/052073 и EP-A-427 529.

Примерами трансгенных растений, содержащих один или несколько генов, кодирующих устойчивость к насекомым, и экспрессирующих один или несколько токсинов, являются KnockOut® (маис), Yield Gard® (маис), NuCOTIN33B® (хлопчатник), Bollgard® (хлопчатник), NewLeaf® (виды картофеля), NatureGard® и Protexcta®. Растительные культуры или их семенной материал могут быть устойчивыми к гербицидам и в то же время устойчивыми к поеданию насекомыми (трансгенные объекты с "пакетированными" генами). Например, семя может обладать способностью экспрессировать инсектицидный белок Cгу3, в то же время будучи толерантным к глифосату.

10 Также следует понимать, что сельскохозяйственные культуры включают те, которые получены традиционными способами селекции или генетической инженерии и обладают так называемыми привнесенными признаками (например, улучшенной стабильностью при хранении, более высокой питательной ценностью и улучшенным вкусом).

15 Другие полезные растения включают газонную траву, например, на площадках для гольфа, лужайках, в парках и на обочинах дороги или коммерчески выращиваемую для газона, и декоративные растения, такие как цветы или кустарники.

Композиции можно применять для контроля нежелательных растений (обобщенно "сорняков"). Сорняки, подлежащие контролю, включают как однодольные виды, например, *Agrostis*, *Alopecurus*, *Avena*, *Brachiaria*, *Bromus*, *Cenchrus*, *Cyperus*, *Digitaria*, *Echinochloa*, *Eleusine*, *Lolium*, *Monochoria*, *Rottboellia*, *Sagittaria*, *Scirpus*, *Setaria* и *Sorghum*, так и двудольные виды, например, *Abutilon*, *Amaranthus*, *Ambrosia*, *Chenopodium*, *Chrysanthemum*, *Conyza*, *Galium*, *Ipomoea*, *Nasturtium*, *Sida*, *Sinapis*, *Solanum*, *Stellaria*, *Veronica*, *Viola* и *Xanthium*. Сорняки также включают растения, которые можно считать культурными растениями, но которые произрастают за пределами посевной площади ("беглецы"), или которые произрастают из семян, оставшихся от предыдущего посева другой сельскохозяйственной культуры ("растения-самосевы"). Такие "растения-самосевы" или "беглецы" могут быть толерантными к некоторым другим гербицидам.

30 Различные аспекты и варианты осуществления настоящего изобретения далее будут более подробно проиллюстрированы с помощью примера. Следует понимать, что можно осуществлять модификацию некоторых элементов без отступления от объема настоящего изобретения.

Типичные аббревиатуры, используемые в данном документе, включают следующие.

br = широкий Dba

^tBu = трет-бутил

5 d = дуплет

dba = дибензилиденацетон

DCM = дихлорметан

DMSO = диметилсульфоксид

DPPA = дифенилфосфорилазид

10 Et₂O = диэтиловый эфир

EtOAc = этилацетат

ч = час

m = мультиплет

Me = метил

15 MeOH = метанол

Ph = фенил

ⁱPr = изопропил

к. т. = комнатная температура

s = синглет

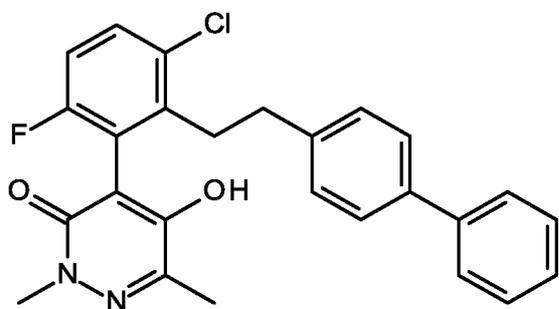
20 t = триплет

THF = тетрагидрофуран

ПРИМЕРЫ ПОЛУЧЕНИЯ

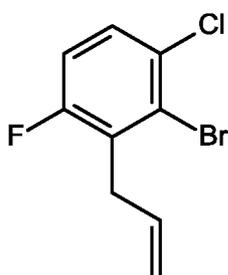
Пример 1. Получение 4-[3-хлор-6-фтор-2-[2-(4-фенилфенил)этил]фенил]-5-гидрокси-2,6-диметил-пиридазин-3-она (А-1.027)

25



1.1 3-Аллил-2-бром-1-хлор-4-фтор-бензол

Раствор диизопропиламида лития (2 М в тетрагидрофуране, 3,6 мл, 7,2 ммоль) охлаждали до -78°C в атмосфере азота. Добавляли по каплям раствор 2-бром-1-хлор-4-фторбензола (1,0 г, 4,8 ммоль) в тетрагидрофуране при -78°C . Смесь перемешивали в течение 45 минут при такой же температуре перед обработкой аллилбромидом (0,3 мл, 5,7 ммоль). Обеспечивали продолжение реакции при -78°C в течение 2 ч., затем обеспечивали нагревание до комнатной температуры. Реакцию гасили с помощью насыщ. раствора NH_4Cl (водн.) и экстрагировали этилацетатом. Органические вещества отделяли и оставляли, затем промывали солевым раствором. Органические вещества высушивали над сульфатом натрия и концентрировали при пониженном давлении с получением 3-аллил-2-бром-1-хлор-4-фтор-бензола (1,2 г, 100%) в виде масла.



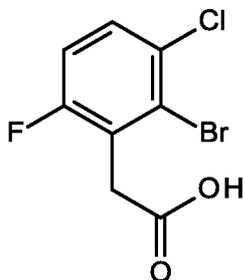
^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ_{H} : 7,34-7,30 (m, 1H), 7,01-6,96 (m, 1H), 5,94-5,83 (m, 1H), 5,10-5,00 (m, 2H), 3,64-3,58 (m, 2H).

1.2 2-(2-Бром-3-хлор-6-фтор-фенил)уксусная кислота

Раствор 3-аллил-2-бром-1-хлор-4-фтор-бензола (15,0 г, 60,1 ммоль) в дихлорметане (200 мл) в 2-горлой колбе охлаждали до -78°C . Горло с одной стороны соединяли с ловушкой, содержащей водный раствор KI . Через раствор барботировали озон, пока исходный материал не был полностью израсходован (5 часов). Через раствор в течение 10 минут барботировали воздух для удаления избытка озона. Добавляли диметилсульфид (44 мл, 601 ммоль) и обеспечивали нагревание смеси до комнатной температуры. Обеспечивали продолжение реакции в течение 16 ч. при комнатной температуре.

Смесь промывали солевым раствором (2 x 100 мл) и органический слой оставляли. Органические вещества высушивали над Na_2SO_4 , фильтровали и концентрировали при пониженном давлении с получением неочищенного 2-(2-бром-3-хлор-6-фтор-фенил)ацетальдегида (15,3 г), который применяли для следующей стадии без дополнительной очистки.

Неочищенный 2-(2-бром-3-хлор-6-фтор-фенил)ацетальдегид (15,3 г, 60,8 ммоль) растворяли в смеси *трет*-бутанола (92 мл) и воды (46 мл), затем охлаждали до 0°C. Добавляли 2-метилбут-2-ен (64,5 мл, 608 ммоль), дигидрофосфат натрия (34,6 г, 243 ммоль) и хлорит натрия (16,5 г, 163 ммоль). Смесь перемешивали в течение 2 ч, затем разбавляли солевым раствором (150 мл) и 2 М хлористоводородной кислотой (150 мл). Смесь экстрагировали этилацетатом (3 x 100 мл). Объединенные органические экстракты промывали насыщенным водным раствором метабисульфита натрия (100 мл), затем высушивали над Na₂SO₄, фильтровали и концентрировали при пониженном давлении с получением бледно-желтого твердого вещества. Неочищенное твердое вещество растворяли в смеси воды (100 мл) и 2,0 М NaOH (30 мл). Водный раствор промывали этилацетатом (100 мл), а органические вещества удаляли. Водный слой подкисляли путем добавления концентрированной хлористоводородной кислоты (20 мл), что привело к образованию белой суспензии. Смесь экстрагировали этилацетатом (3 x 200 мл). Объединенные органические вещества промывали солевым раствором, высушивали над Na₂SO₄, фильтровали и выпаривали с получением 2-(2-бром-3-хлор-6-фтор-фенил)уксусной кислоты (8,0 г, 49%) в виде белого твердого вещества.

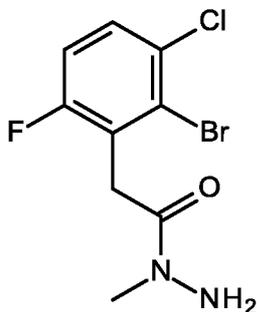


¹H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ_H : 12,79 (br.s, 1H), 7,67-7,59 (m, 1H), 7,39-7,31 (m, 1H), 3,82 (s, 2H).

1.3. 2-(2-Бром-3-хлор-6-фтор-фенил)-*N*-метил-ацетогидразид

К перемешиваемому раствору 2-(2-бром-3-хлор-6-фтор-фенил)уксусной кислоты (2,0 г, 7,5 ммоль) в дихлорметане (20 мл) при 0°C добавляли *N*-(3-диметиламинопропил)-*N'*-этилкарбодиимида гидрохлорид [EDC.HCl] (1,4 г, 9,0 ммоль) с последующим добавлением по каплям метилгидразина (0,4 мл, 7,5 ммоль). Температуру реакционной смеси поддерживали на уровне 0°C в течение 3 ч. Затем реакцию гасили с помощью воды и экстрагировали в дихлорметан. Органические вещества отделяли, промывали солевым раствором и высушивали над Na₂SO₄.

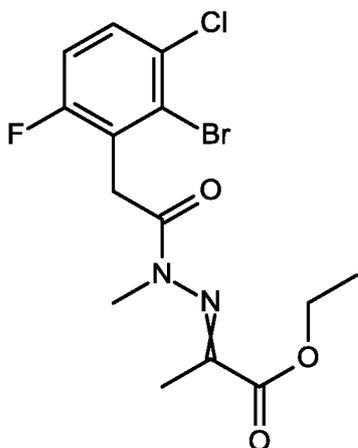
Концентрирование при пониженном давлении обеспечивало получение неочищенного 2-(2-бром-3-хлор-6-фтор-фенил)-*N*-метил-ацетогидразида (1,8 г, 81%), который применяли на следующей стадии без дополнительной очистки.



- 5 ^1H ЯМР (400 МГц, DMSO- d_6) δ_{H} : 7,59 (dd, $J=8,9$ и $5,4$, 1H), 7,30 (t, $J=8,9$, 1H), 4,91 (s, 2H), 4,10 (br. s, 2H), 3,02 (s, 3H).

1.4 Сложный этиловый эфир 2-{{2-(2-бром-3-хлор-6-фтор-фенил)-ацетил}-метил-гидразоно}-пропионовой кислоты

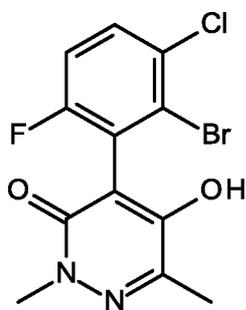
- 10 К перемешиваемому раствору 2-(2-бром-3-хлор-6-фтор-фенил)-*N*-метилацетогидразида (1,8 г, 6,09 ммоль) в этаноле (5 мл) по каплям добавляли этилпируват (0,7 мл, 6,7 ммоль). Реакционную смесь нагревали при 80°C в течение 4 ч. Затем обеспечивали охлаждение реакционной смеси до комнатной температуры и выпаривали при пониженном давлении. Остаток очищали посредством колоночной
- 15 хроматографии на силикагеле (градиентное элюирование смесью этилацетат/гексан) с получением требуемого соединения, сложного этилового эфира 2-{{2-(2-бром-3-хлор-6-фтор-фенил)-ацетил}-метил-гидразоно}-пропионовой кислоты (1,8 г, 75%), в виде грязно-белого твердого вещества.



^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ_{H} : 7,40-7,35 (m, 1H), 7,04-6,98 (m, 1H), 4,32 (q, $J=7,1$, 2H), 4,24 (s, 2H), 3,41 (s, 3H), 2,32 (s, 3H), 1,36 (t, $J=7,1$, 3H).

1.5. 4-(2-Бром-3-хлор-6-фтор-фенил)-5-гидрокси-2,6-диметил-пиридазин-3-он

5 Сложный этиловый эфир 2-{[2-(2-бром-3-хлор-6-фтор-фенил)-ацетил]-метил-гидразино}-пропионовой кислоты (500 мг, 1,27 ммоль) растворяли в ацетонитриле (2,5 мл) и обрабатывали 1,8-диазабицикло[5.4.0]ундец-7-еном [DBU] (0,47 мл, 3,2 ммоль). Смесь нагревали до 125°C с помощью микроволнового излучения в течение 1 ч. Затем реакционную смесь выпаривали при пониженном давлении. Остаток
10 растворяли в воде и подкисляли до pH 1 с помощью 2 н. хлористоводородной кислоты. Смесь экстрагировали с помощью DCM, органические вещества отделяли и промывали соевым раствором. Органический раствор высушивали над Na_2SO_4 и концентрировали при пониженном давлении с получением неочищенного продукта. Неочищенное
15 вещество очищали посредством колоночной хроматографии на силикагеле (градиентное элюирование смесью этилацетат/гексан) с получением 4-(2-бром-3-хлор-6-фтор-фенил)-5-гидрокси-2,6-диметил-пиридазин-3-она (340 мг, 77,1%) в виде грязно-белого твердого вещества.



^1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d_6) δ_{H} : 11,01 (s, 1H), 7,77-7,73 (m, 1H), 7,39 (t, $J=8,7$, 1H), 3,58 (s, 3H), 2,24 (s, 3H).

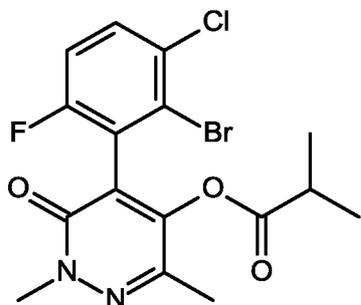
20

1.6 [5-(2-Бром-3-хлор-6-фтор-фенил)-1,3-диметил-6-оксо-пиридазин-4-ил]-2-метилпропаноат

К перемешиваемому раствору 4-(2-бром-3-хлор-6-фтор-фенил)-5-гидрокси-2,6-диметил-пиридазин-3-она (1,4 г, 4,02 ммоль) в дихлорметане (32 мл) при к. т. добавляли триэтиламин (1,1 мл, 8,06 ммоль), 4-(диметиламино)пиридин [DMAP] (49 мг, 0,40 ммоль) и изобутирилхлорид (0,6 мл, 4,83 ммоль).
25

После завершения реакции реакционную смесь разбавляли дихлорметаном и водой. Органический слой отделяли, высушивали над Na_2SO_4 и концентрировали при

пониженном давлении с получением неочищенного продукта. Неочищенное вещество очищали посредством колоночной хроматографии на силикагеле (градиентное элюирование смесью этилацетат/гексан) с получением [5-(2-бром-3-хлор-6-фтор-фенил)-1,3-диметил-6-оксо-пиридазин-4-ил]-2-метилпропаноата (1,47 г, 87%).



5

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ_{H} : 7,51-7,47 (m, 1H), 7,10-7,05 (m, 1H), 3,82 (s, 3H), 2,60-2,55 (m, 1H), 2,25 (s, 3H), 1,02-0,98 (m, 6H).

1.7. 4-[3-Хлор-6-фтор-2-[(E)-2-(4-фенилфенил)винил]фенил]-5-гидрокси-2,6-диметил-пиридазин-3-он (А-2.027)

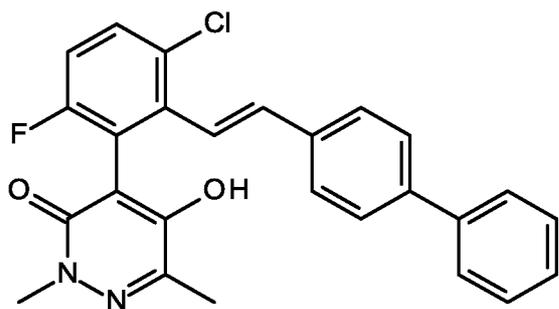
10

[5-(2-Бром-3-хлор-6-фтор-фенил)-1,3-диметил-6-оксо-пиридазин-4-ил]-2-метилпропаноат (0,54 г, 1,3 ммоль), K_2CO_3 (0,55 г, 3,9 ммоль), *транс*-2-(4-фенилфенил)винилбороновую кислоту (0,44 г, 2,00 ммоль), $\text{PdCl}_2(\text{dppf})\cdot\text{DCM}$ (53 мг, 0,065 ммоль), 1,4-диоксан (13 мл) и H_2O (3,3 мл) объединяли во флаконе для микроволновой обработки объемом 20 мл, затем нагревали при 140°C в течение 30 мин. в условиях микроволнового облучения.

15

Реакционную смесь концентрировали *in vacuo* с удалением 1,4-диоксана, затем разделяли между 2 н. HCl (водн.) и DCM . Органический слой отделяли и водный слой экстрагировали с помощью дополнительных порций DCM (x2). Объединенные органические вещества концентрировали *in vacuo* с получением неочищенного остатка, который очищали посредством колоночной хроматографии на силикагеле (градиентное элюирование смесью этилацетат/гексан) с получением 4-[3-хлор-6-фтор-2-[(E)-2-(4-фенилфенил)винил]фенил]-5-гидрокси-2,6-диметил-пиридазин-3-она (343 мг, 53 %, А-2.027)) в виде желтой пены.

20

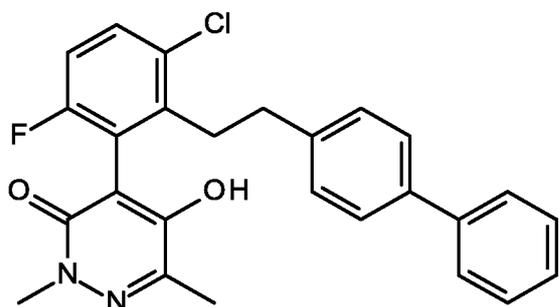


^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) $\delta = 7,59 - 7,33$ (m, 10H), 7,07 (t, $J = 8,6$ Гц, 1H), 7,01 (d, $J = 16,4$ Гц, 1H), 6,70 (d, $J = 16,5$ Гц, 1H), 5,63 (s, 1H), 3,73 (s, 3H), 2,28 (s, 3H)

5 **1.8. 4-(3-Хлор-6-фтор-2-фенэтил-фенил)-5-гидрокси-2,6-диметил-пиридазин-3-он (А-1.027)**

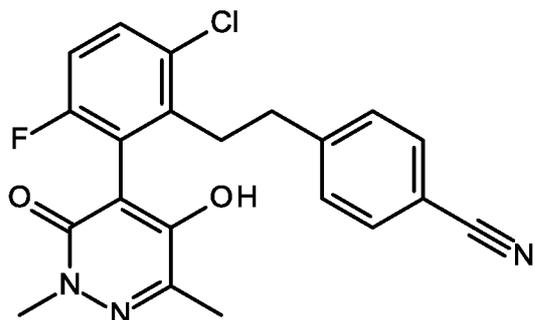
В круглодонную колбу объемом 10 мл добавляли 5% Pd/C (73 мг, 0,034 ммоль), затем раствор 4-[3-хлор-6-фтор-2-[(E)-2-(4-фенилфенил)винил]фенил]-5-гидрокси-2,6-диметил-пиридазин-3-она (308 мг, 0,69 ммоль) в DCM/MeOH 10:1 (об./об.) (4 мл).
10 Затем добавляли $\text{B}_2(\text{OH})_4$ (325 мг, 3,45 ммоль) и реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение ночи.

Затем реакционную смесь фильтровали через Celite® с элюированием с помощью смеси DCM/MeOH 10:1 (об./об.). Фильтрат путем сухой загрузки переносили на диоксид кремния и очищали посредством колоночной хроматографии на силикагеле (градиентное элюирование смесью этилацетат/гексан) с получением 4-[3-хлор-6-фтор-2-[2-(4-фенилфенил)этил]фенил]-5-гидрокси-2,6-диметил-пиридазин-3-она (299 мг, выход 97%, **A-1.027**) в виде желтого масла, которое затвердевало при отстаивании.



15 ^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) $\delta = 7,57 - 7,52$ (m, 2H), 7,50 - 7,40 (m, 5H), 7,37 - 7,30 (m, 1H), 7,07 (d, $J = 8,2$ Гц, 2H), 7,02 (t, $J = 8,6$ Гц, 1H), 5,47 (s, 1H), 3,75 (s, 3H), 2,88 - 2,80 (m, 3H), 2,27 (s, 3H)
20

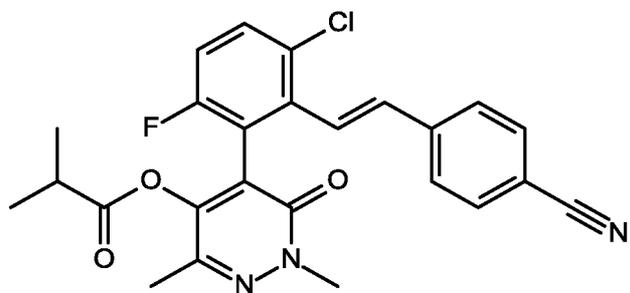
Пример 2. Получение 4-[2-[6-хлор-3-фтор-2-(5-гидрокси-2,6-диметил-3-оксо-пиридазин-4-ил)фенил]этил]бензонитрила (А-1.036)



5 2.1. [5-[3-Хлор-2-[(E)-2-(4-цианофенил)винил]-6-фтор-фенил]-1,3-диметил-6-оксо-пиридазин-4-ил]-2-метилпропаноат (4.036)

[5-(2-Бром-3-хлор-6-фтор-фенил)-1,3-диметил-6-оксо-пиридазин-4-ил]-2-метилпропаноат (1,10 г, 2,63 ммоль) [полученный, как описано в примере 1] и хлор[(три-трет-бутилфосфин)-2-(2-аминобифенил)]палладий(II) (68 мг, 0,13 ммоль) объединяли в дегазированном толуоле (12 мл). Затем добавляли 4-винилбензонитрил (408 мг, 3,16 ммоль) и основание Хунига (0,92 мл, 5,27 ммоль) и реакционную смесь нагревали до 95°C в течение 2,5 ч.

Обеспечивали охлаждение реакционной смеси до комнатной температуры, затем разбавляли дихлорметаном и фильтровали через целит, промывая с помощью дополнительного количества дихлорметана. Фильтрат концентрировали *in vacuo*, затем очищали посредством колоночной хроматографии на силикагеле (градиентное элюирование смесью этилацетат/гексан) с получением [5-[3-хлор-2-[(E)-2-(4-цианофенил)винил]-6-фтор-фенил]-1,3-диметил-6-оксо-пиридазин-4-ил]-2-метилпропаноата (781 мг, выход 64%, **А-4.036**) в виде белого твердого вещества.



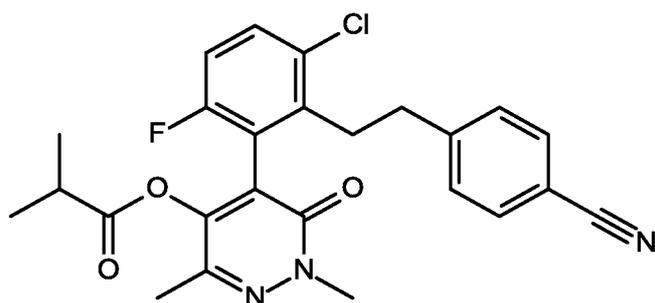
20 ^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,62 - 7,55 (m, 2H), 7,45 (dd, $J=5,0, 8,5$ Гц, 1H), 7,45 - 7,40 (m, 1H), 7,13 (d, $J=16,5$ Гц, 1H), 7,05 (t, $J=8,5$ Гц, 1H), 6,68 (d, $J=16,5$ Гц, 1H), 3,69 (s, 3H), 2,65 (spt, $J=7,0$ Гц, 1H), 2,23 (s, 3H), 1,11 (d, $J=7,0$ Гц, 3H), 1,07 (d, $J=7,0$ Гц, 3H).

2.2. [5-[3-Хлор-2-[2-(4-цианофенил)этил]-6-фтор-фенил]-1,3-диметил-6-оксо-пиридазин-4-ил]-2-метилпропаноат (А-3.036)

5 [5-[3-Хлор-2-[(E)-2-(4-цианофенил)винил]-6-фтор-фенил]-1,3-диметил-6-оксо-пиридазин-4-ил]-2-метилпропаноат (900 мг, 1,93 ммоль) подвергали каталитической гидрогенизации в EtOAc (20 мл) в присутствии катализатора 5% Pd/C (влажность 50%) (0,82 г) при давлении H₂ 4 бар.

10 Через 1,5 ч. LC/MS показала завершение реакции. Реакционную смесь фильтровали через слой Celite®, промывая этилацетатом. Фильтрат концентрировали *in-vacuo* с получением неочищенного остатка.

15 Остаток адсорбировали на диоксид кремния и очищали посредством колоночной хроматографии на силикагеле (градиентное элюирование смесью этилацетат/гексан) с получением [5-[3-хлор-2-[2-(4-цианофенил)этил]-6-фтор-фенил]-1,3-диметил-6-оксо-пиридазин-4-ил]-2-метилпропаноата (800 мг, выход 81%, **А-3.036**) в виде белого твердого вещества.



¹H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,56 - 7,51 (m, 2H), 7,42 (dd, J = 5,2, 8,9 Гц, 1H), 7,26 - 7,21 (m, 2H), 7,00 (t, J = 8,9 Гц, 1H), 3,84 (s, 3H), 3,02 - 2,92 (m, 1H), 2,91 - 2,80 (m, 2H), 2,75 - 2,65 (m, 1H), 2,54 (spt, J = 7,0 Гц, 1H), 2,25 (s, 3H), 0,98 (d, J = 7,0 Гц, 3H), 0,95 (d, J = 7,0 Гц, 3H).

20

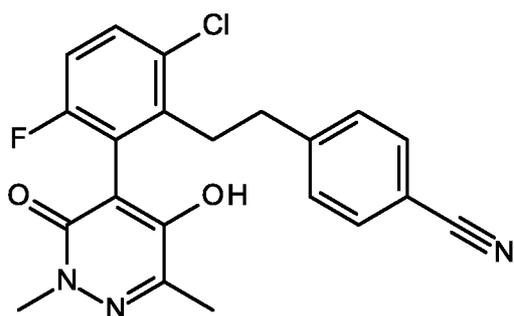
2.3. 4-[2-[6-Хлор-3-фтор-2-(5-гидрокси-2,6-диметил-3-оксо-пиридазин-4-ил)фенил]этил]бензонитрил (А-1.036)

25 [[5-[3-Хлор-2-[2-(4-цианофенил)этил]-6-фтор-фенил]-1,3-диметил-6-оксо-пиридазин-4-ил]-2-метилпропаноат (400 мг, 0,855 ммоль) растворяли в этаноле (6 мл). Смесь обрабатывали раствором гидроксида лития (108 мг, 2,56 ммоль) в воде (2 мл). Реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 2 ч.

Реакционную смесь концентрировали *in-vacuo* с удалением этанола. Оставшийся водный раствор разбавляли водой (15 мл), затем подкисляли до pH ~3 с помощью 2 М

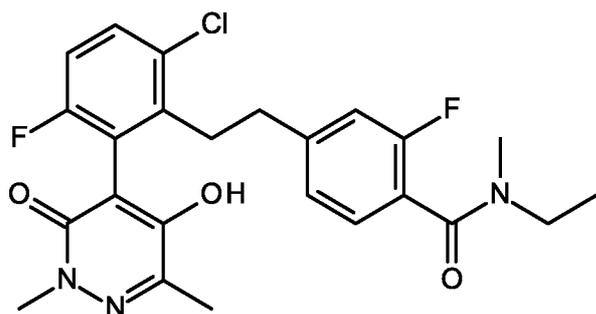
НCl и экстрагировали с помощью DCM (3 x 10 мл). Объединенные органические вещества высушивали над MgSO₄, фильтровали и концентрировали *in vacuo* с получением неочищенного продукта.

5 Неочищенный продукт очищали посредством колоночной хроматографии на силикагеле (градиентное элюирование смесью этилацетат/гексан) с получением 4-[2-[6-хлор-3-фтор-2-(5-гидрокси-2,6-диметил-3-оксо-пиридазин-4-ил)фенил]этил]бензонитрила (83 мг, выход 91%, **A-1.036**) в виде белого твердого вещества.



10 ¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ ppm 7,46 - 7,51 (m, 2 H) 7,26 - 7,31 (m, 1 H) 7,08 (d, J=8,19 Гц, 2 H) 6,86 (t, J=8,50 Гц, 1 H) 3,63 (s, 3 H) 2,61 - 2,77 (m, 4 H) 2,24 (s, 3 H).

15 **Пример 4. Получение 4-[2-[6-хлор-3-фтор-2-(5-гидрокси-2,6-диметил-3-оксо-пиридазин-4-ил)фенил]этил]-N-этил-2-фтор-N-метил-бензамида (A-1.028)**



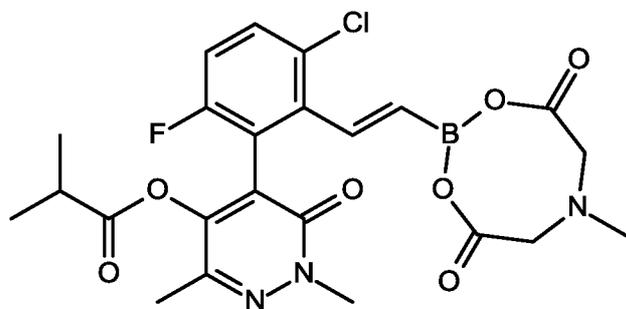
20 **4.1. [5-[3-Хлор-6-фтор-2-[(E)-2-(6-метил-4,8-диоксо-1,3,6,2-диоксазаборокан-2-ил)винил]фенил]-1,3-диметил-6-оксо-пиридазин-4-ил]-2-метилпропаноат [5-(2-Бром-3-хлор-6-фтор-фенил)-1,3-диметил-6-оксо-пиридазин-4-ил]-2-метилпропаноат (5,00 г, 11,97 ммоль, 1,0 экв.), 6-метил-2-винил-1,3,6,2-диоксазаборокан-4,8-дион (2,63 г, 14,36 ммоль, 1,2 экв.) и хлор[(три-трет-бутилфосфин)-2-(2-**

аминобифенил)]палладий(II) (307 мг, 0,60 ммоль, 0,05 экв.) загружали в круглодонную колбу объемом 250 мл, оснащенную холодильником, якорем магнитной мешалки и барботером для азота. Добавляли THF (100 мл) с последующим добавлением N,N-диизопропилэтиламина (4,2 мл, 23,94 ммоль, 2,0 экв.) против потока азота и смесь

5 нагревали до температуры образования флегмы в течение 3 ч.

Обеспечивали охлаждение реакционной смеси до комнатной температуры, затем разбавляли в DCM и фильтровали через Celite® с промыванием дополнительными порциями DCM. Элюент затем концентрировали до сухого состояния.

10 Неочищенный продукт очищали посредством колоночной флэш-хроматографии с получением [5-[3-хлор-6-фтор-2-[(E)-2-(6-метил-4,8-диоксо-1,3,6,2-диоксазаборокан-2-ил)винил]фенил]-1,3-диметил-6-оксо-пиридазин-4-ил]-2-метилпропаноата (5,91 г, 11,4 ммоль, выход 95%) в виде грязно-белого твердого вещества.



^1H ЯМР (400 МГц, DMSO- d_6) δ = 7,63 (dd, J = 5,1, 8,9 Гц, 1H), 7,31 (t, J = 8,9 Гц, 1H), 6,65 (d, J = 18,3 Гц, 1H), 5,68 (d, J = 18,3 Гц, 1H), 4,24 (dd, J = 11,9, 17,2 Гц, 2H), 3,95 - 3,83 (m, 2H), 3,70 (s, 3H), 2,66 (spt, J = 7,0 Гц, 1H), 2,16 (s, 3H), 0,90 (d, J = 7,0 Гц, 3H), 0,89 (d, J = 7,0 Гц, 3H)

15

4.2. [5-[3-Хлор-2-[2-[4-[этил(метил)карбамоил]-3-фтор-фенил]этил]-6-фтор-фенил]-1,3-диметил-6-оксо-пиридазин-4-ил]-2-метилпропаноат (А-3.028)

20 [5-[3-Хлор-6-фтор-2-[(E)-2-(6-метил-4,8-диоксо-1,3,6,2-диоксазаборокан-2-ил)винил]фенил]-1,3-диметил-6-оксо-пиридазин-4-ил]-2-метилпропаноат (500 мг, 0,96 ммоль), K_3PO_4 (886 мг, 3,85 ммоль) и комплекс 1,1-бис(дифенилфосфино)ферроцен]дихлорпалладия(II) и дихлорметана [$\text{PdCl}_2(\text{dppf})\cdot\text{DCM}$] (39 мг, 0,05 ммоль) добавляли во флакон для микроволновой обработки объемом 20 мл.

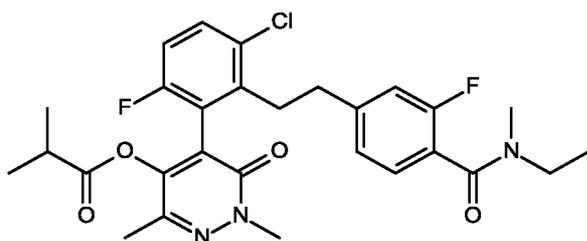
25 Добавляли THF (10 мл), 4-бром-N-этил-2-фтор-N-метил-бензамид (500 мг, 1,92 ммоль) и воду (0,35 мл), затем реакционную смесь нагревали до 100°C в течение 2 часов в условиях микроволнового облучения.

Реакционную смесь концентрировали *in vacuo* с удалением THF, затем разбавляли с помощью воды (20 мл) и DCM (20 мл). Органический слой отделяли и водный слой экстрагировали с помощью DCM (3 x 5 мл). Объединенные органические вещества высушивали и концентрировали *in vacuo* с получением неочищенного остатка, который очищали посредством колоночной хроматографии на силикагеле с градиентным элюированием смесью циклогексан/этилацетат с получением [5-[3-хлор-2-[(E)-2-[4-[этил(метил)карбамоил]-3-фтор-фенил]винил]-6-фтор-фенил]-1,3-диметил-6-оксо-пиридазин-4-ил]-2-метилпропаноата (397 мг, выход 76%, **A-4.028**) в виде грязно-белого твердого вещества.

[5-[3-Хлор-2-[(E)-2-[4-[этил(метил)карбамоил]-3-фтор-фенил]винил]-6-фтор-фенил]-1,3-диметил-6-оксо-пиридазин-4-ил]-2-метилпропаноат (300 мг, 0,55 ммоль) подвергали каталитической гидрогенизации в EtOAc (6 мл) в присутствии катализатора 5% Pd/C (влажность 50%) (0,12 г) при давлении H₂ 3 бар.

Через 5,5 ч. LC/MS показала завершение реакции. Реакционную смесь фильтровали через слой Celite®, промывая смесью этилацетат/метанол. Фильтрат концентрировали *in vacuo* с получением неочищенного остатка.

Остаток адсорбировали на диоксид кремния и очищали посредством колоночной хроматографии на силикагеле (градиентное элюирование смесью этилацетат/гексан) с получением [5-[3-хлор-2-[2-[4-[этил(метил)карбамоил]-3-фтор-фенил]этил]-6-фтор-фенил]-1,3-диметил-6-оксо-пиридазин-4-ил]-2-метилпропаноата (285 мг, выход 95%, **A-3.028**) в виде бесцветной смолы.



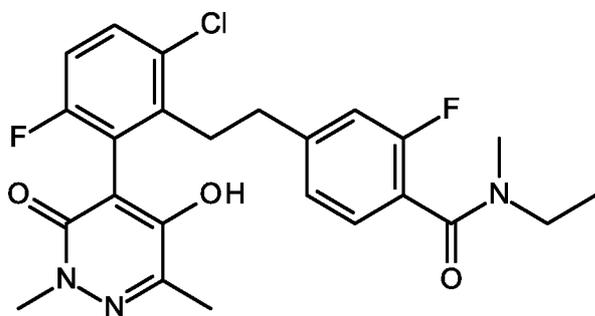
[ЯМР смеси ротамеров] ¹H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,42 (dd, J = 5,1, 8,9 Гц, 1H), [7,25 (t, J = 7,2 Гц, 0,5H), 7,21 (t, J = 7,5 Гц, 0,5H)], 6,99 (t, J = 8,9 Гц, 1H), 6,96 (dd, J = 1,2, 7,5 Гц, 1H), [6,89 (dd, J = 1,2, 6,9 Гц, 1H), 6,86 (dd, J = 1,2, 6,9 Гц, 1H)], 3,85 (s, 3H), [3,59 (q, J = 7,4 Гц, 1H), 3,24 (q, J = 7,4 Гц, 1H)], [3,08 (s, 1,5H), 2,90 (br s, 1,5H)], 2,88 - 2,78 (m, 3H), 2,75 - 2,64 (m, 1H), 2,55 (spt, J = 7,0 Гц, 1H), 2,26 (s, 3H), [1,23 (t, J = 7,2 Гц, 1,5H), 1,10 (t, J = 7,2 Гц, 1,5H)], 0,98 (d, J = 7,0 Гц, 3H), 0,96 (d, J = 7,1 Гц, 3H)

4.3. 4-[2-[6-Хлор-3-фтор-2-(5-гидрокси-2,6-диметил-3-оксо-пиридазин-4-ил)фенил]этил]-N-этил-2-фтор-N-метил-бензамид (А-1.028)

[5-[3-Хлор-2-[2-[4-[этил(метил)карбамоил]-3-фтор-фенил]этил]-6-фтор-фенил]-1,3-диметил-6-оксо-пиридазин-4-ил]-2-метилпропаноат (300 мг, 0,55 ммоль) растворяли в этаноле (3 мл). Смесь обрабатывали раствором гидроксида лития (69 мг, 1,65 ммоль) в воде (3 мл). Реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 2 ч.

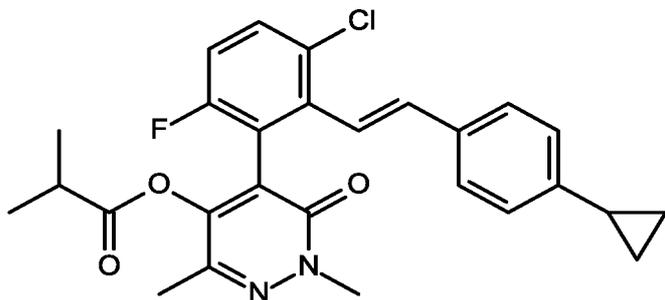
Реакционную смесь концентрировали *in vacuo* с удалением этанола. Оставшийся водный раствор разбавляли водой (15 мл), затем подкисляли до pH ~3 с помощью 2 М HCl и экстрагировали с помощью DCM (3 x 10 мл). Объединенные органические вещества высушивали и концентрировали *in-vacuo* с получением неочищенного продукта.

Неочищенный продукт очищали посредством колоночной хроматографии на силикагеле (градиентное элюирование смесью DCM/метанол) с получением 4-[2-[6-хлор-3-фтор-2-(5-гидрокси-2,6-диметил-3-оксо-пиридазин-4-ил)фенил]этил]-N-этил-2-фтор-N-метил-бензамида (224 мг, выход 86%, **А-1.028**) в виде белого твердого вещества.



[ЯМР смеси ротамеров] ^1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ = 10,86 (br s, 1H), 7,55 - 7,49 (m, 1H), 7,25 - 7,19 (m, 2H), 6,95 - 6,89 (m, 2H), 3,61 (s, 3H), 3,46 (q, J = 7,1 Гц, 1H), 3,12 (q, J = 7,1 Гц, 1H), 2,95 (s, 1,5H), 2,78 (s, 1,5H), 2,78 - 2,63 (m, 4H), 2,26 (s, 3H), 1,11 (t, J = 7,1 Гц, 1,5H), 1,00 (t, J = 7,1 Гц, 1,5H).

Пример 5. Получение [5-[3-хлор-2-[(E)-2-(4-циклопропилфенил)винил]-6-фтор-фенил]-1,3-диметил-6-оксо-пиридазин-4-ил]-2-метилпропаноата (А-4.038)



5.1. [5-(3-Хлор-6-фтор-2-винил-фенил)-1,3-диметил-6-оксо-пиридазин-4-ил]-2-метилпропаноат

5

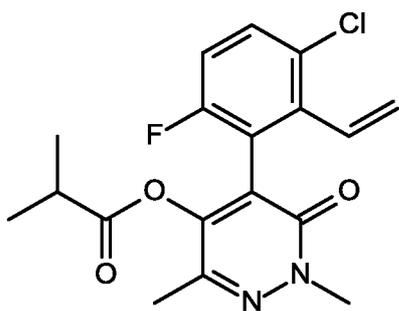
[5-(2-Бром-3-хлор-6-фтор-фенил)-1,3-диметил-6-оксо-пиридазин-4-ил]-2-

метилпропаноат (4,177 г, 10,00 ммоль, 1,0 экв.) и трибутил(винил)станнан (4,384 мл, 15,00 ммоль, 1,50 экв.) растворяли в толуоле (60,00 мл), затем добавляли комплекс 1,1-бис(дифенилфосфино)ферроцен]дихлорпалладия(II) и дихлорметана [PdCl₂(dppf).DCM] (408 мг, 0,50 ммоль, 0,05 экв.). Реакционную смесь нагревали с обратным холодильником в течение ночи.

10

Обеспечивали охлаждение реакционной смеси до комнатной температуры, затем ее концентрировали *in vacuo*. Затем неочищенный продукт очищали посредством колоночной флэш-хроматографии с получением [5-(3-хлор-6-фтор-2-винил-фенил)-1,3-диметил-6-оксо-пиридазин-4-ил]-2-метилпропаноата в виде грязно-белого твердого вещества (3,02 г, выход 83%).

15



¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ = 7,40 (dd, J=5,1, 8,7 Гц, 1H), 6,99 (t, J=8,7 Гц, 1H), 6,65 (dd, J=11,6, 17,6 Гц, 1H), 5,37 - 5,30 (m, 2H), 3,79 (s, 3H), 2,59 (spt, J=7,0 Гц, 1H), 2,23 (s, 3H), 1,04 (d, J=7,0 Гц, 4H), 1,03 (d, J=7,0 Гц, 1H)

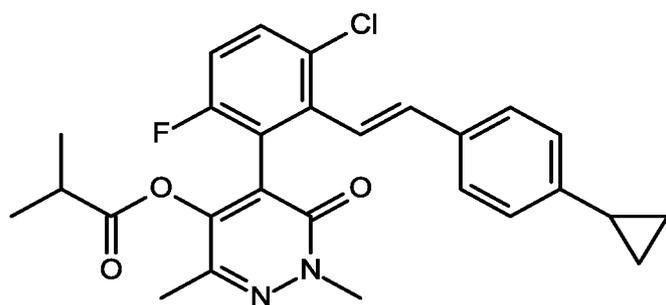
20

5.2. [5-[3-Хлор-2-[(E)-2-(4-циклопропилфенил)винил]-6-фтор-фенил]-1,3-диметил-6-оксо-пиридазин-4-ил]-2-метилпропаноат (А-4.038)

Перемешиваемую смесь [5-(3-хлор-6-фтор-2-винил-фенил)-1,3-диметил-6-оксо-пиридазин-4-ил]-2-метилпропаноата (300 мг, 1,0 экв.), хлор[(три-трет-бутилфосфин)-2-(2-аминобифенил)]палладия(II) (21 мг, 0,05 экв.), 1-бром-4-циклопропилбензола (243 мг, 1,5 экв.) и N,N-диизопропилэтиламина (0,29 мл, 2,0 экв.) в толуоле (5 мл) в атмосфере азота нагревали с обратным холодильником в течение 3 ч.

Обеспечивали охлаждение реакционной смеси до комнатной температуры, затем разбавляли с помощью DCM и фильтровали через слой целита с элюированием дополнительными порциями DCM. Фильтрат концентрировали *in vacuo* с получением неочищенного продукта.

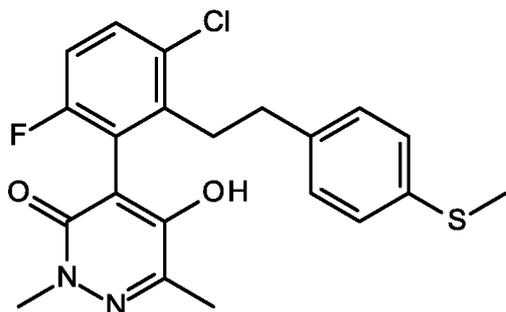
Неочищенный продукт очищали посредством колоночной флэш-хроматографии с получением [5-[3-хлор-2-[(E)-2-(4-циклопропилфенил)винил]-6-фтор-фенил]-1,3-диметил-6-оксопиридазин-4-ил]-2-метилпропаноата (285 мг, выход 72%) в виде бледно-желтой смолы.



^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) $\delta = 7,41$

(dd, $J = 5,1, 8,9$ Гц, 1H), 7,26 - 7,22 (m, 2H), 7,02 - 6,98 (m, 2H), 6,99 (t, $J = 8,9$ Гц, 1H), 6,93 (d, $J = 16,5$ Гц, 1H), 6,59 (d, $J = 16,5$ Гц, 1H), 3,71 (s, 3H), 2,62 (spt, $J = 7,0$ Гц, 1H), 2,19 (s, 3H), 1,87 (tt, $J = 5,0, 8,4$ Гц, 1H), 1,07 (d, $J = 7,0$ Гц, 3H), 1,06 (d, $J = 7,0$ Гц, 1H), 0,99 - 0,93 (m, $J = 2,0, 8,4$ Гц, 2H), 0,73 - 0,64 (m, 2H).

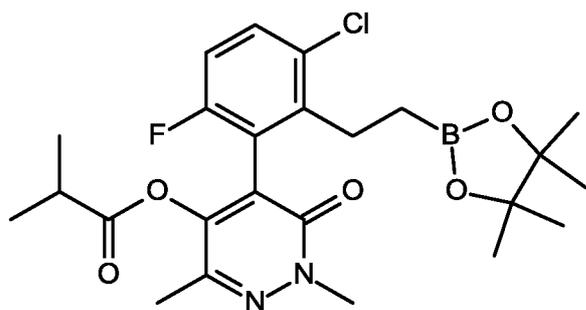
Пример 6. Получение 4-[3-хлор-6-фтор-2-[2-(4-метилсульфанил)этил]-фенил]-5-гидрокси-2,6-диметил-пиридазин-3-она (А-1.039)



5 6.1. [5-[3-Хлор-6-фтор-2-[2-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)этил]фенил]-1,3-диметил-6-оксо-пиридазин-4-ил]-2-метилпропаноат

Затем в высушенную в печи круглодонную колбу загружали $\text{Ir}(\text{COD})\text{Cl}_2$ (299 мг, 0,45 ммоль) и 4-дифенилфосфанилбутил(дифенил)фосфан (0380 мг, 0,89 ммоль). Из колбы откачивали воздух и заполняли ее азотом (x 3), затем добавляли THF (75 мл) и
 10 реакцию смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 30 мин. Добавляли по каплям раствор [5-(3-хлор-6-фтор-2-винил-фенил)-1,3-диметил-6-оксо-пиридазин-4-ил]-2-метилпропаноата [полученного, как описано в примере 4] (6,7 г, 17,8 ммоль) в THF и смесь перемешивали в течение 10 мин. с последующим добавлением по каплям 4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолана (3,02 мл, 20,8 ммоль).
 15 Реакционную смесь перемешивали при 60°C в течение ночи.

Через 24 ч. обеспечивали охлаждение реакционной смеси до комнатной температуры, затем концентрировали *in vacuo*. Неочищенный продукт очищали посредством колоночной хроматографии на силикагеле с градиентным элюированием смесью циклогексан/этилацетат с получением [5-[3-хлор-6-фтор-2-[2-(4,4,5,5-
 20 тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)этил]фенил]-1,3-диметил-6-оксо-пиридазин-4-ил]-2-метилпропаноата (4,50 г, выход 51%) в виде желтого твердого вещества.



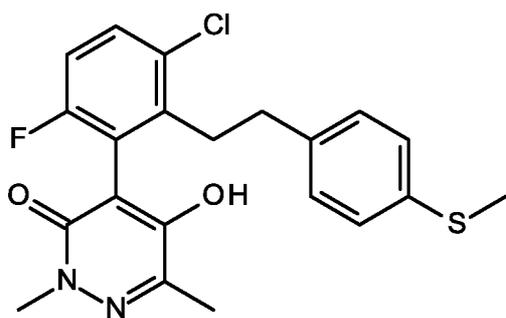
^1H ЯМР (500 МГц, хлороформ) $\delta = 7,35$ (dd, $J = 5,2, 8,9$ Гц, 1H), 6,90 (t, $J = 8,6$ Гц, 1H), 3,81 (s, 3H), 2,59 (t, $J = 8,5$ Гц, 2H), 2,53 (spt, J

= 7,0 Гц, 1H), 2,24 (s, 3H), 1,32 - 1,16 (m, 12H), 1,08 - 1,00 (m, 2H), 0,98 (d, J = 7,0 Гц, 3H), 0,94 (d, J = 7,0 Гц, 3H).

6.2. 4-[3-Хлор-6-фтор-2-[2-(4-метилсульфанилфенил)этил]фенил]-5-гидрокси-2,6-диметил-пиридазин-3-он (А-1.039)

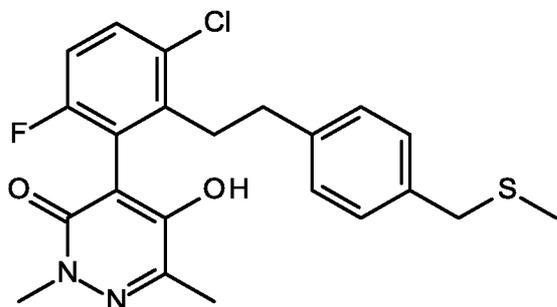
[5-[3-Хлор-6-фтор-2-[2-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)этил]фенил]-1,3-диметил-6-оксо-пиридазин-4-ил]-2-метилпропаноат (100 мг, 0,20 ммоль), 1-бром-4-метилсульфанил-бензол (62 мг, 0,30 ммоль), хлор(2-дициклогексилфосфино-2',6'-диизопропокси-1,1'-бифенил)[2-(2'-амино-1,1'-бифенил)]палладий(II) (24 мг, 0,03 ммоль), K₂CO₃ (84 мг, 0,61 ммоль), 1,4-диоксан (2 мл) и воду (0,2 мл) объединяли во флаконе для микроволновой обработки объемом 5 мл. Затем реакционную смесь нагревали при 140°C в течение 90 минут в условиях микроволнового облучения.

Обеспечивали охлаждение реакционной смеси до комнатной температуры, затем разбавляли водой (10 мл), подкисляли до pH ~3 с помощью 2 М HCl и экстрагировали с помощью DCM (4x). Объединенные органические вещества концентрировали *in vacuo* с получением неочищенного продукта, который очищали посредством масс-направленной HPLC с обращенной фазой с получением 4-[3-хлор-6-фтор-2-[2-(4-метилсульфанилфенил)этил]фенил]-5-гидрокси-2,6-диметил-пиридазин-3-она в виде белого твердого вещества (22 мг, выход 22%, **А-1.039**).

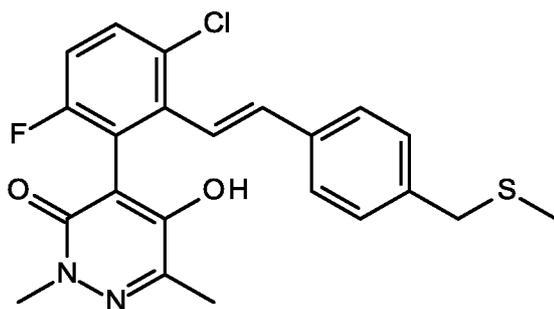


¹H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,46 - 7,39 (m, 3H), 7,12 (d, J = 8,0 Гц, 2H), 6,98 (t, J = 8,6 Гц, 1H), 6,90 (d, J = 8,0 Гц, 2H), 3,73 (s, 3H), 2,84 - 2,64 (m, 4H), 2,45 (s, 3H), 2,29 (s, 3H).

Пример 7. Получение 4-[3-хлор-6-фтор-2-[2-[4-(метилсульфанилметил)фенил]этил]фенил]-5-гидрокси-2,6-диметил-пиридазин-3-она (А-1.388)



- 5 **7.1. 4-[3-Хлор-6-фтор-2-[(E)-2-[4-(метилсульфанилметил)фенил]винил]фенил]-5-гидрокси-2,6-диметил-пиридазин-3-он**
- [5-[3-Хлор-6-фтор-2-[(E)-2-(6-метил-4,8-диоксо-1,3,6,2-диоксазаборокан-2-ил)винил]фенил]-1,3-диметил-6-оксо-пиридазин-4-ил]-2-метилпропаноат (500 мг, 0,96 ммоль), 1-бром-4-(метилсульфанилметил)бензол (324 мг, 1,44 ммоль), комплекс
- 10 1,1-бис(дифенилфосфино)ферроцен]дихлорпалладия(II) и дихлорметана [PdCl₂(dppf).DCM] (41 мг, 0,05 ммоль) и КАРБОНАТ КАЛИЯ (417 мг, 2,89 ммоль) добавляли во флакон для микроволновой обработки объемом 10-20 мл в атмосфере азота. Добавляли дегазированный ацетонитрил (11,5 мл) и воду (2,9 мл) и смесь нагревали до 150°C в течение 20 мин. в условиях микроволнового облучения.
- 15 Реакционную смесь концентрировали до сухого состояния. Остаток обрабатывали водой (20 мл) и водную фазу подкисляли до pH 3 путем добавления 2 М HCl, что приводило к образованию осадка. Добавляли DCM (20 мл) для поглощения осадка. Добавляли солевой раствор (20 мл) и фазы разделяли. Водную фазу экстрагировали двумя дополнительными порциями DCM, затем объединенные
- 20 органические экстракты высушивали и концентрировали непосредственно на диоксид кремния. Неочищенный материал очищали посредством автоматизированной системы флэш-хроматографии на силикагеле с градиентным элюированием смесью циклогексан/этилацетат с получением 4-[3-хлор-6-фтор-2-[(E)-2-[4-(метилсульфанилметил)фенил]винил]фенил]-5-гидрокси-2,6-диметил-пиридазин-3-она
- 25 (341 мг, выход 82%) в виде грязно-белого твердого вещества.



^1H ЯМР (500 МГц, DMSO- d_6) δ =

10,78 (br s, 1H), 7,60 (dd, J = 5,2, 8,7 Гц, 1H), 7,30 - 7,24 (m, 5H), 6,93 (d, J = 16,5 Гц, 1H), 6,56 (d, J = 16,5 Гц, 1H), 3,67 (s, 2H), 3,54 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 1,94 (s, 3H)

5 **7.2. 4-[3-Хлор-6-фтор-2-[2-[4-(метилсульфанилметил)фенил]этил]фенил]-5-гидрокси-2,6-диметил-пиридазин-3-он (А-1.388)**

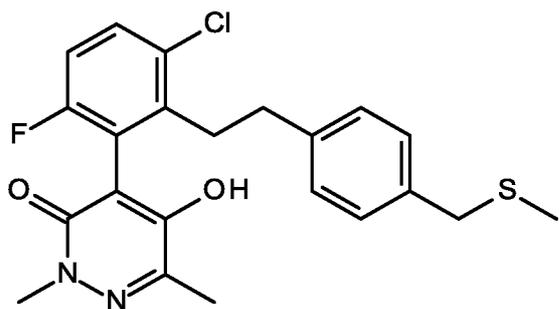
К раствору 4-[3-хлор-6-фтор-2-[(Е)-2-[4-(метилсульфанилметил)фенил]винил]фенил]-5-гидрокси-2,6-диметил-пиридазин-3-она (335 мг, 0,78 ммоль) в тетрагидрофуране (12 мл) в атмосфере азота добавляли N,N-диизопропилэтиламин (1,08 мл, 6,20 ммоль).

10 Перемешиваемую реакционную смесь нагревали до 70°C и добавляли порциями 2,4,6-триизопропилбензолсульфонилгидразид (2,06 г, 6,21 ммоль) в течение 6 ч, затем смесь нагревали до температуры образования флегмы в течение 16 ч. К реакционной смеси добавляли дополнительное количество N,N-диизопропилэтиламина (0,68 мл, 3,89 ммоль), затем 2,4,6-триизопропилбензолсульфонилгидразид (1,29 г, 3,89 ммоль) и

15 смесь нагревали до температуры образования флегмы в течение дополнительных 6 ч.

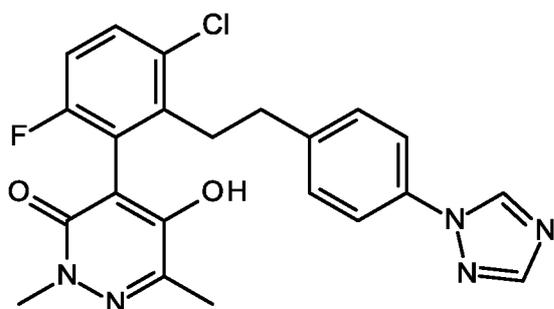
Обеспечивали охлаждение реакционной смеси до комнатной температуры, затем концентрировали непосредственно на диоксид кремния. Неочищенный материал частично очищали посредством автоматизированной системы флэш-хроматографии на силикагеле с градиентным элюированием смесью циклогексан/этилацетат. Полученный

20 материал дополнительно очищали посредством масс-направленной HPLC с обращенной фазой с получением 4-[3-хлор-6-фтор-2-[2-[4-(метилсульфанилметил)фенил]этил]фенил]-5-гидрокси-2,6-диметил-пиридазин-3-она в виде белого твердого вещества (208 мг, выход 62%, **А-1.388**).



^1H ЯМР (400 МГц, d_6 -DMSO), $\delta = 10,83$ (s, 1H), 7,56-7,53 (m, 1H), 7,23-7,16 (m, 3H), 6,96-6,94 (d, 2H), 3,62 (s, 2H), 3,60 (s, 3H), 2,68-2,54 (m, 4H), 2,26 (s, 3H), 1,92 (s, 3H)

5 **Пример 8. 4-[3-Хлор-6-фтор-2-[2-[4-(1,2,4-триазол-1-ил)фенил]этил]фенил]-5-гидрокси-2,6-диметил-пиридазин-3-он (А-1.385)**

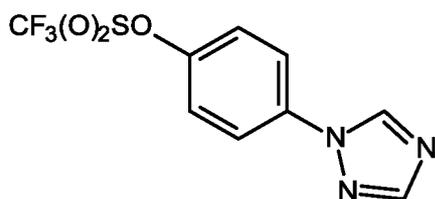


8.1. **[4-(1,2,4-Триазол-1-ил)фенил]трифторметансульфонат**

10 4-(1,2,4-Триазол-1-ил)фенол (1,22 г, 7,57 ммоль) растворяли в дихлорметане (10 мл) в атмосфере азота и охлаждали до $\sim 0^\circ\text{C}$. Добавляли по каплям раствор пиридина (1,22 мл, 15,1 ммоль) в дихлорметане (5 мл) в течение ~ 2 минут. Смесь перемешивали 5 минут, затем добавляли по каплям раствор трифторметансульфонового ангидрида (1,53 мл, 9,08 ммоль) в дихлорметане (5 мл) в течение ~ 2 минут. Охлаждение прекращали и
15 обеспечивали нагревание реакционной смеси до комнатной температуры, затем перемешивали при комнатной температуре в течение 16 ч.

Реакционную смесь гасили путем добавления 2 М водн. раствора HCl (20 мл), затем органическую фазу отделяли. Водную фазу дополнительно экстрагировали дихлорметаном (2 x 20 мл). Объединенные органические вещества промывали водой
20 (20 мл), высушивали, затем концентрировали при пониженном давлении с получением твердого вещества кремового цвета. Неочищенный материал очищали посредством автоматизированной системы флэш-хроматографии на диоксиде кремния с градиентным элюированием смесью циклогексан/этилацетат с получением [4-(1,2,4-

триазол-1-ил)фенил]трифторметансульфоната в виде белого твердого вещества (2,02 г, выход 91%).

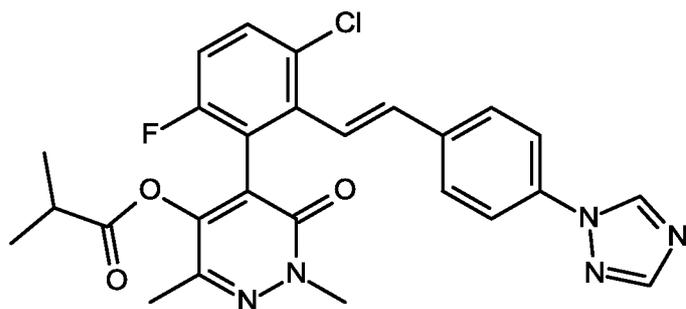


¹H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 8,59 (s, 1H), 8,14 (s, 1H), 7,86 - 7,78 (m, 2H), 7,50 - 7,41 (m, 2H).

8.2. [5-[3-Хлор-6-фтор-2-[(E)-2-[4-(1,2,4-триазол-1-ил)фенил]винил]фенил]-1,3-диметил-6-оксо-пиридазин-4-ил]-2-метилпропаноат

[5-[3-Хлор-6-фтор-2-[(E)-2-(6-метил-4,8-диоксо-1,3,6,2-диоксазаборокан-2-ил)винил]фенил]-1,3-диметил-6-оксо-пиридазин-4-ил]-2-метилпропаноат (500 мг, 0,96 ммоль), комплекс 1,1-бис(дифенилфосфино)ферроцен]дихлорпалладия(II) и дихлорметана [PdCl₂(dppf).DCM] (39 мг, 0,048 ммоль), [4-(1,2,4-триазол-1-ил)фенил]трифторметансульфонат (367 мг, 1,25 ммоль) и фосфат калия (834 мг, 3,85 ммоль) добавляли во флакон для микроволновой обработки объемом 10-20 мл. Добавляли тетрагидрофуран (10 мл) и воду (0,5 мл), затем реакционную смесь дегазировали путем перемешивания под вакуумом, затем заполняли азотом (X3). Реакционную смесь нагревали в микроволновом реакторе при 120°C в течение 60 мин. в условиях микроволнового облучения.

Реакционную смесь фильтровали через слой Celite®, промывая с помощью EtOAc и EtOH. Фильтрат концентрировали при пониженном давлении с получением коричневой смолы (840 мг). Неочищенный материал очищали посредством автоматизированной системы флэш-хроматографии на силикагеле с градиентным элюированием смесью циклогексан/этилацетат с получением бледно-желтой смолы (389 мг). Очищенный материал растворяли в ацетонитриле (10 мл) и обрабатывали тиоловой (SH) смолой, поглощающей металл, SiliCycle SiliaMetS® (365 мг) при комнатной температуре. Суспензию перемешивали при комнатной температуре в течение 3 ч., затем фильтровали с удалением смолы, промывая дополнительным количеством ацетонитрила. Фильтрат концентрировали *in vacuo* с получением [5-[3-хлор-6-фтор-2-[(E)-2-[4-(1,2,4-триазол-1-ил)фенил]винил]фенил]-1,3-диметил-6-оксо-пиридазин-4-ил]-2-метилпропаноата в виде бесцветной смолы (361 мг, выход 73%).



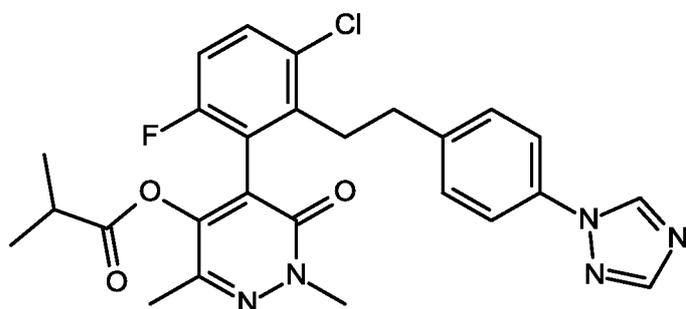
^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ
ppm 8,55 (s, 1H), 8,11 (s, 1H), 7,60 - 7,66 (m, 2H), 7,42 - 7,53 (m, 3H), 7,01 - 7,10 (m, 2H),
6,69 (d, $J=16,5$ Гц, 1H), 3,70 (s, 3H), 2,66 (spt, $J=7,0$ Гц, 1H), 2,23 (s, 3H), 1,11 (d, $J = 7,0$
Гц, 1H), 1,08 (d, $J = 7,1$ Гц, 1H)

5

8.3. [5-[3-Хлор-6-фтор-2-[2-[4-(1,2,4-триазол-1-ил)фенил]этил]фенил]-1,3-диметил-6-оксо-пиридазин-4-ил]-2-метилпропаноат (А-3.385)

[5-[3-Хлор-6-фтор-2-[(E)-2-[4-(1,2,4-триазол-1-ил)фенил]винил]фенил]-1,3-диметил-6-оксо-пиридазин-4-ил]-2-метилпропаноат (365 мг, 0,72 ммоль) подвергали каталитической гидрогенизации в EtOAc (10 мл) в присутствии катализатора 5% Pd/C (влажность 50%) (0,15 г) при давлении H_2 3 бар в течение 24 ч.

Реакционную смесь фильтровали через слой Celite®, промывая этилацетатом. Фильтрат концентрировали *in-vacuo* с получением неочищенного остатка (350 мг), который адсорбировали на диоксид кремния и очищали посредством автоматизированной системы флэш-хроматографии на силикагеле с градиентным элюированием смесью циклогексан/этилацетат. [5-[3-Хлор-6-фтор-2-[2-[4-(1,2,4-триазол-1-ил)фенил]этил]фенил]-1,3-диметил-6-оксо-пиридазин-4-ил]-2-метилпропаноат (А-3.385) получали в виде бесцветной смолы (321 мг, выход 88%).



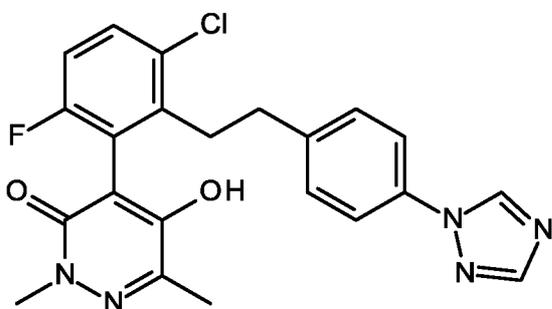
^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) $\delta =$
20 8,51 (s, 1H), 8,09 (s, 1H), 7,55 (d, $J = 8,2$ Гц, 2H), 7,43 (dd, $J = 5,2, 8,7$ Гц, 1H), 7,27 (d, $J =$
8,2 Гц, 2H), 7,00 (t, $J = 8,7$ Гц, 1H), 3,84 (s, 3H), 2,97 - 2,80 (m, 3H), 2,79 - 2,67 (m, 1H),
2,55 (spt, $J = 7,0$ Гц, 1H), 2,25 (s, 3H), 0,98 (d, $J = 7,0$ Гц, 3H), 0,96 (d, $J = 7,0$ Гц, 1H)

8.4. 4-[3-Хлор-6-фтор-2-[2-[4-(1,2,4-триазол-1-ил)фенил]этил]фенил]-5-гидрокси-2,6-диметил-пиридазин-3-он (А-1.385)

[5-[3-Хлор-6-фтор-2-[2-[4-(1,2,4-триазол-1-ил)фенил]этил]фенил]-1,3-диметил-6-оксо-пиридазин-4-ил]-2-метилпропаноат (320 мг, 0,63 ммоль) перемешивали в этаноле (5 мл) при комнатной температуре.

Добавляли по каплям раствор моногидрата гидроксида лития (81 мг, 1,88 ммоль) в воде (2 мл) и реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 1 ч.

Растворитель, представляющий собой этанол, удаляли при пониженном давлении, затем остаток разбавляли водой (20 мл). Водную фазу подкисляли до pH ~3-4 путем добавления 2 М HCl (водн.), затем экстрагировали с помощью EtOAc (3 x 10 мл). Объединенные органические экстракты концентрировали при пониженном давлении с получением белого твердого вещества (292 мг). Неочищенный остаток очищали посредством автоматизированной системы флэш-хроматографии на диоксиде кремния с градиентным элюированием смесью циклогексан/этилацетат и этилацетат/этанол с получением 4-[3-хлор-6-фтор-2-[2-[4-(1,2,4-триазол-1-ил)фенил]этил]фенил]-5-гидрокси-2,6-диметил-пиридазин-3-она (**А-1.365**) в виде белого твердого вещества (260 мг, выход 94%).



¹H ЯМР (400 МГц, метанол), δ ppm 9,03 (s, 1H), 8,14 (s, 1H), 7,65 - 7,70 (m, 2H), 7,51 (dd, J=5,2, 8,7 Гц, 1H), 7,20 (m, 2H), 7,11 (t, J=8,7 Гц, 1H), 3,72 (s, 3H), 2,72 - 2,89 (m, 4H), 2,32 (s, 3H)

Пример 9. 4-[3-Циклопропил-6-фтор-2-[2-(2-фтор-4-пиридил)этил]фенил]-5-гидрокси-2,6-диметил-пиридазин-3-он (С-1.013)

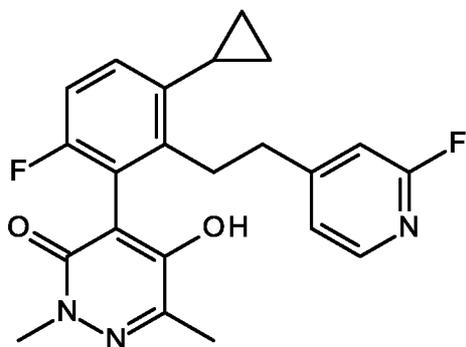
[5-[3-Хлор-6-фтор-2-[2-(2-фтор-4-пиридил)этил]фенил]-1,3-диметил-6-оксо-пиридазин-4-ил]-2-метилпропаноат (250 мг, 0,54 ммоль), моногидрат фосфата трикалия (374 мг, 1,62 ммоль) и RuPhos Pd G2 (42 мг, 0,05 ммоль) загружали во флакон для микроволновой обработки объемом 2-5 мл, оснащенный якорем магнитной мешалки.

Из реакционного сосуда откачивали воздух и заполняли его азотом (X3). Добавляли 1,4-диоксан (4 мл), затем циклопропилбороновую кислоту (139 мг, 1,62 ммоль) и воду (1 мл) (оба растворителя дегазировали). Затем смесь нагревали до 120°C в течение 1 ч. в условиях микроволнового облучения.

5 Реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры, затем добавляли дополнительное количество циклопропилбороновой кислоты (139 мг, 1,62 ммоль) и RuPhos Pd G2 (42 мг, 0,05 ммоль) и реакционную смесь нагревали до 120°C в течение еще 2,5 часа.

10 Реакционную смесь концентрировали *in vacuo* с удалением диоксана. Остаток разбавляли водой (20 мл) и DCM (20 мл) и слои разделяли. Водную фазу экстрагировали дополнительными порциями DCM (3 x 5 мл), затем объединенные органические экстракты высушивали и концентрировали с получением твердого вещества темного цвета (331 мг).

15 Неочищенный остаток очищали посредством масс-направленной HPLC с обращенной фазой с получением 4-[3-циклопропил-6-фтор-2-[2-(2-фтор-4-пиридил)этил]фенил]-5-гидрокси-2,6-диметил-пиридазин-3-она (**C-1.013**) в виде белого твердого вещества.

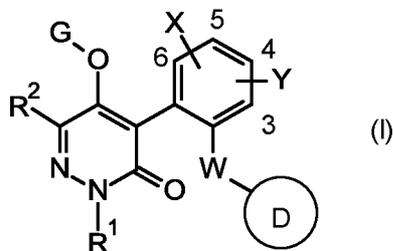


20 ^1H ЯМР (400 МГц, метанол) δ = 8,01 (d, J = 5,1 Гц, 1H), 7,13 (dd, J = 5,6, 8,3 Гц, 1H), 7,02 - 6,93 (m, 2H), 6,72 (br s, 1H), 3,72 (s, 3H), 3,02 - 2,75 (m, 4H), 2,32 (s, 3H), 1,97 - 1,87 (m, 1H), 1,02 - 0,89 (m, 2H), 0,74 - 0,61 (m, 2H)

Соединения A-1.023. A-1.024. A-1.025. A-1.026. A-1.027. A-1.028. A-1.029. A-1.030. A-1.031. A-1.032. A-1.033. A-1.034. A-1.035. A-1.036. A-1.037. A-1.038. A-1.039. A-1.040. A-1.041. A-1.042. A-1.043. A-1.044. A-2.027. A-2.030. A-2.037. A-3.028. A-3.029. 25 A-3.030. A-3.035. A-3.036. A-3.038. A-4.029. A-4.030. A-4.035. A-4.036. A-1.373. A-1.374. A-1.375. A-1.376. A-1.377. A-1.378. A-1.379. A-1.380. A-1.381. A-1.382. A-1.383. A-1.384. A-1.386. A-1.387. A-1.389. A-1.390. A-1.391 и A-1.392 получали с применением общих

способов, описанных выше. В таблице 4 ниже показана структура этих соединений и данные ЯМР, характеризующие их.

5 **Таблица 4.** Примеры получения соединений формулы (I). Система нумерации, используемая для описания положений X и Y, показана исключительно для ясности.



Соединение	R ¹	R ²	G	X	Y	W	D	Подробные данные ЯМР
A-1.023	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-Оксазол-5-илфенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, метанол) δ = 8,22 (s, 1H), 7,63 - 7,56 (m, 2H), 7,51 (dd, J = 5,2, 8,9 Гц, 1H), 7,45 (s, 1H), 7,14 - 7,07 (m, 3H), 3,72 (s, 3H), 2,86 - 2,66 (m, 4H), 2,32 (s, 3H).
A-1.024	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-Ацетамидофенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, метанол) δ = 7,50 (dd, J = 5,3, 8,6 Гц, 1H), 7,38 (d, J = 8,4 Гц, 2H), 7,09 (t, J = 8,6 Гц, 1H), 6,94 (d, J = 8,4 Гц, 2H), 3,72 (s, 3H), 2,74 (s, 4H), 2,33 (s, 3H), 2,09 (s, 3H)
A-1.025	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-(Диметилсульфамонил)фенил-	¹ H ЯМР (500 МГц, DMSO-d ₆) δ = 10,86 (br s, 1H), 7,62 (d, J = 8,3 Гц, 2H), 7,53 (dd, J = 5,2, 8,8 Гц, 1H), 7,29 (d, J = 8,3 Гц, 2H), 7,22 (t, J = 8,8 Гц, 1H), 3,61 (s, 3H), 2,83 - 2,64 (m, 4H), 2,57 (s, 6H), 2,26 (s, 3H)

Соединение	R ¹	R ²	G	X	Y	W	D	Подробные данные ЯМР
A-1.026	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-трет-Бутилфенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ = 10,86 (br s, 1H), 7,57 (dd, J = 5,1, 8,9 Гц, 1H), 7,28 (d, J = 8,3 Гц, 2H), 7,22 (t, J = 8,9 Гц, 1H), 6,93 (d, J = 8,3 Гц, 2H), 3,62 (s, 3H), 2,70 - 2,53 (m, 4H), 2,27 (s, 3H), 1,24 (s, 9H)
A-1.027	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-Бифенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,57 - 7,52 (m, 2H), 7,50 - 7,40 (m, 5H), 7,37 - 7,30 (m, 1H), 7,07 (d, J = 8,2 Гц, 2H), 7,02 (t, J = 8,6 Гц, 1H), 5,47 (s, 1H), 3,75 (s, 3H), 2,88 - 2,80 (m, 3H), 2,27 (s, 3H)
A-1.028	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-[Этил(метил)карбамоил]-3-фтор-фенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ = 10,86 (br s, 1H), 7,55 - 7,49 (m, 1H), 7,25 - 7,19 (m, 2H), 6,95 - 6,89 (m, 2H), 3,61 (s, 3H), 3,46 (q, J = 7,1 Гц, 1H), 3,12 (q, J = 7,1 Гц, 1H), 2,95 (s, 1,5H), 2,78 (s, 1,5H), 2,78 - 2,63 (m, 4H), 2,26 (s, 3H), 1,11 (t, J = 7,1 Гц, 1,5H), 1,00 (t, J = 7,1 Гц, 1,5H)
A-1.029	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	2-Цианофенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,51 - 7,44 (m, 2H), 7,33 - 7,24 (m, 3H + CHCl ₃ пик), 6,95 (t, J = 8,6 Гц, 1H), 3,69 (s, 3H), 2,95 - 2,79 (m, 4H), 2,30 (s, 3H).
A-1.030	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	3-Цианофенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,46 (td, J = 1,4, 7,6 Гц, 1H), 7,37 (dd, J = 5,2, 8,9 Гц, 1H), 7,35 - 7,28 (m, 2H), 7,26 - 7,23 (m, 1H), 6,95 (t, J = 8,6 Гц, 1H), 3,69 (s, 3H), 2,82 - 2,63 (m, 4H), 2,28 (s, 3H).

Соединение	R ¹	R ²	G	X	Y	W	D	Подробные данные ЯМР
A-1.031	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-Амино-3-метилфенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ ppm 2,09 (s, 3 H) 2,27 (s, 3 H) 2,50 - 2,83 (m, 4 H) 3,70 (s, 3 H) 6,52 (d, J=7,83 Гц, 1 H) 6,59 - 6,73 (m, 2 H) 6,93 (t, J=8,56 Гц, 1 H) 7,38 (dd, J=8,86, 5,20 Гц, 1 H)
A-1.032	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-Метилсульфонилфенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ = 10,86 (br s, 1H), 7,81 (кажущийся d, J = 8,3 Гц, 2H), 7,56 (dd, J = 5,2, 8,6 Гц, 1H), 7,29 (кажущийся d, J = 8,3 Гц, 2H), 7,23 (t, J = 8,6 Гц, 1H), 3,61 (s, 3H), 3,17 (s, 3H), 2,86 - 2,63 (m, 4H), 2,26 (s, 3H)
A-1.033	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-Диметиламинофенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ ppm 2,27 (s, 3 H) 2,62 - 2,77 (m, 3 H) 2,80 - 2,87 (m, 1 H) 2,90 (s, 6 H) 3,72 (s, 3 H) 6,59 - 6,65 (m, 2 H) 6,86 (d, J=8,68 Гц, 2 H) 6,96 (t, J=8,56 Гц, 1 H) 7,42 (dd, J=8,80, 5,14 Гц, 1 H)
A-1.034	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-Метиламинофенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ ppm 2,28 (s, 3 H) 2,80 (s, 7 H) 3,73 (s, 3 H) 6,49 (d, J=8,44 Гц, 2 H) 6,81 (d, J=8,44 Гц, 2 H) 6,97 (t, J=8,56 Гц, 1 H) 7,42 (dd, J=8,80, 5,14 Гц, 1 H)
A-1.035	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-трет-Бутоксифенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,28 (dd, J = 5,2, 8,9 Гц, 1H), 6,82 (s, 5H), 3,62 (s, 3H), 2,73 - 2,50 (m, 4H), 2,23 (s, 3H)
A-1.036	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-Цианофенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ ppm 7,46 - 7,51 (m, 2 H) 7,26 - 7,31 (m, 1 H) 7,08 (d, J=8,19 Гц, 2 H) 6,86 (t, J=8,50 Гц, 1 H) 3,63 (s, 3 H) 2,61 - 2,77 (m, 4 H) 2,24 (s, 3 H)

Соединение	R ¹	R ²	G	X	Y	W	D	Подробные данные ЯМР
A-1.037	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-Гидроксифенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ = 10,82 (br s, 1H), 9,17 (s, 1H), 7,54 (dd, J=5,2, 8,9 Гц, 1H), 7,20 (t, J=8,9 Гц, 1H), 6,82 - 6,75 (m, 2H), 6,65 - 6,60 (m, 2H), 3,61 (s, 3H), 2,69 - 2,43 (m, 4H), 2,26 (s, 3H)
A-1.038	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-Циклопропилфенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,37 (dd, J=5,2, 8,8 Гц, 1H), 6,96 - 6,88 (m, 2H), 6,91 (t, J=8,8 Гц, 1H), 6,88 - 6,83 (m, 2H), 3,67 (s, 3H), 2,82 - 2,62 (m, 4H), 2,25 (s, 3H), 1,84 (tt, J=5,0, 8,5 Гц, 1H), 0,95 - 0,88 (m, 2H), 0,68 - 0,60 (m, 2H)
A-1.039	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-(Метилсульфанил)фенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,46 - 7,39 (m, 3H), 7,12 (d, J = 8,0 Гц, 2H), 6,98 (t, J = 8,6 Гц, 1H), 6,90 (d, J = 8,0 Гц, 2H), 3,73 (s, 3H), 2,84 - 2,64 (m, 4H), 2,45 (s, 3H), 2,29 (s, 3H)
A-1.040	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-Карбоксифенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, метанол) δ = 7,88 (d, J = 8,4 Гц, 2H), 7,51 (dd, J = 5,2, 8,9 Гц, 1H), 7,11 (d, J = 8,0 Гц, 1H), 7,11 (t, J = 8,5 Гц, 1H), 3,74 - 3,70 (m, 3H), 2,88 - 2,70 (m, 3H), 2,34 - 2,26 (m, 3H)
A-1.041	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-Метоксикарбонилфенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,88 (d, J = 8,3 Гц, 2H), 7,40 (dd, J = 5,2, 8,9 Гц, 1H), 7,05 (d, J = 8,3 Гц, 2H), 6,96 (t, J = 8,9 Гц, 1H), 3,89 (s, 3H), 3,72 (s, 3H), 2,86 - 2,72 (m, 4H), 2,28 (s, 3H)

Соединение	R ¹	R ²	G	X	Y	W	D	Подробные данные ЯМР
A-1.042	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-(трет-Бутоксикарбониламино)-3-фтор-фенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, метанол) δ = 7,66 - 7,55 (m, 1H), 7,48 (br dd, J = 5,3, 8,7 Гц, 1H), 7,08 (t, J = 8,7 Гц, 1H), 6,78 - 6,71 (m, 2H), 3,72 (s, 3H), 2,82 - 2,60 (m, 4H), 2,32 (s, 3H), 1,50 (s, 9H)
A-1.043	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	2-(Метилсульфанил)-4-пиридил-	¹ H ЯМР (500 МГц, хлороформ) δ ppm 2,30 (s, 3 H) 2,52 (s, 3 H) 2,69 - 2,80 (m, 1 H) 2,85 - 2,94 (m, 1 H) 2,96 - 3,09 (m, 2 H) 3,69 (s, 3 H) 6,85 (d, J=5,54 Гц, 1 H) 6,89 - 6,97 (m, 2 H) 7,35 (dd, J=8,77, 4,99 Гц, 1 H) 8,18 (d, J=5,79 Гц, 1 H)
A-1.044	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	2-Ацетиамидо-4-пиридил-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ ppm 8,00 (d, J=5,26 Гц, 1 H) 7,64 (br s, 1 H) 7,37 (br s, 1 H) 7,00 (br d, J=1,10 Гц, 1 H) 6,78 (dd, J=5,26, 1,34 Гц, 1 H) 3,73 (s, 3 H) 2,97 (br d, J=9,66 Гц, 1 H) 2,73 - 2,88 (m, 3 H) 2,27 (s, 4 H) 2,16 (s, 3 H)
A-2.027	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	(E) -CH=CH-	4-Бифенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,59 - 7,33 (m, 10H), 7,07 (t, J = 8,6 Гц, 1H), 7,01 (d, J = 16,4 Гц, 1H), 6,70 (d, J = 16,5 Гц, 1H), 5,63 (s, 1H), 3,73 (s, 3H), 2,28 (s, 3H)
A-2.030	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	(E) -CH=CH-	3-Цианофенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,56 - 7,47 (m, 3H), 7,44 - 7,38 (m, 2H), 7,04 - 6,93 (m, 2H), 6,53 (d, J = 16,5 Гц, 1H), 3,64 (s, 3H), 2,25 (s, 3H).

Соединение	R ¹	R ²	G	X	Y	W	D	Подробные данные ЯМР
А-2.037	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	(E) -CH=CH-	4-Гидроксифенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ = 10,75 (br s, 1H), 9,67 (s, 1H), 7,58 (dd, J=5,3, 8,8 Гц, 1H), 7,23 (t, J=8,8 Гц, 1H), 7,19 - 7,13 (m, 2H), 6,75 - 6,72 (m, 2H), 6,73 (d, J=16,5 Гц, 1H), 6,48 (d, J=16,5 Гц, 1H), 3,55 (s, 3H), 2,19 (s, 3H)
А-3.028	-Me	-Me	-(C=O) iPr	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-[Этил(метил)карбамоил]-3-фторфенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,42 (dd, J = 5,1, 8,9 Гц, 1H), [7,25 (t, J = 7,2 Гц, 0,5H), 7,21 (t, J = 7,5 Гц, 0,5H)], 6,99 (t, J = 8,9 Гц, 1H), 6,96 (dd, J = 1,2, 7,5 Гц, 1H), [6,89 (dd, J = 1,2, 6,9 Гц, 1H), 6,86 (dd, J = 1,2, 6,9 Гц, 1H)], 3,85 (s, 3H), [3,59 (q, J = 7,4 Гц, 1H), 3,24 (q, J = 7,4 Гц, 1H)], [3,08 (s, 1,5H), 2,90 (br s, 1,5H)], 2,88 - 2,78 (m, 3H), 2,75 - 2,64 (m, 1H), 2,55 (spt, J = 7,0 Гц, 1H), 2,26 (s, 3H), 1,23 (t, J = 7,2 Гц, 1,5H), 1,10 (t, J = 7,2 Гц, 1,5H)], 0,98 (d, J = 7,0 Гц, 3H), 0,96 (d, J = 7,1 Гц, 3H)
А-3.029	-Me	-Me	- (C=O) Pr	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	2-Цианофенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,56 (dd, J = 1,1, 7,7 Гц, 1H), 7,51 - 7,46 (m, 1H), 7,43 (dd, J = 5,1, 8,8 Гц, 1H), 7,32 (d, J = 7,7 Гц, 1H), 7,30 - 7,26 (m, 1H + CHCl ₃ пик), 7,01 (t, J = 8,6 Гц, 1H), 3,85 (s, 3H), 3,15 - 3,05 (m, 1H), 3,04 - 2,80 (m, 3H), 2,55 (spt, J = 7,0 Гц, 1H), 2,27 (s, 3H), 0,97 (dd, J = 1,1, 7,0 Гц, 6H).

Соединение	R ¹	R ²	G	X	Y	W	D	Подробные данные ЯМР
A-3.030	-Me	-Me	-(C=O) iPr	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	3-Цианофенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,50 - 7,46 (m, 1H), 7,46 - 7,37 (m, 3H), 7,37 - 7,31 (m, 1H), 7,00 (t, J = 8,6 Гц, 1H), 3,86 (s, 3H), 3,00 - 2,78 (m, 3H), 2,73 - 2,63 (m, 1H), 2,55 (quin, J = 7,0 Гц, 1H), 2,26 (s, 3H), 0,97 (dd, J = 7,0, 13,5 Гц, 6H).
A-3.035	-Me	-Me	-(C=O) iPr	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-трет-Бутоксифенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,40 (dd, J = 5,1, 8,8 Гц, 1H), 7,03 - 6,99 (m, 2H), 6,97 (t, J = 8,8 Гц, 1H), 6,90 - 6,83 (m, 2H), 3,84 (s, 3H), 2,85 - 2,68 (m, 4H), 2,55 (spt, J = 7,0 Гц, 1H), 2,25 (s, 3H), 1,32 (s, 9H), 0,97 (d, J = 7,0 Гц, 3H), 0,97 (d, J = 7,0 Гц, 3H)
A-3.036	-Me	-Me	- (C=O) iPr	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-Цианофенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,56 - 7,51 (m, 2H), 7,42 (dd, J = 5,2, 8,9 Гц, 1H), 7,26 - 7,21 (m, 2H), 7,00 (t, J = 8,9 Гц, 1H), 3,84 (s, 3H), 3,02 - 2,92 (m, 1H), 2,91 - 2,80 (m, 2H), 2,75 - 2,65 (m, 1H), 2,54 (spt, J = 7,0 Гц, 1H), 2,25 (s, 3H), 0,98 (d, J = 7,0 Гц, 3H), 0,95 (d, J = 7,0 Гц, 3H)
A-3.038	-Me	-Me	-(C=O) iPr	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-Циклопропилфенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,41 (dd, J=5,2, 8,8 Гц, 1H), 7,04 - 7,00 (m, 2H), 6,98 - 6,94 (m, 2H), 6,97 (t, J=8,8 Гц, 1H), 3,83 (s, 3H), 2,84 - 2,67 (m, 4H), 2,53 (spt, J=7,0 Гц, 1H), 2,24 (s, 3H), 1,85 (tt, J=5,1, 8,4 Гц, 1H), 0,96 (d, J=7,0 Гц, 3H), 0,96 (d, J=7,0 Гц, 3H), 0,94 - 0,88 (m, J=1,9, 8,5 Гц, 2H), 0,68 - 0,61 (m, 2H)

Соединение	R ¹	R ²	G	X	Y	W	D	Подробные данные ЯМР
A-4.029	-Me	-Me	-(C=O) iPr	6-F	3-Cl	(E) - CH=CH-	2-Цианофенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,70 (d, J = 8,1 Гц, 1H), 7,61 - 7,53 (m, 2H), 7,46 (dd, J = 5,1, 8,9 Гц, 1H), 7,34 (dt, J = 1,0, 7,6 Гц, 1H), 7,24 (d, J = 16,5 Гц, 1H), 7,10 - 6,97 (m, 2H), 3,76 (s, 3H), 2,65 (spt, J = 7,0 Гц, 1H), 2,26 (s, 3H), 1,08 (dd, J = 3,0, 7,0 Гц, 6H).
A-4.030	-Me	-Me	-(C=O) iPr	6-F	3-Cl	(E) - CH=CH-	3-Цианофенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,63 - 7,55 (m, 2H), 7,55 - 7,50 (m, 1H), 7,48 - 7,38 (m, 2H), 7,12 - 7,00 (m, 2H), 6,65 (d, J = 16,5 Гц, 1H), 3,70 (s, 3H), 2,65 (spt, J = 7,0 Гц, 1H), 2,24 (s, 3H), 1,09 (dd, J = 7,0, 12,5 Гц, 6H).
A-4.035	-Me	-Me	-(C=O) iPr	6-F	3-Cl	(E) - CH=CH-	4-трет- Бутоксифенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,41 (dd, J = 5,0, 8,6 Гц, 1H), 7,26 - 7,23 (m, 2H), 6,99 (t, J = 8,6 Гц, 1H), 6,94 - 6,90 (m, 1H), 6,91 (d, J = 16,5 Гц, 1H), 6,60 (d, J = 16,5 Гц, 1H), 3,71 (s, 3H), 2,63 (spt, J = 7,0 Гц, 1H), 2,22 (s, 3H), 1,35 (s, 9H), 1,08 (d, J = 7,0 Гц, 3H), 1,06 (d, J = 7,0 Гц, 1H)
A-4.036	-Me	-Me	-(C=O) iPr	6-F	3-Cl	(E) - CH=CH-	4-Цианофенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,62 - 7,55 (m, 2H), 7,45 (dd, J=5,0, 8,5 Гц, 1H), 7,45 - 7,40 (m, 1H), 7,13 (d, J=16,5 Гц, 1H), 7,05 (t, J=8,5 Гц, 1H), 6,68 (d, J=16,5 Гц, 1H), 3,69 (s, 3H), 2,65 (spt, J=7,0 Гц, 1H), 2,23 (s, 3H), 1,11 (d, J=7,0 Гц, 3H), 1,07 (d, J=7,0 Гц, 3H)

Соединение	R ¹	R ²	G	X	Y	W	D	Подробные данные ЯМР
A-1.373	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-(1-Метилпиразол-3-ил)фенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, метанол) δ ppm 7,62 (d, J=8,3 Гц, 2H) 7,57 (d, J=2,3 Гц, 1H) 7,48 - 7,54 (m, 1H), 7,07 - 7,17 (m, 1H), 7,03 (d, J=8,3 Гц, 2H), 6,56 (d, J=2,3 Гц, 1H), 3,91 (s, 3H), 3,73 (s, 3H), 2,63 - 2,85 (m, 4H), 2,32 (s, 3H)
A-1.374	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-(5-Метилтетразол-1-ил)фенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ ppm 7,58 - 7,53 (m, 3H), 7,28 (d, J = 8,2 Гц, 2H), 7,23 (t, J = 8,7 Гц, 1H), 3,61 (s, 3H), 2,87 - 2,68 (m, 4H), 2,53 (s, 3H), 2,27 (s, 3H)
A-1.375	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-Морфолинофенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ ppm 7,55 (dd, J = 5,2, 8,8 Гц, 1H), 7,21 (t, J = 8,8 Гц, 1H), 6,89 - 6,80 (m, 4H), 3,73 - 3,69 (m, 4H), 3,61 (s, 3H), 3,05 - 3,00 (m, 4H), 2,69 - 2,49 (m, 4H), 2,26 (s, 3H)
A-1.376	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-(3-Метилпиразол-1-ил)фенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ = 10,84 (s, 1H), 8,30 (d, J = 2,3 Гц, 1H), 7,65 (d, J = 8,5 Гц, 2H), 7,55 (dd, J = 5,3, 8,7 Гц, 1H), 7,22 (t, J = 8,7 Гц, 1H), 7,07 (d, J = 8,5 Гц, 2H), 6,30 (d, J = 2,3 Гц, 1H), 3,61 (s, 3H), 2,76 - 2,61 (m, 4H), 2,26 (s, 3H), 2,25 (s, 3H)
A-1.377	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-(3,5-Диметилпиразол-1-ил)фенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ = 10,84 (br s, 1H), 7,56 (dd, J = 5,3, 8,7 Гц, 1H), 7,35 (d, J = 8,3 Гц, 2H), 7,22 (t, J = 8,7 Гц, 1H), 7,12 (d, J = 8,3 Гц, 2H), 6,04 (s, 1H), 3,62 (s, 3H), 2,81 - 2,66 (m, 4H), 2,27 (s, 3H), 2,25 (s, 3H), 2,16 (s, 3H)

Соединение	R ¹	R ²	G	X	Y	W	D	Подробные данные ЯМР
A-1.378	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-Пиразол-1-илфенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ = 10,85 (s, 1H), 8,44 (s, 1H), 7,77 - 7,65 (m, 3H), 7,56 (dd, J = 5,3, 8,7 Гц, 1H), 7,22 (t, J = 8,7 Гц, 1H), 7,11 (d, J = 8,2 Гц, 2H), 6,52 (s, 1H), 3,61 (s, 3H), 2,78 - 2,61 (m, 4H), 2,26 (s, 3H)
A-1.379	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-Пиррол-1-илфенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ = 10,85 (s, 1H), 7,56 (dd, J = 5,2, 8,7 Гц, 1H), 7,45 (d, J = 8,4 Гц, 2H), 7,31 (t, J = 2,1 Гц, 2H), 7,22 (t, J = 8,7 Гц, 1H), 7,07 (d, J = 8,4 Гц, 2H), 6,24 (t, J = 2,1 Гц, 2H), 3,62 (s, 3H), 2,76 - 2,60 (m, 4H), 2,27 (s, 3H)
A-1.380	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-(5-Метилтетрагидрофуран-2-ил)фенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,42 - 7,36 (m, 1H), 7,20 - 7,14 (m, 2H), 6,96 - 6,87 (m, 3H), 4,79 - 4,71 (m, 1H), 4,16 - 4,05 (m, 1H), 2,84 - 2,62 (m, 4H), 2,27 (s, 3H), 2,29 - 2,16 (m, 1H), 2,13 - 2,02 (m, 1H), 1,92 - 1,71 (m, 1H), 1,68 - 1,49 (m, 1H), 1,33 (d, J = 6,1 Гц, 3H)
A-1.381	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-(5-Метил-2-фурил)фенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ ppm 7,44 - 7,48 (m, 2H) 7,42 (dd, J=5,2, 8,8 Гц, 1H) 6,93 - 7,00 (m, 3H) 6,47 (d, J=3,2 Гц, 1H) 6,00 - 6,05 (m, 1H) 3,72 (s, 3H) 2,68 - 2,89 (m, 4H) 2,35 (s, 3H) 2,25 (s, 3H)

Соединение	R ¹	R ²	G	X	Y	W	D	Подробные данные ЯМР
A-1.382	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-Оксазол-2-илфенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ ppm 7,75 (d, J=8,2 Гц, 2H), 7,57 (s, 1H), 7,20 (dd, J=5,1, 8,8 Гц, 1H), 7,01 (d, J=8,2 Гц, 2H), 6,84 - 6,91 (m, 2H), 3,77 (s, 3H), 2,74 (td, J=5,2, 12,5 Гц, 1H) 2,58 (td, J=4,9, 12,5 Гц, 1H) 2,32 - 2,42 (m, 4H) 2,11 (td, J=4,9, 12,4 Гц, 1H)
A-1.383	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-(2-Метилтиазол-4-ил)фенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, метанол) δ ppm 7,73 (d, J=8,1 Гц, 2H), 7,55 (s, 1H), 7,51 (dd, J=5,2, 8,7 Гц, 1H), 7,11 (t, J=8,7 Гц, 1H), 7,06 (d, J=8,1 Гц, 2H), 3,73 (s, 3H), 2,65 - 2,86 (m, 7H) 2,33 (s, 3H)
A-1.384	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-(2-Тиенил)фенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, метанол) δ ppm 7,54 - 7,46 (m, 3H), 7,32 (d, J = 3,8 Гц, 2H), 7,10 (t, J = 8,7 Гц, 1H), 7,06 (dd, J = 3,8, 5,1 Гц, 1H), 7,02 (d, J = 8,2 Гц, 2H), 3,72 (s, 3H), 2,84 - 2,64 (m, 4H), 2,32 (s, 3H)
A-1.386	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	1-Фенил-4-пиразолил-	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ ppm 8,20 (s, 1H), 7,78 - 7,74 (m, 2H), 7,56 (dd, J = 5,2, 8,7 Гц, 1H), 7,49 - 7,43 (m, 2H), 7,40 (s, 1H), 7,29 - 7,25 (m, 1H), 7,22 (t, J = 8,7 Гц, 1H), 3,59 (s, 3H), 2,81 - 2,69 (m, 2H), 2,67 - 2,52 (m, 2H), 2,24 (s, 3H)
A-1.387	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	1-Циклопропил-4-пиразолил-	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) δ = 10,77 (s, 1H), 7,54 (dd, J = 5,2, 8,9 Гц, 1H), 7,43 (s, 1H), 7,20 (t, J = 8,7 Гц, 1H), 7,04 (s, 1H), 3,59 (s, 3H), 3,63 - 3,55 (m, 1H), 2,70 - 2,56 (m, 2H), 2,49 - 2,35 (m, 2H), 2,25 (s, 3H), 0,98 - 0,91 (m, 2H), 0,91 - 0,84 (m, 2H)

Соединение	R ¹	R ²	G	X	Y	W	D	Подробные данные ЯМР
A-1.389	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-(Изопропилсульфанилметил)фенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, d6-DMSO), δ ppm 10,82 (br. s, 1H), 7,56 - 7,52 (m, 1H), 7,23 - 7,18 (m, 3H), 6,95 - 6,93 (d, 2H), 3,69 (s, 2H), 3,60 (s, 3H), 2,76-2,49(m, 5H), 2,26 (s, 3H), 1,17 (d, 6H)
A-1.390	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-(Метилсульфамоил)фенил-	¹ H ЯМР (500 МГц, хлороформ) δ ppm 7,68 (d, J = 8,2 Гц, 2H), 7,38 (dd, J = 5,1, 8,7 Гц, 1H), 7,17 - 7,11 (m, J = 8,2 Гц, 2H), 6,96 (t, J = 8,7 Гц, 1H), 3,72 (s, 3H), 2,84 - 2,71 (m, 4H), 2,63 (s, 3H), 2,30 (s, 3H)
A-1.391	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-Сульфоамилфенил-	¹ H ЯМР (500 МГц, хлороформ) δ ppm 7,76 (d, J = 8,4 Гц, 2H), 7,48 (dd, J = 5,2, 8,7 Гц, 2H), 7,15 (d, J = 8,4 Гц, 2H), 7,05 (t, J = 8,7 Гц, 1H), 3,76 (s, 3H), 2,94 - 2,72 (m, 4H), 2,32 (s, 3H)
A-1.392	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-Карбамоилфенил-	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) δ ppm 10,83 (s, 1H), 7,87 (br s, 1H), 7,76 (d, J = 8,2 Гц, 2H), 7,55 (dd, J = 5,3, 8,7 Гц, 1H), 7,26 (br s, 1H), 7,22 (t, J = 8,7 Гц, 1H), 7,07 (d, J = 8,2 Гц, 2H), 3,61 (s, 3H), 2,75 - 2,63 (m, 4H), 2,26 (s, 3H)

В1 Послевсходовая эффективность – тест 1

Семена ряда тестируемых видов высевали в стандартную почву в горшках:-
Solanum nigrum (SOLNI), *Amaranthus retroflexus* (AMARE), *Setaria faberi* (SETFA),
5 *Echinochloa crus-galli* (ECHCG), *Ipomoea hederacea* (IPOHE), *Lolium perenne* (LOLPE).
После культивирования в течение 8 дней (после появления всходов) при контролируемых условиях в теплице (при 24/16°C, день/ночь; 14-часовой световой период; влажность 65%) растения опрыскивали водным раствором для опрыскивания, полученным из состава на основе технического активного ингредиента в растворе
10 ацетон/вода (50:50), содержащем 0,5% Tween 20 (полиоксиэтиленсорбитанмонолаурат,

CAS RN 9005-64-5). Соединения применяли из расчета 1000 г/га. Затем тестируемые растения выращивали в теплице при контролируемых условиях в теплице (при 24/16°C, день/ночь; 14-часовой световой период; влажность 65%) и поливали дважды в день. Через 13 дней в тесте проводили оценку повреждения, выраженного в процентах, которое было нанесено растению. Значения биологической активности определяли по пятибалльной шкале (5 = 80-100%; 4 = 60-79%; 3 = 40-59%; 2 = 20-39%; 1 = 0-19%). Отсутствие значения в таблице указывает на то, что соединение не тестировали в отношении данного вида.

10 **Таблица 5. Контроль некоторых видов сорняков с помощью соединений формулы (I) после послевсходового применения**

Соединение	AMARE	SOLNI	SETFA	LOLPE	ECHCG	IPOHE
A-1.036	5	5	5	5	5	5

B2 Послевсходовая эффективность – тест 2

15 Семена ряда тестируемых видов высевали в стандартную почву в горшках:- *Solanum nigrum* (SOLNI), *Amaranthus retroflexus* (AMARE), *Setaria faberi* (SETFA), *Echinochloa crus-galli* (ECHCG), *Ipomoea hederacea* (IPOHE), *Lolium perenne* (LOLPE). После культивирования в течение 8 дней (после появления всходов) при контролируемых условиях в теплице (при 24/16°C, день/ночь; 14-часовой световой период; влажность 65%) растения опрыскивали водным раствором для опрыскивания, полученным из состава на основе технического активного ингредиента в растворе ацетон/вода (50:50), содержащем 0,5% Tween 20 (полиоксиэтиленсорбитанмонолаурат, CAS RN 9005-64-5). Соединения применяли из расчета 250 г/га. Затем тестируемые растения выращивали в теплице при контролируемых условиях в теплице (при 24/16°C, день/ночь; 14-часовой световой период; влажность 65%) и поливали дважды в день. Через 13 дней в тесте проводили оценку повреждения, выраженного в процентах, которое было нанесено растению. Значения биологической активности определяли по пятибалльной шкале (5 = 80-100%; 4 = 60-79%; 3 = 40-59%; 2 = 20-39%; 1 = 0-19%). Отсутствие значения в таблице указывает на то, что соединение не тестировали в отношении данного вида.

Таблица 6. Контроль некоторых видов сорняков с помощью соединений формулы (I) после послевсходового применения

Соединение	AMARE	SOLNI	SETFA	LOLPE	ECHCG	IPOHE
A-1.024	5	5	5	5	4	5
A-1.025	5	5	5	5	5	5
A-1.026	4	4	2	1	0	0
A-1.027	5	4	5	5	5	4
A-1.028	5	5	5	5	5	5
A-1.029	4	5	4	4	2	5
A-1.030	4	5	4	5	4	5
A-1.031	5	5	4	4	4	4
A-1.032	5	5	5	5	5	5
A-1.033	5	5	5	5	4	5
A-1.034	5	5	5	5	1	5
A-1.035	4	5	4	4	4	4
A-1.036	5	5	5	5	5	5
A-1.037	1	5	5	1	3	5
A-1.038	5	5	5	5	5	5
A-1.039	5	5	5	5	5	5
A-1.040	3	3	0	0	0	0
A-1.041	5	5	4	1	1	2
A-1.042	5	5	5	5	5	3
A-1.044	5	5	5	4	3	0
A-2.030	3	4	0	1	0	4
A-2.037	1	2	1	1	2	2
A-3.028	4	5	4	5	5	5
A-3.029	4	5	2	2	1	5
A-3.030	5	5	5	4	2	5
A-3.035	5	5	5	5	4	5
A-3.036	5	5	4	4	4	5
A-3.038	5	5	5	5	2	5
A-4.029	4	4	0	1	1	4
A-4.030	2	3	0	1	1	3
A-4.035	1	3	0	0	0	3
A-4.036	2	5	1	3	3	4
A-4.038	1	5	0	1	1	2
A-1.383	5	5	5	5	5	5
A-1.384	5	5	5	4	3	5
A-1.385	5	5	5	5	5	5

В3 Послевсходовая эффективность – тест 3

5 Семена ряда тестируемых видов высевали в стандартную почву в горшках:- *Amaranthus retroflexus* (AMARE), *Setaria faberi* (SETFA), *Echinochloa crus-galli* (ECHCG), *Ipomoea hederacea* (IPOHE), *Zea Mays* (ZEAMX), *Abutilon theophrasti* (ABUTH). После

культивирования в течение 8 дней (после появления всходов) при контролируемых условиях в теплице (при 24/16°C, день/ночь; 14-часовой световой период; влажность 65%) растения опрыскивали водным раствором для опрыскивания, полученным из состава на основе технического активного ингредиента в растворе ацетон/вода (50:50), содержащем 0,5% Tween 20 (полиоксиэтиленсорбитанмонолаурат, CAS RN 9005-64-5). Соединения применяли из расчета 250 г/га. Затем тестируемые растения выращивали в теплице при контролируемых условиях в теплице (при 24/16°C, день/ночь; 14-часовой световой период; влажность 65%) и поливали дважды в день. Через 13 дней в тесте проводили оценку повреждения, выраженного в процентах, которое было нанесено растению. Значения биологической активности определяли по пятибалльной шкале (5 = 80-100%; 4 = 60-79%; 3 = 40-59%; 2 = 20-39%; 1 = 0-19%). Отсутствие значения в таблице указывает на то, что соединение не тестировали в отношении данного вида.

Таблица 7. Контроль некоторых видов сорняков с помощью соединений формулы (I) после послевсходового применения

Соединение	AMARE	ZEAMX	SETFA	ABUTH	ECHCG	IPOHE
A-1.380	4	2	3	3	1	3
A-1.381	4	1	2	3	0	4
A-1.382	4	5	4	4	4	5
A-3.386	4	5	4	4	5	4
C-1.013	5	4	4	4	5	4
A-1.386	4	4	4	3	4	4
A-1.387	4	4	4	4	4	4
A-1.388	5	4	4	5	4	4
A-1.389	4	5	5	4	5	5
A-1.390	5	1	5	4		4
A-1.391	4	1	4	2		3
A-1.392	5	2	5	4		3

В4 Предвсходовая эффективность – тест 1

Семена ряда тестируемых видов высевали в стандартную почву в горшках: *Solanum nigrum* (SOLNI), *Amaranthus retroflexus* (AMARE), *Setaria faberi* (SETFA), *Echinochloa crus-galli* (ECHCG), *Ipomoea hederacea* (IPOHE), *Lolium perenne* (LOLPE). После культивирования в течение одного дня (до появления всходов) при контролируемых условиях в теплице (24/16°C, день/ночь; 14-часовой световой период; влажность 65%) растения опрыскивали водным раствором для опрыскивания, полученным из состава на основе технического активного ингредиента в растворе

ацетон/вода (50:50), содержащем 0,5% Tween 20 (полиоксиэтиленсорбитанмонолаурат, CAS RN CAS 9005-64-5). Соединения применяли из расчета 1000 г/га. Затем тестируемые растения выращивали в теплице при контролируемых условиях (при 24/16°C, день/ночь; 14-часовой световой период; влажность 65%) и поливали дважды в день. Через 13 дней в тесте проводили оценку повреждения, выраженного в процентах, которое было нанесено растению. Значения биологической активности определяли по пятибалльной шкале (5 = 80-100%; 4 = 60-79%; 3 = 40-59%; 2 = 20-39%; 1 = 0-19%). Отсутствие значения в таблице указывает на то, что соединение не тестировали в отношении данного вида.

10

Таблица 8. Контроль некоторых видов сорняков с помощью соединений формулы (I) после предвсходного применения

Соединение	AMARE	SOLNI	SETFA	LOLPE	ECHCG	IPOHE
A-1.036	5	5	5	5	5	5

B5 Предвсходовая эффективность – тест 2

Семена ряда тестируемых видов высевали в стандартную почву в горшках: *Solanum nigrum* (SOLNI), *Amaranthus retroflexus* (AMARE), *Setaria faberi* (SETFA), *Echinochloa crus-galli* (ECHCG), *Ipomoea hederacea* (IPOHE), *Lolium perenne* (LOLPE). После культивирования в течение одного дня (до появления всходов) при контролируемых условиях в теплице (24/16°C, день/ночь; 14-часовой световой период; влажность 65%) растения опрыскивали водным раствором для опрыскивания, полученным из состава на основе технического активного ингредиента в растворе ацетон/вода (50:50), содержащем 0,5% Tween 20 (полиоксиэтиленсорбитанмонолаурат, CAS RN CAS 9005-64-5). Соединения применяли из расчета 250 г/га. Затем тестируемые растения выращивали в теплице при контролируемых условиях (при 24/16°C, день/ночь; 14-часовой световой период; влажность 65%) и поливали дважды в день. Через 13 дней в тесте проводили оценку повреждения, выраженного в процентах, которое было нанесено растению. Значения биологической активности определяли по пятибалльной шкале (5 = 80-100%; 4 = 60-79%; 3 = 40-59%; 2 = 20-39%; 1 = 0-19%). Отсутствие значения в таблице указывает на то, что соединение не тестировали в отношении данного вида.

30

Таблица 9. Контроль некоторых видов сорняков с помощью соединений формулы (I) после предвсходового применения

Соединение	AMARE	SOLNI	SETFA	LOLPE	ECHCG	IPONE
A-1.024	5	5	5	4	2	0
A-1.025	5	5	5	4	5	1
A-1.026	0	0	0	0	0	0
A-1.027	5	4	3	2	1	4
A-1.028	5	5	5	5	4	5
A-1.029	3	5	1	2	5	1
A-1.030	5	5	5	4	5	0
A-1.031	3	2	1	1	2	1
A-1.032	5	5	5	5	5	2
A-1.033	1	1	2	1	0	1
A-1.034	0	2	0	0	0	0
A-1.035	4	3	3	3	1	1
A-1.036	5	5	5	5	5	5
A-1.037	1	2	0	0	2	0
A-1.038	5	5	0	5	5	2
A-1.039	5	5	5	4	5	3
A-1.040	0	0	0	0	0	0
A-1.041	4	0	0	0	0	0
A-1.042	5	5	5	1	2	2
A-1.044	5	5	5	2	3	1
A-2.030	0	0	0	0	0	0
A-2.037	0	0	1	1	0	1
A-3.028	5	5	5	5	5	5
A-3.029	4	5	2	2	3	3
A-3.030	5	5	5	4	4	3
A-3.035	4	5	5	5	4	5
A-3.036	5	5	5	5	5	5
A-3.038	5	5	1	5	2	5
A-4.029	2	4	0	0	0	0
A-4.030	3	4	1	2	1	1
A-4.035	0	0	0	1	1	1
A-4.036	2	5	0	1	1	3
A-4.038	2	1	0	0	0	0
A-1.383	5	5	4	3	4	5
A-1.384	2	1	0	0	0	2
A-1.385	5	5	5	5	5	5

В6 Предвсходовая эффективность – тест 3

- 5 Семена ряда тестируемых видов высевали в стандартную почву в горшках: : *Amaranthus retroflexus* (AMARE), *Setaria faberi* (SETFA), *Echinochloa crus-galli* (ECHCG), *Ipomoea hederacea* (IPONE), *Zea Mays* (ZEAMX), *Abutilon theophrasti* (ABUTH). После культивирования в течение одного дня (до появления всходов) при контролируемых

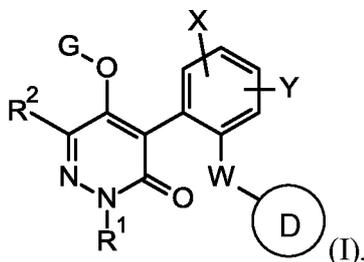
условиях в теплице (24/16°C, день/ночь; 14-часовой световой период; влажность 65%) растения опрыскивали водным раствором для опрыскивания, полученным из состава на основе технического активного ингредиента в растворе ацетон/вода (50:50), содержащем 0,5% Tween 20 (полиоксиэтиленсорбитанмонолаурат, CAS RN CAS 9005-64-5). Соединения применяли из расчета 250 г/га. Затем тестируемые растения выращивали в теплице при контролируемых условиях (при 24/16°C, день/ночь; 14-часовой световой период; влажность 65%) и поливали дважды в день. Через 13 дней в тесте проводили оценку повреждения, выраженного в процентах, которое было нанесено растению. Значения биологической активности определяли по пятибалльной шкале (5 = 80-100%; 4 = 60-79%; 3 = 40-59%; 2 = 20-39%; 1 = 0-19%). Отсутствие значения в таблице указывает на то, что соединение не тестировали в отношении данного вида.

Таблица 10. Контроль некоторых видов сорняков с помощью соединений формулы (I) после предвсходового применения

Соединение	AMARE	ZEAMX	SETFA	ABUTH	ECHCG	IPOHE
A-1.380	5	2	1	4	0	4
A-1.381	3	1	0	1	0	3
A-1.382	5	4	5	4	5	5
A-3.386	5	5	5	5	5	5
C-1.013	5	4	5	5	5	5
A-1.386	2	2	5	2	5	4
A-1.387	5	4	5	4	5	5
A-1.388	5	4	5	5	5	5
A-1.389	5	4	5	3	5	5
A-1.390	5	1	5	5		5
A-1.391	5	0	5	2		2
A-1.392	5	2	5	5	5	5

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Соединение формулы (I),



- 5 или его соль или N-оксид, где
 R¹ представляет собой метил;
 R² представляет собой метил;
 G представляет собой H;
 X представляет собой 6-F;
 10 Y представляет собой 3-Cl;
 W представляет собой -CH₂-CH₂-;
 D представляет собой 4-ацетидамофенил-.
2. Гербицидная композиция, содержащая соединение формулы (I) по п. 1 и
 15 приемлемое с точки зрения сельского хозяйства вспомогательное средство.
3. Гербицидная композиция по п. 2, дополнительно содержащая по меньшей мере
 один дополнительный пестицид.
- 20 4. Гербицидная композиция по п. 3, где дополнительный пестицид представляет
 собой гербицид или антидот гербицида.
5. Способ контроля роста нежелательных растений, включающий применение
 соединения формулы (I) по п. 1 или гербицидной композиции по любому из
 25 пп. 2-4 в отношении нежелательных растений или места их произрастания.
6. Применение соединения формулы (I) по п. 1 в качестве гербицида.

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

(PCT Article 18 and Rules 43 and 44)

Applicant's or agent's file reference 81897-WO-REG-ORG-P-1	FOR FURTHER ACTION see Form PCT/ISA/220 as well as, where applicable, item 5 below.	
International application No. PCT/EP2020/070242	International filing date (<i>day/month/year</i>) 17 July 2020 (17-07-2020)	(Earliest) Priority Date (<i>day/month/year</i>) 18 July 2019 (18-07-2019)
Applicant SYNGENTA CROP PROTECTION AG		

This international search report has been prepared by this International Searching Authority and is transmitted to the applicant according to Article 18. A copy is being transmitted to the International Bureau.

This international search report consists of a total of 4 sheets.

It is also accompanied by a copy of each prior art document cited in this report.

1. **Basis of the report**

a. With regard to the **language**, the international search was carried out on the basis of:

- the international application in the language in which it was filed
 a translation of the international application into _____, which is the language of a translation furnished for the purposes of international search (Rules 12.3(a) and 23.1(b))

b. This international search report has been established taking into account the **rectification of an obvious mistake** authorized by or notified to this Authority under Rule 91 (Rule 43.6*bis*(a)).

c. With regard to any **nucleotide and/or amino acid sequence** disclosed in the international application, see Box No. I.

2. **Certain claims were found unsearchable** (See Box No. II)

3. **Unity of invention is lacking** (see Box No III)

4. With regard to the **title**,

- the text is approved as submitted by the applicant
 the text has been established by this Authority to read as follows:

SUBSTITUTED PYRIDAZINONES AS HERBICIDES

5. With regard to the **abstract**,

- the text is approved as submitted by the applicant
 the text has been established, according to Rule 38.2, by this Authority as it appears in Box No. IV. The applicant may, within one month from the date of mailing of this international search report, submit comments to this Authority

6. With regard to the **drawings**,

- a. the figure of the **drawings** to be published with the abstract is Figure No. _____
 as suggested by the applicant
 as selected by this Authority, because the applicant failed to suggest a figure
 as selected by this Authority, because this figure better characterizes the invention
- b. none of the figures is to be published with the abstract

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2020/070242

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
 INV. C07D237/16 A01N43/58 C07D401/10 C07D403/10 C07D409/10
 C07D413/10 C07D417/10
 ADD.
 According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED
 Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
 C07D A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)
 EPO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 2011/045271 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]; BOJACK GUIDO [DE] ET AL.) 21 April 2011 (2011-04-21) examples claims	1-21
A	WO 2016/008816 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG [CH]) 21 January 2016 (2016-01-21) examples claims	1-21
A	WO 2011/035878 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]; LEHR STEFAN [DE] ET AL.) 31 March 2011 (2011-03-31) examples claims	1-21
	----- -/--	

Further documents are listed in the continuation of Box C. See patent family annex.

* Special categories of cited documents :

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance	"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date	"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)	"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means	"&" document member of the same patent family
"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed	

Date of the actual completion of the international search 13 January 2021	Date of mailing of the international search report 20/01/2021
---	---

Name and mailing address of the ISA/ European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016	Authorized officer Stix-Malaun, Elke
--	--

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2020/070242

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X,P	WO 2019/137851 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG [CH]) 18 July 2019 (2019-07-18) examples claims page 60 - page 100	1-21
X,P	----- WO 2020/114869 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG [CH]) 11 June 2020 (2020-06-11) examples page 44 - page 63 claims -----	1-21

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No PCT/EP2020/070242

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2011045271	A1	21-04-2011	NONE

WO 2016008816	A1	21-01-2016	AR 101201 A1 30-11-2016
		BR 112017000541	A2 26-06-2018
		CN 106536486	A 22-03-2017
		EP 3169668	A1 24-05-2017
		ES 2760264	T3 13-05-2020
		JP 6524207	B2 05-06-2019
		JP 2017522318	A 10-08-2017
		KR 20170029528	A 15-03-2017
		US 2017166535	A1 15-06-2017
		WO 2016008816	A1 21-01-2016

WO 2011035878	A1	31-03-2011	US 2011118118 A1 19-05-2011
		WO 2011035878	A1 31-03-2011

WO 2019137851	A1	18-07-2019	AR 114175 A1 29-07-2020
		AU 2019207340	A1 09-07-2020
		BR 112020013958	A2 01-12-2020
		CA 3087639	A1 18-07-2019
		CN 111566094	A 21-08-2020
		EA 202091638	A1 17-11-2020
		EP 3737667	A1 18-11-2020
		KR 20200108010	A 16-09-2020
		TW 201930271	A 01-08-2019
		UY 38047	A 30-08-2019
		WO 2019137851	A1 18-07-2019

WO 2020114869	A1	11-06-2020	NONE
