



УКРАЇНА

(19) **UA** (11) **130693** (13) **C2**
(51) МПК

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)

НАЦІОНАЛЬНИЙ ОРГАН
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ ВЛАСНОСТІ
ДЕРЖАВНА ОРГАНІЗАЦІЯ
"УКРАЇНСЬКИЙ НАЦІОНАЛЬНИЙ
ОФІС ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ ТА ІННОВАЦІЙ"

(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД

(21) Номер заявки: a 2022 00604 (22) Дата подання заявки: 17.07.2020 (24) Дата, з якої є чинними права інтелектуальної власності: 23.04.2026 (31) Номер попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції: 1910290.4 (32) Дата подання попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції: 18.07.2019 (33) Код держави-учасниці Паризької конвенції, до якої подано попередню заявку: GB (41) Публікація відомостей про заявку: 23.03.2022, Бюл.№ 12 (46) Публікація відомостей про державну реєстрацію: 22.04.2026, Бюл.№ 16 (86) Номер та дата подання міжнародної заявки, поданої відповідно до Договору РСТ: PCT/EP2020/070242, 17.07.2020	(72) Винахідник(и): Лінг Кеннет Брюс (GB), Седен Пітер Тімоті (GB), Мет'юз Крістофер Джон (GB), Шенахен Стівен Едвард (GB), Кіціу Крістіана (GB), Фінні Джон (GB) (73) Володілець (володільці): СІНГЕНТА КРОП ПРОТЕКШН АГ, Rosentalstrasse 67, 4058 Basel, Switzerland (CH) (74) Представник: Петров Андрій Володимирович, реєстр. №139 (56) Перелік документів, взятих до уваги експертизою: WO 2011/045271 A1, 21.04.2011 WO 2016/008816 A1, 21.01.2016 WO 2011/035878 A1, 31.03.2011
---	---

(54) ЗАМІЩЕНІ ПІРИДАЗИНОНИ ЯК ГЕРБІЦИДИ

(57) Реферат:

Винахід стосується гербіцидних заміщених фенілпіридазиндіонів та заміщених фенілпіридазинонових похідних формули (I), а також способів і проміжних сполук, застосовуваних для одержання таких похідних. Даний винахід додатково поширюється на гербіцидні композиції, які містять такі похідні, а також на застосування таких сполук і композицій у забезпеченні контролю росту небажаних рослин, зокрема на застосування в забезпеченні контролю бур'янів, таких як широколисті дводольні бур'яни, у сільськогосподарських культурах корисних рослин.

UA 130693 C2

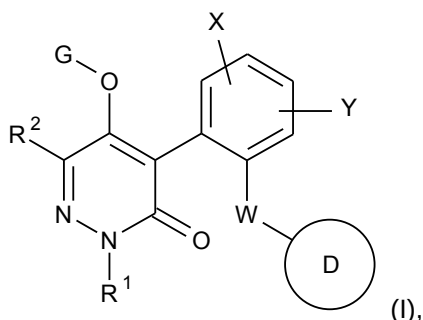
Заміщені піридазинони як гербіциди

Даний винахід стосується гербіцидних заміщених фенілпіридазиндіонів та заміщених фенілпіридазинонових похідних формули (I), а також способів і проміжних сполук, застосовуваних для одержання таких похідних. Даний винахід додатково поширюється на гербіцидні композиції, які містять такі похідні, а також на застосування таких сполук і композицій у забезпеченні контролю росту небажаних рослин, зокрема на застосування в забезпеченні контролю бур'янів, таких як широколисті дводольні бур'яни, у сільськогосподарських культурах корисних рослин.

Гербіцидні піридазинони відомі з WO 2009/086041. Крім того, гербіцидні 5/6-членні гетероциклі-заміщені піридазинони відомі з WO 2011/045271. При цьому у WO 2013/160126 описані індолілпіридазинонові похідні, які проявляють гербіцидну активність.

Даний винахід базується на відкритті того, що заміщені фенілпіридазиндіони та заміщені фенілпіридазинонові похідні формули (I) проявляють несподівано добру гербіцидну активність.

Таким чином, у першому аспекті передбачена сполука формули (I),



або її сіль або N-оксид, де

R¹ вибраний із групи, яка складається з C₁-C₄алкілу, C₃-C₆циклоалкілу, C₃-C₆алкокси, C₁-C₂алкокси-C₁-C₂алкілу, C₂-C₄алкенілу, C₁-C₄галогеналкілу, ціано-C₁-C₄алкілу, C₂-C₄галогеналкенілу, C₂-C₄алкінілу і C₂-C₄галогеналкінілу;

R² вибраний із групи, яка складається з водню, галогену, ціано, C₁-C₆алкілу, C₁-C₆галогеналкілу, C₁-C₆галогеналкокси, C₁-C₃галогеналкокси-C₁-C₃алкіл-, C₁-C₆алкокси, C₁-C₃алкокси-C₁-C₃алкіл-, C₁-C₃алкокси-C₁-C₃алкокси-C₁-C₃алкіл-, C₃-C₆циклоалкілу, C₂-C₆алкенілу, C₂-C₆галогеналкенілу, C₂-C₆алкінілу, C₁-C₆гідроксиалкіл-, C₁-C₆алкілкарбоніл-, -S(O)_mC₁-C₆алкілу, аміно, C₁-C₆алкіламіно, C₁-C₆діалкіламіно, -C(C₁-C₃алкіл)=N-O-C₁-C₃алкілу й C₂-C₆галогеналкінілу;

G являє собою водень або C(O)R³;

R³ вибраний із групи, яка складається з C₁-C₆алкілу, C₂-C₆алкенілу, C₂-C₆алкінілу, C₁-C₆алкіл-S-, C₁-C₆алкокси, -NR⁴R⁵ і фенілу, необов'язково заміщеного одним або декількома R⁶;

кожний з R⁴ та R⁵ незалежно вибраний із групи, яка складається з водню, C₁-C₆алкілу, C₁-C₆алкокси і C₃-C₆циклоалкілу, або R⁴ та R⁵ разом можуть утворювати морфолінільне кільце; і

кожний з R^{4a} та R^{5a} незалежно вибраний із групи, яка складається з C₁-C₆алкокси і C₃-C₆циклоалкілу, або R^{4a} та R^{5a} разом можуть утворювати морфолінільне кільце; і

R⁶ вибраний із групи, яка складається з галогену, ціано, нітро, C₁-C₃алкілу, C₁-C₃галогеналкілу, C₁-C₃алкокси і C₁-C₃галогеналкокси;

кожний з X і Y незалежно являє собою водень, C₁-C₃алкіл, циклопропіл, C₁-C₃алкокси, C₁-C₃галогеналкіл, C₁-C₃галогеналкокси або галоген;

D являє собою заміщене моноциклічне гетероарильне кільце, що містить 1, 2 або 3 гетероатоми, незалежно вибрані з кисню, азоту і сірки, при цьому заміщене за щонайменше одним атомом вуглецю в кільці за допомогою R⁸ і/або за щонайменше одним атомом азоту в кільці за допомогою R⁹;

щонайменше один R⁸ вибраний із групи, яка складається з C₁-C₆галогеналкілкарбоніл-, C₃-C₆циклоалкілкарбоніл-, -S(O)_m-C₁-C₆галогеналкілу, -S(O)_m-C₃-C₆циклоалкілу, -O-S(O)₂C₁-C₃алкілу, -C₁-C₃алкіл-S(O)_m-C₁-C₆алкілу, -C₁-C₃алкіл-S(O)_m-C₁-C₆галогеналкілу, -C₁-C₃алкіл-S(O)_m-C₃-C₆циклоалкілу, ціано-C₁-C₆-алкіл-, -NR^{4a}R^{5a}, -C(S)NR⁴R⁵, -S(O)₂NHC(O)C₁-C₃алкілу, -S(O)₂NR⁴R⁵, -C(O)OH, -C(O)OC₁-C₆алкілу, -C(O)NHS-(O)₂C₁-C₆алкілу, -C(O)NR⁴R⁵, -NR⁴C(O)NR⁴R⁵, C₁-C₆алкілкарбоніл(C₁-C₆алкіл)аміно-, C₁-C₆галогеналкілкарбоніламіно-, C₁-C₆галогеналкілкарбоніл(C₁-C₆алкіл)аміно-, C₁-C₆алкілсульфоніламіно-, C₁-C₆алкілсульфоніл(C₁-C₆алкіл)аміно-, C₁-C₆галогеналкілсульфоніламіно-, C₁-C₆галогеналкілсульфоніл(C₁-C₆алкіл)аміно-, C₃-C₆циклоалкілсульфоніламіно-, C₃-C₆циклоалкілсульфоніл(C₁-C₆алкіл)аміно-,

гідроксиаміно-, гідрокси(C₁-C₆алкіл)аміно, C₁-C₆алкоксиаміно, C₁-C₆алкокси(C₁-C₆алкіл)аміно, C₁-C₆галогеналкоксиаміно, C₁-C₆галогеналкокси(C₁-C₆алкіл)аміно і кільцевої системи, вибраної із групи, яка складається з фенільного кільця, 5-6-членного гетероарильного кільця і 3-6-членного гетероциклічного кільця, при цьому вказана кільцева система заміщена за допомогою 0-5 R¹⁶;

5 щонайменше один R⁹ вибраний із групи, яка складається з C₅-C₆алкілу, C₅-C₆галогеналкілу, C₃-C₆-циклоалкілу, C₁-C₃алкокси-C₃алкіл-, C₃алкокси-C₁-C₂алкіл-, C₁-C₃галогеналкокси-C₁-C₃алкіл-, C₁-C₃алкокси-C₁-C₃алкокси-C₁-C₃алкіл-, C₁-C₆гідроксиалкіл-, -C₁-C₃алкіл-S(O)_m-C₁-C₆алкілу, -C₁-C₃алкіл-S(O)_m-C₁-C₆галогеналкілу, -C₁-C₃алкіл-S(O)_m-C₃-C₆циклоалкілу, ціано-C₁-C₆-алкіл- і кільцевої системи, вибраної із групи, яка складається з фенільного кільця, 5-6-членного гетероарильного кільця і 3-6-членного гетероциклічного кільця, при цьому вказана кільцева система заміщена за допомогою 0-5 R¹⁶;

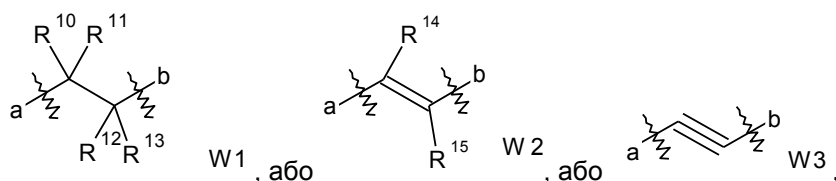
m являє собою ціле число, яке дорівнює 0, 1 або 2;

кожний R¹⁶ незалежно являє собою галоген, ціано, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галогеналкіл, C₁-C₆алкокси або C₁-C₆галогеналкокси;

15 або D являє собою фенільне кільце, заміщене щонайменше одним R⁸;

i

W являє собою або



20 де "a" означає точку приєднання до фенілпіридазиндіонового/фенілпіридазинового фрагмента,

"b" означає точку приєднання до кільця D,

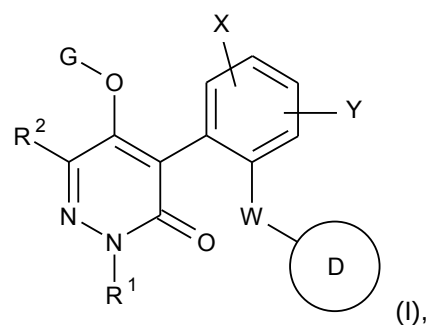
25 кожний з R¹⁰, R¹², R¹⁴ та R¹⁵ незалежно являє собою водень, C₁-C₃алкіл або C₁-C₃галогеналкіл;

або R¹⁰ та R¹² разом з атомами вуглецю, до яких вони приєднані, утворюють C₃-C₆карбоциклічне кільце; і

30 кожний з R¹¹ та R¹³ незалежно являє собою водень, галоген, C₁-C₃алкіл або C₁-C₃галогеналкіл;

за умови, що якщо один з R¹¹ або R¹³ являє собою галоген, C₁-C₃алкіл або C₁-C₃галогеналкіл, то інший являє собою водень.

У другому аспекті передбачена сполука формула (I),



або її сіль або N-оксид, де

40 R¹ вибраний із групи, що складається з C₁-C₄алкілу, C₃-C₆циклоалкілу, C₃-C₆алкокси, C₁-C₂алкокси-C₁-C₂алкілу, C₂-C₄алкенілу, C₁-C₄галогеналкілу, ціано-C₁-C₄алкілу, C₂-C₄галогеналкенілу, C₂-C₄алкінілу та C₂-C₄галогеналкінілу;

R² вибраний із групи, яка складається з водню, галогену, ціано, C₁-C₆алкілу, C₁-C₆галогеналкілу, C₁-C₆галогеналкокси, C₁-C₃галогеналкокси-C₁-C₃алкіл-, C₁-C₆алкокси, C₁-C₃алкокси-C₁-C₃алкілу, C₁-C₃алкокси-C₁-C₃алкокси-C₁-C₃алкіл-, C₃-C₆циклоалкілу, C₂-C₆алкенілу, C₂-C₆галогеналкенілу, C₂-C₆алкінілу, C₁-C₆гідроксиалкіл-, C₁-C₆алкілкарбоніл-, -S(O)_mC₁-C₆алкілу, -NR⁴R⁵, -C(C₁-C₃алкіл)=N-O-C₁-C₃алкілу та C₂-C₆галогеналкінілу;

45 G являє собою водень або C(O)R³;

R^3 вибраний із групи, яка складається з C_1 - C_6 алкілу, C_2 - C_6 алкенілу, C_2 - C_6 алкінілу, C_1 - C_6 алкіл-S-, C_1 - C_6 алкокси, $-NR^4R^5$ і фенілу, необов'язково заміщеного одним або декількома R^6 ;

кожний з R^4 та R^5 незалежно вибраний із групи, яка складається з водню, C_1 - C_6 алкілу, C_1 - C_6 алкокси і C_3 - C_6 циклоалкілу, або R^4 та R^5 разом можуть утворювати морфолінільне кільце; і

5 R^6 вибраний із групи, яка складається з галогену, ціано, нітро, C_1 - C_3 алкілу, C_1 - C_3 галогеналкілу, C_1 - C_3 алкокси і C_1 - C_3 галогеналкокси;

X являє собою циклопропіл (переважно X знаходиться в орто-положенні відносно піридазинового/піридазиндіонового фрагмента);

10 Y являє собою водень, C_1 - C_3 алкіл, циклопропіл, C_1 - C_3 алкокси, C_1 - C_3 галогеналкіл, C_1 - C_3 галогеналкокси або галоген (Y знаходиться в орто-положенні (3-положенні) відносно фрагмента -W-D);

D являє собою заміщене або незаміщене моноциклічне гетероарильне кільце, яке містить 1, 2 або 3 гетероатоми, незалежно вибрані з кисню, азоту і сірки, і при цьому, якщо D є заміщеним, то він заміщений за щонайменше одним атомом вуглецю в кільці за допомогою R^8 і/або за

15 атомом азоту в кільці за допомогою R^9 ;

кожний R^8 незалежно являє собою кисень, гідроксил, галоген, ціано, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_3 - C_6 циклоалкіл, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_6 галогеналкокси, C_1 - C_3 алкокси- C_1 - C_3 алкіл, C_1 - C_3 галогеналкокси- C_1 - C_3 алкіл-, C_1 - C_3 алкокси- C_1 - C_3 алкокси- C_1 - C_3 алкіл-, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкініл, C_2 - C_6 галогеналкініл, C_1 - C_6 гідроксиалкіл-, C_1 - C_6 алкілкарбоніл-, C_1 - C_6 галогеналкілкарбоніл-, C_3 - C_6 циклоалкілкарбоніл-, $-S(O)_m$ - C_1 - C_6 галогеналкіл, $-S(O)_m$ - C_3 - C_6 циклоалкіл, $-O-S(O)_2$ - C_1 - C_3 алкіл, $-C_1$ - C_3 алкіл- $S(O)_m$ - C_1 - C_6 алкіл, $-C_1$ - C_3 алкіл- $S(O)_m$ - C_1 - C_6 галогеналкіл, $-C_1$ - C_3 алкіл- $S(O)_m$ - C_3 - C_6 циклоалкіл, ціано- C_1 - C_6 -алкіл-, NR^4R^5 , $-C(S)NR^4R^5$, $-S(O)_2NHC(O)C_1$ - C_3 алкіл, $-S(O)_2NR^4R^5$, $-C(O)OH$, $-C(O)OC_1$ - C_6 алкіл, $-C(O)NHS-(O)_2C_1$ - C_6 алкіл, $-C(O)NR^4R^5$, $-NR^4C(O)NR^4R^5$, C_1 - C_6 алкілкарбоніл(C_1 - C_6 алкіл)аміно-, C_1 - C_6 галогеналкілкарбоніламіно-, C_1 - C_6 галогеналкілкарбоніл(C_1 - C_6 алкіл)аміно-, C_1 - C_6 алкілсульфоніламіно-, C_1 - C_6 алкілсульфоніл(C_1 - C_6 алкіл)аміно-, C_1 - C_6 галогеналкілсульфоніламіно-, C_1 - C_6 галогеналкілсульфоніл(C_1 - C_6 алкіл)аміно-, C_3 - C_6 циклоалкілсульфоніламіно-, C_3 - C_6 циклоалкілсульфоніл(C_1 - C_6 алкіл)аміно-, гідроксиаміно-, гідрокси(C_1 - C_6 алкіл)аміно-, C_1 - C_6 алкоксиаміно-, C_1 - C_6 алкокси(C_1 - C_6 алкіл)аміно-, C_1 - C_6 галогеналкоксиаміно-, C_1 - C_6 галогеналкокси(C_1 - C_6 алкіл)аміно або кільцеву систему, вибрану з

25 групи, яка складається з фенільного кільця, 5-6-членного гетероарильного кільця і 3-6-членного гетероциклічного кільця, при цьому вказана кільцева система заміщена за допомогою 0-5 R^{16} ;

т являє собою ціле число, що дорівнює 0, 1 або 2 (переважно 0 або 2); і

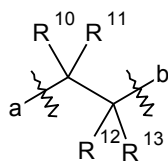
30 кожний R^9 незалежно являє собою C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_3 - C_6 циклоалкіл, C_1 - C_3 алкокси- C_1 - C_3 алкіл, C_1 - C_3 галогеналкокси- C_1 - C_3 алкіл-, C_1 - C_3 алкокси- C_1 - C_3 алкокси- C_1 - C_3 алкіл-, C_1 - C_6 гідроксиалкіл-, $-C_1$ - C_3 алкіл- $S(O)_m$ - C_1 - C_6 алкіл, $-C_1$ - C_3 алкіл- $S(O)_m$ - C_1 - C_6 галогеналкіл, $-C_1$ - C_3 алкіл- $S(O)_m$ - C_3 - C_6 циклоалкіл, ціано- C_1 - C_6 -алкіл- або кільцеву систему, вибрану з групи, яка складається з фенільного кільця, 5-6-членного гетероарильного кільця і 3-6-членного гетероциклічного кільця, при цьому вказана кільцева система заміщена за допомогою 0-5 R^{16} ;

40 кожний R^{16} незалежно являє собою галоген, ціано, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_1 - C_6 алкокси або C_1 - C_6 галогеналкокси;

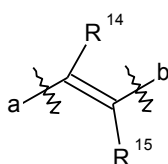
або D являє собою заміщене або незаміщене фенільне кільце, і при цьому, якщо вказане фенільне кільце є заміщеним, то воно заміщене за допомогою 1-5 R^8 ;

і W являє собою або

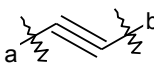
45



W1, або



W2, або



W3, де

"a" означає точку приєднання до фенілпіридазиндіонового/фенілпіридазинонового фрагмента,

50 "b" означає точку приєднання до кільця D,

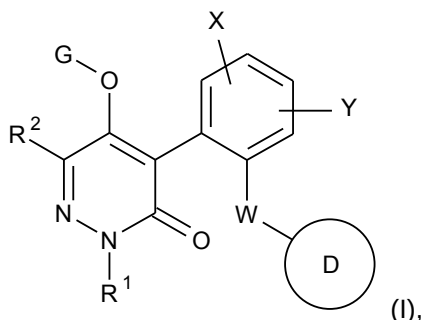
кожний з R^{10} , R^{12} , R^{14} та R^{15} незалежно являє собою водень, C_1 - C_3 алкіл або C_1 - C_3 галогеналкіл;

або R^{10} та R^{12} разом з атомами вуглецю, до яких вони приєднані, утворюють C_3 - C_6 карбоциклічне кільце; і

55 кожний з R^{11} та R^{13} незалежно являє собою водень, галоген, C_1 - C_3 алкіл або C_1 - C_3 галогеналкіл;

за умови, що якщо один з R^{11} або R^{13} являє собою галоген, C_1 - C_3 алкіл або C_1 - C_3 галогеналкіл, то інший являє собою водень.

У третьому аспекті передбачена сполука формула (I),



або її сіль або N-оксид, де

R^1 вибраний із групи, що складається з C_1 - C_4 алкілу, C_3 - C_6 циклоалкілу, C_3 - C_6 алкокси, C_1 - C_2 алкокси- C_1 - C_2 алкілу, C_2 - C_4 алкенілу, C_1 - C_4 галогеналкілу, ціано- C_1 - C_4 алкілу, C_2 - C_4 галогеналкенілу, C_2 - C_4 алкінілу та C_2 - C_4 галогеналкінілу;

R^2 вибраний із групи, яка складається з водню, галогену, ціано, C_1 - C_6 алкілу, C_1 - C_6 галогеналкілу, C_1 - C_6 галогеналкокси, C_1 - C_3 галогеналкокси- C_1 - C_3 алкіл-, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_3 алкокси- C_1 - C_3 алкілу, C_1 - C_3 алкокси- C_1 - C_3 алкокси- C_1 - C_3 алкіл-, C_3 - C_6 циклоалкілу, C_2 - C_6 алкенілу, C_2 - C_6 галогеналкенілу, C_2 - C_6 алкінілу, C_1 - C_6 гідроксиалкіл-, C_1 - C_6 алкілкарбоніл-, $-S(O)_mC_1$ - C_6 алкілу, $-NR^4R^5$, $-C(C_1-C_3алкіл)=N-O-C_1-C_3алкілу$ та C_2 - C_6 галогеналкінілу;

G являє собою водень або $C(O)R^3$;

R^3 вибраний із групи, яка складається з C_1 - C_6 алкілу, C_2 - C_6 алкенілу, C_2 - C_6 алкінілу, C_1 - C_6 алкіл-S-, C_1 - C_6 алкокси, $-NR^4R^5$ і фенілу, необов'язково заміщеного одним або декількома R^6 ;

кожний з R^4 та R^5 незалежно вибраний із групи, яка складається з водню, C_1 - C_6 алкілу, C_1 - C_6 алкокси і C_3 - C_6 циклоалкілу, або R^4 та R^5 разом можуть утворювати морфолінільне кільце; і

R^6 вибраний із групи, яка складається з галогену, ціано, нітро, C_1 - C_3 алкілу, C_1 - C_3 галогеналкілу, C_1 - C_3 алкокси і C_1 - C_3 галогеналкокси;

X являє собою водень, C_1 - C_3 алкіл, циклопропіл, C_1 - C_3 алкокси, C_1 - C_3 галогеналкіл, C_1 - C_3 галогеналкокси або галоген (переважно X знаходиться в орто-положенні відносно піридазинового/піридазиндіонового фрагмента);

Y являє собою циклопропіл (переважно Y знаходиться в орто-положенні відносно фрагмента -W-D);

D являє собою заміщене або незаміщене моноциклічне гетероарильне кільце, яке містить 1, 2 або 3 гетероатоми, незалежно вибрані з кисню, азоту і сірки, і при цьому, якщо D є заміщеним, то він заміщений за щонайменше одним атомом вуглецю в кільці за допомогою R^8 і/або за атомом азоту в кільці за допомогою R^9 ;

кожний R^8 незалежно являє собою кисень, гідроксил, галоген, ціано, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_3 - C_6 циклоалкіл, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_6 галогеналкокси, C_1 - C_3 алкокси- C_1 - C_3 алкіл, C_1 - C_3 галогеналкокси- C_1 - C_3 алкіл-, C_1 - C_3 алкокси- C_1 - C_3 алкокси- C_1 - C_3 алкіл-, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 галогеналкеніл, C_2 - C_6 алкініл, C_2 - C_6 галогеналкініл, C_1 - C_6 гідроксиалкіл-, C_1 - C_6 алкілкарбоніл-, C_1 - C_6 галогеналкілкарбоніл-, C_3 - C_6 циклоалкілкарбоніл-, $-S(O)_mC_1$ - C_6 галогеналкіл, $-S(O)_mC_3$ - C_6 циклоалкіл, $-O-S(O)_2C_1$ - C_3 алкіл, $-C_1$ - C_3 алкіл-S(O) $_m$ - C_1 - C_6 алкіл, $-C_1$ - C_3 алкіл-S(O) $_m$ - C_1 - C_6 галогеналкіл, $-C_1$ - C_3 алкіл-S(O) $_m$ - C_3 - C_6 циклоалкіл, ціано- C_1 - C_6 -алкіл-, NR^4R^5 , $-C(S)NR^4R^5$, $-S(O)_2NHC(O)C_1$ - C_3 алкіл, $-S(O)_2NR^4R^5$, $-C(O)OH$, $-C(O)OC_1$ - C_6 алкіл, $-C(O)NHS-(O)_2C_1$ - C_6 алкіл, $-C(O)NR^4R^5$, $-NR^4C(O)NR^4R^5$, C_1 - C_6 алкілкарбоніл(C_1 - C_6 алкіл)аміно-, C_1 - C_6 галогеналкілкарбоніламіно-, C_1 - C_6 галогеналкілкарбоніл(C_1 - C_6 алкіл)аміно-, C_1 - C_6 алкілсульфоніламіно-, C_1 - C_6 алкілсульфоніл(C_1 - C_6 алкіл)аміно-, C_1 - C_6 галогеналкілсульфоніламіно-, C_1 - C_6 галогеналкілсульфоніл(C_1 - C_6 алкіл)аміно-, C_3 - C_6 циклоалкілсульфоніламіно-, C_3 - C_6 циклоалкілсульфоніл(C_1 - C_6 алкіл)аміно-, гідроксиаміно-, гідрокси(C_1 - C_6 алкіл)аміно, C_1 - C_6 алкоксиаміно, C_1 - C_6 алкокси(C_1 - C_6 алкіл)аміно, C_1 - C_6 галогеналкоксиаміно, C_1 - C_6 галогеналкокси(C_1 - C_6 алкіл)аміно або кільцеву систему, вибрану з групи, яка складається з фенільного кільця, 5-6-членного гетероарильного кільця і 3-6-членного гетероциклічного кільця, при цьому вказана кільцева система заміщена за допомогою 0-5 R^{16} ;

m являє собою ціле число, яке дорівнює 0, 1 або 2; та

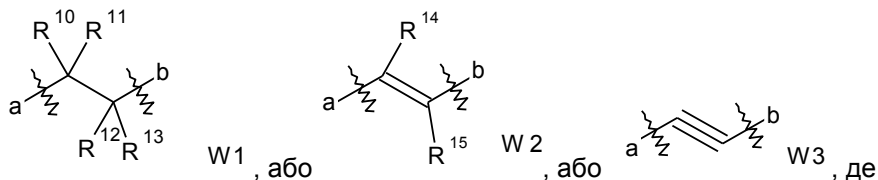
кожний R^9 незалежно являє собою C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_3 - C_6 циклоалкіл, C_1 - C_3 алкокси- C_1 - C_3 алкіл, C_1 - C_3 галогеналкокси- C_1 - C_3 алкіл-, C_1 - C_3 алкокси- C_1 - C_3 алкокси- C_1 - C_3 алкіл-,

C₁-C₆гідроксиалкіл-, -C₁-C₃алкіл-S(O)_m-C₁-C₆алкіл, -C₁-C₃алкіл-S(O)_m-C₁-C₆галогеналкіл, -C₁-C₃алкіл-S(O)_m-C₃-C₆циклоалкіл, ціано-C₁-C₆-алкіл- або кільцеву систему, вибрану з групи, яка складається з фенільного кільця, 5-6-членного гетероарильного кільця і 3-6-членного гетероциклічного кільця, при цьому вказана кільцева система заміщена за допомогою 0-5 R¹⁶;

кожний R¹⁶ незалежно являє собою галоген, ціано, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галогеналкіл, C₁-C₆алкокси або C₁-C₆галогеналкокси;

або D являє собою заміщене або незаміщене фенільне кільце, і при цьому, якщо вказане фенільне кільце є заміщеним, то воно заміщене за допомогою 1-5 R⁸; і

W являє собою або



"a" означає точку приєднання до фенілпіридазиндіонового/фенілпіридазинового фрагмента,

"b" означає точку приєднання до кільця D,

кожний з R¹⁰, R¹², R¹⁴ та R¹⁵ незалежно являє собою водень, C₁-C₃алкіл або C₁-C₃галогеналкіл;

або R¹⁰ та R¹² разом із атомами вуглецю, до яких вони приєднані, утворюють C₃-C₆карбоциклічне кільце;

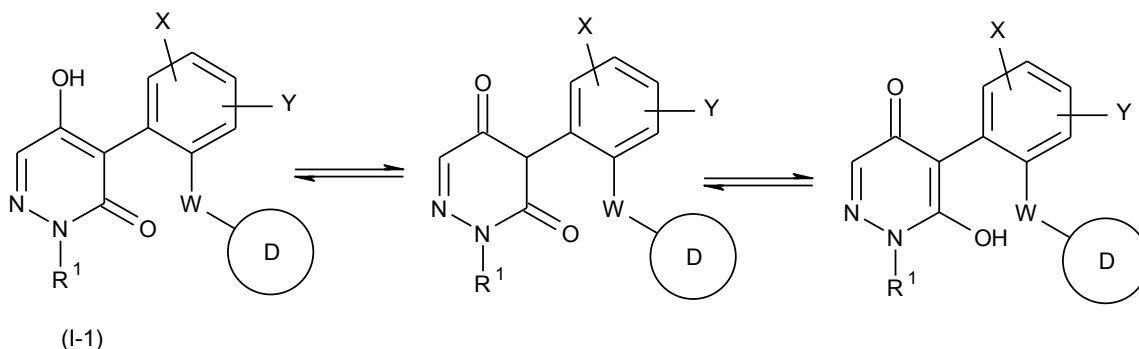
кожний з R¹¹ та R¹³ незалежно являє собою водень, галоген, C₁-C₃алкіл або C₁-C₃галогеналкіл;

за умови, що якщо один з R¹¹ або R¹³ являє собою галоген, C₁-C₃алкіл або C₁-C₃галогеналкіл, то інший являє собою водень.

Сполуки формули (I) можуть містити асиметричні центри та можуть бути представлені у вигляді одного енантіомеру, пар енантіомерів у будь-якій пропорції або, за наявності більше ніж одного асиметричного центру, містити діастереоізомери в усіх можливих співвідношеннях. Зазвичай один з енантіомерів характеризується підвищеною біологічною активністю порівняно з іншими варіантами.

Аналогічно у разі дизамічених алкенів вони можуть бути представлені в E- або Z-формі або у вигляді сумішей обох у будь-якій пропорції.

До того ж сполуки формули (I) можуть бути у стані рівноваги з альтернативними таутомерними формами. Наприклад, сполука формули (I-i), тобто сполука формули (I), де R² являє собою водень, і G являє собою водень, може бути зображена в щонайменше трьох таутомерних формах:



Слід розуміти, що всі таутомерні форми (окремий таутомер або їх суміші), рацемічні суміші й окремі ізомери охоплюються обсягом даного винаходу.

Кожен алкільний фрагмент або окремо, або як частина більшої групи (такої як алкокси, алкілтіо, алкоксикарбоніл, алкілкарбоніл, алкіламінокарбоніл або діалкіламінокарбоніл тощо) може бути з прямим ланцюгом або розгалуженим. Зазвичай алкіл являє собою, наприклад, метил, етил, н-пропіл, ізопропіл, н-бутил, втор-бутил, ізобутил, трет-бутил, н-пентил, неопентил або н-гексил. Алкільні групи зазвичай являють собою C₁-C₆алкільні групи (за винятком випадків,

коли вони вже визначені в більш вузькому сенсі), але переважно являють собою C₁-C₄алкільні або C₁-C₃алкільні групи та більш переважно являють собою C₁-C₂алкільні групи (такі як метил).

Алкенільні та алкінільні фрагменти можуть бути представлені у формі прямих або розгалужених ланцюгів, й алкенільні фрагменти, якщо необхідно, можуть характеризуватись або (E)-, або (Z)-конфігурацією. Алкенільні або алкінільні фрагменти зазвичай являють собою C₂-C₄алкеніл або C₂-C₄алкініл, більш конкретно вініл, аліл, етиніл, пропаргіл або проп-1-ініл. Алкенільні та алкінільні фрагменти можуть містити один або декілька подвійних та/або потрійних зв'язків у будь-якій комбінації, але переважно вони містять тільки один подвійний зв'язок (для алкенілу) або тільки один потрійний зв'язок (для алкінілу).

Переважно термін "циклоалкіл" стосується циклопропілу, циклобутилу, циклопентилу або циклогексилу.

У контексті даного опису термін "арил" переважно означає феніл. Термін "гетероарил", застосовуваний у даному документі, означає ароматичну кільцеву систему, що містить щонайменше один гетероатом у кільці та складається з одинарного кільця. Переважно одинарні кільця будуть містити 1, 2 або 3 гетероатоми в кільці, незалежно вибрані з азоту, кисню та сірки. Зазвичай "гетероарил" являє собою фурил, тієніл, піроліл, піразоліл, імідазоліл, 1,2,3-триазоліл, 1,2,4-триазоліл, оксазоліл, ізоксазоліл, тіазоліл, ізотіазоліл, 1,2,4-оксадіазоліл, 1,3,4-оксадіазоліл, 1,2,5-оксадіазоліл, 1,2,3-тіадіазоліл, 1,2,4-тіадіазоліл, 1,3,4-тіадіазоліл, 1,2,5-тіадіазоліл, піридил, піримідиніл, піридазиніл, піразиніл, 1,2,3-триазиніл, 1,2,4-триазиніл або 1,3,5-триазиніл.

Гетероциклільні групи та гетероциклічні кільця (або окремо, або як частина більшої групи, такої як гетероцикліл-алкіл-) являють собою кільцеві системи, які містять щонайменше один гетероатом, і можуть перебувати у моно- або біциклічній формі. Переважно гетероциклільні групи будуть містити до двох гетероатомів, які переважно будуть вибрані з азоту, кисню та сірки. Приклади гетероциклічних груп включають оксетаніл, тіетаніл, азетидиніл та 7-оксабіцикло[2.2.1]гепт-2-іл. Гетероциклільні групи, які містять один атом кисню як гетероатом, є найбільш переважними. Гетероциклільні групи переважно являють собою 3-8-членні, більш переважно 3-6-членні моноциклічні кільця і можуть бути повністю або частково насиченими.

Галоген (або галогенід) охоплює фтор, хлор, бром або йод. Те саме, відповідно, стосується галогену в контексті інших визначень, таких як галогеналкіл або галогенфеніл.

Галогеналкільними групами з довжиною ланцюга від 1 до 6 атомів вуглецю є, наприклад, фторметил, дифторметил, трифторметил, хлорметил, дихлорметил, трихлорметил, 2,2,2-трифторетил, 2-фторетил, 2-хлоретил, пентафторетил, 1,1-дифтор-2,2,2-трихлоретил, 2,2,3,3-тетрафторетил та 2,2,2-трихлоретил, гептафтор-н-пропіл і перфтор-н-гексил.

Алкоксигрупи переважно характеризуються довжиною ланцюга від 1 до 6 атомів вуглецю. Алкокси являє собою, наприклад, метокси, етокси, пропокси, ізопропокси, н-бутокси, ізобутокси, втор-бутокси або трет-бутокси або ізомер пентилокси або гексилокси, переважно метокси та етокси. Також слід розуміти, що два алкокси-замісники можуть бути наявними на одному й тому ж атомі вуглецю.

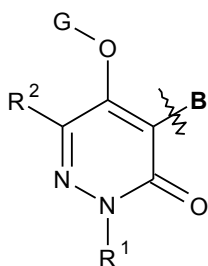
Галогеналкокси являє собою, наприклад, фторметокси, дифторметокси, трифторметокси, 2,2,2-трифторетокси, 1,1,2,2-тетрафторетокси, 2-фторетокси, 2-хлоретокси, 2,2-дифторетокси або 2,2,2-трихлоретокси, переважно дифторметокси, 2-хлоретокси або трифторметокси.

C₁-C₆алкіл-S- (алкілтіо) являє собою, наприклад, метилтіо, етилтіо, пропілтіо, ізопропілтіо, н-бутилтіо, ізобутилтіо, втор-бутилтіо або трет-бутилтіо, переважно метилтіо або етилтіо.

C₁-C₆алкіл-S(O)- (алкілсульфініл) являє собою, наприклад, метилсульфініл, етилсульфініл, пропілсульфініл, ізопропілсульфініл, н-бутилсульфініл, ізобутилсульфініл, втор-бутилсульфініл або трет-бутилсульфініл, переважно метилсульфініл або етилсульфініл.

C₁-C₆алкіл-S(O)₂- (алкілсульфоніл) являє собою, наприклад, метилсульфоніл, етилсульфоніл, пропілсульфоніл, ізопропілсульфоніл, н-бутилсульфоніл, ізобутилсульфоніл, втор-бутилсульфоніл або трет-бутилсульфоніл, переважно метилсульфоніл або етилсульфоніл.

Група Q



(Q) згадується в даному документі як піридазиндіононий/піридазинононий фрагмент, де B означає точку приєднання до решти молекули (тобто до необов'язково заміщеного феніл-W-D-фрагмента).

Даний винахід також включає прийнятні в сільському господарстві солі, які сполуки формули (I) можуть утворювати з амінами (наприклад, аміаком, диметиламіном і триетиламіном), основами лужних металів та лужноземельних металів або четвертинними амонієвими основами. Серед гідроксидів, оксидів, алкоксидів, і гідрокарбонатів, і карбонатів лужних металів та лужноземельних металів, застосовуваних як солеутворювачі, особливу увагу слід приділяти гідроксидам, алкоксидам, оксидам і карбонатам літію, натрію, калію, магнію та кальцію, але особливо гідроксидам, алкоксидам, оксидам і карбонатам натрію, магнію та кальцію. Також можна застосовувати відповідну триметилсульфонієву сіль. Сполуки формули (I) згідно з даним винаходом також включають гідрати, які можуть бути утворені під час солеутворення.

Переважні значення 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, Dr, G, X, Y, і m викладені нижче, і сполука формули (I) відповідно до даного винаходу може містити будь-яку комбінацію вказаних значень. Фахівцю в даній галузі буде зрозуміло, що значення для будь-якої вказаної групи варіантів здійснення можна комбінувати зі значеннями для будь-якої іншої групи варіантів здійснення, якщо такі комбінації не є взаємовиключними.

Переважно R^1 вибраний із групи, що складається з метилу, етилу, пропілу (зокрема, n- або циклопропілу), пропаргілу або C_1 галогеналкілу. Більш переважно R^1 являє собою метил, етил, циклопропіл, пропаргіл або C_1 фторалкіл. Ще більш переважно R^1 являє собою метил, етил, циклопропіл або пропаргіл. Найбільш переважно R^1 являє собою метил.

Переважно R^2 вибраний із групи, що складається з водню, галогену, C_1 - C_6 алкілу, C_1 - C_6 галогеналкілу, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_3 алкокси- C_1 - C_3 алкіл-, C_3 - C_6 циклоалкілу, C_2 - C_6 алкенілу, C_2 - C_6 галогеналкенілу, C_2 - C_6 алкінілу і C_2 - C_6 галогеналкінілу. Більш переважно R^2 вибраний із групи, що складається з хлору, фтору, метилу, етилу, циклопропілу, трифторметилу і метоксиметилу, ще більш переважно хлору, циклопропілу, трифторметилу або метилу, найбільш переважно хлору або метилу. В одній групі варіантів здійснення даного винаходу R^2 являє собою водень. У додатковій групі варіантів здійснення R^2 являє собою циклопропіл, у третій групі варіантів здійснення R^2 являє собою метил, у четвертій групі варіантів здійснення R^2 являє собою трифторметил, і в п'ятій групі варіантів здійснення R^2 являє собою хлор.

Як описано в даному документі, G може являти собою водень або -C(O)- R^3 , та R^3 вибраний із групи, що складається з C_1 - C_6 алкілу, C_2 - C_6 алкенілу, C_2 - C_6 алкінілу, C_1 - C_6 алкіл-S-, C_1 - C_6 алкокси, -NR⁴R⁵ та фенілу, необов'язково заміщеного одним або декількома R^6 .

Як визначено в даному документі, R^4 та R^5 незалежно вибрані з групи, яка складається з водню, C_1 - C_6 алкілу, C_1 - C_6 алкокси і C_3 - C_6 циклоалкілу, або вони разом можуть утворювати морфолінільне кільце. У контексті замісника G (і, таким чином, також R^3) кожний із R^4 та R^5 переважно незалежно вибраний із групи, яка складається з метилу, етилу, пропілу, метокси, етокси і пропокси, і вони можуть називатися R^{34} та R^{35} відповідно. У контексті інших замісників (наприклад, R^2 , R^8) кожний з R^4 та R^5 переважно незалежно являє собою водень, C_1 - C_3 алкіл, C_1 - C_3 алкокси або C_3 - C_6 циклоалкіл, і вони можуть називатися R^{84} та R^{85} відповідно. Якщо в більшому фрагменті міститься більше ніж один R^4 , наприклад у групі -NR⁴C(O)NR⁴R⁵, фахівцю у даній галузі буде зрозуміло, що кожний R^4 визначається незалежно, і тому в такому фрагменті дві групи R^4 можуть бути або однаковими, або ж вони можуть відрізнитися одна від одної.

R^6 вибраний із групи, яка складається з галогену, ціано, нітро, C_1 - C_3 алкілу, C_1 - C_3 галогеналкілу, C_1 - C_3 алкокси і C_1 - C_3 галогеналкокси. Переважно R^6 вибраний із групи, яка складається з галогену, C_1 - C_3 алкілу і C_1 - C_3 галогеналкілу.

Переважно R^3 являє собою C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_3 алкеніл, C_2 - C_3 алкініл, - C_1 - C_4 алкокси, -NR⁴R⁵, де R^4 та R^5 разом утворюють морфолінільне кільце, або феніл. Більш переважно R^3 являє собою ізопропіл, трет-бутил, метил, етил, пропаргіл, метокси, етокси або трет-бутокс. Більш переважно R^3 являє собою ізопропіл, трет-бутил, метил, етил, пропаргіл або метокси.

В одній групі варіантів здійснення G являє собою водень або $-C(O)-R^3$, де R^3 являє собою C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_3 алкеніл, C_2 - C_3 алкініл або $-C_1$ - C_4 алкокси. У додатковій групі варіантів здійснення G являє собою водень або $-C(O)-R^3$, де R^3 являє собою ізопропіл, трет-бутил, метил, етил, пропаргіл або метокси. Однак особливо переважно, щоб G являв собою водень або $-C(O)-R^3$, де R^3 являє собою ізопропіл.

Якщо Y являє собою циклопропіл, то X переважно являє собою водень, циклопропіл, галоген або C_1 галогеналкіл, більш переважно водень, фтор, хлор, бром або C_1 фторалкіл, і ще більш переважно водень, фтор, хлор або трифторметил. Найбільш переважно, якщо Y являє собою циклопропіл, X являє собою фтор. В одній групі варіантів здійснення переважно, щоб X знаходився в орто-положенні (6-положення) відносно піридазинового/піридазиндіонового фрагмента (група Q). Особливо переважно, щоб X являв собою фтор, хлор або C_1 галогеналкіл (зокрема, C_1 фторалкіл) і знаходився в орто-положенні (6-положення) відносно піридазинового/піридазиндіонового фрагмента (група Q). Найбільш переважно X являє собою фтор і знаходиться в орто-положенні (6-положення) відносно піридазинового/піридазиндіонового фрагмента (група Q).

Якщо X являє собою циклопропіл, то Y переважно являє собою водень, C_1 - C_3 алкіл, циклопропіл, C_1 - C_3 галогеналкіл або галоген, і більш переважно Y являє собою водень, хлор, фтор або бром у таких варіантах здійснення. Найбільш переважно, якщо X являє собою циклопропіл, Y являє собою хлор.

В одній групі варіантів здійснення переважно, щоб Y знаходився в орто-положенні (3-положення) відносно фрагмента $-W-D$. У додатковій групі варіантів здійснення Y знаходиться в пара-положенні відносно піридазинового/піридазиндіонового фрагмента (група Q).

Особливо переважно, щоб Y знаходився в орто-положенні (3-положення) відносно фрагмента $-W-D$ і являв собою галоген, зокрема хлор або фтор; більш переважно хлор.

Як описано в даному документі, D являє собою заміщене або незаміщене фенільне кільце (Dp) або являє собою заміщене або незаміщене 5- або 6-членне моноциклічне гетероарильне кільце, яка містить 1, 2 або 3 гетероатоми, незалежно вибрані з кисню, азоту і сірки, і при цьому, якщо D являє собою заміщене гетероарильне кільце або заміщене фенільне кільце, то він заміщений за щонайменше одним атомом вуглецю в кільці за допомогою R^8 і/або, в разі гетероарильного кільця, за атомом азоту в кільці за допомогою R^9 . Якщо D являє собою заміщене або незаміщене 5- або 6-членне моноциклічне гетероарильне кільце, то він переважно являє собою заміщене (як описано в даному документі) або незаміщене фурильне, тієнільне, піролільне, піразолільне, імідазолільне, 1,2,3-триазолільне, 1,2,4-триазолільне, оксазолільне, ізоксазолільне, тіазолільне, ізотіазолільне, 1,2,4-оксадіазолільне, 1,3,4-оксадіазолільне, 1,2,5-оксадіазолільне, 1,2,3-тіадіазолільне, 1,2,4-тіадіазолільне, 1,3,4-тіадіазолільне, 1,2,5-тіадіазолільне, піридилільне, піридонільне, піримідинільне, піридазинільне, піразинільне, 1,2,3-триазинільне, 1,2,4-триазинільне або 1,3,5-триазинільне кільце.

У таких варіантах здійснення D переважно являє собою заміщене (як описано в даному документі) або незаміщене піридилільне, піразолільне, тіазолільне, піримідинільне, тієнільне, триазолільне або оксадіазолільне кільце та більш переважно піридилільне кільце.

В одній групі варіантів здійснення D являє собою заміщене (як описано в даному документі) або незаміщене піразолільне, імідазолільне, оксазолільне, ізоксазолільне, тіазолільне, ізотіазолільне, піридилільне, піридонільне, піримідинільне, піридазинільне або піразинільне кільце.

У додатковій групі таких варіантів здійснення D являє собою заміщене (як описано в даному документі) або незаміщене оксазолільне, тіазолільне або піридилільне кільце. У деяких варіантах здійснення D являє собою заміщене або незаміщене піридилільне кільце або заміщене або незаміщене тіазолільне кільце.

Заміщення D за допомогою R^8 буде залежати від наявності або відсутності циклопропілу в положенні X і/або Y. Однак загалом, якщо D являє собою заміщене 5- або 6-членне гетероарильне кільце, то він переважно заміщений за допомогою 1 або 2 R^8 і/або 1 R^9 , більш переважно 1 або 2 R^8 . Якщо D являє собою 5-членне заміщене гетероарильне кільце, то він найбільш переважно заміщений за допомогою 1 R^8 . Якщо D являє собою заміщене фенільне кільце, то він переважно заміщений за допомогою 1 або 2 R^8 , більш переважно 1 R^8 .

Якщо щонайменше один з X і Y являє собою циклопропіл, і D є заміщеним, то кожний R^8 може бути незалежно вибраний із водню, кисню, гідроксилу, галогену, ціано, C_1 - C_6 алкілу, C_1 - C_6 галогеналкілу, C_3 - C_6 -циклоалкілу, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_6 галогеналкокси, C_1 - C_3 алкокси- C_1 - C_3 алкілу, C_1 - C_3 галогеналкокси- C_1 - C_3 алкіл-, C_1 - C_3 алкокси- C_1 - C_3 алкокси- C_1 - C_3 алкіл-, C_2 - C_6 алкенілу, C_2 - C_6 галогеналкенілу, C_2 - C_6 алкінілу, C_2 - C_6 галогеналкінілу, C_1 - C_6 гідроксиалкіл-, C_1 - C_6 алкілкарбоніл-, C_1 - C_6 галогеналкілкарбоніл-, C_3 - C_6 циклоалкілкарбоніл-, $-S(O)_m$ - C_1 -

С₆галогеналкілу, -S(O)_m-С₃-С₆циклоалкілу, -O-S(O)₂С₁-С₃алкілу, -С₁-С₃алкіл-S(O)_m-С₁-С₆алкілу, -С₁-С₃алкіл-S(O)_m-С₁-С₆галогеналкілу, -С₁-С₃алкіл-S(O)_m-С₃-С₆циклоалкілу, ціано-С₁-С₆-алкіл-, NR⁴R⁵, -C(S)NR⁴R⁵, -S(O)₂NHC(O)С₁-С₃алкілу, -S(O)₂NR⁴R⁵, -C(O)ОН, -C(O)OC₁-С₆алкілу, -C(O)NHS-(O)₂С₁-С₆алкілу, -C(O)NR⁴R⁵, -NR⁴C(O)NR⁴R⁵, С₁-С₆алкілкарбоніл(С₁-С₆алкіл)аміно-, С₁-С₆галогеналкілкарбоніламіно-, С₁-С₆галогеналкілкарбоніл(С₁-С₆алкіл)аміно-, -NR⁴C(O)NR⁴R⁵, С₁-С₆алкілсульфоніламіно-, С₁-С₆алкілсульфоніл(С₁-С₆алкіл)аміно-, С₁-С₆галогеналкілсульфоніламіно-, С₁-С₆галогеналкілсульфоніл(С₁-С₆алкіл)аміно-, С₃-С₆циклоалкілсульфоніламіно-, С₃-С₆циклоалкілсульфоніл(С₁-С₆алкіл)аміно-, гідроксиаміно-, гідрокси(С₁-С₆алкіл)аміно, С₁-С₆алкоксиаміно, С₁-С₆алкокси(С₁-С₆алкіл)аміно, С₁-С₆галогеналкоксиаміно, С₁-С₆галогеналкокси(С₁-С₆алкіл)аміно або кільцевої системи, вибраної із групи, яка складається з фенільного кільця, 5-6-членного гетероарильного кільця і 3-6-членного гетероциклічного кільця, при цьому вказана кільцева система заміщена за допомогою 0-5 R¹⁶;

т являє собою ціле число, що дорівнює 0, 1 або 2 (переважно 0 або 2); і кожний R⁹ незалежно являє собою водень, С₁-С₆алкіл, С₁-С₆галогеналкіл, С₃-С₆-циклоалкіл, С₁-С₃алкокси-С₁-С₃алкіл, С₁-С₃галогеналкокси-С₁-С₃алкіл-, С₁-С₃алкокси-С₁-С₃алкокси-С₁-С₃алкіл-, С₁-С₆гідроксиалкіл-, -С₁-С₃алкіл-S(O)_m-С₁-С₆алкіл, -С₁-С₃алкіл-S(O)_m-С₁-С₆галогеналкіл, -С₁-С₃алкіл-S(O)_m-С₃-С₆циклоалкіл, ціано-С₁-С₆-алкіл- або кільцеву систему, вибрану з групи, яка складається з фенільного кільця, 5-6-членного гетероарильного кільця і 3-6-членного гетероциклічного кільця, при цьому вказана кільцева система заміщена за допомогою 0-5 R¹⁶; кожний R¹⁶ незалежно являє собою галоген, ціано, С₁-С₆алкіл, С₁-С₆галогеналкіл, С₁-С₆алкокси або С₁-С₆галогеналкокси.

Якщо обидва з X і Y є відмінними від циклопропілу, і D являє собою фенільне кільце, D буде заміщений щонайменше одним R⁸, вибраним із групи, яка складається з С₁-С₆галогеналкілкарбоніл-, С₃-С₆циклоалкілкарбоніл-, -S(O)_m-С₁-С₆галогеналкілу, -S(O)_m-С₃-С₆циклоалкілу, -O-S(O)₂С₁-С₃алкілу, -С₁-С₃алкіл-S(O)_m-С₁-С₆алкілу, -С₁-С₃алкіл-S(O)_m-С₁-С₆галогеналкілу, -С₁-С₃алкіл-S(O)_m-С₃-С₆циклоалкілу, ціано-С₁-С₆-алкіл-, -NR^{4a}R^{5a}, -C(S)NR⁴R⁵, -S(O)₂NHC(O)С₁-С₃алкілу, -S(O)₂NR⁴R⁵, -C(O)ОН, -C(O)OC₁-С₆алкілу, -C(O)NHS-(O)₂С₁-С₆алкілу, -C(O)NR⁴R⁵, -NR⁴C(O)NR⁴R⁵, С₁-С₆алкілкарбоніл(С₁-С₆алкіл)аміно-, С₁-С₆галогеналкілкарбоніламіно-, С₁-С₆галогеналкілкарбоніл(С₁-С₆алкіл)аміно-, С₁-С₆алкілсульфоніламіно-, С₁-С₆алкілсульфоніл(С₁-С₆алкіл)аміно-, С₁-С₆галогеналкілсульфоніламіно-, С₁-С₆галогеналкілсульфоніл(С₁-С₆алкіл)аміно-, С₃-С₆циклоалкілсульфоніламіно-, С₃-С₆циклоалкілсульфоніл(С₁-С₆алкіл)аміно-, гідроксиаміно-, гідрокси(С₁-С₆алкіл)аміно, С₁-С₆алкоксиаміно, С₁-С₆алкокси(С₁-С₆алкіл)аміно, С₁-С₆галогеналкоксиаміно, С₁-С₆галогеналкокси(С₁-С₆алкіл)аміно або кільцевої системи, вибраної із групи, яка складається з фенільного кільця, 5-6-членного гетероарильного кільця і 3-6-членного гетероциклічного кільця, при цьому вказана кільцева система заміщена за допомогою 0-5 R¹⁶; де m, R⁴, R⁵ та R¹⁶ є такими, як визначено в даному документі.

Як визначено в даному документі, в контексті, де обидва з X і Y відрізняються від циклопропілу, кожний з R^{4a} та R^{5a} незалежно вибраний із групи, яка складається з С₁-С₆алкокси і С₃-С₆циклоалкілу, або R⁴ та R⁵ разом можуть утворювати морфолінільне кільце.

Будь-який додатковий замісник R⁸ може бути вибраний із групи, яка складається з кисню, гідроксилу, галогену, ціано, С₁-С₆алкілу, С₁-С₆галогеналкілу, С₃-С₆циклоалкілу, С₁-С₆алкокси, С₁-С₆галогеналкокси, С₁-С₃алкокси-С₁-С₃алкілу, С₁-С₃галогеналкокси-С₁-С₃алкіл-, С₁-С₃алкокси-С₁-С₃алкіл-, С₂-С₆алкенілу, С₂-С₆галогеналкенілу, С₂-С₆алкінілу, С₂-С₆галогеналкінілу, С₁-С₆гідроксиалкіл-, С₁-С₆алкілкарбоніл-, С₁-С₆галогеналкілкарбоніл-, С₃-С₆циклоалкілкарбоніл-, -S(O)_m-С₁-С₆галогеналкілу, -S(O)_m-С₃-С₆циклоалкілу, -O-S(O)₂С₁-С₃алкілу, -С₁-С₃алкіл-S(O)_m-С₁-С₆алкілу, -С₁-С₃алкіл-S(O)_m-С₁-С₆галогеналкілу, -С₁-С₃алкіл-S(O)_m-С₃-С₆циклоалкілу, ціано-С₁-С₆-алкіл-, NR⁴R⁵, -C(S)NR⁴R⁵, -S(O)₂NHC(O)С₁-С₃алкілу, -S(O)₂NR⁴R⁵, -C(O)ОН, -C(O)OC₁-С₆алкілу, -C(O)NHS-(O)₂С₁-С₆алкілу, -C(O)NR⁴R⁵, -NR⁴C(O)NR⁴R⁵, С₁-С₆алкілкарбоніл(С₁-С₆алкіл)аміно-, С₁-С₆галогеналкілкарбоніламіно-, С₁-С₆галогеналкілкарбоніл(С₁-С₆алкіл)аміно-, -NR⁴C(O)NR⁴R⁵, С₁-С₆алкілсульфоніламіно-, С₁-С₆алкілсульфоніл(С₁-С₆алкіл)аміно-, С₁-С₆галогеналкілсульфоніламіно-, С₁-С₆галогеналкілсульфоніл(С₁-С₆алкіл)аміно-, С₃-С₆циклоалкілсульфоніламіно-, С₃-С₆циклоалкілсульфоніл(С₁-С₆алкіл)аміно-, гідроксиаміно-, гідрокси(С₁-С₆алкіл)аміно, С₁-С₆алкоксиаміно, С₁-С₆алкокси(С₁-С₆алкіл)аміно, С₁-С₆галогеналкоксиаміно, С₁-С₆галогеналкокси(С₁-С₆алкіл)аміно або кільцевої системи, вибраної із групи, яка складається з фенільного кільця, 5-6-членного гетероарильного кільця і 3-6-членного гетероциклічного кільця, при цьому вказана кільцева система заміщена за допомогою 0-5 R¹⁶; де m, R⁴, R⁵ та R¹⁶ є такими, як визначено в даному документі.

Якщо обидва з X і Y є відмінними від циклопропілу, і D являє собою моноциклічне гетероарильне кільце, то D буде або заміщений за атомом вуглецю в кільці щонайменше одним R⁸, вибраним із групи, яка складається з C₁-C₆галогеналкілкарбоніл-, C₃-C₆циклоалкілкарбоніл-, -S(O)_m-C₁-C₆галогеналкілу, -S(O)_m-C₃-C₆циклоалкілу, -O-S(O)₂C₁-C₃алкілу, -C₁-C₃алкіл-S(O)_m-C₁-C₆алкілу, -C₁-C₃алкіл-S(O)_m-C₁-C₆галогеналкілу, -C₁-C₃алкіл-S(O)_m-C₃-C₆циклоалкілу, ціано-C₁-C₆-алкіл-, NR^{4a}R^{5a}, -C(S)NR⁴R⁵, -S(O)₂NHC(O)C₁-C₃алкілу, -S(O)₂NR⁴R⁵, -C(O)OH, -C(O)OC₁-C₆алкілу, -C(O)NHS-(O)₂C₁-C₆алкілу, -C(O)NR⁴R⁵, -NR⁴C(O)NR⁴R⁵, C₁-C₆алкілкарбоніл(C₁-C₆алкіл)аміно-, C₁-C₆галогеналкілкарбоніламіно-, C₁-C₆галогеналкілкарбоніл(C₁-C₆алкіл)аміно-, C₁-C₆алкілсульфоніламіно-, C₁-C₆алкілсульфоніл(C₁-C₆алкіл)аміно-, C₁-C₆галогеналкілсульфоніламіно-, C₁-C₆галогеналкілсульфоніл(C₁-C₆алкіл)аміно-, C₃-C₆циклоалкілсульфоніламіно-, C₃-C₆циклоалкілсульфоніл(C₁-C₆алкіл)аміно-, гідроксиаміно-, гідрокси(C₁-C₆алкіл)аміно-, C₁-C₆алкоксиаміно-, C₁-C₆алкокси(C₁-C₆алкіл)аміно-, C₁-C₆галогеналкоксиаміно-, C₁-C₆галогеналкокси(C₁-C₆алкіл)аміно і кільцевої системи, вибраної із групи, яка складається з фенільного кільця, 5-6-членного гетероарильного кільця і 3-6-членного гетероциклічного кільця, при цьому вказана кільцева система заміщена за допомогою 0-5 R¹⁶; і/або D буде заміщений за атомом азоту в кільці щонайменше одним R⁹, вибраним із групи, яка складається з C₅-C₆алкілу, C₅-C₆галогеналкілу, C₃-C₆циклоалкілу, C₁-C₃алкокси-C₃алкіл-, C₃алкокси-C₁-C₂алкіл-, C₁-C₃галогеналкокси-C₁-C₃алкіл-, C₁-C₃алкокси-C₁-C₃алкокси-C₁-C₃алкіл-, C₁-C₆гідроксиалкіл-, -C₁-C₃алкіл-S(O)_m-C₁-C₆алкілу, -C₁-C₃алкіл-S(O)_m-C₁-C₆галогеналкілу, -C₁-C₃алкіл-S(O)_m-C₃-C₆циклоалкілу, ціано-C₁-C₆-алкіл- і кільцевої системи, вибраної із групи, яка складається з фенільного кільця, 5-6-членного гетероарильного кільця і 3-6-членного гетероциклічного кільця, при цьому вказана кільцева система заміщена за допомогою 0-5 R¹⁶; де m, R⁴, R⁵, R^{4a}, R^{5a} та R¹⁶ є такими, як визначено в даному документі.

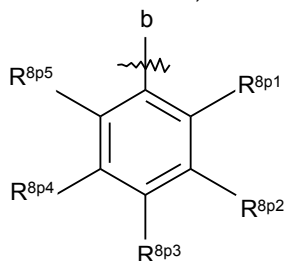
У таких варіантах здійснення, де обидва з X і Y є відмінними від циклопропілу, будь-які додаткові замісники R⁸ при атомі вуглецю в кільці можуть бути вибрані з групи, яка складається з групи, яка складається з кисню, гідроксилу, галогену, ціано, C₁-C₆алкілу, C₁-C₆галогеналкілу, C₃-C₆циклоалкілу, C₁-C₆алкокси, C₁-C₆галогеналкокси, C₁-C₃алкокси-C₁-C₃алкілу, C₁-C₃галогеналкокси-C₁-C₃алкіл-, C₁-C₃алкокси-C₁-C₃алкокси-C₁-C₃алкіл-, C₂-C₆алкенілу, C₂-C₆галогеналкенілу, C₂-C₆алкінілу, C₂-C₆галогеналкінілу, C₁-C₆гідроксиалкіл-, C₁-C₆алкілкарбоніл-, C₁-C₆галогеналкілкарбоніл-, C₃-C₆циклоалкілкарбоніл-, -S(O)_m-C₁-C₆галогеналкілу, -S(O)_m-C₃-C₆циклоалкілу, -O-S(O)₂C₁-C₃алкілу, -C₁-C₃алкіл-S(O)_m-C₁-C₆алкілу, -C₁-C₃алкіл-S(O)_m-C₁-C₆галогеналкілу, -C₁-C₃алкіл-S(O)_m-C₃-C₆циклоалкілу, ціано-C₁-C₆-алкіл-, -NR⁴R⁵, -C(S)NR⁴R⁵, -S(O)₂NHC(O)C₁-C₃алкілу, -S(O)₂NR⁴R⁵, -C(O)OH, -C(O)OC₁-C₆алкілу, -C(O)NHS-(O)₂C₁-C₆алкілу, -C(O)NR⁴R⁵, -NR⁴C(O)NR⁴R⁵, C₁-C₆алкілкарбоніл(C₁-C₆алкіл)аміно-, C₁-C₆галогеналкілкарбоніламіно-, C₁-C₆галогеналкілкарбоніл(C₁-C₆алкіл)аміно-, C₁-C₆алкілсульфоніламіно-, C₁-C₆алкілсульфоніл(C₁-C₆алкіл)аміно-, C₁-C₆галогеналкілсульфоніламіно-, C₁-C₆галогеналкілсульфоніл(C₁-C₆алкіл)аміно-, C₃-C₆циклоалкілсульфоніламіно-, C₃-C₆циклоалкілсульфоніл(C₁-C₆алкіл)аміно-, гідроксиаміно-, гідрокси(C₁-C₆алкіл)аміно-, C₁-C₆алкоксиаміно-, C₁-C₆алкокси(C₁-C₆алкіл)аміно-, C₁-C₆галогеналкоксиаміно-, C₁-C₆галогеналкокси(C₁-C₆алкіл)аміно або кільцевої системи, вибраної із групи, яка складається з фенільного кільця, 5-6-членного гетероарильного кільця і 3-6-членного гетероциклічного кільця, при цьому вказана кільцева система заміщена за допомогою 0-5 R¹⁶; де m, R⁴, R⁵ та R¹⁶ є такими, як визначено в даному документі, і/або будь-які додаткові замісники R⁹ при атомі азоту в кільці можуть бути вибрані з групи, яка складається з C₁-C₆алкілу, C₁-C₆галогеналкілу, C₃-C₆циклоалкілу, C₁-C₃алкокси-C₁-C₃алкілу, C₁-C₃галогеналкокси-C₁-C₃алкіл-, C₁-C₃алкокси-C₁-C₃алкокси-C₁-C₃алкіл-, C₁-C₆гідроксиалкіл-, -C₁-C₃алкіл-S(O)_m-C₁-C₆алкілу, -C₁-C₃алкіл-S(O)_m-C₁-C₆галогеналкілу, -C₁-C₃алкіл-S(O)_m-C₃-C₆циклоалкілу, ціано-C₁-C₆-алкіл- і кільцевої системи, вибраної з групи, яка складається з фенільного кільця, 5-6-членного гетероарильного кільця і 3-6-членного гетероциклічного кільця, при цьому вказана кільцева система заміщена за допомогою 0-5 R¹⁶; де m, R⁴, R⁵ та R¹⁶ є такими, як визначено в даному документі.

У варіантах здійснення, де щонайменше один з X і Y являє собою циклопропіл, кожний R⁸ переважно незалежно являє собою оксо, C₁-C₄алкіл, C₁-C₄галогеналкіл, галоген, ціано, аміно, -NHC(O)CH₃, гідроксил, C₁-C₄алкокси або C₁-C₄алкілтіо. Більш переважно кожний R⁸ незалежно являє собою оксо, C₁-C₄алкіл, C₁-C₄галогеналкіл, галоген, ціано, гідроксил, C₁-C₄алкокси або C₁-C₄алкілтіо, найбільш переважно кожний R⁸ незалежно являє собою галоген або C₁-C₄галогеналкіл.

У варіантах здійснення, де щонайменше один з X і Y являє собою циклопропіл, кожний R⁹ переважно незалежно являє собою C₁-C₄алкіл, C₁-C₄галогеналкіл, гідроксил, C₁-C₄алкокси або C₁-C₄алкілтіо.

У конкретних варіантах здійснення, де щонайменше один з X і Y являє собою циклопропіл, і D являє собою заміщене або незаміщене 5- або 6-членне моноциклічне гетероарильне кільце, як описано вище, D вибраний із групи, яка складається з 4-хлор-3-піридилу, 4-трифторметилпіридилу, 3-піридилу і 2-хлортіазо-5-їлу, 2-хлор-3-піридилу, 3-хлор-4-піридилу, 1-метил-3-(трифторметил)-піразол-4-їлу, тіазол-2-їлу, тіазол-5-їлу, піримідин-5-їлу, 4-(трет-бутоксифенілу), 2-хлор-4-піридилу, 2-метил-4-піридилу, 2-трифторметил-4-піридилу, 4-піридилу, 2-аміно-4-піридилу, тіофен-3-їлу, 1-метилпіразол-4-їлу, 2-метилтріазол-4-їлу, 5-метил-1,3,4-оксадіазол-2-їлу, 5-метил-3-піридилу, 5-метил-2-піридилу, 6-метил-2-піридилу, 3-метил-2-піридилу, 6-хлор-3-піридилу, 3-трифторметил-3-піридилу, 4-метил-2-піридилу, 2-ацетамідотіазол-5-їлу, 2-фтор-4-піридилу і 2-трифторметил-3-піридилу. У підгрупі цих варіантів здійснення D вибраний із групи, яка складається з 4-хлор-3-піридилу, 4-трифторметилпіридилу, 3-піридилу і 2-хлортіазо-5-їлу, 2-хлор-3-піридилу, 3-хлор-4-піридилу, 1-метил-3-(трифторметил)-піразол-4-їлу, тіазол-2-їлу, тіазол-5-їлу, піримідин-5-їлу, 4-(трет-бутоксифенілу), 2-хлор-4-піридилу, 2-метил-4-піридилу, 2-трифторметил-4-піридилу, 4-піридилу, тіофен-3-їлу, 5-метил-3-піридилу, 5-метил-2-піридилу, 6-метил-2-піридилу, 3-трифторметил-3-піридилу, 2-фтор-4-піридилу і 2-трифторметил-3-піридилу. У додатковій підгрупі цих варіантів здійснення D вибраний із групи, яка складається з 4-хлор-3-піридилу, 4-трифторметилпіридилу, 3-піридилу, 2-фтор-4-піридилу і 2-хлортіазо-5-їлу (переважно 2-фтор-4-піридилу).

Якщо D являє собою фенільне кільце D_p і є заміщеним, то він може бути заміщений за допомогою 1-5 R⁸ і, таким чином, може бути представлений наступною структурою:



(D_p), де щонайменше один із R^{8p1}, R^{8p2}, R^{8p3}, R^{8p4} та R^{8p5} є відмінним від водню. Фахівець у даній галузі зрозуміє, що якщо щонайменше один з R^{8p1}, R^{8p2}, R^{8p3}, R^{8p4} та R^{8p5} не являє собою водень, то будь-яке положення, що залишилося, при фенільному кільці може бути незаміщеним або альтернативно нести додатковий замісник R⁸, положення якого при фенільному кільці позначене надрядковим числом p. Якщо D_p є незаміщеним, то R^{8p1}, R^{8p2}, R^{8p3}, R^{8p4} та R^{8p5} будуть відсутніми.

Як указано вище, заміщення D за допомогою R⁸ буде залежати від наявності або відсутності циклопропілу в положенні X і/або Y. Таким чином, у D_p, де щонайменше один з X і Y являє собою циклопропіл, переважно, щоб один або декілька з R^{8p1}, R^{8p2}, R^{8p3}, R^{8p4} та R^{8p5} незалежно були вибрані з групи, яка складається з ціано, аміно, C₁-C₃діалкіламіно, гідрокси, C₁-C₃залкілу, C₁-C₄алкокси, C₁-C₃галогеналкілу, C₁-C₃галогеналкокси і галогену, і b являє собою точку приєднання до решти молекули.

В одній такій групі варіантів здійснення кожний з одного або декількох з R^{8p1}, R^{8p2}, R^{8p3}, R^{8p4} та R^{8p5} незалежно вибраний із ціано, C₁-C₃залкілу, C₁-C₄алкокси, C₁-C₃галогеналкілу, C₁-C₃галогеналкокси або галогену. Переважно один або декілька з R^{8p1}, R^{8p2}, R^{8p3}, R^{8p4} та R^{8p5} незалежно вибрані з ціано, галогену (зокрема, хлору або фтору), метилу, метокси і трифторметилу.

У ще одній групі варіантів здійснення кожний з R^{8p1}, R^{8p2}, R^{8p4} та R^{8p5} відсутній, та R^{8p3} являє собою ціано, C₁-C₃залкіл, C₁-C₄алкокси, C₁-C₃галогеналкіл, C₁-C₃галогеналкокси або галоген. Переважно в цій групі варіантів здійснення R^{8p3} являє собою галоген, більш переважно хлор.

У додатковій групі варіантів здійснення кожний з R^{8p1}, R^{8p4} та R^{8p5} відсутній, і кожний з R^{8p2} та R^{8p3} незалежно являє собою ціано, C₁-C₃залкіл, C₁-C₄алкокси, C₁-C₃галогеналкіл, C₁-C₃галогеналкокси або галоген. У цій групі варіантів здійснення особливо переважно, щоб кожний з R^{8p2} та R^{8p3} незалежно являв собою галоген, і більш переважно, щоб обидва з R^{8p2} та R^{8p3} являли собою хлор.

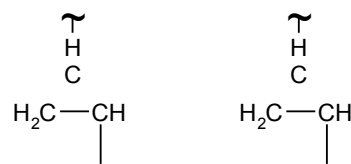
В одній особливо переважній групі варіантів здійснення, де щонайменше один з X і/або Y являє собою циклопропіл, D являє собою незаміщене фенільне кільце.

У додаткових варіантах здійснення, особливо переважній групі варіантів здійснення, де щонайменше один з X і/або Y являє собою циклопропіл, D вибраний із групи, яка складається з 4-хлорфенілу, 4-трифторметилфенілу, 4-ціанофенілу, 4-фторфенілу, 3,4-дифторфенілу, 2-трифторметилфенілу і 4-толїлу.

W виконує функцію лінкерного фрагмента, що зв'язує кільце D з рештою молекули (тобто з фенілпіридазиновим/фенілпіридазиндіоновим фрагментом). Сполуки формули (I), де лінкер являє собою W1, мають гербіцидну активність, при цьому сполуки формули (I), де лінкер являє собою W2, можуть не тільки мати гербіцидну активність, але також бути придатними проміжними сполуками в одержанні сполук формули (I), що містять W1-лінкери. Таким чином, у першій групі варіантів здійснення W являє собою W1, при цьому у другій групі варіантів здійснення W являє собою W2. У третій групі варіантів здійснення W являє собою $-C\equiv C-$.

Переважно кожний з R^{10} , R^{11} , R^{12} та R^{13} незалежно вибраний із водню або C_1 -С3алкілу. В одній групі варіантів здійснення всі з R^{10} , R^{11} , R^{12} та R^{13} являють собою водень.

Переважно кожний з R^{14} та R^{15} незалежно вибраний із водню або C_1 -С3алкілу. В одній групі варіантів здійснення обидва з R^{14} та R^{15} являють собою водень.



Конкретні приклади W включають $-CH_2-CH_2-$ і $-CH=CH-$, цис- і транс- та $-C\equiv C-$. У більш переважних варіантах здійснення W являє собою або $-CH_2-CH_2-$, або $-CH=CH-$ (зокрема, (E) $-CH=CH-$), ще більш переважно $-CH_2-CH_2-$.

В одній переважній групі варіантів здійснення (де обидва з X і Y є відмінними від циклопропілу) у сполуці формули (I):

R^1 являє собою метил, етил, циклопропіл, пропаргіл або C_1 фторалкіл;

R^2 являє собою хлор, циклопропіл, трифторметил або метил;

G являє собою водень або $-C(O)-R^3$, де R^3 являє собою ізопропіл, трет-бутил, метил, етил, пропаргіл, метокси, етокси або трет-бутокс;

X являє собою фтор, хлор або C_1 галогеналкіл і знаходиться в орто-положенні відносно піридазинового/піридазиндіонового фрагмента;

Y являє собою водень, хлор, фтор або бром і знаходиться в орто-положенні відносно фрагмента $-W-D$;

D являє собою фенільне кільце, заміщене щонайменше одним R^8 , вибраним із групи, яка складається з C_1 - C_6 галогеналкілкарбоніл-, C_3 - C_6 циклоалкілкарбоніл-, $-S(O)_m$ - C_1 - C_6 галогеналкілу, $-S(O)_m$ - C_3 - C_6 циклоалкілу, $-O-S(O)_2$ - C_1 -С3алкілу, $-C_1$ -С3алкіл- $S(O)_m$ - C_1 - C_6 алкілу, $-C_1$ -С3алкіл- $S(O)_m$ - C_1 - C_6 галогеналкілу, $-C_1$ -С3алкіл- $S(O)_m$ - C_3 - C_6 циклоалкілу, ціано- C_1 - C_6 -алкіл-, $-NR^{4a}R^{5a}$, $-C(S)NR^4R^5$, $-S(O)_2NHC(O)C_1$ -С3алкілу, $-S(O)_2NR^4R^5$, $-C(O)OH$, $-C(O)OC_1$ -С6алкілу, $-C(O)NHS(O)_2C_1$ -С6алкілу, $-C(O)NR^4R^5$, $-NR^4C(O)NR^4R^5$, C_1 -С6алкілкарбоніл(C_1 -С6алкіл)аміно-, C_1 -С6галогеналкілкарбоніламіно-, C_1 -С6галогеналкілкарбоніл(C_1 -С6алкіл)аміно-, C_1 -С6алкілсульфоніламіно-, C_1 -С6алкілсульфоніл(C_1 -С6алкіл)аміно-, C_1 -С6галогеналкілсульфоніламіно-, C_1 -С6галогеналкілсульфоніл(C_1 -С6алкіл)аміно-, C_3 -С6циклоалкілсульфоніламіно-, C_3 -С6циклоалкілсульфоніл(C_1 -С6алкіл)аміно-, гідроксиаміно-, гідрокси(C_1 -С6алкіл)аміно-, C_1 -С6алкоксиаміно-, C_1 -С6алкокси(C_1 -С6алкіл)аміно-, C_1 -С6галогеналкоксиаміно і C_1 -С6галогеналкокси(C_1 -С6алкіл)аміно або кільцевої системи, вибраної із групи, яка складається з фенільного кільця, 5-6-членного гетероарильного кільця і 3-6-членного гетероциклічного кільця, при цьому вказана кільцева система заміщена за допомогою 0-5 R^{16} ; і

будь-який додатковий замісник R^8 може бути вибраний із групи, яка складається з гідроксилу, галогену, ціано, C_1 -С6алкілу, C_1 -С6галогеналкілу, C_3 -С6циклоалкілу, C_1 -С6алкокси, C_2 -С6алкенілу і C_2 -С6алкінілу;

кожний з R^4 та R^5 незалежно являє собою водень, C_1 -С3алкіл, C_1 -С3алкокси або C_3 -С6циклоалкіл;

m являє собою ціле число, яке дорівнює 0, 1 або 2 (переважно 0 або 2);

кожний з R^{4a} та R^{5a} незалежно вибраний із групи, яка складається з C_1 -С6алкокси і C_3 -С6циклоалкілу, або R^{4a} та R^{5a} разом можуть утворювати морфолінільне кільце; і

кожний R^{16} незалежно являє собою галоген, ціано, C_1 -С6алкіл, C_1 -С6галогеналкіл, C_1 -С6алкокси або C_1 -С6галогеналкокси;

W являє собою W1; і

всі з R^{10} , R^{11} , R^{12} та R^{13} являють собою водень.

У більш переважній групі варіантів здійснення (де обидва з X і Y є відмінними від циклопропілу) у сполуці формули (I):

R^1 являє собою метил;

R^2 являє собою метил;

G являє собою водень або $-C(O)-R^3$, де R^3 являє собою ізопропіл, трет-бутил, метил, етил, пропаргіл, метокси, етокси або трет-бутокс;

Х являє собою фтор і знаходиться в орто-положенні відносно піридазинового/піридазиндіонового фрагмента;

Y являє собою хлор і знаходиться в орто-положенні відносно фрагмента $-W-D$;

D являє собою фенільне кільце, заміщене за допомогою 1 або 2 R^8 , де щонайменше один R^8 вибраний із групи, яка складається з C_1-C_6 галогеналкілкарбоніл-, C_3-C_6 циклоалкілкарбоніл-, $-S(O)_m-C_1-C_6$ галогеналкілу, $-S(O)_m-C_3-C_6$ циклоалкілу, $-O-S(O)_2C_1-C_3$ алкілу, $-C_1-C_3$ алкіл- $S(O)_m-C_1-C_6$ алкілу, $-C_1-C_3$ алкіл- $S(O)_m-C_1-C_6$ галогеналкілу, $-C_1-C_3$ алкіл- $S(O)_m-C_3-C_6$ циклоалкілу, $-S(O)_2NHC(O)C_1-C_3$ алкілу, $-S(O)_2NR^4R^5$, $-C(O)OH$, $-C(O)OC_1-C_6$ алкілу, $-C(O)NHS-(O)_2C_1-C_6$ алкілу, $-C(O)NR^4R^5$, $-NR^4C(O)NR^4R^5$, C_1-C_6 алкілкарбоніл(C_1-C_6 алкіл)аміно-, C_1-C_6 галогеналкілкарбоніламіно- і C_1-C_6 галогеналкілкарбоніл(C_1-C_6 алкіл)аміно- або кільцевої системи, вибраної із групи, яка складається з фенільного кільця, 5-6-членного гетероарильного кільця і 3-6-членного гетероциклічного кільця, при цьому вказана кільцева система заміщена за допомогою 0-5 R^{16} ; і

будь-який додатковий замісник R^8 може бути вибраний із групи, яка складається з галогену, C_1-C_6 алкілу і C_1-C_6 галогеналкілу;

кожний з R^4 та R^5 незалежно являє собою водень, C_1-C_3 алкіл, C_1-C_3 алкокси або C_3-C_6 циклоалкіл;

m дорівнює 0 або 2 (переважно 0);

кожний R^{16} незалежно являє собою галоген, ціано, C_1-C_4 алкіл, C_1-C_3 галогеналкіл або C_1-C_4 алкокси;

W являє собою $W1$; і

всі з R^{10} , R^{11} , R^{12} та R^{13} являють собою водень.

У ще більш переважній групі варіантів здійснення (де обидва з X і Y є відмінними від циклопропілу) у сполучі формули (I):

R^1 являє собою метил;

R^2 являє собою метил;

G являє собою водень або $-C(O)-R^3$, де R^3 являє собою ізопропіл, трет-бутил, метил, етил, пропаргіл або метокси;

Х являє собою фтор і знаходиться в орто-положенні відносно піридазинового/піридазиндіонового фрагмента;

Y являє собою хлор і знаходиться в орто-положенні відносно фрагмента $-W-D$;

D являє собою фенільне кільце, заміщене одним R^8 , вибраним із групи, яка складається з $-C_1-C_3$ алкіл- $S(O)_m-C_1-C_6$ алкілу, $-S(O)_2NHC(O)C_1-C_3$ алкілу, $-S(O)_2NR^4R^5$, $-C(O)OH$, $-C(O)OC_1-C_6$ алкілу і $-C(O)NR^4R^5$ або кільцевої системи, вибраної із групи, яка складається з фенілу, морфолінілу, тетрагідрофуранілу, фурилу, тієнілу, піролілу, піразолілу, імідазолілу, 1,2,3-триазолілу, 1,2,4-триазолілу, тетразолілу, оксазолілу, ізоксазолілу, тіазолілу, ізотіазолілу, 1,2,4-оксадіазолілу, 1,3,4-оксадіазолілу, 1,2,5-оксадіазолілу, 1,2,3-тіадіазолілу, 1,2,4-тіадіазолілу, 1,3,4-тіадіазолілу, 1,2,5-тіадіазолілу, піридили, піридонілу, піримідинілу, піридазинілу, піразинілу, 1,2,3-триазинілу, 1,2,4-триазинілу або 1,3,5-триазинільного кільця, при цьому вказана кільцева система заміщена за допомогою 0-2 R^{16} ;

кожний з R^4 та R^5 незалежно являє собою водень або C_1-C_3 алкіл;

m дорівнює 0 або 2 (переважно 0);

кожний R^{16} незалежно являє собою галоген або C_1-C_4 алкіл (переважно метил);

W являє собою $W1$; і

всі з R^{10} , R^{11} , R^{12} та R^{13} являють собою водень.

У все ще більш переважній групі варіантів здійснення (де обидва з X і Y є відмінними від циклопропілу) у сполучі формули (I):

R^1 являє собою метил;

R^2 являє собою метил;

G являє собою водень або $-C(O)-R^3$, де R^3 являє собою ізопропіл;

Х являє собою фтор і знаходиться в орто-положенні відносно піридазинового/піридазиндіонового фрагмента;

Y являє собою хлор і знаходиться в орто-положенні відносно фрагмента $-W-D$;

D являє собою фенільне кільце, заміщене одним R^8 , вибраним із групи, яка складається з метилсульфанілметилу, ізопропілсульфанілметилу, сульфамілу, метилсульфамілу і карбамілу або кільцевої системи, вибраної із групи, яка складається з фенілу, морфолінілу,

тетрагідрофуранілу, фурилу, тієнілу, піролілу, піразолілу, 1,2,4-триазолілу, оксазолілу і тiazолільного кільця, при цьому вказана кільцева система заміщена за допомогою 0-2 R¹⁶;

кожний R¹⁶ являє собою метил;

W являє собою W1; і

5 всі з R¹⁰, R¹¹, R¹² та R¹³ являють собою водень.

В альтернативній переважній групі варіантів здійснення (де обидва з X і Y є відмінними від циклопропілу) у сполучі формули (I):

R¹ являє собою метил, етил, циклопропіл, пропаргіл або C₁фторалкіл;

R² являє собою хлор, циклопропіл, трифторметил або метил;

10 G являє собою водень або -C(O)-R³, де R³ являє собою ізопропіл, трет-бутил, метил, етил, пропаргіл, метокси, етокси або трет-бутокс;

X являє собою фтор, хлор або C₁галогеналкіл і знаходиться в орто-положенні відносно піридазинового/піридазиндіонового фрагмента;

Y являє собою водень, хлор, фтор або бром і знаходиться в орто-положенні відносно фрагмента -W-D;

15 D являє собою 5- або 6-членне моноциклічне гетероарильне кільце, яке містить 1, 2 або 3 гетероатоми, незалежно вибрані з кисню, азоту і сірки, або заміщене за атомом вуглецю в кільці щонайменше одним R⁸, вибраним із групи, яка складається з C₁-C₆галогеналкілкарбоніл-, C₃-C₆циклоалкілкарбоніл-, -S(O)_m-C₁-C₆галогеналкілу, -S(O)_m-C₃-C₆циклоалкілу, -O-S(O)₂C₁-C₃алкілу, -C₁-C₃алкіл-S(O)_m-C₁-C₆алкілу, -C₁-C₃алкіл-S(O)_m-C₁-C₆галогеналкілу, -C₁-C₃алкіл-S(O)_m-C₃-C₆циклоалкілу, ціано-C₁-C₆-алкіл-, NR^{4a}R^{5a}, -C(S)NR⁴R⁵, -S(O)₂NHC(O)C₁-C₃алкілу, -S(O)₂NR⁴R⁵, -C(O)OH, -C(O)OC₁-C₆алкілу, -C(O)NHS-(O)₂C₁-C₆алкілу, -C(O)NR⁴R⁵, -NR⁴C(O)NR⁴R⁵, C₁-C₆алкілкарбоніл(C₁-C₆алкіл)аміно-, C₁-C₆галогеналкілкарбоніламіно-, C₁-C₆галогеналкілкарбоніл(C₁-C₆алкіл)аміно-, C₁-C₆алкілсульфоніламіно-, C₁-C₆алкілсульфоніл(C₁-C₆алкіл)аміно-, C₁-C₆галогеналкілсульфоніламіно-, C₁-C₆галогеналкілсульфоніл(C₁-C₆алкіл)аміно-, C₃-C₆циклоалкілсульфоніламіно-, C₃-C₆циклоалкілсульфоніл(C₁-C₆алкіл)аміно-, гідроксиаміно-, гідрокси(C₁-C₆алкіл)аміно, C₁-C₆алкоксиаміно, C₁-C₆алкокси(C₁-C₆алкіл)аміно, C₁-C₆галогеналкоксиаміно, C₁-C₆галогеналкокси(C₁-C₆алкіл)аміно і кільцевої системи, вибраної із групи, яка складається з фенільного кільця, 5-6-членного гетероарильного кільця і 3-6-членного гетероциклічного кільця, при цьому вказана кільцева система заміщена за допомогою 0-5 R¹⁶; і

30 будь-який додатковий замісник R⁸ може бути вибраний із групи, яка складається з гідроксилу, галогену, ціано, C₁-C₆алкілу, C₁-C₆галогеналкілу, C₃-C₆циклоалкілу, C₁-C₆алкокси, C₂-C₆алкенілу і C₂-C₆алкінілу; і/або D буде заміщений за атомом азоту в кільці щонайменше одним R⁹, вибраним із групи, яка складається з C₅-C₆алкілу, C₅-C₆галогеналкілу, C₃-C₆циклоалкілу, C₁-C₃алкокси-C₃алкіл-, C₃алкокси-C₁-C₂алкіл-, C₁-C₃галогеналкокси-C₁-C₃алкіл-, C₁-C₃алкокси-C₁-C₃алкіл-, C₁-C₆гідроксиалкіл-, -C₁-C₃алкіл-S(O)_m-C₁-C₆алкілу, -C₁-C₃алкіл-S(O)_m-C₁-C₆галогеналкілу, -C₁-C₃алкіл-S(O)_m-C₃-C₆циклоалкілу, ціано-C₁-C₆-алкіл- і кільцевої системи, вибраної із групи, яка складається з фенільного кільця, 5-6-членного гетероарильного кільця і 3-6-членного гетероциклічного кільця, при цьому вказана кільцева система заміщена за допомогою 0-5 R¹⁶;

40 кожний з R⁴ та R⁵ незалежно являє собою водень, C₁-C₃алкіл, C₁-C₃алкокси або C₃-C₆циклоалкіл;

m являє собою ціле число, яке дорівнює 0, 1 або 2 (переважно 0 або 2);

45 кожний з R^{4a} та R^{5a} незалежно вибраний із групи, яка складається з C₁-C₆алкокси і C₃-C₆циклоалкілу, або R^{4a} та R^{5a} разом можуть утворювати морфолінільне кільце; і

кожний R¹⁶ незалежно являє собою галоген, ціано, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галогеналкіл, C₁-C₆алкокси або C₁-C₆галогеналкокси;

W являє собою W1; і

50 всі з R¹⁰, R¹¹, R¹² та R¹³ являють собою водень.

В альтернативній більш переважній групі варіантів здійснення (де обидва з X і Y є відмінними від циклопропілу) у сполучі формули (I):

R¹ являє собою метил;

R² являє собою метил;

55 G являє собою водень або -C(O)-R³, де R³ являє собою ізопропіл, трет-бутил, метил, етил, пропаргіл, метокси, етокси або трет-бутокс;

X являє собою фтор і знаходиться в орто-положенні відносно піридазинового/піридазиндіонового фрагмента;

Y являє собою хлор і знаходиться в орто-положенні відносно фрагмента -W-D;

60 D являє собою 5- або 6-членне моноциклічне гетероарильне кільце, яке містить 1, 2 або 3 гетероатоми, незалежно вибрані з кисню, азоту і сірки, або заміщене за атомом вуглецю в кільці

за допомогою 1 або 2 R^8 , де щонайменше один R^8 вибраний із групи, яка складається з C_1 - C_6 галогеналкілкарбоніл-, C_3 - C_6 циклоалкілкарбоніл-, $-S(O)_m$ - C_1 - C_6 галогеналкілу, $-S(O)_m$ - C_3 - C_6 циклоалкілу, $-O-S(O)_2$ - C_1 - C_3 алкілу, $-C_1$ - C_3 алкіл- $S(O)_m$ - C_1 - C_6 алкілу, $-C_1$ - C_3 алкіл- $S(O)_m$ - C_1 - C_6 галогеналкілу, $-C_1$ - C_3 алкіл- $S(O)_m$ - C_3 - C_6 циклоалкілу, $-S(O)_2$ NHC(O)- C_1 - C_3 алкілу, $-S(O)_2$ NR⁴R⁵, -C(O)OH, -C(O)OC₁-C₆алкілу, -C(O)NHS-(O)₂C₁-C₆алкілу, -C(O)NR⁴R⁵, -NR⁴C(O)NR⁴R⁵, C_1 - C_6 алкілкарбоніл(C_1 - C_6 алкіл)аміно-, C_1 - C_6 галогеналкілкарбоніламіно- і C_1 - C_6 галогеналкілкарбоніл(C_1 - C_6 алкіл)аміно- або кільцевої системи, вибраної із групи, яка складається з фенільного кільця, 5-6-членного гетероарильного кільця і 3-6-членного гетероциклічного кільця, при цьому вказана кільцева система заміщена за допомогою 0-5 R^{16} ; і

будь-який додатковий замісник R^8 може бути вибраний із групи, яка складається з галогену, C_1 - C_6 алкілу і C_1 - C_6 галогеналкілу; і/або D буде заміщений за атомом азоту в кільці одним R^9 , вибраним із групи, яка складається з C_5 - C_6 алкілу, C_5 - C_6 галогеналкілу, C_3 - C_6 циклоалкілу, $-C_1$ - C_3 алкіл- $S(O)_m$ - C_1 - C_6 алкілу, $-C_1$ - C_3 алкіл- $S(O)_m$ - C_1 - C_6 галогеналкілу, $-C_1$ - C_3 алкіл- $S(O)_m$ - C_3 - C_6 циклоалкілу і кільцевої системи, вибраної із групи, яка складається з фенільного кільця, 5-6-членного гетероарильного кільця і 3-6-членного гетероциклічного кільця, при цьому вказана кільцева система заміщена за допомогою 0-5 R^{16} ;

кожний з R^4 та R^5 незалежно являє собою водень, C_1 - C_3 алкіл, C_1 - C_3 алкокси або C_3 - C_6 циклоалкіл;

m дорівнює 0 або 2 (переважно 0);

кожний R^{16} незалежно являє собою галоген, ціано, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_3 галогеналкіл або C_1 - C_4 алкокси;

W являє собою W₁; і

всі з R^{10} , R^{11} , R^{12} та R^{13} являють собою водень.

В альтернативній ще більш переважній групі варіантів здійснення (де обидва з X і Y є відмінними від циклопропілу) у сполучі формули (I):

R^1 являє собою метил;

R^2 являє собою метил;

G являє собою водень або -C(O)- R^3 , де R^3 являє собою ізопропіл, трет-бутил, метил, етил, пропаргіл або метокси;

X являє собою фтор і знаходиться в орто-положенні відносно піридазинового/піридазиндіонового фрагмента;

Y являє собою хлор і знаходиться в орто-положенні відносно фрагмента -W-D;

D являє собою 5- або 6-членне моноциклічне гетероарильне кільце, яке містить 1, 2 або 3 атоми азоту, або заміщене за атомом вуглецю в кільці одним R^8 , вибраним із групи, яка складається з $-C_1$ - C_3 алкіл- $S(O)_m$ - C_1 - C_6 алкілу, $-S(O)_2$ NHC(O)- C_1 - C_3 алкілу, $-S(O)_2$ NR⁴R⁵, -C(O)OH, -C(O)OC₁-C₆алкілу і -C(O)NR⁴R⁵ або кільцевої системи, вибраної із групи, яка складається з фенілу, морфолінілу, тетрагідрофуранілу, фурилу, тієнілу, піролілу, піразолілу, імідазолілу, 1,2,3-триазолілу, 1,2,4-триазолілу, тетразолілу, оксазолілу, ізоксазолілу, тіазолілу, ізотіазолілу, 1,2,4-оксадіазолілу, 1,3,4-оксадіазолілу, 1,2,5-оксадіазолілу, 1,2,3-тіадіазолілу, 1,2,4-тіадіазолілу, 1,3,4-тіадіазолілу, 1,2,5-тіадіазолілу, піридили, піридонілу, піримідинілу, піридазинілу, піразинілу, 1,2,3-триазинілу, 1,2,4-триазинілу або 1,3,5-триазинільного кільця, при цьому вказана кільцева система заміщена за допомогою 0-2 R^{16} ; і/або D буде заміщений за атомом азоту в кільці одним R^9 , вибраним із групи, яка складається з C_5 - C_6 алкілу, C_3 - C_6 циклоалкілу і кільцевої системи, вибраної із групи, яка складається з фенільного кільця, 5-6-членного гетероарильного кільця і 3-6-членного гетероциклічного кільця, при цьому вказана кільцева система заміщена за допомогою 0-2 R^{16} ;

кожний з R^4 та R^5 незалежно являє собою водень або C_1 - C_3 алкіл;

m дорівнює 0 або 2 (переважно 0);

кожний R^{16} незалежно являє собою галоген або C_1 - C_4 алкіл (переважно метил);

W являє собою W₁; і

всі з R^{10} , R^{11} , R^{12} та R^{13} являють собою водень.

В альтернативній все ще більш переважній групі варіантів здійснення (де обидва з X і Y є відмінними від циклопропілу) у сполучі формули (I):

R^1 являє собою метил;

R^2 являє собою метил;

G являє собою водень або -C(O)- R^3 , де R^3 являє собою ізопропіл;

X являє собою фтор і знаходиться в орто-положенні відносно піридазинового/піридазиндіонового фрагмента;

Y являє собою хлор і знаходиться в орто-положенні відносно фрагмента -W-D;

D являє собою піразоліл або піридил, заміщений за атомом вуглецю в кільці одним R⁸, вибраним із групи, яка складається з метилсульфанілметилу, ізопропілсульфанілметилу, сульфоамілу, метилсульфоамілу і карбамоілу або кільцевої системи, вибраної із групи, яка складається з фенілу, морфолінілу, тетрагідрофуранілу, фурилу, тієнілу, піролілу, піразолілу, 1,2,4-триазолілу, оксазолілу та тіазолільного кільця, при цьому вказана кільцева система заміщена за допомогою 0-2 R¹⁶; і/або D буде заміщений за атомом азоту в кільці одним R⁹, вибраним із циклопропілу або фенілу;

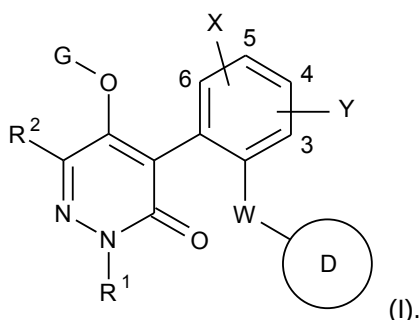
кожний R¹⁶ являє собою метил;

W являє собою W1; і

всі з R¹⁰, R¹¹, R¹² та R¹³ являють собою водень.

У таблицях A-1, A-2, A-3, A-4, B-1, B-2, B-3, B-4, C-1, C-2, C-3 та C-4 нижче проілюстровані конкретні приклади сполук формули (I) за даним винаходом.

Гербіцидні сполуки за даним винаходом. Система нумерації, використовувана для опису положень X і Y у сполучі формули (I), показаній нижче, показана лише для ясності.



У таблиці A-1 наведено 672 сполуки від A-1.001 до A-1.672 формули (I), де G являє собою -H, W являє собою -CH₂-CH₂-, та R¹, R², X, Y, D є такими, як визначено для сполук № 1.001 - 1.672 відповідно в таблиці 1 нижче.

Таблиця 1

Визначення замісників R¹, R², X, Y і D

№ спол.	R ¹	R ²	X	Y	D
1,001	-Me	-Me	6-F	3-F	4-Оксазол-5-ілфеніл-
1,002	-Me	-Me	6-F	3-F	4-Ацетамідофеніл-
1,003	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(Диметилсульфоаміл)феніл-
1,004	-Me	-Me	6-F	3-F	4-трет-Бутилфеніл-
1,005	-Me	-Me	6-F	3-F	4-Біфеніл-
1,006	-Me	-Me	6-F	3-F	4-[Етил(метил)карбамоіл]-3-фтор-феніл-
1,007	-Me	-Me	6-F	3-F	2-Ціанофеніл-
1,008	-Me	-Me	6-F	3-F	3-Ціанофеніл-
1,009	-Me	-Me	6-F	3-F	4-Аміно-3-метилфеніл-
1,010	-Me	-Me	6-F	3-F	4-Метилсульфонілфеніл-
1,011	-Me	-Me	6-F	3-F	4-Диметиламінофеніл-
1,012	-Me	-Me	6-F	3-F	4-Метиламінофеніл-
1,013	-Me	-Me	6-F	3-F	4-трет-Бутоксифеніл-
1,014	-Me	-Me	6-F	3-F	4-Ціанофеніл-
1,015	-Me	-Me	6-F	3-F	4-Гідроксифеніл-
1,016	-Me	-Me	6-F	3-F	4-Циклопропілфеніл-
1,017	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(Метилсульфаніл)феніл-
1,018	-Me	-Me	6-F	3-F	4-Карбоксифеніл-
1,019	-Me	-Me	6-F	3-F	4-Метоксикарбонілфеніл-
1,020	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(трет-Бутоксикарбоніламіно)-3-фтор-феніл-
1,021	-Me	-Me	6-F	3-F	2-(Метилсульфаніл)-4-піридил-
1,022	-Me	-Me	6-F	3-F	2-Ацетамідо-4-піридил-

Таблиця 1 (продовження)

№ спол.	R ¹	R ²	X	Y	D
1,023	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-Оксазол-5-ілфеніл-
1,024	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-Ацетамідофеніл-
1,025	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(Диметилсульфамойл)феніл-
1,026	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-трет-Бутилфеніл-
1,027	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-Біфеніл-
1,028	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-[Етил(метил)карбамоїл]-3-фтор-феніл-
1,029	-Me	-Me	6-F	3-Cl	2-Ціанофеніл-
1,030	-Me	-Me	6-F	3-Cl	3-Ціанофеніл-
1,031	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-Аміно-3-метилфеніл-
1,032	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-Метилсульфонілфеніл-
1,033	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-Диметиламінофеніл-
1,034	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-Метиламінофеніл-
1,035	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-трет-Бутоксифеніл-
1,036	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-Ціанофеніл-
1,037	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-Гідроксифеніл-
1,038	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-Циклопропілфеніл-
1,039	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(Метилсульфаніл)феніл-
1,040	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-Карбоксифеніл-
1,041	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-Метоксикарбонілфеніл-
1,042	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(трет-Бутоксикарбоніламіно)-3-фтор-феніл-
1,043	-Me	-Me	6-F	3-Cl	2-(Метилсульфаніл)-4-піридил-
1,044	-Me	-Me	6-F	3-Cl	2-Ацетамідо-4-піридил-
1,045	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-Оксазол-5-ілфеніл-
1,046	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-Ацетамідофеніл-
1,047	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(Диметилсульфамойл)феніл-
1,048	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-трет-Бутилфеніл-
1,049	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-Біфеніл-
1,050	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-[Етил(метил)карбамоїл]-3-фтор-феніл-
1,051	-Me	-Me	6-Cl	3-F	2-Ціанофеніл-
1,052	-Me	-Me	6-Cl	3-F	3-Ціанофеніл-
1,053	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-Аміно-3-метилфеніл-
1,054	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-Метилсульфонілфеніл-
1,055	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-Диметиламінофеніл-
1,056	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-Метиламінофеніл-
1,057	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-трет-Бутоксифеніл-
1,058	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-Ціанофеніл-
1,059	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-Гідроксифеніл-
1,060	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-Циклопропілфеніл-
1,061	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(Метилсульфаніл)феніл-
1,062	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-Карбоксифеніл-
1,063	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-Метоксикарбонілфеніл-
1,064	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(трет-Бутоксикарбоніламіно)-3-фтор-феніл-
1,065	-Me	-Me	6-Cl	3-F	2-(Метилсульфаніл)-4-піридил-
1,066	-Me	-Me	6-Cl	3-F	2-Ацетамідо-4-піридил-
1,067	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Оксазол-5-ілфеніл-
1,068	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Ацетамідофеніл-
1,069	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(Диметилсульфамойл)феніл-
1,070	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-трет-Бутилфеніл-
1,071	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Біфеніл-

Таблиця 1 (продовження)

№ спол.	R ¹	R ²	X	Y	D
1,072	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-[Етил(метил)карбамоїл]-3-фтор-феніл-
1,073	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	2-Ціанофеніл-
1,074	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	3-Ціанофеніл-
1,075	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Аміно-3-метилфеніл-
1,076	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Метилсульфонілфеніл-
1,077	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Диметиламінофеніл-
1,078	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Метиламінофеніл-
1,079	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-трет-Бутоксифеніл-
1,080	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Ціанофеніл-
1,081	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Гідроксифеніл-
1,082	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Циклопропілфеніл-
1,083	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(Метилсульфаніл)феніл-
1,084	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Карбоксифеніл-
1,085	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Метоксикарбонілфеніл-
1,086	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(трет-Бутоксикарбоніламіно)-3-фтор-феніл-
1,087	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	2-(Метилсульфаніл)-4-піридил-
1,088	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	2-Ацетамідо-4-піридил-
1,089	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-Оксазол-5-ілфеніл-
1,090	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-Ацетамідофеніл-
1,091	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(Диметилсульфамоїл)феніл-
1,092	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-трет-Бутилфеніл-
1,093	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-Біфеніл-
1,094	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-[Етил(метил)карбамоїл]-3-фтор-феніл-
1,095	-Me	-Cl	6-F	3-F	2-Ціанофеніл-
1,096	-Me	-Cl	6-F	3-F	3-Ціанофеніл-
1,097	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-Аміно-3-метилфеніл-
1,098	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-Метилсульфонілфеніл-
1,099	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-Диметиламінофеніл-
1,100	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-Метиламінофеніл-
1,101	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-трет-Бутоксифеніл-
1,102	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-Ціанофеніл-
1,103	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-Гідроксифеніл-
1,104	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-Циклопропілфеніл-
1,105	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(Метилсульфаніл)феніл-
1,106	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-Карбоксифеніл-
1,107	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-Метоксикарбонілфеніл-
1,108	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(трет-Бутоксикарбоніламіно)-3-фтор-феніл-
1,109	-Me	-Cl	6-F	3-F	2-(Метилсульфаніл)-4-піридил-
1,110	-Me	-Cl	6-F	3-F	2-Ацетамідо-4-піридил-
1,111	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-Оксазол-5-ілфеніл-
1,112	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-Ацетамідофеніл-
1,113	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(Диметилсульфамоїл)феніл-
1,114	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-трет-Бутилфеніл-
1,115	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-Біфеніл-
1,116	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-[Етил(метил)карбамоїл]-3-фтор-феніл-
1,117	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	2-Ціанофеніл-
1,118	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	3-Ціанофеніл-
1,119	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-Аміно-3-метилфеніл-
1,120	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-Метилсульфонілфеніл-

Таблиця 1 (продовження)

№ спол.	R ¹	R ²	X	Y	D
1,121	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-Диметиламінофеніл-
1,122	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-Метиламінофеніл-
1,123	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-трет-Бутоксифеніл-
1,124	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-Ціанофеніл-
1,125	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-Гідроксифеніл-
1,126	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-Циклопропілфеніл-
1,127	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(Метилсульфаніл)феніл-
1,128	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-Карбоксифеніл-
1,129	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-Метоксикарбонілфеніл-
1,130	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(трет-Бутоксикарбоніламіно)-3-фтор-феніл-
1,131	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	2-(Метилсульфаніл)-4-піридил-
1,132	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	2-Ацетамідо-4-піридил-
1,133	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-Оксазол-5-ілфеніл-
1,134	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-Ацетамідофеніл-
1,135	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(Диметилсульфаміно)феніл-
1,136	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-трет-Бутилфеніл-
1,137	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-Біфеніл-
1,138	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-[Етил(метил)карбамоїл]-3-фтор-феніл-
1,139	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	2-Ціанофеніл-
1,140	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	3-Ціанофеніл-
1,141	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-Аміно-3-метилфеніл-
1,142	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-Метилсульфонілфеніл-
1,143	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-Диметиламінофеніл-
1,144	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-Метиламінофеніл-
1,145	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-трет-Бутоксифеніл-
1,146	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-Ціанофеніл-
1,147	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-Гідроксифеніл-
1,148	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-Циклопропілфеніл-
1,149	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(Метилсульфаніл)феніл-
1,150	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-Карбоксифеніл-
1,151	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-Метоксикарбонілфеніл-
1,152	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(трет-Бутоксикарбоніламіно)-3-фтор-феніл-
1,153	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	2-(Метилсульфаніл)-4-піридил-
1,154	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	2-Ацетамідо-4-піридил-
1,155	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Оксазол-5-ілфеніл-
1,156	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Ацетамідофеніл-
1,157	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(Диметилсульфаміно)феніл-
1,158	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-трет-Бутилфеніл-
1,159	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Біфеніл-
1,160	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-[Етил(метил)карбамоїл]-3-фтор-феніл-
1,161	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	2-Ціанофеніл-
1,162	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	3-Ціанофеніл-
1,163	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Аміно-3-метилфеніл-
1,164	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Метилсульфонілфеніл-
1,165	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Диметиламінофеніл-
1,166	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Метиламінофеніл-
1,167	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-трет-Бутоксифеніл-
1,168	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Ціанофеніл-
1,169	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Гідроксифеніл-
1,170	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Циклопропілфеніл-

Таблиця 1 (продовження)

№ спол.	R ¹	R ²	X	Y	D
1,171	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(Метилсульфаніл)феніл-
1,172	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Карбоксифеніл-
1,173	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Метоксикарбонілфеніл-
1,174	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(трет-Бутоксикарбоніламіно)-3-фтор-феніл-
1,175	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	2-(Метилсульфаніл)-4-піридил-
1,176	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	2-Ацетамідо-4-піридил-
1,177	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-Оксазол-5-ілфеніл-
1,178	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-Ацетамідофеніл-
1,179	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(Диметилсульфамойл)феніл-
1,180	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-трет-Бутилфеніл-
1,181	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-Біфеніл-
1,182	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-[Етил(метил)карбамоїл]-3-фтор-феніл-
1,183	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	2-Ціанофеніл-
1,184	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	3-Ціанофеніл-
1,185	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-Аміно-3-метилфеніл-
1,186	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-Метилсульфонілфеніл-
1,187	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-Диметиламінофеніл-
1,188	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-Метиламінофеніл-
1,189	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-трет-Бутоксифеніл-
1,190	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-Ціанофеніл-
1,191	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-Гідроксифеніл-
1,192	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-Циклопропілфеніл-
1,193	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(Метилсульфаніл)феніл-
1,194	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-Карбоксифеніл-
1,195	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-Метоксикарбонілфеніл-
1,196	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(трет-Бутоксикарбоніламіно)-3-фтор-феніл-
1,197	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	2-(Метилсульфаніл)-4-піридил-
1,198	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	2-Ацетамідо-4-піридил-
1,199	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-Оксазол-5-ілфеніл-
1,200	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-Ацетамідофеніл-
1,201	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(Диметилсульфамойл)феніл-
1,202	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-трет-Бутилфеніл-
1,203	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-Біфеніл-
1,204	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-[Етил(метил)карбамоїл]-3-фтор-феніл-
1,205	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	2-Ціанофеніл-
1,206	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	3-Ціанофеніл-
1,207	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-Аміно-3-метилфеніл-
1,208	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-Метилсульфонілфеніл-
1,209	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-Диметиламінофеніл-
1,210	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-Метиламінофеніл-
1,211	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-трет-Бутоксифеніл-
1,212	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-Ціанофеніл-
1,213	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-Гідроксифеніл-
1,214	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-Циклопропілфеніл-
1,215	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(Метилсульфаніл)феніл-
1,216	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-Карбоксифеніл-
1,217	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-Метоксикарбонілфеніл-
1,218	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(трет-Бутоксикарбоніламіно)-3-фтор-феніл-
1,219	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	2-(Метилсульфаніл)-4-піридил-

Таблиця 1 (продовження)

№ спол.	R ¹	R ²	X	Y	D
1,220	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	2-Ацетамідо-4-піридил-
1,221	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-Оксазол-5-ілфеніл-
1,222	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-Ацетамідофеніл-
1,223	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(Диметилсульфамінол)феніл-
1,224	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-трет-Бутилфеніл-
1,225	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-Біфеніл-
1,226	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-[Етил(метил)карбамоіл]-3-фтор-феніл-
1,227	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	2-Ціанофеніл-
1,228	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	3-Ціанофеніл-
1,229	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-Аміно-3-метилфеніл-
1,230	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-Метилсульфонілфеніл-
1,231	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-Диметиламінофеніл-
1,232	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-Метиламінофеніл-
1,233	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-трет-Бутоксифеніл-
1,234	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-Ціанофеніл-
1,235	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-Гідроксифеніл-
1,236	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-Циклопропілфеніл-
1,237	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(Метилсульфаніл)феніл-
1,238	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-Карбоксифеніл-
1,239	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-Метоксикарбонілфеніл-
1,240	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(трет-Бутоксикарбоніламіно)-3-фтор-феніл-
1,241	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	2-(Метилсульфаніл)-4-піридил-
1,242	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	2-Ацетамідо-4-піридил-
1,243	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Оксазол-5-ілфеніл-
1,244	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Ацетамідофеніл-
1,245	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(Диметилсульфамінол)феніл-
1,246	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-трет-Бутилфеніл-
1,247	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Біфеніл-
1,248	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-[Етил(метил)карбамоіл]-3-фтор-феніл-
1,249	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	2-Ціанофеніл-
1,250	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	3-Ціанофеніл-
1,251	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Аміно-3-метилфеніл-
1,252	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Метилсульфонілфеніл-
1,253	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Диметиламінофеніл-
1,254	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Метиламінофеніл-
1,255	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-трет-Бутоксифеніл-
1,256	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Ціанофеніл-
1,257	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Гідроксифеніл-
1,258	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Циклопропілфеніл-
1,259	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(Метилсульфаніл)феніл-
1,260	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Карбоксифеніл-
1,261	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Метоксикарбонілфеніл-
1,262	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(трет-Бутоксикарбоніламіно)-3-фтор-феніл-
1,263	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	2-(Метилсульфаніл)-4-піридил-
1,264	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	2-Ацетамідо-4-піридил-
1,265	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-Оксазол-5-ілфеніл-
1,266	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-Ацетамідофеніл-
1,267	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(Диметилсульфамінол)феніл-
1,268	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-трет-Бутилфеніл-
1,269	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-Біфеніл-

Таблиця 1 (продовження)

№ спол.	R ¹	R ²	X	Y	D
1,270	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-[Етил(метил)карбамоїл]-3-фтор-феніл-
1,271	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	2-Ціанофеніл-
1,272	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	3-Ціанофеніл-
1,273	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-Аміно-3-метилфеніл-
1,274	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-Метилсульфонілфеніл-
1,275	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-Диметиламінофеніл-
1,276	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-Метиламінофеніл-
1,277	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-трет-Бутоксифеніл-
1,278	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-Ціанофеніл-
1,279	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-Гідроксифеніл-
1,280	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-Циклопропілфеніл-
1,281	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(Метилсульфаніл)феніл-
1,282	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-Карбоксифеніл-
1,283	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-Метоксикарбонілфеніл-
1,284	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(трет-Бутоксикарбоніламіно)-3-фтор-феніл-
1,285	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	2-(Метилсульфаніл)-4-піридил-
1,286	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	2-Ацетамідо-4-піридил-
1,287	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-Оксазол-5-ілфеніл-
1,288	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-Ацетамідофеніл-
1,289	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(Диметилсульфамоїл)феніл-
1,290	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-трет-Бутилфеніл-
1,291	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-Біфеніл-
1,292	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-[Етил(метил)карбамоїл]-3-фтор-феніл-
1,293	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	2-Ціанофеніл-
1,294	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	3-Ціанофеніл-
1,295	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-Аміно-3-метилфеніл-
1,296	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-Метилсульфонілфеніл-
1,297	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-Диметиламінофеніл-
1,298	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-Метиламінофеніл-
1,299	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-трет-Бутоксифеніл-
1,300	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-Ціанофеніл-
1,301	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-Гідроксифеніл-
1,302	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-Циклопропілфеніл-
1,303	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(Метилсульфаніл)феніл-
1,304	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-Карбоксифеніл-
1,305	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-Метоксикарбонілфеніл-
1,306	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(трет-Бутоксикарбоніламіно)-3-фтор-феніл-
1,307	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	2-(Метилсульфаніл)-4-піридил-
1,308	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	2-Ацетамідо-4-піридил-
1,309	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-Оксазол-5-ілфеніл-
1,310	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-Ацетамідофеніл-
1,311	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(Диметилсульфамоїл)феніл-
1,312	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-трет-Бутилфеніл-
1,313	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-Біфеніл-
1,314	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-[Етил(метил)карбамоїл]-3-фтор-феніл-
1,315	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	2-Ціанофеніл-
1,316	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	3-Ціанофеніл-
1,317	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-Аміно-3-метилфеніл-
1,318	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-Метилсульфонілфеніл-

Таблиця 1 (продовження)

№ спол.	R ¹	R ²	X	Y	D
1,319	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-Диметиламінофеніл-
1,320	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-Метиламінофеніл-
1,321	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-трет-Бутоксифеніл-
1,322	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-Ціанофеніл-
1,323	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-Гідроксифеніл-
1,324	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-Циклопропілфеніл-
1,325	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(Метилсульфаніл)феніл-
1,326	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-Карбоксифеніл-
1,327	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-Метоксикарбонілфеніл-
1,328	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(трет-Бутоксикарбоніламіно)-3-фтор-феніл-
1,329	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	2-(Метилсульфаніл)-4-піридил-
1,330	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	2-Ацетамідо-4-піридил-
1,331	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Оксазол-5-ілфеніл-
1,332	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Ацетамідофеніл-
1,333	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(Диметилсульфамойл)феніл-
1,334	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-трет-Бутилфеніл-
1,335	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Біфеніл-
1,336	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-[Етил(метил)карбамоїл]-3-фтор-феніл-
1,337	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	2-Ціанофеніл-
1,338	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	3-Ціанофеніл-
1,339	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Аміно-3-метилфеніл-
1,340	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Метилсульфонілфеніл-
1,341	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Диметиламінофеніл-
1,342	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Метиламінофеніл-
1,343	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-трет-Бутоксифеніл-
1,344	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Ціанофеніл-
1,345	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Гідроксифеніл-
1,346	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Циклопропілфеніл-
1,347	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(Метилсульфаніл)феніл-
1,348	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Карбоксифеніл-
1,349	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Метоксикарбонілфеніл-
1,350	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(трет-Бутоксикарбоніламіно)-3-фтор-феніл-
1,351	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	2-(Метилсульфаніл)-4-піридил-
1,352	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	2-Ацетамідо-4-піридил-
1,353	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(1-Метилпіразол-3-іл)феніл-
1,354	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(5-Метилтетразол-1-іл)феніл-
1,355	-Me	-Me	6-F	3-F	4-Морфолінофеніл-
1,356	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(3-Метилпіразол-1-іл)феніл-
1,357	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(3,5-Диметилпіразол-1-іл)феніл-
1,358	-Me	-Me	6-F	3-F	4-Піразол-1-ілфеніл-
1,359	-Me	-Me	6-F	3-F	4-Пірол-1-ілфеніл-
1,360	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(5-Метилтетрагідрофуран-2-іл)феніл-
1,361	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(5-Метил-2-фурил)феніл-
1,362	-Me	-Me	6-F	3-F	4-Оксазол-2-ілфеніл-
1,363	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(2-Метилтіазол-4-іл)феніл-
1,364	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(2-Тієніл)феніл-
1,365	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(1,2,4-Триазол-1-іл)феніл-
1,366	-Me	-Me	6-F	3-F	1-Феніл-4-піразоліл-
1,367	-Me	-Me	6-F	3-F	1-Циклопропіл-4-піразоліл-
1,368	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(Метилсульфанілметил)феніл-

Таблиця 1 (продовження)

№ спол.	R ¹	R ²	X	Y	D
1,369	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(Ізопропілсульфанілметил)феніл-
1,370	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(Метилсульфаміл)феніл-
1,371	-Me	-Me	6-F	3-F	4-Сульфамілфеніл-
1,372	-Me	-Me	6-F	3-F	4-Карбамілфеніл-
1,373	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(1-Метилпіразол-3-іл)феніл-
1,374	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(5-Метилтетразол-1-іл)феніл-
1,375	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-Морфолінофеніл-
1,376	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(3-Метилпіразол-1-іл)феніл-
1,377	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(3,5-Диметилпіразол-1-іл)феніл-
1,378	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-Піразол-1-ілфеніл-
1,379	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-Пірол-1-ілфеніл-
1,380	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(5-Метилтетрагідрофуран-2-іл)феніл-
1,381	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(5-Метил-2-фурил)феніл-
1,382	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-Оксазол-2-ілфеніл-
1,383	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(2-Метилтіазол-4-іл)феніл-
1,384	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(2-Тієніл)феніл-
1,385	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(1,2,4-Триазол-1-іл)феніл-
1,386	-Me	-Me	6-F	3-Cl	1-Феніл-4-піразоліл-
1,387	-Me	-Me	6-F	3-Cl	1-Циклопропіл-4-піразоліл-
1,388	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(Метилсульфанілметил)феніл-
1,389	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(Ізопропілсульфанілметил)феніл-
1,390	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(Метилсульфаміл)феніл-
1,391	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-Сульфамілфеніл-
1,392	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-Карбамілфеніл-
1,393	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(1-Метилпіразол-3-іл)феніл-
1,394	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(5-Метилтетразол-1-іл)феніл-
1,395	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-Морфолінофеніл-
1,396	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(3-Метилпіразол-1-іл)феніл-
1,397	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(3,5-Диметилпіразол-1-іл)феніл-
1,398	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-Піразол-1-ілфеніл-
1,399	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-Пірол-1-ілфеніл-
1,400	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(5-Метилтетрагідрофуран-2-іл)феніл-
1,401	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(5-Метил-2-фурил)феніл-
1,402	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-Оксазол-2-ілфеніл-
1,403	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(2-Метилтіазол-4-іл)феніл-
1,404	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(2-Тієніл)феніл-
1,405	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(1,2,4-Триазол-1-іл)феніл-
1,406	-Me	-Me	6-Cl	3-F	1-Феніл-4-піразоліл-
1,407	-Me	-Me	6-Cl	3-F	1-Циклопропіл-4-піразоліл-
1,408	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(Метилсульфанілметил)феніл-
1,409	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(Ізопропілсульфанілметил)феніл-
1,410	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(Метилсульфаміл)феніл-
1,411	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-Сульфамілфеніл-
1,412	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-Карбамілфеніл-
1,413	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(1-Метилпіразол-3-іл)феніл-
1,414	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(5-Метилтетразол-1-іл)феніл-
1,415	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Морфолінофеніл-
1,416	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(3-Метилпіразол-1-іл)феніл-
1,417	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(3,5-Диметилпіразол-1-іл)феніл-
1,418	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Піразол-1-ілфеніл-
1,419	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Пірол-1-ілфеніл-

Таблиця 1 (продовження)

№ спол.	R ¹	R ²	X	Y	D
1,420	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(5-Метилтетрагідрофуран-2-іл)феніл-
1,421	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(5-Метил-2-фурил)феніл-
1,422	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Оксазол-2-ілфеніл-
1,423	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(2-Метилтіазол-4-іл)феніл-
1,424	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(2-Тієніл)феніл-
1,425	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(1,2,4-Триазол-1-іл)феніл-
1,426	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	1-Феніл-4-піразоліл-
1,427	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	1-Циклопропіл-4-піразоліл-
1,428	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(Метилсульфанілметил)феніл-
1,429	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(Ізопропілсульфанілметил)феніл-
1,430	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(Метилсульфамойл)феніл-
1,431	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Сульфамойлфеніл-
1,432	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Карбамойлфеніл-
1,433	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(1-Метилпіразол-3-іл)феніл-
1,434	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(5-Метилтетразол-1-іл)феніл-
1,435	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-Морфолінофеніл-
1,436	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(3-Метилпіразол-1-іл)феніл-
1,437	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(3,5-Диметилпіразол-1-іл)феніл-
1,438	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-Піразол-1-ілфеніл-
1,439	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-Пірол-1-ілфеніл-
1,440	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(5-Метилтетрагідрофуран-2-іл)феніл-
1,441	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(5-Метил-2-фурил)феніл-
1,442	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-Оксазол-2-ілфеніл-
1,443	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(2-Метилтіазол-4-іл)феніл-
1,444	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(2-Тієніл)феніл-
1,445	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(1,2,4-Триазол-1-іл)феніл-
1,446	-Me	-Cl	6-F	3-F	1-Феніл-4-піразоліл-
1,447	-Me	-Cl	6-F	3-F	1-Циклопропіл-4-піразоліл-
1,448	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(Метилсульфанілметил)феніл-
1,449	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(Ізопропілсульфанілметил)феніл-
1,450	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(Метилсульфамойл)феніл-
1,451	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-Сульфамойлфеніл-
1,452	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-Карбамойлфеніл-
1,453	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(1-Метилпіразол-3-іл)феніл-
1,454	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(5-Метилтетразол-1-іл)феніл-
1,455	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-Морфолінофеніл-
1,456	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(3-Метилпіразол-1-іл)феніл-
1,457	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(3,5-Диметилпіразол-1-іл)феніл-
1,458	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-Піразол-1-ілфеніл-
1,459	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-Пірол-1-ілфеніл-
1,460	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(5-Метилтетрагідрофуран-2-іл)феніл-
1,461	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(5-Метил-2-фурил)феніл-
1,462	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-Оксазол-2-ілфеніл-
1,463	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(2-Метилтіазол-4-іл)феніл-
1,464	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(2-Тієніл)феніл-
1,465	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(1,2,4-Триазол-1-іл)феніл-
1,466	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	1-Феніл-4-піразоліл-
1,467	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	1-Циклопропіл-4-піразоліл-
1,468	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(Метилсульфанілметил)феніл-
1,469	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(Ізопропілсульфанілметил)феніл-
1,470	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(Метилсульфамойл)феніл-

Таблиця 1 (продовження)

№ спол.	R ¹	R ²	X	Y	D
1,471	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-Сульфамойлфеніл-
1,472	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-Карбамоїлфеніл-
1,473	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(1-Метилпіразол-3-іл)феніл-
1,474	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(5-Метилтетразол-1-іл)феніл-
1,475	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-Морфолінофеніл-
1,476	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(3-Метилпіразол-1-іл)феніл-
1,477	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(3,5-Диметилпіразол-1-іл)феніл-
1,478	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-Піразол-1-ілфеніл-
1,479	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-Пірол-1-ілфеніл-
1,480	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(5-Метилтетрагідрофуран-2-іл)феніл-
1,481	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(5-Метил-2-фурил)феніл-
1,482	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-Оксазол-2-ілфеніл-
1,483	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(2-Метилтіазол-4-іл)феніл-
1,484	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(2-Тієніл)феніл-
1,485	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(1,2,4-Триазол-1-іл)феніл-
1,486	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	1-Феніл-4-піразоліл-
1,487	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	1-Циклопропіл-4-піразоліл-
1,488	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(Метилсульфанілметил)феніл-
1,489	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(Ізопропілсульфанілметил)феніл-
1,490	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(Метилсульфамойл)феніл-
1,491	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-Сульфамойлфеніл-
1,492	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-Карбамоїлфеніл-
1,493	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(1-Метилпіразол-3-іл)феніл-
1,494	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(5-Метилтетразол-1-іл)феніл-
1,495	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Морфолінофеніл-
1,496	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(3-Метилпіразол-1-іл)феніл-
1,497	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(3,5-Диметилпіразол-1-іл)феніл-
1,498	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Піразол-1-ілфеніл-
1,499	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Пірол-1-ілфеніл-
1,500	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(5-Метилтетрагідрофуран-2-іл)феніл-
1,501	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(5-Метил-2-фурил)феніл-
1,502	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Оксазол-2-ілфеніл-
1,503	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(2-Метилтіазол-4-іл)феніл-
1,504	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(2-Тієніл)феніл-
1,505	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(1,2,4-Триазол-1-іл)феніл-
1,506	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	1-Феніл-4-піразоліл-
1,507	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	1-Циклопропіл-4-піразоліл-
1,508	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(Метилсульфанілметил)феніл-
1,509	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(Ізопропілсульфанілметил)феніл-
1,510	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(Метилсульфамойл)феніл-
1,511	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Сульфамойлфеніл-
1,512	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Карбамоїлфеніл-
1,513	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(1-Метилпіразол-3-іл)феніл-
1,514	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(5-Метилтетразол-1-іл)феніл-
1,515	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-Морфолінофеніл-
1,516	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(3-Метилпіразол-1-іл)феніл-
1,517	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(3,5-Диметилпіразол-1-іл)феніл-
1,518	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-Піразол-1-ілфеніл-
1,519	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-Пірол-1-ілфеніл-
1,520	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(5-Метилтетрагідрофуран-2-іл)феніл-
1,521	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(5-Метил-2-фурил)феніл-

Таблиця 1 (продовження)

№ спол.	R ¹	R ²	X	Y	D
1,522	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-Оксазол-2-ілфеніл-
1,523	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(2-Метилтіазол-4-іл)феніл-
1,524	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(2-Тієніл)феніл-
1,525	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(1,2,4-Триазол-1-іл)феніл-
1,526	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	1-Феніл-4-піразоліл-
1,527	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	1-Циклопропіл-4-піразоліл-
1,528	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(Метилсульфанілметил)феніл-
1,529	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(Ізопропілсульфанілметил)феніл-
1,530	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(Метилсульфамойл)феніл-
1,531	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-Сульфамойлфеніл-
1,532	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-Карбамойлфеніл-
1,533	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(1-Метилпіразол-3-іл)феніл-
1,534	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(5-Метилтетразол-1-іл)феніл-
1,535	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-Морфолінофеніл-
1,536	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(3-Метилпіразол-1-іл)феніл-
1,537	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(3,5-Диметилпіразол-1-іл)феніл-
1,538	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-Піразол-1-ілфеніл-
1,539	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-Пірол-1-ілфеніл-
1,540	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(5-Метилтетрагідрофуран-2-іл)феніл-
1,541	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(5-Метил-2-фурил)феніл-
1,542	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-Оксазол-2-ілфеніл-
1,543	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(2-Метилтіазол-4-іл)феніл-
1,544	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(2-Тієніл)феніл-
1,545	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(1,2,4-Триазол-1-іл)феніл-
1,546	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	1-Феніл-4-піразоліл-
1,547	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	1-Циклопропіл-4-піразоліл-
1,548	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(Метилсульфанілметил)феніл-
1,549	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(Ізопропілсульфанілметил)феніл-
1,550	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(Метилсульфамойл)феніл-
1,551	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-Сульфамойлфеніл-
1,552	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-Карбамойлфеніл-
1,553	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(1-Метилпіразол-3-іл)феніл-
1,554	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(5-Метилтетразол-1-іл)феніл-
1,555	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-Морфолінофеніл-
1,556	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(3-Метилпіразол-1-іл)феніл-
1,557	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(3,5-Диметилпіразол-1-іл)феніл-
1,558	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-Піразол-1-ілфеніл-
1,559	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-Пірол-1-ілфеніл-
1,560	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(5-Метилтетрагідрофуран-2-іл)феніл-
1,561	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(5-Метил-2-фурил)феніл-
1,562	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-Оксазол-2-ілфеніл-
1,563	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(2-Метилтіазол-4-іл)феніл-
1,564	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(2-Тієніл)феніл-
1,565	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(1,2,4-Триазол-1-іл)феніл-
1,566	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	1-Феніл-4-піразоліл-
1,567	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	1-Циклопропіл-4-піразоліл-
1,568	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(Метилсульфанілметил)феніл-
1,569	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(Ізопропілсульфанілметил)феніл-
1,570	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(Метилсульфамойл)феніл-
1,571	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-Сульфамойлфеніл-
1,572	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-Карбамойлфеніл-
1,573	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(1-Метилпіразол-3-іл)феніл-

Таблиця 1 (продовження)

№ спол.	R ¹	R ²	X	Y	D
1,574	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(5-Метилтетразол-1-іл)феніл-
1,575	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Морфолінофеніл-
1,576	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(3-Метилпіразол-1-іл)феніл-
1,577	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(3,5-Диметилпіразол-1-іл)феніл-
1,578	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Піразол-1-ілфеніл-
1,579	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Пірол-1-ілфеніл-
1,580	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(5-Метилтетрагідрофуран-2-іл)феніл-
1,581	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(5-Метил-2-фурил)феніл-
1,582	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Оксазол-2-ілфеніл-
1,583	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(2-Метилтіазол-4-іл)феніл-
1,584	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(2-Тієніл)феніл-
1,585	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(1,2,4-Триазол-1-іл)феніл-
1,586	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	1-Феніл-4-піразоліл-
1,587	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	1-Циклопропіл-4-піразоліл-
1,588	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(Метилсульфанілметил)феніл-
1,589	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(Ізопропілсульфанілметил)феніл-
1,590	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(Метилсульфамоїл)феніл-
1,591	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Сульфамоїлфеніл-
1,592	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-Карбамоїлфеніл-
1,593	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(1-Метилпіразол-3-іл)феніл-
1,594	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(5-Метилтетразол-1-іл)феніл-
1,595	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-Морфолінофеніл-
1,596	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(3-Метилпіразол-1-іл)феніл-
1,597	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(3,5-Диметилпіразол-1-іл)феніл-
1,598	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-Піразол-1-ілфеніл-
1,599	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-Пірол-1-ілфеніл-
1,600	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(5-Метилтетрагідрофуран-2-іл)феніл-
1,601	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(5-Метил-2-фурил)феніл-
1,602	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-Оксазол-2-ілфеніл-
1,603	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(2-Метилтіазол-4-іл)феніл-
1,604	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(2-Тієніл)феніл-
1,605	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(1,2,4-Триазол-1-іл)феніл-
1,606	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	1-Феніл-4-піразоліл-
1,607	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	1-Циклопропіл-4-піразоліл-
1,608	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(Метилсульфанілметил)феніл-
1,609	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(Ізопропілсульфанілметил)феніл-
1,610	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(Метилсульфамоїл)феніл-
1,611	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-Сульфамоїлфеніл-
1,612	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-Карбамоїлфеніл-
1,613	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(1-Метилпіразол-3-іл)феніл-
1,614	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(5-Метилтетразол-1-іл)феніл-
1,615	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-Морфолінофеніл-
1,616	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(3-Метилпіразол-1-іл)феніл-
1,617	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(3,5-Диметилпіразол-1-іл)феніл-
1,618	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-Піразол-1-ілфеніл-
1,619	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-Пірол-1-ілфеніл-
1,620	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(5-Метилтетрагідрофуран-2-іл)феніл-
1,621	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(5-Метил-2-фурил)феніл-
1,622	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-Оксазол-2-ілфеніл-
1,623	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(2-Метилтіазол-4-іл)феніл-
1,624	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(2-Тієніл)феніл-

Таблиця 1 (продовження)

№ спол.	R ¹	R ²	X	Y	D
1,625	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(1,2,4-Триазол-1-іл)феніл-
1,626	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	1-Феніл-4-піразоліл-
1,627	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	1-Циклопропіл-4-піразоліл-
1,628	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(Метилсульфанілметил)феніл-
1,629	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(Ізопропілсульфанілметил)феніл-
1,630	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(Метилсульфамінол)феніл-
1,631	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-Сульфамінолфеніл-
1,632	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-Карбамінолфеніл-
1,633	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(1-Метилпіразол-3-іл)феніл-
1,634	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(5-Метилтетразол-1-іл)феніл-
1,635	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-Морфолінофеніл-
1,636	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(3-Метилпіразол-1-іл)феніл-
1,637	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(3,5-Диметилпіразол-1-іл)феніл-
1,638	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-Піразол-1-ілфеніл-
1,639	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-Пірол-1-ілфеніл-
1,640	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(5-Метилтетрагідрофуран-2-іл)феніл-
1,641	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(5-Метил-2-фурил)феніл-
1,642	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-Оксазол-2-ілфеніл-
1,643	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(2-Метилтіазол-4-іл)феніл-
1,644	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(2-Тієніл)феніл-
1,645	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(1,2,4-Триазол-1-іл)феніл-
1,646	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	1-Феніл-4-піразоліл-
1,647	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	1-Циклопропіл-4-піразоліл-
1,648	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(Метилсульфанілметил)феніл-
1,649	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(Ізопропілсульфанілметил)феніл-
1,650	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(Метилсульфамінол)феніл-
1,651	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-Сульфамінолфеніл-
1,652	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-Карбамінолфеніл-
1,653	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(1-Метилпіразол-3-іл)феніл-
1,654	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(5-Метилтетразол-1-іл)феніл-
1,655	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Морфолінофеніл-
1,656	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(3-Метилпіразол-1-іл)феніл-
1,657	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(3,5-Диметилпіразол-1-іл)феніл-
1,658	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Піразол-1-ілфеніл-
1,659	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Пірол-1-ілфеніл-
1,660	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(5-Метилтетрагідрофуран-2-іл)феніл-
1,661	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(5-Метил-2-фурил)феніл-
1,662	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Оксазол-2-ілфеніл-
1,663	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(2-Метилтіазол-4-іл)феніл-
1,664	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(2-Тієніл)феніл-
1,665	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(1,2,4-Триазол-1-іл)феніл-
1,666	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	1-Феніл-4-піразоліл-
1,667	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	1-Циклопропіл-4-піразоліл-
1,668	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(Метилсульфанілметил)феніл-
1,669	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(Ізопропілсульфанілметил)феніл-
1,670	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(Метилсульфамінол)феніл-
1,671	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Сульфамінолфеніл-
1,672	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-Карбамінолфеніл-

У таблиці А-2 наведено 672 сполуки від А-2.001 до А-2.672 формули (I), де G являє собою -H, W являє собою (E)-CH=CH-, та R¹, R², X, Y, D є такими, як визначено для сполук № 1.001 - 1.672 відповідно в таблиці 1 вище.

У таблиці А-3 наведено 672 сполуки від А-3.001 до А-3.672 формули (I), де G являє собою - (C=O)iPr, W являє собою -CH₂-CH₂-, та R¹, R², X, Y, D є такими, як визначено для сполук № 1.001 - 1.672 відповідно в таблиці 1 вище.

У таблиці А-4 наведено 672 сполуки від А-4.001 до А-4.672 формули (I), де G являє собою - (C=O)iPr, W являє собою (E)-CH=CH-, та R¹, R², X, Y, D є такими, як визначено для сполук № 1.001 - 1.672 відповідно в таблиці 1 вище.

У таблиці В-1 наведено 744 сполуки від В-1.001 до В-1.744 формули (I), де G являє собою - Н, W являє собою -CH₂-CH₂-, X являє собою 6-циклопропіл, та R¹, R², Y, D є такими, як визначено для сполук № 2.001 - 2.744 відповідно в таблиці 2 нижче.

Таблиця 2

Визначення замісників R¹, R², Y і D

№ сполуки	R ¹	R ²	Y	D
2,001	-Me	-Me	3-F	-Ph
2,002	-Me	-Me	3-F	1-Метил-3-(трифторметил)піразол-4-іл-
2,003	-Me	-Me	3-F	1-Метил-піразол-4-іл-
2,004	-Me	-Me	3-F	2-(Метилсульфаніл)-4-піридил-
2,005	-Me	-Me	3-F	2-Ацетамідо-4-піридил-
2,006	-Me	-Me	3-F	2-Ацетамідотіазол-5-іл-
2,007	-Me	-Me	3-F	2-Аміно-4-піридил-
2,008	-Me	-Me	3-F	2-Хлор-3-піридил-
2,009	-Me	-Me	3-F	2-Хлор-4-піридил-
2,010	-Me	-Me	3-F	2-Хлортіазол-5-іл-
2,011	-Me	-Me	3-F	2-Ціанофеніл-
2,012	-Me	-Me	3-F	2-Ціано-феніл-
2,013	-Me	-Me	3-F	2-Фтор-4-піридил-
2,014	-Me	-Me	3-F	2-Метил-4-піридил-
2,015	-Me	-Me	3-F	2-Метил-триазол-4-іл-
2,016	-Me	-Me	3-F	2-Толіл-
2,017	-Me	-Me	3-F	2-Трифторметил-4-піридил-
2,018	-Me	-Me	3-F	2-Трифторметил-феніл-
2,019	-Me	-Me	3-F	3,4-Дифтор-феніл-
2,020	-Me	-Me	3-F	3,5-Дифтор-феніл-
2,021	-Me	-Me	3-F	3-Хлор-4-фтор-феніл-
2,022	-Me	-Me	3-F	3-Хлор-4-піридил-
2,023	-Me	-Me	3-F	3-Ціанофеніл-
2,024	-Me	-Me	3-F	3-Ціано-феніл-
2,025	-Me	-Me	3-F	3-Метил-2-піридил-
2,026	-Me	-Me	3-F	3-Метил-4-аміно-феніл-
2,027	-Me	-Me	3-F	3-Піридил-
2,028	-Me	-Me	3-F	3-Толіл-
2,029	-Me	-Me	3-F	3-Трифторметил-3-піридил-
2,030	-Me	-Me	3-F	3-Трифторметил-феніл-
2,031	-Me	-Me	3-F	4-(Диметиламіно)-феніл-
2,032	-Me	-Me	3-F	4-(Диметилсульфаміно)-феніл-
2,033	-Me	-Me	3-F	4-(Метиламіно)-феніл-
2,034	-Me	-Me	3-F	4-(Метилсульфаніл)-феніл-
2,035	-Me	-Me	3-F	4-(трет-Бутокси)-феніл-
2,036	-Me	-Me	3-F	4-(трет-Бутоксикарбоніламіно)-3-фтор-феніл-
2,037	-Me	-Me	3-F	4-(Трифторметокси)-феніл-
2,038	-Me	-Me	3-F	4-[Етил(метил)карбамоїл]-3-фтор-феніл-
2,039	-Me	-Me	3-F	4-Ацетамідофеніл-
2,040	-Me	-Me	3-F	4-Аміно-3-метилфеніл-
2,041	-Me	-Me	3-F	4-Аміно-феніл-

Таблиця 2 (продовження)

№ сполуки	R ¹	R ²	Y	D
2,042	-Me	-Me	3-F	4-Біфеніл-
2,043	-Me	-Me	3-F	4-Карбоксифеніл-
2,044	-Me	-Me	3-F	4-Хлор-3-піридил-
2,045	-Me	-Me	3-F	4-Хлор-феніл-
2,046	-Me	-Me	3-F	4-Ціанофеніл-
2,047	-Me	-Me	3-F	4-Ціано-феніл-
2,048	-Me	-Me	3-F	4-Циклопропілфеніл-
2,049	-Me	-Me	3-F	4-Циклопропіл-феніл-
2,050	-Me	-Me	3-F	4-Диметиламінофеніл-
2,051	-Me	-Me	3-F	4-Фтор-феніл-
2,052	-Me	-Me	3-F	4-Гідроксифеніл-
2,053	-Me	-Me	3-F	4-Гідрокси-феніл-
2,054	-Me	-Me	3-F	4-Метоксикарбонілфеніл-
2,055	-Me	-Me	3-F	4-Метил-2-піридил-
2,056	-Me	-Me	3-F	4-Метиламінофеніл-
2,057	-Me	-Me	3-F	4-Метилсульфонілфеніл-
2,058	-Me	-Me	3-F	4-Оксазол-5-ілфеніл-
2,059	-Me	-Me	3-F	4-Піридил-
2,060	-Me	-Me	3-F	4-трет-Бутоксифеніл-
2,061	-Me	-Me	3-F	4-трет-Бутилфеніл-
2,062	-Me	-Me	3-F	4-Толіл-
2,063	-Me	-Me	3-F	4-Трифторметил-3-піридил-
2,064	-Me	-Me	3-F	4-Трифторметил-феніл-
2,065	-Me	-Me	3-F	5-Метил-1,3,4-оксадіазол-2-іл-
2,066	-Me	-Me	3-F	5-Метил-2-піридил-
2,067	-Me	-Me	3-F	5-Метил-3-піридил-
2,068	-Me	-Me	3-F	6-Хлор-3-піридил-
2,069	-Me	-Me	3-F	6-Метил-2-піридил-
2,070	-Me	-Me	3-F	Піримідин-5-іл-
2,071	-Me	-Me	3-F	Тіазол-2-іл-
2,072	-Me	-Me	3-F	Тіазол-5-іл-
2,073	-Me	-Me	3-F	Тіофен-3-іл-
2,074	-Me	-Me	3-Cl	-Ph
2,075	-Me	-Me	3-Cl	1-Метил-3-(трифторметил)піразол-4-іл-
2,076	-Me	-Me	3-Cl	1-Метил-піразол-4-іл-
2,077	-Me	-Me	3-Cl	2-(Метилсульфаніл)-4-піридил-
2,078	-Me	-Me	3-Cl	2-Ацетамідо-4-піридил-
2,079	-Me	-Me	3-Cl	2-Ацетамідотіазол-5-іл-
2,080	-Me	-Me	3-Cl	2-Аміно-4-піридил-
2,081	-Me	-Me	3-Cl	2-Хлор-3-піридил-
2,082	-Me	-Me	3-Cl	2-Хлор-4-піридил-
2,083	-Me	-Me	3-Cl	2-Хлортіазол-5-іл-
2,084	-Me	-Me	3-Cl	2-Ціанофеніл-
2,085	-Me	-Me	3-Cl	2-Ціано-феніл-
2,086	-Me	-Me	3-Cl	2-Фтор-4-піридил-
2,087	-Me	-Me	3-Cl	2-Метил-4-піридил-
2,088	-Me	-Me	3-Cl	2-Метил-триазол-4-іл-
2,089	-Me	-Me	3-Cl	2-Толіл-
2,090	-Me	-Me	3-Cl	2-Трифторметил-4-піридил-
2,091	-Me	-Me	3-Cl	2-Трифторметил-феніл-
2,092	-Me	-Me	3-Cl	3,4-Дифтор-феніл-
2,093	-Me	-Me	3-Cl	3,5-Дифтор-феніл-
2,094	-Me	-Me	3-Cl	3-Хлор-4-фтор-феніл-

Таблиця 2 (продовження)

№ сполуки	R ¹	R ²	Y	D
2,095	-Me	-Me	3-Cl	3-Хлор-4-піридил-
2,096	-Me	-Me	3-Cl	3-Ціанофеніл-
2,097	-Me	-Me	3-Cl	3-Ціано-феніл-
2,098	-Me	-Me	3-Cl	3-Метил-2-піридил-
2,099	-Me	-Me	3-Cl	3-Метил-4-аміно-феніл-
2,100	-Me	-Me	3-Cl	3-Піридил-
2,101	-Me	-Me	3-Cl	3-Толіл-
2,102	-Me	-Me	3-Cl	3-Трифторметил-3-піридил-
2,103	-Me	-Me	3-Cl	3-Трифторметил-феніл-
2,104	-Me	-Me	3-Cl	4-(Диметиламіно)-феніл-
2,105	-Me	-Me	3-Cl	4-(Диметилсульфамойл)феніл-
2,106	-Me	-Me	3-Cl	4-(Метиламіно)-феніл-
2,107	-Me	-Me	3-Cl	4-(Метилсульфаніл)феніл-
2,108	-Me	-Me	3-Cl	4-(трет-Бутокси)-феніл-
2,109	-Me	-Me	3-Cl	4-(трет-Бутоксикарбоніламіно)-3-фтор-феніл-
2,110	-Me	-Me	3-Cl	4-(Трифторметокси)-феніл-
2,111	-Me	-Me	3-Cl	4-[Етил(метил)карбамоїл]-3-фтор-феніл-
2,112	-Me	-Me	3-Cl	4-Ацетамідофеніл-
2,113	-Me	-Me	3-Cl	4-Аміно-3-метилфеніл-
2,114	-Me	-Me	3-Cl	4-Аміно-феніл-
2,115	-Me	-Me	3-Cl	4-Біфеніл-
2,116	-Me	-Me	3-Cl	4-Карбоксифеніл-
2,117	-Me	-Me	3-Cl	4-Хлор-3-піридил-
2,118	-Me	-Me	3-Cl	4-Хлор-феніл-
2,119	-Me	-Me	3-Cl	4-Ціанофеніл-
2,120	-Me	-Me	3-Cl	4-Ціано-феніл-
2,121	-Me	-Me	3-Cl	4-Циклопропілфеніл-
2,122	-Me	-Me	3-Cl	4-Циклопропіл-феніл-
2,123	-Me	-Me	3-Cl	4-Диметиламінофеніл-
2,124	-Me	-Me	3-Cl	4-Фтор-феніл-
2,125	-Me	-Me	3-Cl	4-Гідроксифеніл-
2,126	-Me	-Me	3-Cl	4-Гідрокси-феніл-
2,127	-Me	-Me	3-Cl	4-Метоксикарбонілфеніл-
2,128	-Me	-Me	3-Cl	4-Метил-2-піридил-
2,129	-Me	-Me	3-Cl	4-Метиламінофеніл-
2,130	-Me	-Me	3-Cl	4-Метилсульфонілфеніл-
2,131	-Me	-Me	3-Cl	4-Оксазол-5-ілфеніл-
2,132	-Me	-Me	3-Cl	4-Піридил-
2,133	-Me	-Me	3-Cl	4-трет-Бутоксифеніл-
2,134	-Me	-Me	3-Cl	4-трет-Бутилфеніл-
2,135	-Me	-Me	3-Cl	4-Толіл-
2,136	-Me	-Me	3-Cl	4-Трифторметил-3-піридил-
2,137	-Me	-Me	3-Cl	4-Трифторметил-феніл-
2,138	-Me	-Me	3-Cl	5-Метил-1,3,4-оксадіазол-2-іл-
2,139	-Me	-Me	3-Cl	5-Метил-2-піридил-
2,140	-Me	-Me	3-Cl	5-Метил-3-піридил-
2,141	-Me	-Me	3-Cl	6-Хлор-3-піридил-
2,142	-Me	-Me	3-Cl	6-Метил-2-піридил-
2,143	-Me	-Me	3-Cl	Піримідин-5-іл-
2,144	-Me	-Me	3-Cl	Тіазол-2-іл-
2,145	-Me	-Me	3-Cl	Тіазол-5-іл-
2,146	-Me	-Me	3-Cl	Тіофен-3-іл-

Таблиця 2 (продовження)

№ сполуки	R ¹	R ²	Y	D
2,147	-Me	-Cl	3-F	-Ph
2,148	-Me	-Cl	3-F	1-Метил-3-(трифторметил)піразол-4-іл-
2,149	-Me	-Cl	3-F	1-Метил-піразол-4-іл-
2,150	-Me	-Cl	3-F	2-(Метилсульфаніл)-4-піридил-
2,151	-Me	-Cl	3-F	2-Ацетамідо-4-піридил-
2,152	-Me	-Cl	3-F	2-Ацетамідотіазол-5-іл-
2,153	-Me	-Cl	3-F	2-Аміно-4-піридил-
2,154	-Me	-Cl	3-F	2-Хлор-3-піридил-
2,155	-Me	-Cl	3-F	2-Хлор-4-піридил-
2,156	-Me	-Cl	3-F	2-Хлортіазол-5-іл-
2,157	-Me	-Cl	3-F	2-Ціанофеніл-
2,158	-Me	-Cl	3-F	2-Ціано-феніл-
2,159	-Me	-Cl	3-F	2-Фтор-4-піридил-
2,160	-Me	-Cl	3-F	2-Метил-4-піридил-
2,161	-Me	-Cl	3-F	2-Метил-триазол-4-іл-
2,162	-Me	-Cl	3-F	2-Толіл-
2,163	-Me	-Cl	3-F	2-Трифторметил-4-піридил-
2,164	-Me	-Cl	3-F	2-Трифторметил-феніл-
2,165	-Me	-Cl	3-F	3,4-Дифтор-феніл-
2,166	-Me	-Cl	3-F	3,5-Дифтор-феніл-
2,167	-Me	-Cl	3-F	3-Хлор-4-фтор-феніл-
2,168	-Me	-Cl	3-F	3-Хлор-4-піридил-
2,169	-Me	-Cl	3-F	3-Ціанофеніл-
2,170	-Me	-Cl	3-F	3-Ціано-феніл-
2,171	-Me	-Cl	3-F	3-Метил-2-піридил-
2,172	-Me	-Cl	3-F	3-Метил-4-аміно-феніл-
2,173	-Me	-Cl	3-F	3-Піридил-
2,174	-Me	-Cl	3-F	3-Толіл-
2,175	-Me	-Cl	3-F	3-Трифторметил-3-піридил-
2,176	-Me	-Cl	3-F	3-Трифторметил-феніл-
2,177	-Me	-Cl	3-F	4-(Диметиламіно)-феніл-
2,178	-Me	-Cl	3-F	4-(Диметилсульфаміно)-феніл-
2,179	-Me	-Cl	3-F	4-(Метиламіно)-феніл-
2,180	-Me	-Cl	3-F	4-(Метилсульфаніл)-феніл-
2,181	-Me	-Cl	3-F	4-(трет-Бутокси)-феніл-
2,182	-Me	-Cl	3-F	4-(трет-Бутоксикарбоніламіно)-3-фтор-феніл-
2,183	-Me	-Cl	3-F	4-(Трифторметокси)-феніл-
2,184	-Me	-Cl	3-F	4-[Етил(метил)карбамоїл]-3-фтор-феніл-
2,185	-Me	-Cl	3-F	4-Ацетамідофеніл-
2,186	-Me	-Cl	3-F	4-Аміно-3-метилфеніл-
2,187	-Me	-Cl	3-F	4-Аміно-феніл-
2,188	-Me	-Cl	3-F	4-Біфеніл-
2,189	-Me	-Cl	3-F	4-Карбоксифеніл-
2,190	-Me	-Cl	3-F	4-Хлор-3-піридил-
2,191	-Me	-Cl	3-F	4-Хлор-феніл-
2,192	-Me	-Cl	3-F	4-Ціанофеніл-
2,193	-Me	-Cl	3-F	4-Ціано-феніл-
2,194	-Me	-Cl	3-F	4-Циклопропілфеніл-
2,195	-Me	-Cl	3-F	4-Циклопропіл-феніл-
2,196	-Me	-Cl	3-F	4-Диметиламінофеніл-
2,197	-Me	-Cl	3-F	4-Фтор-феніл-

Таблиця 2 (продовження)

№ сполуки	R ¹	R ²	Y	D
2,198	-Me	-Cl	3-F	4-Гідроксифеніл-
2,199	-Me	-Cl	3-F	4-Гідрокси-феніл-
2,200	-Me	-Cl	3-F	4-Метоксикарбонілфеніл-
2,201	-Me	-Cl	3-F	4-Метил-2-піридил-
2,202	-Me	-Cl	3-F	4-Метиламінофеніл-
2,203	-Me	-Cl	3-F	4-Метилсульфонілфеніл-
2,204	-Me	-Cl	3-F	4-Оксазол-5-ілфеніл-
2,205	-Me	-Cl	3-F	4-Піридил-
2,206	-Me	-Cl	3-F	4-трет-Бутоксифеніл-
2,207	-Me	-Cl	3-F	4-трет-Бутилфеніл-
2,208	-Me	-Cl	3-F	4-Толіл-
2,209	-Me	-Cl	3-F	4-Трифторметил-3-піридил-
2,210	-Me	-Cl	3-F	4-Трифторметил-феніл-
2,211	-Me	-Cl	3-F	5-Метил-1,3,4-оксадіазол-2-іл-
2,212	-Me	-Cl	3-F	5-Метил-2-піридил-
2,213	-Me	-Cl	3-F	5-Метил-3-піридил-
2,214	-Me	-Cl	3-F	6-Хлор-3-піридил-
2,215	-Me	-Cl	3-F	6-Метил-2-піридил-
2,216	-Me	-Cl	3-F	Піримідин-5-іл-
2,217	-Me	-Cl	3-F	Тіазол-2-іл-
2,218	-Me	-Cl	3-F	Тіазол-5-іл-
2,219	-Me	-Cl	3-F	Тіофен-3-іл-
2,220	-Me	-Cl	3-Cl	-Ph
2,221	-Me	-Cl	3-Cl	1-Метил-3-(трифторметил)піразол-4-іл-
2,222	-Me	-Cl	3-Cl	1-Метил-піразол-4-іл-
2,223	-Me	-Cl	3-Cl	2-(Метилсульфаніл)-4-піридил-
2,224	-Me	-Cl	3-Cl	2-Ацетамідо-4-піридил-
2,225	-Me	-Cl	3-Cl	2-Ацетамідотіазол-5-іл-
2,226	-Me	-Cl	3-Cl	2-Аміно-4-піридил-
2,227	-Me	-Cl	3-Cl	2-Хлор-3-піридил-
2,228	-Me	-Cl	3-Cl	2-Хлор-4-піридил-
2,229	-Me	-Cl	3-Cl	2-Хлортіазол-5-іл-
2,230	-Me	-Cl	3-Cl	2-Ціанофеніл-
2,231	-Me	-Cl	3-Cl	2-Ціано-феніл-
2,232	-Me	-Cl	3-Cl	2-Фтор-4-піридил-
2,233	-Me	-Cl	3-Cl	2-Метил-4-піридил-
2,234	-Me	-Cl	3-Cl	2-Метил-триазол-4-іл-
2,235	-Me	-Cl	3-Cl	2-Толіл-
2,236	-Me	-Cl	3-Cl	2-Трифторметил-4-піридил-
2,237	-Me	-Cl	3-Cl	2-Трифторметил-феніл-
2,238	-Me	-Cl	3-Cl	3,4-Дифтор-феніл-
2,239	-Me	-Cl	3-Cl	3,5-Дифтор-феніл-
2,240	-Me	-Cl	3-Cl	3-Хлор-4-фтор-феніл-
2,241	-Me	-Cl	3-Cl	3-Хлор-4-піридил-
2,242	-Me	-Cl	3-Cl	3-Ціанофеніл-
2,243	-Me	-Cl	3-Cl	3-Ціано-феніл-
2,244	-Me	-Cl	3-Cl	3-Метил-2-піридил-
2,245	-Me	-Cl	3-Cl	3-Метил-4-аміно-феніл-
2,246	-Me	-Cl	3-Cl	3-Піридил-
2,247	-Me	-Cl	3-Cl	3-Толіл-
2,248	-Me	-Cl	3-Cl	3-Трифторметил-3-піридил-
2,249	-Me	-Cl	3-Cl	3-Трифторметил-феніл-
2,250	-Me	-Cl	3-Cl	4-(Диметиламіно)-феніл-

Таблиця 2 (продовження)

№ сполуки	R ¹	R ²	Y	D
2,251	-Me	-Cl	3-Cl	4-(Диметилсульфамойл)феніл-
2,252	-Me	-Cl	3-Cl	4-(Метиламіно)-феніл-
2,253	-Me	-Cl	3-Cl	4-(Метилсульфаніл)феніл-
2,254	-Me	-Cl	3-Cl	4-(трет-Бутокси)-феніл-
2,255	-Me	-Cl	3-Cl	4-(трет-Бутоксикарбоніламіно)-3-фтор-феніл-
2,256	-Me	-Cl	3-Cl	4-(Трифторметокси)-феніл-
2,257	-Me	-Cl	3-Cl	4-[Етил(метил)карбамоїл]-3-фтор-феніл-
2,258	-Me	-Cl	3-Cl	4-Ацетамідофеніл-
2,259	-Me	-Cl	3-Cl	4-Аміно-3-метилфеніл-
2,260	-Me	-Cl	3-Cl	4-Аміно-феніл-
2,261	-Me	-Cl	3-Cl	4-Біфеніл-
2,262	-Me	-Cl	3-Cl	4-Карбоксифеніл-
2,263	-Me	-Cl	3-Cl	4-Хлор-3-піридил-
2,264	-Me	-Cl	3-Cl	4-Хлор-феніл-
2,265	-Me	-Cl	3-Cl	4-Ціанофеніл-
2,266	-Me	-Cl	3-Cl	4-Ціано-феніл-
2,267	-Me	-Cl	3-Cl	4-Циклопропілфеніл-
2,268	-Me	-Cl	3-Cl	4-Циклопропіл-феніл-
2,269	-Me	-Cl	3-Cl	4-Диметиламінофеніл-
2,270	-Me	-Cl	3-Cl	4-Фтор-феніл-
2,271	-Me	-Cl	3-Cl	4-Гідроксифеніл-
2,272	-Me	-Cl	3-Cl	4-Гідрокси-феніл-
2,273	-Me	-Cl	3-Cl	4-Метоксикарбонілфеніл-
2,274	-Me	-Cl	3-Cl	4-Метил-2-піридил-
2,275	-Me	-Cl	3-Cl	4-Метиламінофеніл-
2,276	-Me	-Cl	3-Cl	4-Метилсульфонілфеніл-
2,277	-Me	-Cl	3-Cl	4-Оксазол-5-ілфеніл-
2,278	-Me	-Cl	3-Cl	4-Піридил-
2,279	-Me	-Cl	3-Cl	4-трет-Бутоксифеніл-
2,280	-Me	-Cl	3-Cl	4-трет-Бутилфеніл-
2,281	-Me	-Cl	3-Cl	4-Толіл-
2,282	-Me	-Cl	3-Cl	4-Трифторметил-3-піридил-
2,283	-Me	-Cl	3-Cl	4-Трифторметил-феніл-
2,284	-Me	-Cl	3-Cl	5-Метил-1,3,4-оксадіазол-2-іл-
2,285	-Me	-Cl	3-Cl	5-Метил-2-піридил-
2,286	-Me	-Cl	3-Cl	5-Метил-3-піридил-
2,287	-Me	-Cl	3-Cl	6-Хлор-3-піридил-
2,288	-Me	-Cl	3-Cl	6-Метил-2-піридил-
2,289	-Me	-Cl	3-Cl	Піримідин-5-іл-
2,290	-Me	-Cl	3-Cl	Тіазол-2-іл-
2,291	-Me	-Cl	3-Cl	Тіазол-5-іл-
2,292	-Me	-Cl	3-Cl	Тіофен-3-іл-
2,293	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	-Ph
2,294	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	1-Метил-3-(трифторметил)піразол-4-іл-
2,295	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	1-Метил-піразол-4-іл-
2,296	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	2-(Метилсульфаніл)-4-піридил-
2,297	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	2-Ацетамідо-4-піридил-
2,298	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	2-Ацетамідотіазол-5-іл-
2,299	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	2-Аміно-4-піридил-
2,300	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	2-Хлор-3-піридил-
2,301	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	2-Хлор-4-піридил-

Таблиця 2 (продовження)

№ сполуки	R ¹	R ²	Y	D
2,302	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	2-Хлортіазол-5-іл-
2,303	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	2-Ціанофеніл-
2,304	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	2-Ціано-феніл-
2,305	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	2-Фтор-4-піридил-
2,306	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	2-Метил-4-піридил-
2,307	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	2-Метил-триазол-4-іл-
2,308	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	2-Толіл-
2,309	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	2-Трифторметил-4-піридил-
2,310	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	2-Трифторметил-феніл-
2,311	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	3,4-Дифтор-феніл-
2,312	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	3,5-Дифтор-феніл-
2,313	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	3-Хлор-4-фтор-феніл-
2,314	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	3-Хлор-4-піридил-
2,315	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	3-Ціанофеніл-
2,316	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	3-Ціано-феніл-
2,317	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	3-Метил-2-піридил-
2,318	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	3-Метил-4-аміно-феніл-
2,319	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	3-Піридил-
2,320	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	3-Толіл-
2,321	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	3-Трифторметил-3-піридил-
2,322	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	3-Трифторметил-феніл-
2,323	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-(Диметиламіно)-феніл-
2,324	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-(Диметилсульфамойл)феніл-
2,325	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-(Метиламіно)-феніл-
2,326	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-(Метилсульфаніл)феніл-
2,327	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-(трет-Бутокси)-феніл-
2,328	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-(трет-Бутоксикарбоніламіно)-3-фтор-феніл-
2,329	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-(Трифторметокси)-феніл-
2,330	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-[Етил(метил)карбамоїл]-3-фтор-феніл-
2,331	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-Ацетамідофеніл-
2,332	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-Аміно-3-метилфеніл-
2,333	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-Аміно-феніл-
2,334	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-Біфеніл-
2,335	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-Карбоксифеніл-
2,336	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-Хлор-3-піридил-
2,337	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-Хлор-феніл-
2,338	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-Ціанофеніл-
2,339	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-Ціано-феніл-
2,340	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-Циклопропілфеніл-
2,341	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-Циклопропіл-феніл-
2,342	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-Диметиламінофеніл-
2,343	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-Фтор-феніл-
2,344	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-Гідроксифеніл-
2,345	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-Гідрокси-феніл-
2,346	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-Метоксикарбонілфеніл-
2,347	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-Метил-2-піридил-
2,348	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-Метиламінофеніл-
2,349	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-Метилсульфонілфеніл-
2,350	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-Оксазол-5-ілфеніл-
2,351	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-Піридил-
2,352	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-трет-Бутоксифеніл-
2,353	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-трет-Бутилфеніл-

Таблиця 2 (продовження)

№ сполуки	R ¹	R ²	Y	D
2,354	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-Толіл-
2,355	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-Трифторметил-3-піридил-
2,356	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-Трифторметил-феніл-
2,357	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	5-Метил-1,3,4-оксадіазол-2-іл-
2,358	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	5-Метил-2-піридил-
2,359	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	5-Метил-3-піридил-
2,360	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	6-Хлор-3-піридил-
2,361	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	6-Метил-2-піридил-
2,362	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	Піримідин-5-іл-
2,363	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	Тіазол-2-іл-
2,364	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	Тіазол-5-іл-
2,365	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	Тіофен-3-іл-
2,366	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	-Ph
2,367	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	1-Метил-3-(трифторметил)піразол-4-іл-
2,368	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	1-Метил-піразол-4-іл-
2,369	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	2-(Метилсульфаніл)-4-піридил-
2,370	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	2-Ацетамідо-4-піридил-
2,371	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	2-Ацетамідотіазол-5-іл-
2,372	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	2-Аміно-4-піридил-
2,373	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	2-Хлор-3-піридил-
2,374	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	2-Хлор-4-піридил-
2,375	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	2-Хлортіазол-5-іл-
2,376	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	2-Ціанофеніл-
2,377	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	2-Ціано-феніл-
2,378	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	2-Фтор-4-піридил-
2,379	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	2-Метил-4-піридил-
2,380	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	2-Метил-триазол-4-іл-
2,381	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	2-Толіл-
2,382	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	2-Трифторметил-4-піридил-
2,383	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	2-Трифторметил-феніл-
2,384	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	3,4-Дифтор-феніл-
2,385	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	3,5-Дифтор-феніл-
2,386	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	3-Хлор-4-фтор-феніл-
2,387	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	3-Хлор-4-піридил-
2,388	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	3-Ціанофеніл-
2,389	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	3-Ціано-феніл-
2,390	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	3-Метил-2-піридил-
2,391	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	3-Метил-4-аміно-феніл-
2,392	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	3-Піридил-
2,393	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	3-Толіл-
2,394	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	3-Трифторметил-3-піридил-
2,395	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	3-Трифторметил-феніл-
2,396	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(Диметиламіно)-феніл-
2,397	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(Диметилсульфамойл)феніл-
2,398	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(Метиламіно)-феніл-
2,399	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(Метилсульфаніл)феніл-
2,400	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(трет-Бутокси)-феніл-
2,401	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(трет-Бутоксикарбоніламіно)-3-фтор-феніл-
2,402	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(Трифторметокси)-феніл-
2,403	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-[Етил(метил)карбамоїл]-3-фтор-феніл-
2,404	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-Ацетамідофеніл-

Таблиця 2 (продовження)

№ сполуки	R ¹	R ²	Y	D
2,405	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-Аміно-3-метилфеніл-
2,406	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-Аміно-феніл-
2,407	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-Біфеніл-
2,408	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-Карбоксифеніл-
2,409	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-Хлор-3-піридил-
2,410	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-Хлор-феніл-
2,411	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-Ціанофеніл-
2,412	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-Ціано-феніл-
2,413	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-Циклопропілфеніл-
2,414	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-Циклопропіл-феніл-
2,415	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-Диметиламінофеніл-
2,416	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-Фтор-феніл-
2,417	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-Гідроксифеніл-
2,418	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-Гідрокси-феніл-
2,419	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-Метоксикарбонілфеніл-
2,420	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-Метил-2-піридил-
2,421	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-Метиламінофеніл-
2,422	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-Метилсульфонілфеніл-
2,423	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-Оксазол-5-ілфеніл-
2,424	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-Піридил-
2,425	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-трет-Бутоксифеніл-
2,426	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-трет-Бутилфеніл-
2,427	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-Толіл-
2,428	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-Трифторметил-3-піридил-
2,429	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-Трифторметил-феніл-
2,430	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	5-Метил-1,3,4-оксадіазол-2-іл-
2,431	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	5-Метил-2-піридил-
2,432	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	5-Метил-3-піридил-
2,433	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	6-Хлор-3-піридил-
2,434	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	6-Метил-2-піридил-
2,435	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	Піримідин-5-іл-
2,436	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	Тіазол-2-іл-
2,437	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	Тіазол-5-іл-
2,438	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	Тіофен-3-іл-
2,439	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	-Ph
2,440	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	1-Метил-3-(трифторметил)піразол-4-іл-
2,441	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	1-Метил-піразол-4-іл-
2,442	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	2-(Метилсульфаніл)-4-піридил-
2,443	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	2-Ацетамідо-4-піридил-
2,444	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	2-Ацетамідотіазол-5-іл-
2,445	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	2-Аміно-4-піридил-
2,446	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	2-Хлор-3-піридил-
2,447	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	2-Хлор-4-піридил-
2,448	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	2-Хлортіазол-5-іл-
2,449	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	2-Ціанофеніл-
2,450	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	2-Ціано-феніл-
2,451	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	2-Фтор-4-піридил-
2,452	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	2-Метил-4-піридил-
2,453	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	2-Метил-триазол-4-іл-
2,454	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	2-Толіл-
2,455	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	2-Трифторметил-4-піридил-
2,456	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	2-Трифторметил-феніл-
2,457	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	3,4-Дифтор-феніл-

Таблиця 2 (продовження)

№ сполуки	R ¹	R ²	Y	D
2,458	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	3,5-Дифтор-феніл-
2,459	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	3-Хлор-4-фтор-феніл-
2,460	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	3-Хлор-4-піридил-
2,461	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	3-Ціанофеніл-
2,462	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	3-Ціано-феніл-
2,463	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	3-Метил-2-піридил-
2,464	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	3-Метил-4-аміно-феніл-
2,465	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	3-Піридил-
2,466	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	3-Толіл-
2,467	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	3-Трифторметил-3-піридил-
2,468	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	3-Трифторметил-феніл-
2,469	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-(Диметиламіно)-феніл-
2,470	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-(Диметилсульфамойл)феніл-
2,471	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-(Метиламіно)-феніл-
2,472	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-(Метилсульфаніл)феніл-
2,473	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-(трет-Бутокси)-феніл-
2,474	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-(трет-Бутоксикарбоніламіно)-3-фтор-феніл-
2,475	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-(Трифторметокси)-феніл-
2,476	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-[Етил(метил)карбамоїл]-3-фтор-феніл-
2,477	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-Ацетамідофеніл-
2,478	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-Аміно-3-метилфеніл-
2,479	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-Аміно-феніл-
2,480	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-Біфеніл-
2,481	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-Карбоксифеніл-
2,482	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-Хлор-3-піридил-
2,483	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-Хлор-феніл-
2,484	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-Ціанофеніл-
2,485	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-Ціано-феніл-
2,486	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-Циклопропілфеніл-
2,487	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-Циклопропіл-феніл-
2,488	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-Диметиламінофеніл-
2,489	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-Фтор-феніл-
2,490	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-Гідроксифеніл-
2,491	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-Гідрокси-феніл-
2,492	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-Метоксикарбонілфеніл-
2,493	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-Метил-2-піридил-
2,494	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-Метиламінофеніл-
2,495	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-Метилсульфонілфеніл-
2,496	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-Оксазол-5-ілфеніл-
2,497	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-Піридил-
2,498	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-трет-Бутоксифеніл-
2,499	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-трет-Бутилфеніл-
2,500	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-Толіл-
2,501	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-Трифторметил-3-піридил-
2,502	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-Трифторметил-феніл-
2,503	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	5-Метил-1,3,4-оксадіазол-2-іл-
2,504	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	5-Метил-2-піридил-
2,505	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	5-Метил-3-піридил-
2,506	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	6-Хлор-3-піридил-
2,507	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	6-Метил-2-піридил-
2,508	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	Піримідин-5-іл-
2,509	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	Тіазол-2-іл-

Таблиця 2 (продовження)

№ сполуки	R ¹	R ²	Y	D
2,510	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	Тіазол-5-іл-
2,511	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	Тіофен-3-іл-
2,512	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	-Ph
2,513	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	1-Метил-3-(трифторметил)піразол-4-іл-
2,514	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	1-Метил-піразол-4-іл-
2,515	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	2-(Метилсульфаніл)-4-піридил-
2,516	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	2-Ацетамідо-4-піридил-
2,517	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	2-Ацетамідотіазол-5-іл-
2,518	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	2-Аміно-4-піридил-
2,519	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	2-Хлор-3-піридил-
2,520	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	2-Хлор-4-піридил-
2,521	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	2-Хлортіазол-5-іл-
2,522	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	2-Ціанофеніл-
2,523	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	2-Ціано-феніл-
2,524	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	2-Фтор-4-піридил-
2,525	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	2-Метил-4-піридил-
2,526	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	2-Метил-триазол-4-іл-
2,527	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	2-Толіл-
2,528	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	2-Трифторметил-4-піридил-
2,529	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	2-Трифторметил-феніл-
2,530	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	3,4-Дифтор-феніл-
2,531	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	3,5-Дифтор-феніл-
2,532	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	3-Хлор-4-фтор-феніл-
2,533	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	3-Хлор-4-піридил-
2,534	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	3-Ціанофеніл-
2,535	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	3-Ціано-феніл-
2,536	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	3-Метил-2-піридил-
2,537	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	3-Метил-4-аміно-феніл-
2,538	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	3-Піридил-
2,539	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	3-Толіл-
2,540	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	3-Трифторметил-3-піридил-
2,541	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	3-Трифторметил-феніл-
2,542	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(Диметиламіно)-феніл-
2,543	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(Диметилсульфаміно)феніл-
2,544	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(Метиламіно)-феніл-
2,545	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(Метилсульфаніл)феніл-
2,546	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(трет-Бутокси)-феніл-
2,547	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(трет-Бутоксикарбоніламіно)-3-фтор-феніл-
2,548	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(Трифторметокси)-феніл-
2,549	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-[Етил(метил)карбамоїл]-3-фтор-феніл-
2,550	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Ацетамідофеніл-
2,551	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Аміно-3-метилфеніл-
2,552	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Аміно-феніл-
2,553	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Біфеніл-
2,554	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Карбоксифеніл-
2,555	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Хлор-3-піридил-
2,556	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Хлор-феніл-
2,557	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Ціанофеніл-
2,558	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Ціано-феніл-
2,559	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Циклопропілфеніл-
2,560	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Циклопропіл-феніл-

Таблиця 2 (продовження)

№ сполуки	R ¹	R ²	Y	D
2,561	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Диметиламінофеніл-
2,562	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Фтор-феніл-
2,563	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Гідроксифеніл-
2,564	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Гідрокси-феніл-
2,565	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Метоксикарбонілфеніл-
2,566	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Метил-2-піридил-
2,567	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Метиламінофеніл-
2,568	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Метилсульфонілфеніл-
2,569	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Оксазол-5-ілфеніл-
2,570	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Піридил-
2,571	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-трет-Бутоксифеніл-
2,572	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-трет-Бутилфеніл-
2,573	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Толіл-
2,574	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Трифторметил-3-піридил-
2,575	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Трифторметил-феніл-
2,576	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	5-Метил-1,3,4-оксадіазол-2-іл-
2,577	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	5-Метил-2-піридил-
2,578	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	5-Метил-3-піридил-
2,579	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	6-Хлор-3-піридил-
2,580	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	6-Метил-2-піридил-
2,581	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	Піримідин-5-іл-
2,582	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	Тіазол-2-іл-
2,583	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	Тіазол-5-іл-
2,584	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	Тіофен-3-іл-
2,585	-Me	-Me	3-F	4-(1-Метилпіразол-3-іл)феніл-
2,586	-Me	-Me	3-F	4-(5-Метилтетразол-1-іл)феніл-
2,587	-Me	-Me	3-F	4-Морфолінофеніл-
2,588	-Me	-Me	3-F	4-(3-Метилпіразол-1-іл)феніл-
2,589	-Me	-Me	3-F	4-(3,5-Диметилпіразол-1-іл)феніл-
2,590	-Me	-Me	3-F	4-Піразол-1-ілфеніл-
2,591	-Me	-Me	3-F	4-Пірол-1-ілфеніл-
2,592	-Me	-Me	3-F	4-(5-Метилтетрагідрофуран-2-іл)феніл-
2,593	-Me	-Me	3-F	4-(5-Метил-2-фурил)феніл-
2,594	-Me	-Me	3-F	4-Оксазол-2-ілфеніл-
2,595	-Me	-Me	3-F	4-(2-Метилтіазол-4-іл)феніл-
2,596	-Me	-Me	3-F	4-(2-Тієніл)феніл-
2,597	-Me	-Me	3-F	4-(1,2,4-Триазол-1-іл)феніл-
2,598	-Me	-Me	3-F	1-Феніл-4-піразоліл-
2,599	-Me	-Me	3-F	1-Циклопропіл-4-піразоліл-
2,600	-Me	-Me	3-F	4-(Метилсульфанілметил)феніл-
2,601	-Me	-Me	3-F	4-(Ізопропілсульфанілметил)феніл-
2,602	-Me	-Me	3-F	4-(Метилсульфамінол)феніл-
2,603	-Me	-Me	3-F	4-Сульфамінолфеніл-
2,604	-Me	-Me	3-F	4-Карбамоілфеніл-
2,605	-Me	-Me	3-Cl	4-(1-Метилпіразол-3-іл)феніл-
2,606	-Me	-Me	3-Cl	4-(5-Метилтетразол-1-іл)феніл-
2,607	-Me	-Me	3-Cl	4-Морфолінофеніл-
2,608	-Me	-Me	3-Cl	4-(3-Метилпіразол-1-іл)феніл-
2,609	-Me	-Me	3-Cl	4-(3,5-Диметилпіразол-1-іл)феніл-
2,610	-Me	-Me	3-Cl	4-Піразол-1-ілфеніл-
2,611	-Me	-Me	3-Cl	4-Пірол-1-ілфеніл-
2,612	-Me	-Me	3-Cl	4-(5-Метилтетрагідрофуран-2-іл)феніл-

Таблиця 2 (продовження)

№ сполуки	R ¹	R ²	Y	D
2,613	-Me	-Me	3-Cl	4-(5-Метил-2-фурил)феніл-
2,614	-Me	-Me	3-Cl	4-Оксазол-2-ілфеніл-
2,615	-Me	-Me	3-Cl	4-(2-Метилтіазол-4-іл)феніл-
2,616	-Me	-Me	3-Cl	4-(2-Тієніл)феніл-
2,617	-Me	-Me	3-Cl	4-(1,2,4-Триазол-1-іл)феніл-
2,618	-Me	-Me	3-Cl	1-Феніл-4-піразоліл-
2,619	-Me	-Me	3-Cl	1-Циклопропіл-4-піразоліл-
2,620	-Me	-Me	3-Cl	4-(Метилсульфанілметил)феніл-
2,621	-Me	-Me	3-Cl	4-(Ізопропілсульфанілметил)феніл-
2,622	-Me	-Me	3-Cl	4-(Метилсульфамоїл)феніл-
2,623	-Me	-Me	3-Cl	4-Сульфамоїлфеніл-
2,624	-Me	-Me	3-Cl	4-Карбамоїлфеніл-
2,625	-Me	-Cl	3-F	4-(1-Метилпіразол-3-іл)феніл-
2,626	-Me	-Cl	3-F	4-(5-Метилтетразол-1-іл)феніл-
2,627	-Me	-Cl	3-F	4-Морфолінофеніл-
2,628	-Me	-Cl	3-F	4-(3-Метилпіразол-1-іл)феніл-
2,629	-Me	-Cl	3-F	4-(3,5-Диметилпіразол-1-іл)феніл-
2,630	-Me	-Cl	3-F	4-Піразол-1-ілфеніл-
2,631	-Me	-Cl	3-F	4-Пірол-1-ілфеніл-
2,632	-Me	-Cl	3-F	4-(5-Метилтетрагідрофуран-2-іл)феніл-
2,633	-Me	-Cl	3-F	4-(5-Метил-2-фурил)феніл-
2,634	-Me	-Cl	3-F	4-Оксазол-2-ілфеніл-
2,635	-Me	-Cl	3-F	4-(2-Метилтіазол-4-іл)феніл-
2,636	-Me	-Cl	3-F	4-(2-Тієніл)феніл-
2,637	-Me	-Cl	3-F	4-(1,2,4-Триазол-1-іл)феніл-
2,638	-Me	-Cl	3-F	1-Феніл-4-піразоліл-
2,639	-Me	-Cl	3-F	1-Циклопропіл-4-піразоліл-
2,640	-Me	-Cl	3-F	4-(Метилсульфанілметил)феніл-
2,641	-Me	-Cl	3-F	4-(Ізопропілсульфанілметил)феніл-
2,642	-Me	-Cl	3-F	4-(Метилсульфамоїл)феніл-
2,643	-Me	-Cl	3-F	4-Сульфамоїлфеніл-
2,644	-Me	-Cl	3-F	4-Карбамоїлфеніл-
2,645	-Me	-Cl	3-Cl	4-(1-Метилпіразол-3-іл)феніл-
2,646	-Me	-Cl	3-Cl	4-(5-Метилтетразол-1-іл)феніл-
2,647	-Me	-Cl	3-Cl	4-Морфолінофеніл-
2,648	-Me	-Cl	3-Cl	4-(3-Метилпіразол-1-іл)феніл-
2,649	-Me	-Cl	3-Cl	4-(3,5-Диметилпіразол-1-іл)феніл-
2,650	-Me	-Cl	3-Cl	4-Піразол-1-ілфеніл-
2,651	-Me	-Cl	3-Cl	4-Пірол-1-ілфеніл-
2,652	-Me	-Cl	3-Cl	4-(5-Метилтетрагідрофуран-2-іл)феніл-
2,653	-Me	-Cl	3-Cl	4-(5-Метил-2-фурил)феніл-
2,654	-Me	-Cl	3-Cl	4-Оксазол-2-ілфеніл-
2,655	-Me	-Cl	3-Cl	4-(2-Метилтіазол-4-іл)феніл-
2,656	-Me	-Cl	3-Cl	4-(2-Тієніл)феніл-
2,657	-Me	-Cl	3-Cl	4-(1,2,4-Триазол-1-іл)феніл-
2,658	-Me	-Cl	3-Cl	1-Феніл-4-піразоліл-
2,659	-Me	-Cl	3-Cl	1-Циклопропіл-4-піразоліл-
2,660	-Me	-Cl	3-Cl	4-(Метилсульфанілметил)феніл-
2,661	-Me	-Cl	3-Cl	4-(Ізопропілсульфанілметил)феніл-
2,662	-Me	-Cl	3-Cl	4-(Метилсульфамоїл)феніл-
2,663	-Me	-Cl	3-Cl	4-Сульфамоїлфеніл-
2,664	-Me	-Cl	3-Cl	4-Карбамоїлфеніл-

Таблиця 2 (продовження)

№ сполуки	R ¹	R ²	Y	D
2,665	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-(1-Метилпіразол-3-іл)феніл-
2,666	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-(5-Метилтетразол-1-іл)феніл-
2,667	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-Морфолінофеніл-
2,668	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-(3-Метилпіразол-1-іл)феніл-
2,669	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-(3,5-Диметилпіразол-1-іл)феніл-
2,670	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-Піразол-1-ілфеніл-
2,671	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-Пірол-1-ілфеніл-
2,672	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-(5-Метилтетрагідрофуран-2-іл)феніл-
2,673	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-(5-Метил-2-фурил)феніл-
2,674	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-Оксазол-2-ілфеніл-
2,675	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-(2-Метилтіазол-4-іл)феніл-
2,676	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-(2-Тієніл)феніл-
2,677	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-(1,2,4-Триазол-1-іл)феніл-
2,678	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	1-Феніл-4-піразоліл-
2,679	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	1-Циклопропіл-4-піразоліл-
2,680	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-(Метилсульфанілметил)феніл-
2,681	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-(Ізопропілсульфанілметил)феніл-
2,682	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-(Метилсульфамойл)феніл-
2,683	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-Сульфамойлфеніл-
2,684	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-Карбамоїлфеніл-
2,685	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(1-Метилпіразол-3-іл)феніл-
2,686	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(5-Метилтетразол-1-іл)феніл-
2,687	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-Морфолінофеніл-
2,688	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(3-Метилпіразол-1-іл)феніл-
2,689	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(3,5-Диметилпіразол-1-іл)феніл-
2,690	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-Піразол-1-ілфеніл-
2,691	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-Пірол-1-ілфеніл-
2,692	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(5-Метилтетрагідрофуран-2-іл)феніл-
2,693	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(5-Метил-2-фурил)феніл-
2,694	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-Оксазол-2-ілфеніл-
2,695	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(2-Метилтіазол-4-іл)феніл-
2,696	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(2-Тієніл)феніл-
2,697	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(1,2,4-Триазол-1-іл)феніл-
2,698	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	1-Феніл-4-піразоліл-
2,699	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	1-Циклопропіл-4-піразоліл-
2,700	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(Метилсульфанілметил)феніл-
2,701	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(Ізопропілсульфанілметил)феніл-
2,702	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(Метилсульфамойл)феніл-
2,703	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-Сульфамойлфеніл-
2,704	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-Карбамоїлфеніл-
2,705	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-(1-Метилпіразол-3-іл)феніл-
2,706	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-(5-Метилтетразол-1-іл)феніл-
2,707	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-Морфолінофеніл-
2,708	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-(3-Метилпіразол-1-іл)феніл-
2,709	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-(3,5-Диметилпіразол-1-іл)феніл-
2,710	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-Піразол-1-ілфеніл-
2,711	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-Пірол-1-ілфеніл-
2,712	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-(5-Метилтетрагідрофуран-2-іл)феніл-
2,713	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-(5-Метил-2-фурил)феніл-
2,714	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-Оксазол-2-ілфеніл-
2,715	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-(2-Метилтіазол-4-іл)феніл-

Таблиця 2 (продовження)

№ сполуки	R ¹	R ²	Y	D
2,716	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-(2-Тієніл)феніл-
2,717	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-(1,2,4-Триазол-1-іл)феніл-
2,718	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	1-Феніл-4-піразоліл-
2,719	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	1-Циклопропіл-4-піразоліл-
2,720	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-(Метилсульфанілметил)феніл-
2,721	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-(Ізопропілсульфанілметил)феніл-
2,722	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-(Метилсульфаміл)феніл-
2,723	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-Сульфамілфеніл-
2,724	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-Карбамілфеніл-
2,725	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(1-Метилпіразол-3-іл)феніл-
2,726	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(5-Метилтетразол-1-іл)феніл-
2,727	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Морфолінофеніл-
2,728	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(3-Метилпіразол-1-іл)феніл-
2,729	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(3,5-Диметилпіразол-1-іл)феніл-
2,730	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Піразол-1-ілфеніл-
2,731	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Пірол-1-ілфеніл-
2,732	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(5-Метилтетрагідрофуран-2-іл)феніл-
2,733	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(5-Метил-2-фурил)феніл-
2,734	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Оксазол-2-ілфеніл-
2,735	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(2-Метилтіазол-4-іл)феніл-
2,736	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(2-Тієніл)феніл-
2,737	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(1,2,4-Триазол-1-іл)феніл-
2,738	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	1-Феніл-4-піразоліл-
2,739	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	1-Циклопропіл-4-піразоліл-
2,740	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(Метилсульфанілметил)феніл-
2,741	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(Ізопропілсульфанілметил)феніл-
2,742	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(Метилсульфаміл)феніл-
2,743	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Сульфамілфеніл-
2,744	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-Карбамілфеніл-

У таблиці В-2 наведено 744 сполуки від В-2.001 до В-2.744 формули (I), де G являє собою -H, W являє собою (E)-CH=CH-, X являє собою 6-циклопропіл, і R¹, R², Y, D є такими, як визначено для сполук № 2.001 - 2.744 відповідно в таблиці 2 вище.

У таблиці В-3 наведено 744 сполуки від В-3.001 до В-3.744 формули (I), де G являє собою -(C=O)iPr, W являє собою -CH₂-CH₂-, X являє собою 6-циклопропіл, і R¹, R², Y, D є такими, як визначено для сполук № 2.001 - 2.744 відповідно в таблиці 2 вище.

У таблиці В-4 наведено 744 сполуки від В-4.001 до В-4.744 формули (I), де G являє собою -(C=O)iPr, W являє собою (E)-CH=CH-, X являє собою 6-циклопропіл, і R¹, R², Y, D є такими, як визначено для сполук № 2.001 - 2.744 відповідно в таблиці 2 вище.

У таблиці С-1 наведено 744 сполуки від С-1.001 до С-1.744 формули (I), де G являє собою -H, W являє собою -CH₂-CH₂-, Y являє собою 3-циклопропіл, і R¹, R², X і D є такими, як визначено для сполук № 3.001 - 3.744 відповідно в таблиці 3 нижче.

Таблиця 3

Визначення замісників R¹, R², X і D

№ сполуки	R ¹	R ²	X	D
3,001	-Me	-Me	6-F	-Ph
3,002	-Me	-Me	6-F	1-Метил-3-(трифторметил)піразол-4-іл-
3,003	-Me	-Me	6-F	1-Метил-піразол-4-іл-
3,004	-Me	-Me	6-F	2-(Метилсульфаніл)-4-піридил-
3,005	-Me	-Me	6-F	2-Ацетамідо-4-піридил-

Таблиця 3 (продовження)

№ сполуки	R ¹	R ²	X	D
3,006	-Me	-Me	6-F	2-Ацетамідотіазол-5-іл-
3,007	-Me	-Me	6-F	2-Аміно-4-піридил-
3,008	-Me	-Me	6-F	2-Хлор-3-піридил-
3,009	-Me	-Me	6-F	2-Хлор-4-піридил-
3,010	-Me	-Me	6-F	2-Хлортіазол-5-іл-
3,011	-Me	-Me	6-F	2-Ціанофеніл-
3,012	-Me	-Me	6-F	2-Ціано-феніл-
3,013	-Me	-Me	6-F	2-Фтор-4-піридил-
3,014	-Me	-Me	6-F	2-Метил-4-піридил-
3,015	-Me	-Me	6-F	2-Метил-триазол-4-іл-
3,016	-Me	-Me	6-F	2-Толіл-
3,017	-Me	-Me	6-F	2-Триформетил-4-піридил-
3,018	-Me	-Me	6-F	2-Триформетил-феніл-
3,019	-Me	-Me	6-F	3,4-Дифтор-феніл-
3,020	-Me	-Me	6-F	3,5-Дифтор-феніл-
3,021	-Me	-Me	6-F	3-Хлор-4-фтор-феніл-
3,022	-Me	-Me	6-F	3-Хлор-4-піридил-
3,023	-Me	-Me	6-F	3-Ціанофеніл-
3,024	-Me	-Me	6-F	3-Ціано-феніл-
3,025	-Me	-Me	6-F	3-Метил-2-піридил-
3,026	-Me	-Me	6-F	3-Метил-4-аміно-феніл-
3,027	-Me	-Me	6-F	3-Піридил-
3,028	-Me	-Me	6-F	3-Толіл-
3,029	-Me	-Me	6-F	3-Триформетил-3-піридил-
3,030	-Me	-Me	6-F	3-Триформетил-феніл-
3,031	-Me	-Me	6-F	4-(Диметиламіно)-феніл-
3,032	-Me	-Me	6-F	4-(Диметилсульфамойл)феніл-
3,033	-Me	-Me	6-F	4-(Метиламіно)-феніл-
3,034	-Me	-Me	6-F	4-(Метилсульфаніл)феніл-
3,035	-Me	-Me	6-F	4-(трет-Бутокси)-феніл-
3,036	-Me	-Me	6-F	4-(трет-Бутоксикарбоніламіно)-3-фтор-феніл-
3,037	-Me	-Me	6-F	4-(Триформетокси)-феніл-
3,038	-Me	-Me	6-F	4-[Етил(метил)карбамоїл]-3-фтор-феніл-
3,039	-Me	-Me	6-F	4-Ацетамідофеніл-
3,040	-Me	-Me	6-F	4-Аміно-3-метилфеніл-
3,041	-Me	-Me	6-F	4-Аміно-феніл-
3,042	-Me	-Me	6-F	4-Біфеніл-
3,043	-Me	-Me	6-F	4-Карбоксифеніл-
3,044	-Me	-Me	6-F	4-Хлор-3-піридил-
3,045	-Me	-Me	6-F	4-Хлор-феніл-
3,046	-Me	-Me	6-F	4-Ціанофеніл-
3,047	-Me	-Me	6-F	4-Ціано-феніл-
3,048	-Me	-Me	6-F	4-Циклопропілфеніл-
3,049	-Me	-Me	6-F	4-Циклопропіл-феніл-
3,050	-Me	-Me	6-F	4-Диметиламінофеніл-
3,051	-Me	-Me	6-F	4-Фтор-феніл-
3,052	-Me	-Me	6-F	4-Гідроксифеніл-
3,053	-Me	-Me	6-F	4-Гідрокси-феніл-
3,054	-Me	-Me	6-F	4-Метоксикарбонілфеніл-
3,055	-Me	-Me	6-F	4-Метил-2-піридил-
3,056	-Me	-Me	6-F	4-Метиламінофеніл-
3,057	-Me	-Me	6-F	4-Метилсульфонілфеніл-

Таблиця 3 (продовження)

№ сполуки	R ¹	R ²	X	D
3,058	-Me	-Me	6-F	4-Оксазол-5-ілфеніл-
3,059	-Me	-Me	6-F	4-Піридил-
3,060	-Me	-Me	6-F	4-трет-Бутоксифеніл-
3,061	-Me	-Me	6-F	4-трет-Бутилфеніл-
3,062	-Me	-Me	6-F	4-Толіл-
3,063	-Me	-Me	6-F	4-Трифторметил-3-піридил-
3,064	-Me	-Me	6-F	4-Трифторметил-феніл-
3,065	-Me	-Me	6-F	5-Метил-1,3,4-оксадіазол-2-іл-
3,066	-Me	-Me	6-F	5-Метил-2-піридил-
3,067	-Me	-Me	6-F	5-Метил-3-піридил-
3,068	-Me	-Me	6-F	6-Хлор-3-піридил-
3,069	-Me	-Me	6-F	6-Метил-2-піридил-
3,070	-Me	-Me	6-F	Піримідин-5-іл-
3,071	-Me	-Me	6-F	Тіазол-2-іл-
3,072	-Me	-Me	6-F	Тіазол-5-іл-
3,073	-Me	-Me	6-F	Тіофен-3-іл-
3,074	-Me	-Me	6-Cl	-Ph
3,075	-Me	-Me	6-Cl	1-Метил-3-(трифторметил)піразол-4-іл-
3,076	-Me	-Me	6-Cl	1-Метил-піразол-4-іл-
3,077	-Me	-Me	6-Cl	2-(Метилсульфаніл)-4-піридил-
3,078	-Me	-Me	6-Cl	2-Ацетамідо-4-піридил-
3,079	-Me	-Me	6-Cl	2-Ацетамідотіазол-5-іл-
3,080	-Me	-Me	6-Cl	2-Аміно-4-піридил-
3,081	-Me	-Me	6-Cl	2-Хлор-3-піридил-
3,082	-Me	-Me	6-Cl	2-Хлор-4-піридил-
3,083	-Me	-Me	6-Cl	2-Хлортіазол-5-іл-
3,084	-Me	-Me	6-Cl	2-Ціанофеніл-
3,085	-Me	-Me	6-Cl	2-Ціано-феніл-
3,086	-Me	-Me	6-Cl	2-Фтор-4-піридил-
3,087	-Me	-Me	6-Cl	2-Метил-4-піридил-
3,088	-Me	-Me	6-Cl	2-Метил-триазол-4-іл-
3,089	-Me	-Me	6-Cl	2-Толіл-
3,090	-Me	-Me	6-Cl	2-Трифторметил-4-піридил-
3,091	-Me	-Me	6-Cl	2-Трифторметил-феніл-
3,092	-Me	-Me	6-Cl	3,4-Дифтор-феніл-
3,093	-Me	-Me	6-Cl	3,5-Дифтор-феніл-
3,094	-Me	-Me	6-Cl	3-Хлор-4-фтор-феніл-
3,095	-Me	-Me	6-Cl	3-Хлор-4-піридил-
3,096	-Me	-Me	6-Cl	3-Ціанофеніл-
3,097	-Me	-Me	6-Cl	3-Ціано-феніл-
3,098	-Me	-Me	6-Cl	3-Метил-2-піридил-
3,099	-Me	-Me	6-Cl	3-Метил-4-аміно-феніл-
3,100	-Me	-Me	6-Cl	3-Піридил-
3,101	-Me	-Me	6-Cl	3-Толіл-
3,102	-Me	-Me	6-Cl	3-Трифторметил-3-піридил-
3,103	-Me	-Me	6-Cl	3-Трифторметил-феніл-
3,104	-Me	-Me	6-Cl	4-(Диметиламіно)-феніл-
3,105	-Me	-Me	6-Cl	4-(Диметилсульфамойл)феніл-
3,106	-Me	-Me	6-Cl	4-(Метиламіно)-феніл-
3,107	-Me	-Me	6-Cl	4-(Метилсульфаніл)феніл-
3,108	-Me	-Me	6-Cl	4-(трет-Бутокси)-феніл-
3,109	-Me	-Me	6-Cl	4-(трет-Бутоксикарбоніламіно)-3-фтор-феніл-

Таблиця 3 (продовження)

№ сполуки	R ¹	R ²	X	D
3,110	-Me	-Me	6-Cl	4-(Трифторметокси)-феніл-
3,111	-Me	-Me	6-Cl	4-[Етил(метил)карбамоїл]-3-фтор-феніл-
3,112	-Me	-Me	6-Cl	4-Ацетамідофеніл-
3,113	-Me	-Me	6-Cl	4-Аміно-3-метилфеніл-
3,114	-Me	-Me	6-Cl	4-Аміно-феніл-
3,115	-Me	-Me	6-Cl	4-Біфеніл-
3,116	-Me	-Me	6-Cl	4-Карбоксифеніл-
3,117	-Me	-Me	6-Cl	4-Хлор-3-піридил-
3,118	-Me	-Me	6-Cl	4-Хлор-феніл-
3,119	-Me	-Me	6-Cl	4-Ціанофеніл-
3,120	-Me	-Me	6-Cl	4-Ціано-феніл-
3,121	-Me	-Me	6-Cl	4-Циклопропілфеніл-
3,122	-Me	-Me	6-Cl	4-Циклопропіл-феніл-
3,123	-Me	-Me	6-Cl	4-Диметиламінофеніл-
3,124	-Me	-Me	6-Cl	4-Фтор-феніл-
3,125	-Me	-Me	6-Cl	4-Гідроксифеніл-
3,126	-Me	-Me	6-Cl	4-Гідрокси-феніл-
3,127	-Me	-Me	6-Cl	4-Метоксикарбонілфеніл-
3,128	-Me	-Me	6-Cl	4-Метил-2-піридил-
3,129	-Me	-Me	6-Cl	4-Метиламінофеніл-
3,130	-Me	-Me	6-Cl	4-Метилсульфонілфеніл-
3,131	-Me	-Me	6-Cl	4-Оксазол-5-ілфеніл-
3,132	-Me	-Me	6-Cl	4-Піридил-
3,133	-Me	-Me	6-Cl	4-трет-Бутоксифеніл-
3,134	-Me	-Me	6-Cl	4-трет-Бутилфеніл-
3,135	-Me	-Me	6-Cl	4-Толіл-
3,136	-Me	-Me	6-Cl	4-Трифторметил-3-піридил-
3,137	-Me	-Me	6-Cl	4-Трифторметил-феніл-
3,138	-Me	-Me	6-Cl	5-Метил-1,3,4-оксадіазол-2-іл-
3,139	-Me	-Me	6-Cl	5-Метил-2-піридил-
3,140	-Me	-Me	6-Cl	5-Метил-3-піридил-
3,141	-Me	-Me	6-Cl	6-Хлор-3-піридил-
3,142	-Me	-Me	6-Cl	6-Метил-2-піридил-
3,143	-Me	-Me	6-Cl	Піримідин-5-іл-
3,144	-Me	-Me	6-Cl	Тіазол-2-іл-
3,145	-Me	-Me	6-Cl	Тіазол-5-іл-
3,146	-Me	-Me	6-Cl	Тіофен-3-іл-
3,147	-Me	-Cl	6-F	-Ph
3,148	-Me	-Cl	6-F	1-Метил-3-(трифторметил)піразол-4-іл-
3,149	-Me	-Cl	6-F	1-Метил-піразол-4-іл-
3,150	-Me	-Cl	6-F	2-(Метилсульфаніл)-4-піридил-
3,151	-Me	-Cl	6-F	2-Ацетамідо-4-піридил-
3,152	-Me	-Cl	6-F	2-Ацетамідотіазол-5-іл-
3,153	-Me	-Cl	6-F	2-Аміно-4-піридил-
3,154	-Me	-Cl	6-F	2-Хлор-3-піридил-
3,155	-Me	-Cl	6-F	2-Хлор-4-піридил-
3,156	-Me	-Cl	6-F	2-Хлортіазол-5-іл-
3,157	-Me	-Cl	6-F	2-Ціанофеніл-
3,158	-Me	-Cl	6-F	2-Ціано-феніл-
3,159	-Me	-Cl	6-F	2-Фтор-4-піридил-
3,160	-Me	-Cl	6-F	2-Метил-4-піридил-
3,161	-Me	-Cl	6-F	2-Метил-триазол-4-іл-

Таблиця 3 (продовження)

№ сполуки	R ¹	R ²	X	D
3,162	-Me	-Cl	6-F	2-Толіл-
3,163	-Me	-Cl	6-F	2-Триформетил-4-піридил-
3,164	-Me	-Cl	6-F	2-Триформетил-феніл-
3,165	-Me	-Cl	6-F	3,4-Дифтор-феніл-
3,166	-Me	-Cl	6-F	3,5-Дифтор-феніл-
3,167	-Me	-Cl	6-F	3-Хлор-4-фтор-феніл-
3,168	-Me	-Cl	6-F	3-Хлор-4-піридил-
3,169	-Me	-Cl	6-F	3-Ціанофеніл-
3,170	-Me	-Cl	6-F	3-Ціано-феніл-
3,171	-Me	-Cl	6-F	3-Метил-2-піридил-
3,172	-Me	-Cl	6-F	3-Метил-4-аміно-феніл-
3,173	-Me	-Cl	6-F	3-Піридил-
3,174	-Me	-Cl	6-F	3-Толіл-
3,175	-Me	-Cl	6-F	3-Триформетил-3-піридил-
3,176	-Me	-Cl	6-F	3-Триформетил-феніл-
3,177	-Me	-Cl	6-F	4-(Диметиламіно)-феніл-
3,178	-Me	-Cl	6-F	4-(Диметилсульфаміно)феніл-
3,179	-Me	-Cl	6-F	4-(Метиламіно)-феніл-
3,180	-Me	-Cl	6-F	4-(Метилсульфаніл)феніл-
3,181	-Me	-Cl	6-F	4-(трет-Бутокси)-феніл-
3,182	-Me	-Cl	6-F	4-(трет-Бутоксикарбоніламіно)-3-фтор-феніл-
3,183	-Me	-Cl	6-F	4-(Триформетокси)-феніл-
3,184	-Me	-Cl	6-F	4-[Етил(метил)карбамоїл]-3-фтор-феніл-
3,185	-Me	-Cl	6-F	4-Ацетамідофеніл-
3,186	-Me	-Cl	6-F	4-Аміно-3-метилфеніл-
3,187	-Me	-Cl	6-F	4-Аміно-феніл-
3,188	-Me	-Cl	6-F	4-Біфеніл-
3,189	-Me	-Cl	6-F	4-Карбоксифеніл-
3,190	-Me	-Cl	6-F	4-Хлор-3-піридил-
3,191	-Me	-Cl	6-F	4-Хлор-феніл-
3,192	-Me	-Cl	6-F	4-Ціанофеніл-
3,193	-Me	-Cl	6-F	4-Ціано-феніл-
3,194	-Me	-Cl	6-F	4-Циклопропілфеніл-
3,195	-Me	-Cl	6-F	4-Циклопропіл-феніл-
3,196	-Me	-Cl	6-F	4-Диметиламінофеніл-
3,197	-Me	-Cl	6-F	4-Фтор-феніл-
3,198	-Me	-Cl	6-F	4-Гідроксифеніл-
3,199	-Me	-Cl	6-F	4-Гідрокси-феніл-
3,200	-Me	-Cl	6-F	4-Метоксикарбонілфеніл-
3,201	-Me	-Cl	6-F	4-Метил-2-піридил-
3,202	-Me	-Cl	6-F	4-Метиламінофеніл-
3,203	-Me	-Cl	6-F	4-Метилсульфонілфеніл-
3,204	-Me	-Cl	6-F	4-Оксазол-5-ілфеніл-
3,205	-Me	-Cl	6-F	4-Піридил-
3,206	-Me	-Cl	6-F	4-трет-Бутоксифеніл-
3,207	-Me	-Cl	6-F	4-трет-Бутилфеніл-
3,208	-Me	-Cl	6-F	4-Толіл-
3,209	-Me	-Cl	6-F	4-Триформетил-3-піридил-
3,210	-Me	-Cl	6-F	4-Триформетил-феніл-
3,211	-Me	-Cl	6-F	5-Метил-1,3,4-оксадіазол-2-іл-
3,212	-Me	-Cl	6-F	5-Метил-2-піридил-
3,213	-Me	-Cl	6-F	5-Метил-3-піридил-

Таблиця 3 (продовження)

№ сполуки	R ¹	R ²	X	D
3,214	-Me	-Cl	6-F	6-Хлор-3-піридил-
3,215	-Me	-Cl	6-F	6-Метил-2-піридил-
3,216	-Me	-Cl	6-F	Піримідин-5-іл-
3,217	-Me	-Cl	6-F	Тіазол-2-іл-
3,218	-Me	-Cl	6-F	Тіазол-5-іл-
3,219	-Me	-Cl	6-F	Тіофен-3-іл-
3,220	-Me	-Cl	6-Cl	-Ph
3,221	-Me	-Cl	6-Cl	1-Метил-3-(трифторметил)піразол-4-іл-
3,222	-Me	-Cl	6-Cl	1-Метил-піразол-4-іл-
3,223	-Me	-Cl	6-Cl	2-(Метилсульфаніл)-4-піридил-
3,224	-Me	-Cl	6-Cl	2-Ацетамідо-4-піридил-
3,225	-Me	-Cl	6-Cl	2-Ацетамідотіазол-5-іл-
3,226	-Me	-Cl	6-Cl	2-Аміно-4-піридил-
3,227	-Me	-Cl	6-Cl	2-Хлор-3-піридил-
3,228	-Me	-Cl	6-Cl	2-Хлор-4-піридил-
3,229	-Me	-Cl	6-Cl	2-Хлортіазол-5-іл-
3,230	-Me	-Cl	6-Cl	2-Ціанофеніл-
3,231	-Me	-Cl	6-Cl	2-Ціано-феніл-
3,232	-Me	-Cl	6-Cl	2-Фтор-4-піридил-
3,233	-Me	-Cl	6-Cl	2-Метил-4-піридил-
3,234	-Me	-Cl	6-Cl	2-Метил-триазол-4-іл-
3,235	-Me	-Cl	6-Cl	2-Толіл-
3,236	-Me	-Cl	6-Cl	2-Трифторметил-4-піридил-
3,237	-Me	-Cl	6-Cl	2-Трифторметил-феніл-
3,238	-Me	-Cl	6-Cl	3,4-Дифтор-феніл-
3,239	-Me	-Cl	6-Cl	3,5-Дифтор-феніл-
3,240	-Me	-Cl	6-Cl	3-Хлор-4-фтор-феніл-
3,241	-Me	-Cl	6-Cl	3-Хлор-4-піридил-
3,242	-Me	-Cl	6-Cl	3-Ціанофеніл-
3,243	-Me	-Cl	6-Cl	3-Ціано-феніл-
3,244	-Me	-Cl	6-Cl	3-Метил-2-піридил-
3,245	-Me	-Cl	6-Cl	3-Метил-4-аміно-феніл-
3,246	-Me	-Cl	6-Cl	3-Піридил-
3,247	-Me	-Cl	6-Cl	3-Толіл-
3,248	-Me	-Cl	6-Cl	3-Трифторметил-3-піридил-
3,249	-Me	-Cl	6-Cl	3-Трифторметил-феніл-
3,250	-Me	-Cl	6-Cl	4-(Диметиламіно)-феніл-
3,251	-Me	-Cl	6-Cl	4-(Диметилсульфамойл)феніл-
3,252	-Me	-Cl	6-Cl	4-(Метиламіно)-феніл-
3,253	-Me	-Cl	6-Cl	4-(Метилсульфаніл)феніл-
3,254	-Me	-Cl	6-Cl	4-(трет-Бутокси)-феніл-
3,255	-Me	-Cl	6-Cl	4-(трет-Бутоксикарбоніламіно)-3-фтор-феніл-
3,256	-Me	-Cl	6-Cl	4-(Трифторметокси)-феніл-
3,257	-Me	-Cl	6-Cl	4-[Етил(метил)карбамоїл]-3-фтор-феніл-
3,258	-Me	-Cl	6-Cl	4-Ацетамідофеніл-
3,259	-Me	-Cl	6-Cl	4-Аміно-3-метилфеніл-
3,260	-Me	-Cl	6-Cl	4-Аміно-феніл-
3,261	-Me	-Cl	6-Cl	4-Біфеніл-
3,262	-Me	-Cl	6-Cl	4-Карбоксифеніл-
3,263	-Me	-Cl	6-Cl	4-Хлор-3-піридил-
3,264	-Me	-Cl	6-Cl	4-Хлор-феніл-

Таблиця 3 (продовження)

№ сполуки	R ¹	R ²	X	D
3,265	-Me	-Cl	6-Cl	4-Ціанофеніл-
3,266	-Me	-Cl	6-Cl	4-Ціано-феніл-
3,267	-Me	-Cl	6-Cl	4-Циклопропілфеніл-
3,268	-Me	-Cl	6-Cl	4-Циклопропіл-феніл-
3,269	-Me	-Cl	6-Cl	4-Диметиламінофеніл-
3,270	-Me	-Cl	6-Cl	4-Фтор-феніл-
3,271	-Me	-Cl	6-Cl	4-Гідроксифеніл-
3,272	-Me	-Cl	6-Cl	4-Гідрокси-феніл-
3,273	-Me	-Cl	6-Cl	4-Метоксикарбонілфеніл-
3,274	-Me	-Cl	6-Cl	4-Метил-2-піридил-
3,275	-Me	-Cl	6-Cl	4-Метиламінофеніл-
3,276	-Me	-Cl	6-Cl	4-Метилсульфонілфеніл-
3,277	-Me	-Cl	6-Cl	4-Оксазол-5-ілфеніл-
3,278	-Me	-Cl	6-Cl	4-Піридил-
3,279	-Me	-Cl	6-Cl	4-трет-Бутоксифеніл-
3,280	-Me	-Cl	6-Cl	4-трет-Бутилфеніл-
3,281	-Me	-Cl	6-Cl	4-Толіл-
3,282	-Me	-Cl	6-Cl	4-Триформетил-3-піридил-
3,283	-Me	-Cl	6-Cl	4-Триформетил-феніл-
3,284	-Me	-Cl	6-Cl	5-Метил-1,3,4-оксадіазол-2-іл-
3,285	-Me	-Cl	6-Cl	5-Метил-2-піридил-
3,286	-Me	-Cl	6-Cl	5-Метил-3-піридил-
3,287	-Me	-Cl	6-Cl	6-Хлор-3-піридил-
3,288	-Me	-Cl	6-Cl	6-Метил-2-піридил-
3,289	-Me	-Cl	6-Cl	Піримідин-5-іл-
3,290	-Me	-Cl	6-Cl	Тіазол-2-іл-
3,291	-Me	-Cl	6-Cl	Тіазол-5-іл-
3,292	-Me	-Cl	6-Cl	Тіофен-3-іл-
3,293	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	-Ph
3,294	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	1-Метил-3-(триформетил)піразол-4-іл-
3,295	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	1-Метил-піразол-4-іл-
3,296	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	2-(Метилсульфаніл)-4-піридил-
3,297	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	2-Ацетамідо-4-піридил-
3,298	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	2-Ацетамідотіазол-5-іл-
3,299	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	2-Аміно-4-піридил-
3,300	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	2-Хлор-3-піридил-
3,301	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	2-Хлор-4-піридил-
3,302	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	2-Хлортіазол-5-іл-
3,303	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	2-Ціанофеніл-
3,304	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	2-Ціано-феніл-
3,305	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	2-Фтор-4-піридил-
3,306	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	2-Метил-4-піридил-
3,307	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	2-Метил-триазол-4-іл-
3,308	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	2-Толіл-
3,309	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	2-Триформетил-4-піридил-
3,310	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	2-Триформетил-феніл-
3,311	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3,4-Дифтор-феніл-
3,312	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3,5-Дифтор-феніл-
3,313	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Хлор-4-фтор-феніл-
3,314	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Хлор-4-піридил-
3,315	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Ціанофеніл-
3,316	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Ціано-феніл-
3,317	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Метил-2-піридил-

Таблиця 3 (продовження)

№ сполуки	R ¹	R ²	X	D
3,318	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Метил-4-аміно-феніл-
3,319	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Піридил-
3,320	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Толіл-
3,321	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Трифторметил-3-піридил-
3,322	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Трифторметил-феніл-
3,323	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-(Диметиламіно)-феніл-
3,324	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-(Диметилсульфамойл)феніл-
3,325	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-(Метиламіно)-феніл-
3,326	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-(Метилсульфаніл)феніл-
3,327	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-(трет-Бутокси)-феніл-
3,328	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-(трет-Бутоксикарбоніламіно)-3-фтор-феніл-
3,329	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-(Трифторметокси)-феніл-
3,330	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-[Етил(метил)карбамоїл]-3-фтор-феніл-
3,331	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-Ацетамідофеніл-
3,332	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-Аміно-3-метилфеніл-
3,333	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-Аміно-феніл-
3,334	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-Біфеніл-
3,335	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-Карбоксифеніл-
3,336	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-Хлор-3-піридил-
3,337	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-Хлор-феніл-
3,338	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-Ціанофеніл-
3,339	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-Ціано-феніл-
3,340	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-Циклопропілфеніл-
3,341	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-Циклопропіл-феніл-
3,342	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-Диметиламінофеніл-
3,343	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-Фтор-феніл-
3,344	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-Гідроксифеніл-
3,345	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-Гідрокси-феніл-
3,346	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-Метоксикарбонілфеніл-
3,347	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-Метил-2-піридил-
3,348	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-Метиламінофеніл-
3,349	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-Метилсульфонілфеніл-
3,350	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-Оксазол-5-ілфеніл-
3,351	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-Піридил-
3,352	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-трет-Бутоксифеніл-
3,353	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-трет-Бутилфеніл-
3,354	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-Толіл-
3,355	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-Трифторметил-3-піридил-
3,356	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-Трифторметил-феніл-
3,357	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	5-Метил-1,3,4-оксадіазол-2-іл-
3,358	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	5-Метил-2-піридил-
3,359	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	5-Метил-3-піридил-
3,360	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	6-Хлор-3-піридил-
3,361	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	6-Метил-2-піридил-
3,362	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	Піримідин-5-іл-
3,363	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	Тіазол-2-іл-
3,364	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	Тіазол-5-іл-
3,365	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	Тіофен-3-іл-
3,366	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	-Ph
3,367	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	1-Метил-3-(трифторметил)піразол-4-іл-
3,368	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	1-Метил-піразол-4-іл-

Таблиця 3 (продовження)

№ сполуки	R ¹	R ²	X	D
3,369	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	2-(Метилсульфаніл)-4-піридил-
3,370	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	2-Ацетамідо-4-піридил-
3,371	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	2-Ацетамідотіазол-5-іл-
3,372	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	2-Аміно-4-піридил-
3,373	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	2-Хлор-3-піридил-
3,374	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	2-Хлор-4-піридил-
3,375	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	2-Хлортіазол-5-іл-
3,376	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	2-Ціанофеніл-
3,377	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	2-Ціано-феніл-
3,378	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	2-Фтор-4-піридил-
3,379	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	2-Метил-4-піридил-
3,380	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	2-Метил-триазол-4-іл-
3,381	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	2-Толіл-
3,382	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	2-Триформетил-4-піридил-
3,383	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	2-Триформетил-феніл-
3,384	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3,4-Дифтор-феніл-
3,385	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3,5-Дифтор-феніл-
3,386	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Хлор-4-фтор-феніл-
3,387	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Хлор-4-піридил-
3,388	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Ціанофеніл-
3,389	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Ціано-феніл-
3,390	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Метил-2-піридил-
3,391	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Метил-4-аміно-феніл-
3,392	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Піридил-
3,393	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Толіл-
3,394	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Триформетил-3-піридил-
3,395	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Триформетил-феніл-
3,396	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(Диметиламіно)-феніл-
3,397	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(Диметилсульфамойл)феніл-
3,398	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(Метиламіно)-феніл-
3,399	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(Метилсульфаніл)феніл-
3,400	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(трет-Бутокси)-феніл-
3,401	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(трет-Бутоксикарбоніламіно)-3-фтор-феніл-
3,402	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(Триформетокси)-феніл-
3,403	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-[Етил(метил)карбамоїл]-3-фтор-феніл-
3,404	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-Ацетамідофеніл-
3,405	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-Аміно-3-метилфеніл-
3,406	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-Аміно-феніл-
3,407	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-Біфеніл-
3,408	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-Карбоксифеніл-
3,409	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-Хлор-3-піридил-
3,410	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-Хлор-феніл-
3,411	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-Ціанофеніл-
3,412	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-Ціано-феніл-
3,413	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-Циклопропілфеніл-
3,414	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-Циклопропіл-феніл-
3,415	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-Диметиламінофеніл-
3,416	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-Фтор-феніл-
3,417	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-Гідроксифеніл-
3,418	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-Гідрокси-феніл-
3,419	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-Метоксикарбонілфеніл-
3,420	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-Метил-2-піридил-

Таблиця 3 (продовження)

№ сполуки	R ¹	R ²	X	D
3,421	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-Метиламінофеніл-
3,422	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-Метилсульфонілфеніл-
3,423	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-Оксазол-5-ілфеніл-
3,424	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-Піридил-
3,425	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-трет-Бутоксифеніл-
3,426	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-трет-Бутилфеніл-
3,427	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-Толіл-
3,428	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-Триформетил-3-піридил-
3,429	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-Триформетил-феніл-
3,430	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	5-Метил-1,3,4-оксадіазол-2-іл-
3,431	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	5-Метил-2-піридил-
3,432	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	5-Метил-3-піридил-
3,433	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	6-Хлор-3-піридил-
3,434	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	6-Метил-2-піридил-
3,435	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	Піримідин-5-іл-
3,436	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	Тіазол-2-іл-
3,437	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	Тіазол-5-іл-
3,438	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	Тіофен-3-іл-
3,439	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	-Ph
3,440	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	1-Метил-3-(триформетил)піразол-4-іл-
3,441	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	1-Метил-піразол-4-іл-
3,442	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	2-(Метилсульфаніл)-4-піридил-
3,443	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	2-Ацетамідо-4-піридил-
3,444	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	2-Ацетамідотіазол-5-іл-
3,445	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	2-Аміно-4-піридил-
3,446	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	2-Хлор-3-піридил-
3,447	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	2-Хлор-4-піридил-
3,448	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	2-Хлортіазол-5-іл-
3,449	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	2-Ціанофеніл-
3,450	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	2-Ціано-феніл-
3,451	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	2-Фтор-4-піридил-
3,452	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	2-Метил-4-піридил-
3,453	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	2-Метил-триазол-4-іл-
3,454	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	2-Толіл-
3,455	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	2-Триформетил-4-піридил-
3,456	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	2-Триформетил-феніл-
3,457	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3,4-Дифтор-феніл-
3,458	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3,5-Дифтор-феніл-
3,459	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Хлор-4-фтор-феніл-
3,460	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Хлор-4-піридил-
3,461	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Ціанофеніл-
3,462	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Ціано-феніл-
3,463	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Метил-2-піридил-
3,464	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Метил-4-аміно-феніл-
3,465	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Піридил-
3,466	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Толіл-
3,467	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Триформетил-3-піридил-
3,468	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Триформетил-феніл-
3,469	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-(Диметиламіно)-феніл-
3,470	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-(Диметилсульфамойл)феніл-
3,471	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-(Метиламіно)-феніл-
3,472	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-(Метилсульфаніл)феніл-
3,473	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-(трет-Бутокс)-феніл-

Таблиця 3 (продовження)

№ сполуки	R ¹	R ²	X	D
3,474	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-(трет-Бутоксикарбоніламіно)-3-фтор-феніл-
3,475	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-(Трифторметокси)-феніл-
3,476	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-[Етил(метил)карбамоїл]-3-фтор-феніл-
3,477	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-Ацетамідофеніл-
3,478	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-Аміно-3-метилфеніл-
3,479	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-Аміно-феніл-
3,480	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-Біфеніл-
3,481	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-Карбоксифеніл-
3,482	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-Хлор-3-піридил-
3,483	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-Хлор-феніл-
3,484	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-Ціанофеніл-
3,485	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-Ціано-феніл-
3,486	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-Циклопропілфеніл-
3,487	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-Циклопропіл-феніл-
3,488	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-Диметиламінофеніл-
3,489	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-Фтор-феніл-
3,490	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-Гідроксифеніл-
3,491	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-Гідрокси-феніл-
3,492	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-Метоксикарбонілфеніл-
3,493	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-Метил-2-піридил-
3,494	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-Метиламінофеніл-
3,495	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-Метилсульфонілфеніл-
3,496	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-Оксазол-5-ілфеніл-
3,497	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-Піридил-
3,498	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-трет-Бутоксифеніл-
3,499	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-трет-Бутилфеніл-
3,500	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-Толіл-
3,501	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-Трифторметил-3-піридил-
3,502	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-Трифторметил-феніл-
3,503	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	5-Метил-1,3,4-оксадіазол-2-іл-
3,504	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	5-Метил-2-піридил-
3,505	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	5-Метил-3-піридил-
3,506	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	6-Хлор-3-піридил-
3,507	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	6-Метил-2-піридил-
3,508	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	Піримідин-5-іл-
3,509	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	Тіазол-2-іл-
3,510	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	Тіазол-5-іл-
3,511	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	Тіофен-3-іл-
3,512	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	-Ph
3,513	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	1-Метил-3-(трифторметил)піразол-4-іл-
3,514	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	1-Метил-піразол-4-іл-
3,515	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	2-(Метилсульфаніл)-4-піридил-
3,516	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	2-Ацетамідо-4-піридил-
3,517	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	2-Ацетамідотіазол-5-іл-
3,518	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	2-Аміно-4-піридил-
3,519	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	2-Хлор-3-піридил-
3,520	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	2-Хлор-4-піридил-
3,521	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	2-Хлортіазол-5-іл-
3,522	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	2-Ціанофеніл-
3,523	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	2-Ціано-феніл-
3,524	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	2-Фтор-4-піридил-

Таблиця 3 (продовження)

№ сполуки	R ¹	R ²	X	D
3,525	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	2-Метил-4-піридил-
3,526	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	2-Метил-триазол-4-іл-
3,527	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	2-Толіл-
3,528	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	2-Трифторметил-4-піридил-
3,529	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	2-Трифторметил-феніл-
3,530	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3,4-Дифтор-феніл-
3,531	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3,5-Дифтор-феніл-
3,532	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Хлор-4-фтор-феніл-
3,533	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Хлор-4-піридил-
3,534	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Ціанофеніл-
3,535	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Ціано-феніл-
3,536	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Метил-2-піридил-
3,537	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Метил-4-аміно-феніл-
3,538	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Піридил-
3,539	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Толіл-
3,540	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Трифторметил-3-піридил-
3,541	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Трифторметил-феніл-
3,542	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(Диметиламіно)-феніл-
3,543	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(Диметилсульфамойл)феніл-
3,544	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(Метиламіно)-феніл-
3,545	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(Метилсульфаніл)феніл-
3,546	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(трет-Бутокси)-феніл-
3,547	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(трет-Бутоксикарбоніламіно)-3-фтор-феніл-
3,548	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(Трифторметокси)-феніл-
3,549	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-[Етил(метил)карбамоїл]-3-фтор-феніл-
3,550	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Ацетамідофеніл-
3,551	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Аміно-3-метилфеніл-
3,552	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Аміно-феніл-
3,553	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Біфеніл-
3,554	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Карбоксифеніл-
3,555	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Хлор-3-піридил-
3,556	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Хлор-феніл-
3,557	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Ціанофеніл-
3,558	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Ціано-феніл-
3,559	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Циклопропілфеніл-
3,560	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Циклопропіл-феніл-
3,561	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Диметиламінофеніл-
3,562	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Фтор-феніл-
3,563	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Гідроксифеніл-
3,564	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Гідрокси-феніл-
3,565	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Метоксикарбонілфеніл-
3,566	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Метил-2-піридил-
3,567	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Метиламінофеніл-
3,568	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Метилсульфонілфеніл-
3,569	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Оксазол-5-ілфеніл-
3,570	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Піридил-
3,571	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-трет-Бутоксифеніл-
3,572	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-трет-Бутилфеніл-
3,573	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Толіл-
3,574	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Трифторметил-3-піридил-
3,575	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Трифторметил-феніл-
3,576	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	5-Метил-1,3,4-оксадіазол-2-іл-

Таблиця 3 (продовження)

№ сполуки	R ¹	R ²	X	D
3,577	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	5-Метил-2-піридил-
3,578	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	5-Метил-3-піридил-
3,579	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	6-Хлор-3-піридил-
3,580	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	6-Метил-2-піридил-
3,581	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	Піримідин-5-іл-
3,582	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	Тіазол-2-іл-
3,583	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	Тіазол-5-іл-
3,584	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	Тіофен-3-іл-
3,585	-Me	-Me	6-F	4-(1-Метилпіразол-3-іл)феніл-
3,586	-Me	-Me	6-F	4-(5-Метилтетразол-1-іл)феніл-
3,587	-Me	-Me	6-F	4-Морфолінофеніл-
3,588	-Me	-Me	6-F	4-(3-Метилпіразол-1-іл)феніл-
3,589	-Me	-Me	6-F	4-(3,5-Диметилпіразол-1-іл)феніл-
3,590	-Me	-Me	6-F	4-Піразол-1-ілфеніл-
3,591	-Me	-Me	6-F	4-Пірол-1-ілфеніл-
3,592	-Me	-Me	6-F	4-(5-Метилтетрагідрофуран-2-іл)феніл-
3,593	-Me	-Me	6-F	4-(5-Метил-2-фурил)феніл-
3,594	-Me	-Me	6-F	4-Оксазол-2-ілфеніл-
3,595	-Me	-Me	6-F	4-(2-Метилтіазол-4-іл)феніл-
3,596	-Me	-Me	6-F	4-(2-Тієніл)феніл-
3,597	-Me	-Me	6-F	4-(1,2,4-Триазол-1-іл)феніл-
3,598	-Me	-Me	6-F	1-Феніл-4-піразоліл-
3,599	-Me	-Me	6-F	1-Циклопропіл-4-піразоліл-
3,600	-Me	-Me	6-F	4-(Метилсульфанілметил)феніл-
3,601	-Me	-Me	6-F	4-(Ізопропілсульфанілметил)феніл-
3,602	-Me	-Me	6-F	4-(Метилсульфамоїл)феніл-
3,603	-Me	-Me	6-F	4-Сульфамоїлфеніл-
3,604	-Me	-Me	6-F	4-Карбамоїлфеніл-
3,605	-Me	-Me	6-Cl	4-(1-Метилпіразол-3-іл)феніл-
3,606	-Me	-Me	6-Cl	4-(5-Метилтетразол-1-іл)феніл-
3,607	-Me	-Me	6-Cl	4-Морфолінофеніл-
3,608	-Me	-Me	6-Cl	4-(3-Метилпіразол-1-іл)феніл-
3,609	-Me	-Me	6-Cl	4-(3,5-Диметилпіразол-1-іл)феніл-
3,610	-Me	-Me	6-Cl	4-Піразол-1-ілфеніл-
3,611	-Me	-Me	6-Cl	4-Пірол-1-ілфеніл-
3,612	-Me	-Me	6-Cl	4-(5-Метилтетрагідрофуран-2-іл)феніл-
3,613	-Me	-Me	6-Cl	4-(5-Метил-2-фурил)феніл-
3,614	-Me	-Me	6-Cl	4-Оксазол-2-ілфеніл-
3,615	-Me	-Me	6-Cl	4-(2-Метилтіазол-4-іл)феніл-
3,616	-Me	-Me	6-Cl	4-(2-Тієніл)феніл-
3,617	-Me	-Me	6-Cl	4-(1,2,4-Триазол-1-іл)феніл-
3,618	-Me	-Me	6-Cl	1-Феніл-4-піразоліл-
3,619	-Me	-Me	6-Cl	1-Циклопропіл-4-піразоліл-
3,620	-Me	-Me	6-Cl	4-(Метилсульфанілметил)феніл-
3,621	-Me	-Me	6-Cl	4-(Ізопропілсульфанілметил)феніл-
3,622	-Me	-Me	6-Cl	4-(Метилсульфамоїл)феніл-
3,623	-Me	-Me	6-Cl	4-Сульфамоїлфеніл-
3,624	-Me	-Me	6-Cl	4-Карбамоїлфеніл-
3,625	-Me	-Cl	6-F	4-(1-Метилпіразол-3-іл)феніл-
3,626	-Me	-Cl	6-F	4-(5-Метилтетразол-1-іл)феніл-
3,627	-Me	-Cl	6-F	4-Морфолінофеніл-
3,628	-Me	-Cl	6-F	4-(3-Метилпіразол-1-іл)феніл-

Таблиця 3 (продовження)

№ сполуки	R ¹	R ²	X	D
3,629	-Me	-Cl	6-F	4-(3,5-Диметилпіразол-1-іл)феніл-
3,630	-Me	-Cl	6-F	4-Піразол-1-ілфеніл-
3,631	-Me	-Cl	6-F	4-Пірол-1-ілфеніл-
3,632	-Me	-Cl	6-F	4-(5-Метилтетрагідрофуран-2-іл)феніл-
3,633	-Me	-Cl	6-F	4-(5-Метил-2-фурил)феніл-
3,634	-Me	-Cl	6-F	4-Оксазол-2-ілфеніл-
3,635	-Me	-Cl	6-F	4-(2-Метилтіазол-4-іл)феніл-
3,636	-Me	-Cl	6-F	4-(2-Тієніл)феніл-
3,637	-Me	-Cl	6-F	4-(1,2,4-Триазол-1-іл)феніл-
3,638	-Me	-Cl	6-F	1-Феніл-4-піразоліл-
3,639	-Me	-Cl	6-F	1-Циклопропіл-4-піразоліл-
3,640	-Me	-Cl	6-F	4-(Метилсульфанілметил)феніл-
3,641	-Me	-Cl	6-F	4-(Ізопропілсульфанілметил)феніл-
3,642	-Me	-Cl	6-F	4-(Метилсульфамоїл)феніл-
3,643	-Me	-Cl	6-F	4-Сульфамоїлфеніл-
3,644	-Me	-Cl	6-F	4-Карбамоїлфеніл-
3,645	-Me	-Cl	6-Cl	4-(1-Метилпіразол-3-іл)феніл-
3,646	-Me	-Cl	6-Cl	4-(5-Метилтетразол-1-іл)феніл-
3,647	-Me	-Cl	6-Cl	4-Морфолінофеніл-
3,648	-Me	-Cl	6-Cl	4-(3-Метилпіразол-1-іл)феніл-
3,649	-Me	-Cl	6-Cl	4-(3,5-Диметилпіразол-1-іл)феніл-
3,650	-Me	-Cl	6-Cl	4-Піразол-1-ілфеніл-
3,651	-Me	-Cl	6-Cl	4-Пірол-1-ілфеніл-
3,652	-Me	-Cl	6-Cl	4-(5-Метилтетрагідрофуран-2-іл)феніл-
3,653	-Me	-Cl	6-Cl	4-(5-Метил-2-фурил)феніл-
3,654	-Me	-Cl	6-Cl	4-Оксазол-2-ілфеніл-
3,655	-Me	-Cl	6-Cl	4-(2-Метилтіазол-4-іл)феніл-
3,656	-Me	-Cl	6-Cl	4-(2-Тієніл)феніл-
3,657	-Me	-Cl	6-Cl	4-(1,2,4-Триазол-1-іл)феніл-
3,658	-Me	-Cl	6-Cl	1-Феніл-4-піразоліл-
3,659	-Me	-Cl	6-Cl	1-Циклопропіл-4-піразоліл-
3,660	-Me	-Cl	6-Cl	4-(Метилсульфанілметил)феніл-
3,661	-Me	-Cl	6-Cl	4-(Ізопропілсульфанілметил)феніл-
3,662	-Me	-Cl	6-Cl	4-(Метилсульфамоїл)феніл-
3,663	-Me	-Cl	6-Cl	4-Сульфамоїлфеніл-
3,664	-Me	-Cl	6-Cl	4-Карбамоїлфеніл-
3,665	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-(1-Метилпіразол-3-іл)феніл-
3,666	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-(5-Метилтетразол-1-іл)феніл-
3,667	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-Морфолінофеніл-
3,668	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-(3-Метилпіразол-1-іл)феніл-
3,669	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-(3,5-Диметилпіразол-1-іл)феніл-
3,670	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-Піразол-1-ілфеніл-
3,671	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-Пірол-1-ілфеніл-
3,672	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-(5-Метилтетрагідрофуран-2-іл)феніл-
3,673	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-(5-Метил-2-фурил)феніл-
3,674	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-Оксазол-2-ілфеніл-
3,675	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-(2-Метилтіазол-4-іл)феніл-
3,676	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-(2-Тієніл)феніл-
3,677	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-(1,2,4-Триазол-1-іл)феніл-
3,678	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	1-Феніл-4-піразоліл-
3,679	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	1-Циклопропіл-4-піразоліл-

Таблиця 3 (продовження)

№ сполуки	R ¹	R ²	X	D
3,680	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-(Метилсульфанілметил)феніл-
3,681	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-(Ізопропілсульфанілметил)феніл-
3,682	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-(Метилсульфамоїл)феніл-
3,683	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-Сульфамоїлфеніл-
3,684	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-Карбамоїлфеніл-
3,685	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(1-Метилпіразол-3-іл)феніл-
3,686	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(5-Метилтетразол-1-іл)феніл-
3,687	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-Морфолінофеніл-
3,688	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(3-Метилпіразол-1-іл)феніл-
3,689	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(3,5-Диметилпіразол-1-іл)феніл-
3,690	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-Піразол-1-ілфеніл-
3,691	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-Пірол-1-ілфеніл-
3,692	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(5-Метилтетрагідрофуран-2-іл)феніл-
3,693	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(5-Метил-2-фурил)феніл-
3,694	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-Оксазол-2-ілфеніл-
3,695	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(2-Метилтіазол-4-іл)феніл-
3,696	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(2-Тієніл)феніл-
3,697	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(1,2,4-Триазол-1-іл)феніл-
3,698	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	1-Феніл-4-піразоліл-
3,699	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	1-Циклопропіл-4-піразоліл-
3,700	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(Метилсульфанілметил)феніл-
3,701	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(Ізопропілсульфанілметил)феніл-
3,702	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(Метилсульфамоїл)феніл-
3,703	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-Сульфамоїлфеніл-
3,704	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-Карбамоїлфеніл-
3,705	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-(1-Метилпіразол-3-іл)феніл-
3,706	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-(5-Метилтетразол-1-іл)феніл-
3,707	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-Морфолінофеніл-
3,708	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-(3-Метилпіразол-1-іл)феніл-
3,709	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-(3,5-Диметилпіразол-1-іл)феніл-
3,710	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-Піразол-1-ілфеніл-
3,711	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-Пірол-1-ілфеніл-
3,712	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-(5-Метилтетрагідрофуран-2-іл)феніл-
3,713	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-(5-Метил-2-фурил)феніл-
3,714	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-Оксазол-2-ілфеніл-
3,715	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-(2-Метилтіазол-4-іл)феніл-
3,716	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-(2-Тієніл)феніл-
3,717	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-(1,2,4-Триазол-1-іл)феніл-
3,718	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	1-Феніл-4-піразоліл-
3,719	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	1-Циклопропіл-4-піразоліл-
3,720	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-(Метилсульфанілметил)феніл-
3,721	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-(Ізопропілсульфанілметил)феніл-
3,722	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-(Метилсульфамоїл)феніл-
3,723	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-Сульфамоїлфеніл-
3,724	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-Карбамоїлфеніл-
3,725	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(1-Метилпіразол-3-іл)феніл-
3,726	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(5-Метилтетразол-1-іл)феніл-
3,727	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Морфолінофеніл-
3,728	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(3-Метилпіразол-1-іл)феніл-
3,729	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(3,5-Диметилпіразол-1-іл)феніл-
3,730	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Піразол-1-ілфеніл-
3,731	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Пірол-1-ілфеніл-

Таблиця 3 (продовження)

№ сполуки	R ¹	R ²	X	D
3,732	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(5-Метилтетрагідрофуран-2-іл)феніл-
3,733	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(5-Метил-2-фурил)феніл-
3,734	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Оксазол-2-ілфеніл-
3,735	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(2-Метилтіазол-4-іл)феніл-
3,736	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(2-Тієніл)феніл-
3,737	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(1,2,4-Триазол-1-іл)феніл-
3,738	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	1-Феніл-4-піразоліл-
3,739	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	1-Циклопропіл-4-піразоліл-
3,740	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(Метилсульфанілметил)феніл-
3,741	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(Ізопропілсульфанілметил)феніл-
3,742	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(Метилсульфамойл)феніл-
3,743	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Сульфамойлфеніл-
3,744	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-Карбамоїлфеніл-

У таблиці C-2 наведено 744 сполуки від C-2.001 до C-2.744 формули (I), де G являє собою -H, W являє собою (E)-CH=CH-, Y являє собою 3-циклопропіл, і R¹, R², X, Y і D є такими, як визначено для сполук № 3.001 - 3.744 відповідно в таблиці 3 вище.

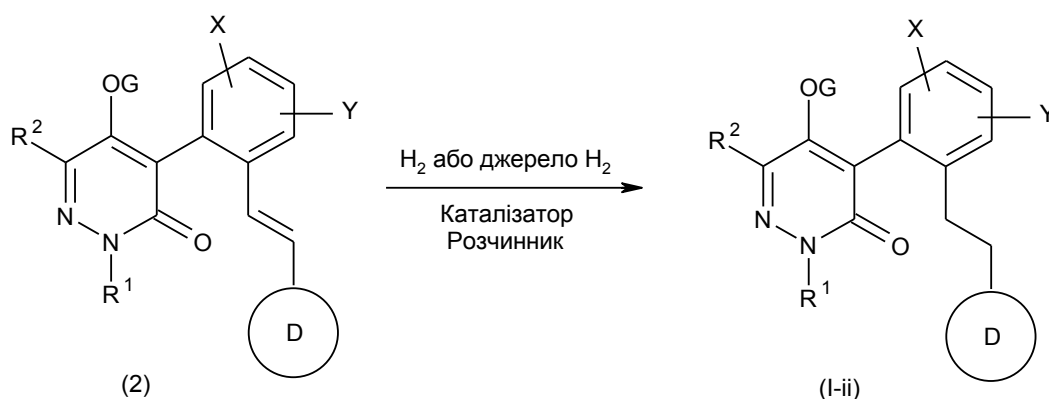
У таблиці C-3 наведено 744 сполуки від C-3.001 до C-3.744 формули (I), де G являє собою -(C=O)iPr, W являє собою -CH₂-CH₂-, Y являє собою 3-циклопропіл, і R¹, R², X і D є такими, як визначено для сполук № 3.001 - 3.744 відповідно в таблиці 3 вище.

У таблиці C-4 наведено 744 сполуки від C-4.001 до C-4.744 формули (I), де G являє собою -(C=O)iPr, W являє собою (E)-CH=CH-, Y являє собою 3-циклопропіл, і R¹, R², X і D є такими, як визначено для сполук № 3.001 - 3.744 відповідно в таблиці 3 вище.

Сполуки за даним винаходом можна одержувати згідно з наступними схемами, на яких замісники R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁴, R¹⁵, R¹⁶, W, D, Dr, G, X, Y, і m мають (якщо явно не вказано інше) визначення, описані в даному документі вище.

Деякі сполуки (I-ii) за даним винаходом можна одержувати зі сполук (2), як показано на схемі реакції 1. Сполуки (I-ii) являють собою сполуки формули (I), в яких W являє собою -CH₂-CH₂-.

Схема реакції 1



Сполуки (I-ii) можна одержувати шляхом каталітичної гідрогенізації сполук (2) за допомогою газоподібного водню в придатному розчиннику [такому як тетрагідрофуран, метанол, етанол, оцтова кислота або етилацетат] у присутності придатного каталізатора [такого як Pd/C, Pd/CaCO₃, Rh/Al₂CO₃ або губчастий нікель] за температури від -10 до 100°C.

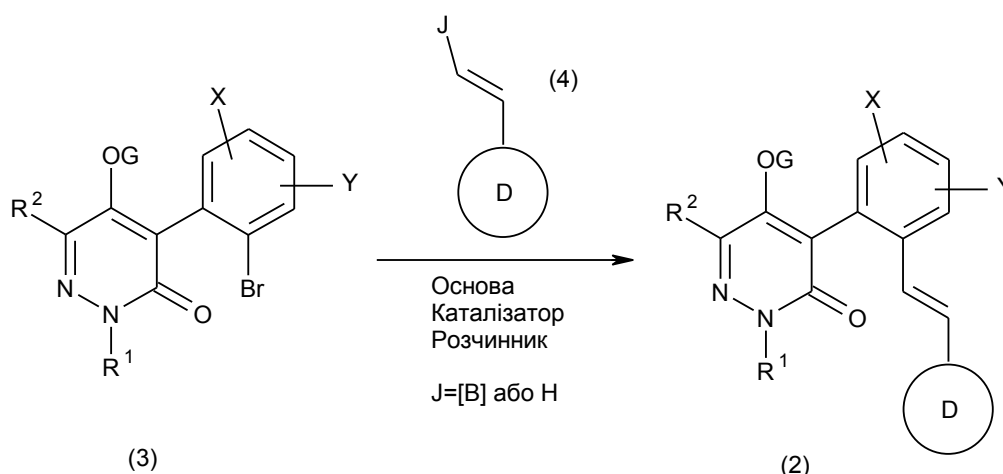
Альтернативно сполуки (I-ii) також можна одержувати шляхом каталітичної трансферної гідрогенізації сполук (2) шляхом обробки за допомогою придатного джерела водню у придатному розчиннику у присутності придатного каталізатора за температури від -10 до 100°C. Прикладами придатних систем є тетрагідроксибор у сумішах дихлорметан/вода або дихлорметан/метанол у присутності Pd/C, Pd(OAc)₂ або Pd(OH)₂/C (J. Am. Chem. Soc., 2016, 138, 6107-6110) або діетил-1,4-дигідро-2,6-диметил-3,5-піридиндикарбоксилат в етанолі у присутності Pd/C (Tetrahedron Letters, 2009, 50, 1026).

Сполуки (2) можна одержувати зі сполук (3) і сполук (4), як показано на схемі реакції 2, згідно або з протоколом реакції Сузукі, або з протоколом реакції Хека, описаними нижче. У разі використання протоколу реакції Сузукі сполуки (4) являють собою борорганічні сполуки, такі як боронові кислоти, боронові естери або солі, які являють собою трифторборат калію. У разі

використання протоколу реакції Хека сполуки (4) являють собою стиролі.
Альтернативно сполуки (1-ii) також можна одержувати шляхом відновлення за допомогою діїміду, одержаного in-situ з придатного попередника у придатному розчиннику за температури від -10 до 200°C. Приклади придатних реагентів для одержання діїміду включають заміщені арилсульфонілгідрозиди, такі як 2,4,6-триізопропілбензолсульфонілгідрозид, необов'язково у

присутності придатної основи. Приклади придатних основ включають триетиламін, діізопропілетиламін, карбонат калію та карбонат натрію. Придатні розчинники включають тетрагідрофуран, 1,4-діоксан, етилацетат, ацетонітрил і диметилформамід.

Схема реакції 2



Протокол реакції Сузукі

Сполуки (2) можна одержувати шляхом обробки сполук (3) за допомогою сполук (4) у присутності придатної основи та придатного каталізатора в придатному розчиннику за температури від 10 до 150°C. Приклади придатних основ включають карбонат калію, фосфат калію, карбонат натрію, бікарбонат натрію та фторид калію. Приклади придатних каталізаторів включають комплекс 1,1'-біс(дифенілфосфіно)фероцен]дихлорпаладію(II) та дихлорметану [PdCl₂(dppf)·DCM], тетракіс(трифенілфосфін)паладій(0) [Pd(PPh₃)₄] і каталітичну систему, утворену in situ із суміші ацетату паладію(II) та трифенілфосфіну. Приклади придатних розчинників включають воду, 1,4-діоксан, тетрагідрофуран, ацетонітрил і толуол. Багато сполук (4) є комерційно доступними [наприклад, транс-2-(4-біфеніл)вінілборонова кислота] або можуть бути одержані за допомогою відомих способів. Прикладами сполук (3), що характеризуються особливою застосовністю в протоколі реакції Сузукі, є ізобутирилові естери (3-і), де G являє собою ізобутирил.

Фахівцю в даній галузі буде зрозуміло, що умови протоколу реакції Сузукі можуть забезпечувати розщеплення естерних груп, отже, схема реакції 2 також може описувати реакцію, де вихідний матеріал (3) містить естерний фрагмент [так що G являє собою ацильну групу], але продукт (2) не містить [так що G являє собою водень].

Протокол реакції Хека

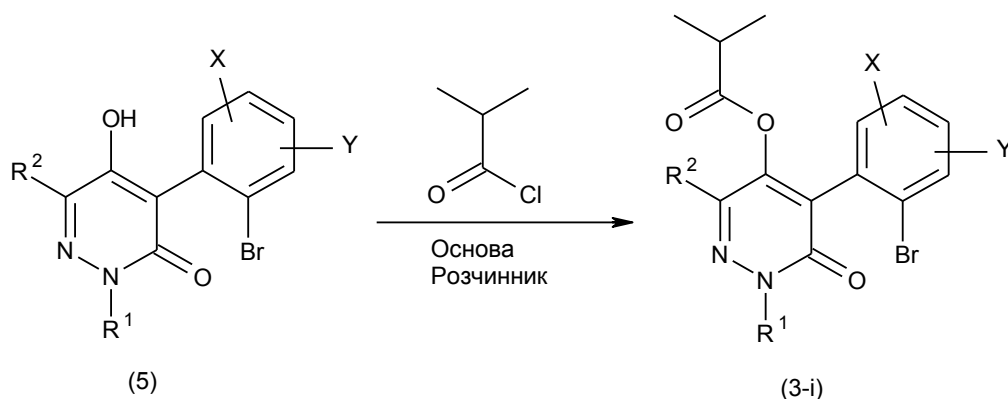
Сполуки (2) можна одержувати шляхом обробки сполук (3) за допомогою сполук (4) у присутності придатної основи та придатного каталізатора за температури від 10 до 150°C. Необов'язково може бути включений додатковий розчинник. Приклади придатних основ включають триетиламін, морфолін, N-метилморфолін, діізопропілетиламін і піридин. Приклади придатних каталізаторів включають тетракіс(трифенілфосфін)паладій(0) [Pd(PPh₃)₄], каталітичну систему, утворену in situ із суміші ацетату паладію(II) і трифенілфосфіну, каталітичну систему, утворену in situ із суміші трис(дифенілденацетон)дипаладію(0) і тетрафторборату три-трет-бутилфосфонію, і каталітичну систему, утворену in situ з паладієвоциклічного передкаталізатора, такого як хлор[(три-трет-бутилфосфін)-2-(2-амінобіфеніл)]паладій(II). Приклади необов'язкового додаткового розчинника включають 1,4-діоксан, тетрагідрофуран, ацетонітрил і толуол. Багато сполук (4) є комерційно доступними [такі як 4-ціаностирол] або можуть бути одержані за допомогою відомих способів. Приклади сполук

(3), що характеризуються особливою застосовністю в протоколі реакції Хека, являють собою ізобутирилові естери (3-і), де G являє собою ізобутирил.

Сполуки (3-і) можна одержувати зі сполук (5), як показано на схемі реакції 3.

Схема реакції 3

5

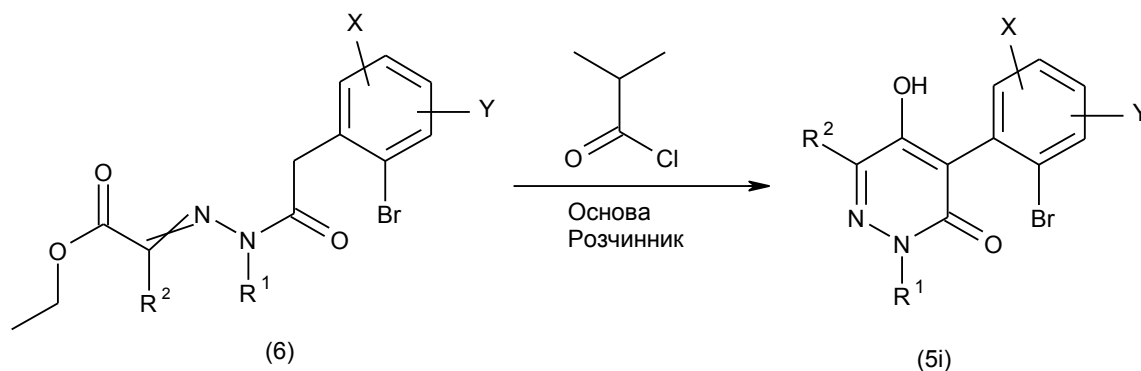


Сполуки (3-і) можна одержувати шляхом обробки сполук (5) за допомогою ізобутирилхлориду в придатному розчиннику [такому як дихлорметан, ацетонітрил або толуол] у присутності придатної основи [такої як триетиламін, діізопропілетиламін або піридин] за температури від -10 до 60°C. Необов'язково може бути включений каталізатор [такий як 4-(диметиламіно)піридин].

Сполуки (5) можна одержувати зі сполук (6), як показано на схемі реакції 4, шляхом нагрівання сполук (6) з основою (такою як 1,8-діазабіцикло[5.4.0]ундец-7-ен, гексаметилдисилазид натрію або гексаметилдисилазид літію) у розчиннику [такому як ацетонітрил, N, N-диметилформамід або толуол] за температури від 50 до 200°C. Може застосовуватися традиційне нагрівання або нагрівання за допомогою мікрохвильового випромінювання.

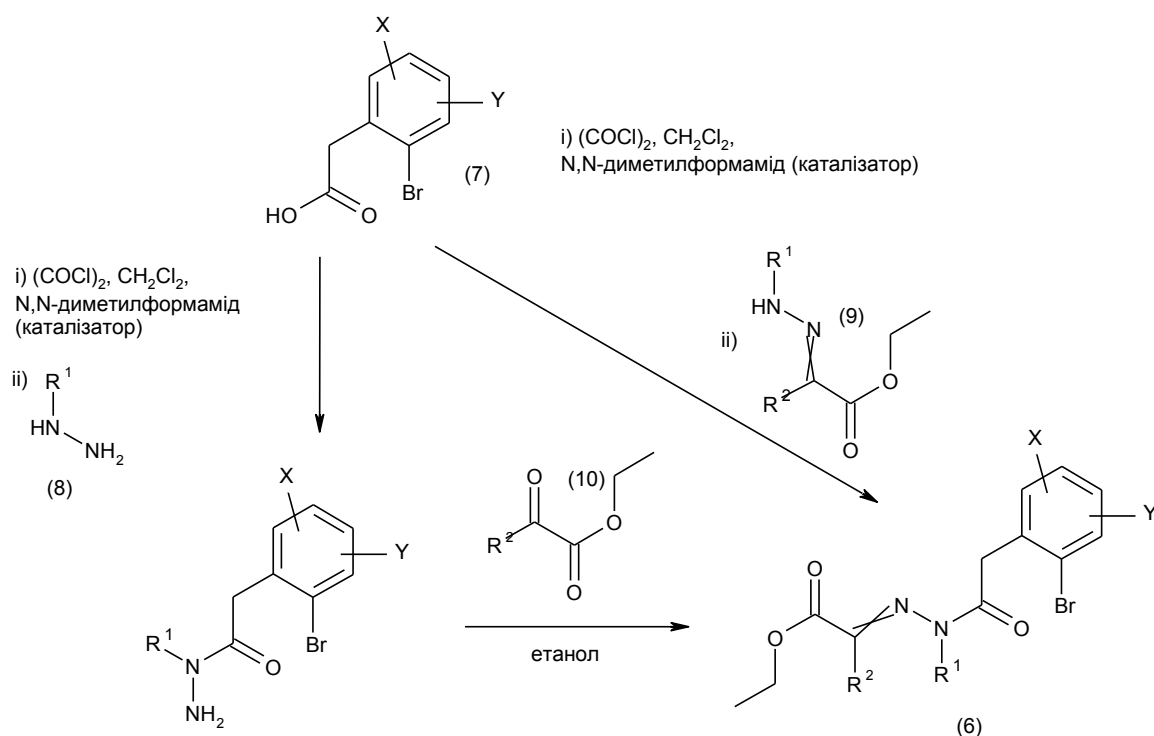
Схема реакції 4

20



Сполуки (6) можна одержувати з фенілоцтових кислот (7), як показано на схемі реакції 5.

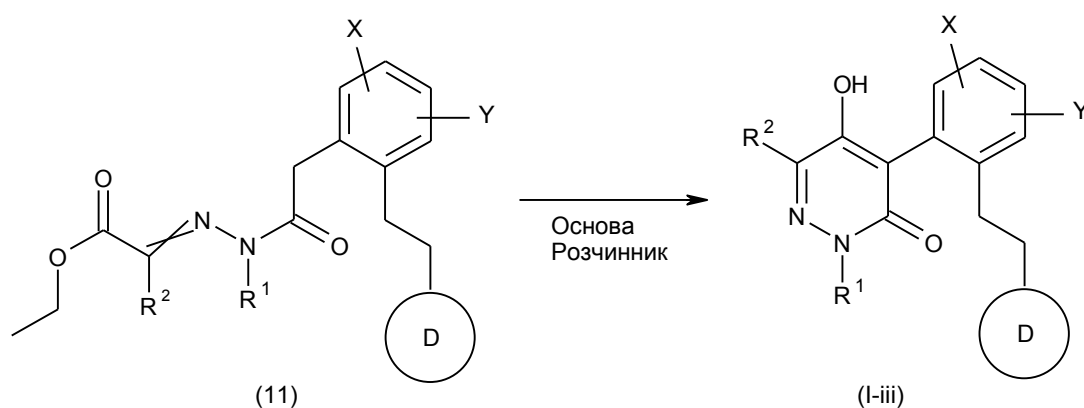
Схема реакції 5



- 5 Щодо схеми реакції 5 приклад гідразину (8) являє собою метилгідразин, і приклад кетоестерів (10) являє собою етилпіруват. Приклад гідразону (9) являє собою етил(2E/Z)-2-(метилгідразоно)пропаноат, одержаний згідно зі способами, описаними в заявці на патент згідно з РСТ № WO 2016/008816. Приклад фенілоцтової кислоти (7) являє собою (2-бром-6-фторфеніл)оцтову кислоту, яка може бути синтезована згідно зі схемою реакції 10. Додатковий
- 10 приклад фенілоцтової кислоти (7) являє собою (2-бром-3-хлор-6-фторфеніл)оцтову кислоту, яка може бути синтезована згідно зі схемою реакції 11.

Деякі сполуки (I-iii) за даним винаходом можна одержувати зі сполук (11), як показано на схемі реакції 6, або зі сполук (I-iv), як показано на схемі реакції 12. Сполуки (I-iii) являють собою сполуки формули (I), в яких W являє собою $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$, і G являє собою водень.

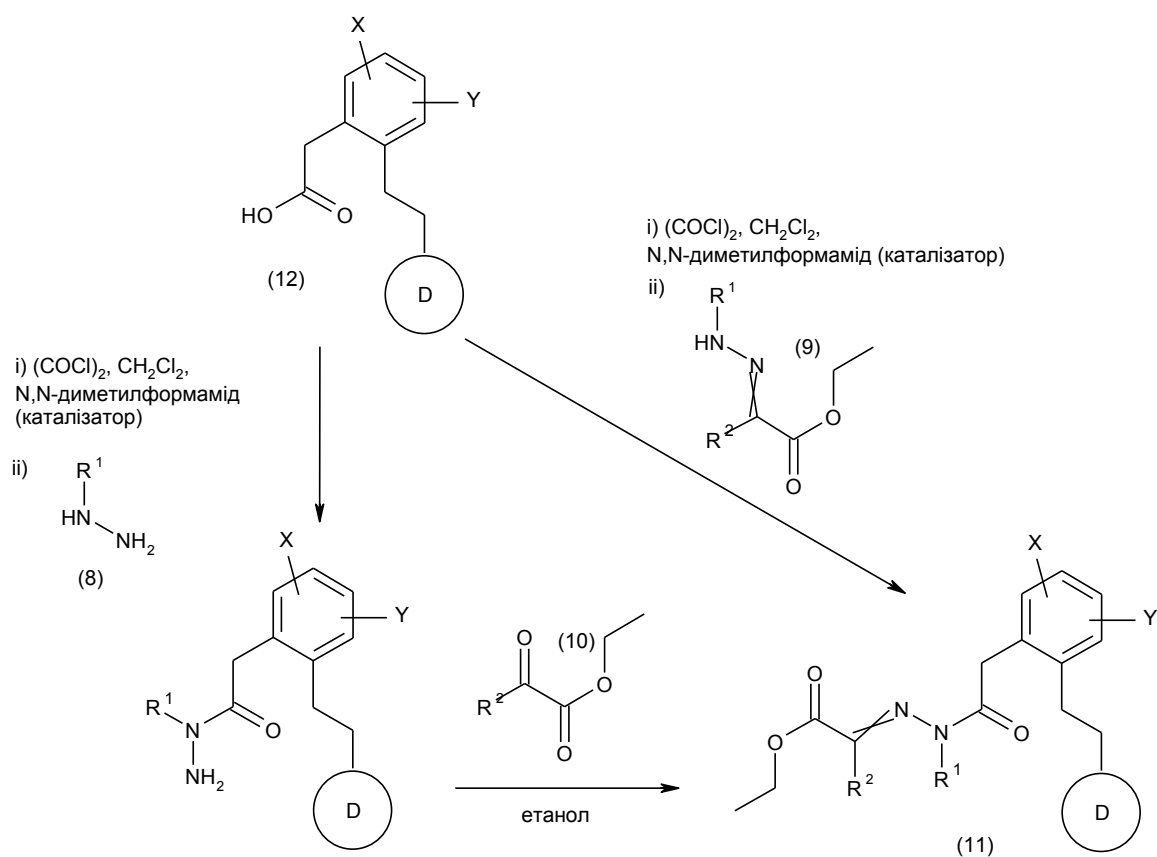
Схема реакції 6



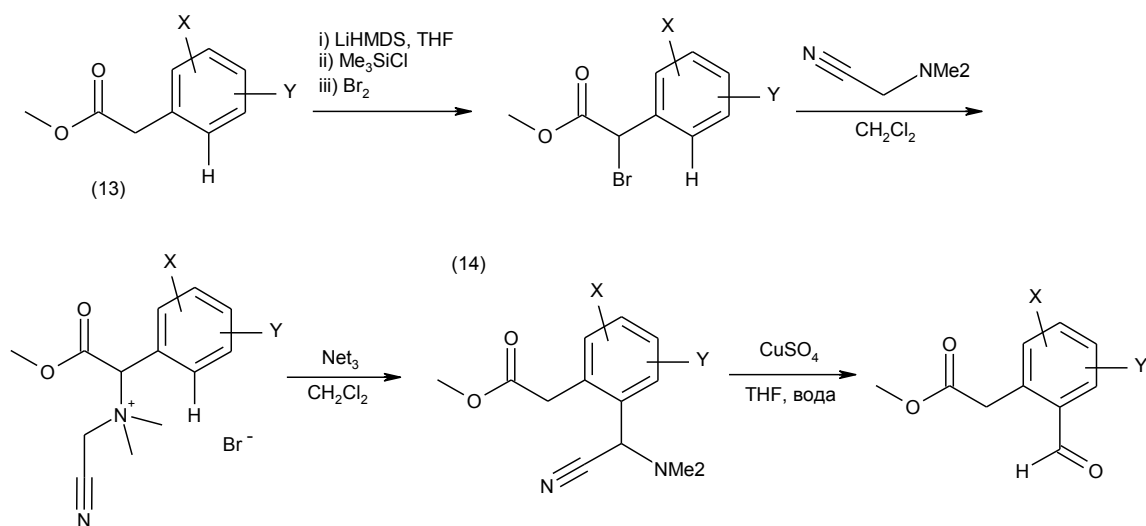
- 20 Сполуки (I-iii) можна одержувати шляхом нагрівання сполук (11) з основою (такою як 1,8-діазабіцикло[5.4.0]ундец-7-ен, гексаметилдисилазид натрію або гексаметилдисилазид літію) в розчиннику [такому як ацетонітрил, N, N-диметилформамід або толуол] за температури від 50 до 200°C. Може застосовуватися традиційне нагрівання або нагрівання за допомогою мікрохвильового випромінювання.

Сполуки (11) можна одержувати зі сполук (12), як показано на схемі реакції 7 нижче.

Схема реакції 7



- 5 Сполуки (12) можна одержувати зі сполук (13), як показано на схемі реакції 8. Багато сполук (13) є комерційно доступними [такі як метил-2-фенілацетат та метил-2-(2-фторфеніл)ацетат]. Щодо схеми реакції 8 фосфорани (15) можуть бути одержані згідно зі схемою реакції 9.



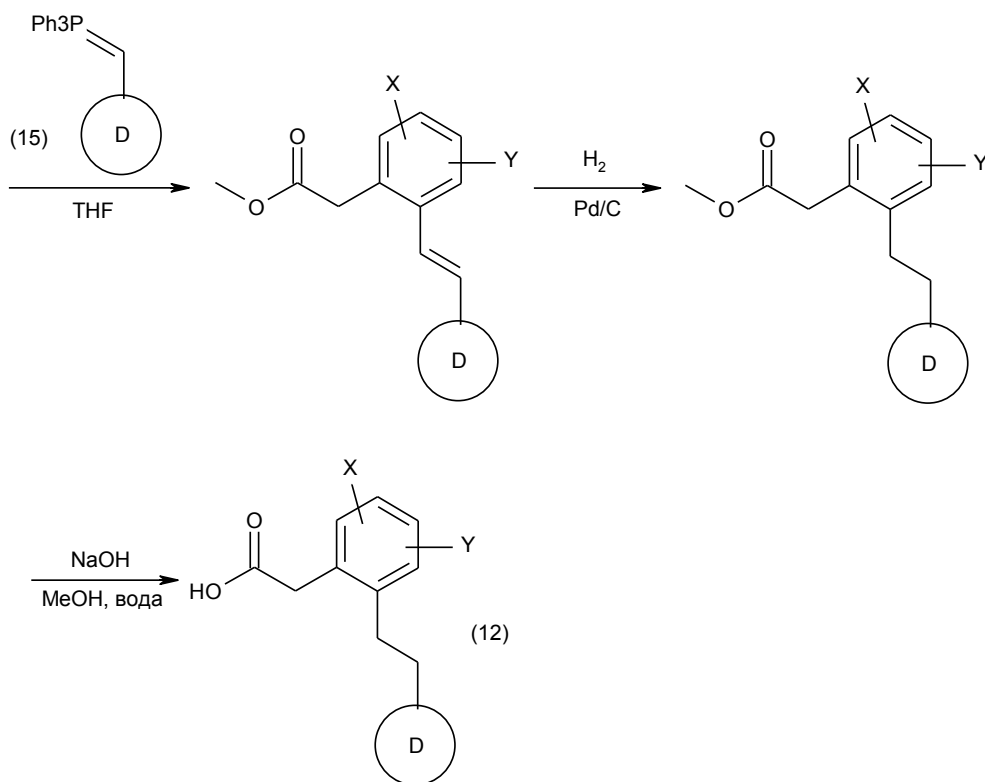
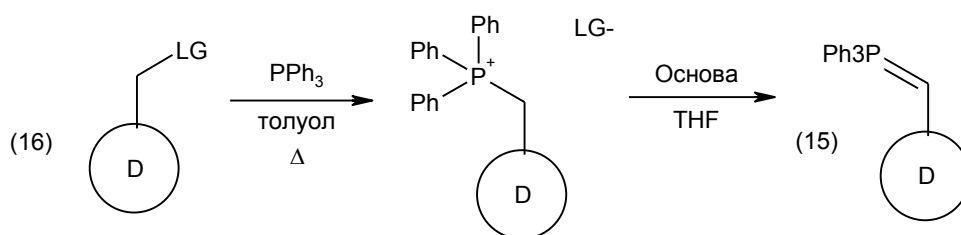


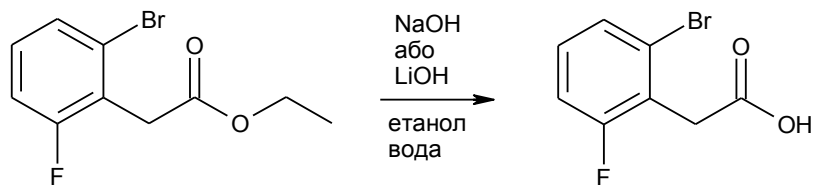
Схема реакції 9

5



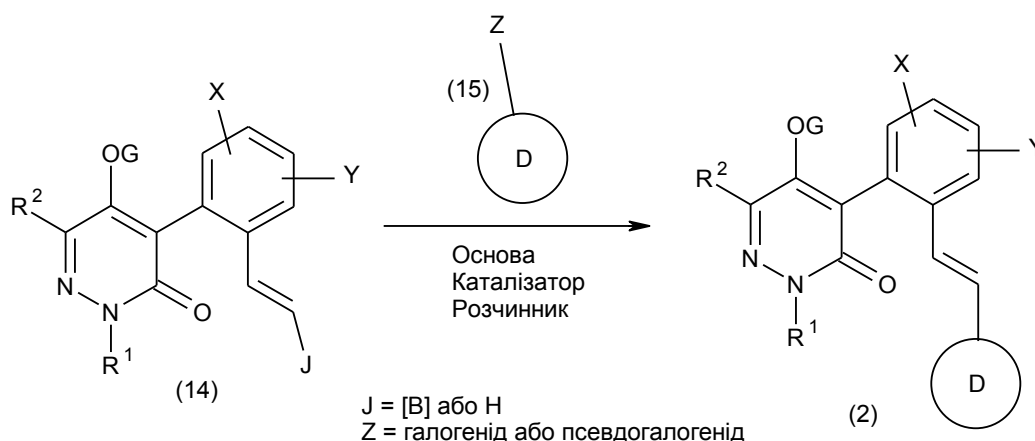
Щодо схеми реакції 9 приклади придатних основ являють собою гідрид натрію, гексаметилдисилазид натрію та трет-бутоксид калію. Сполуки (16) являють собою електрофіли, де LG являє собою групу, що відходить [таку як хлорид, бромід, йодид, тозилат або мезилат]. Багато сполук (16) є комерційно доступними [такі як 4-хлорбензилбромід або 2-хлор-5-хлорметилтіазол].

Схема реакції 10



Щодо схеми реакції 10 етиловий естер (2-бром-6-фторфеніл)оцтової кислоти можна одержувати, як описано в Lundgren et al. JACS 2016, 138, 13826-13829.

Схема реакції 13



5 Протокол реакції Сузукі

Сполуки (2) можна одержувати шляхом обробки сполук (14) за допомогою сполук (15) у присутності придатної основи та придатного каталізатора в придатному розчиннику за температури від 10 до 150°C. Приклади придатних основ включають карбонат калію, фосфат калію, карбонат натрію, бікарбонат натрію та фторид калію. Приклади придатних каталізаторів включають комплекс 1,1'-біс(дифенілфосфіно)фероцен]дихлорпаладію(II) та дихлорметану [PdCl₂(dppf)·DCM], тетракіс(трифенілфосфін)паладій(0) [Pd(PPh₃)₄] і каталітичну систему, утворену in situ із суміші ацетату паладію(II) та трифенілфосфіну. Приклади придатних розчинників включають воду, 1,4-діоксан, тетрагідрофуран, ацетонітрил і толуол. Багато сполук (15) є комерційно доступними або можуть бути одержані за допомогою відомих способів. Прикладами сполук (14), що характеризуються особливою застосовністю в протоколі реакції Сузукі, є ізобутирилові естери (14-i), де G являє собою ізобутирил.

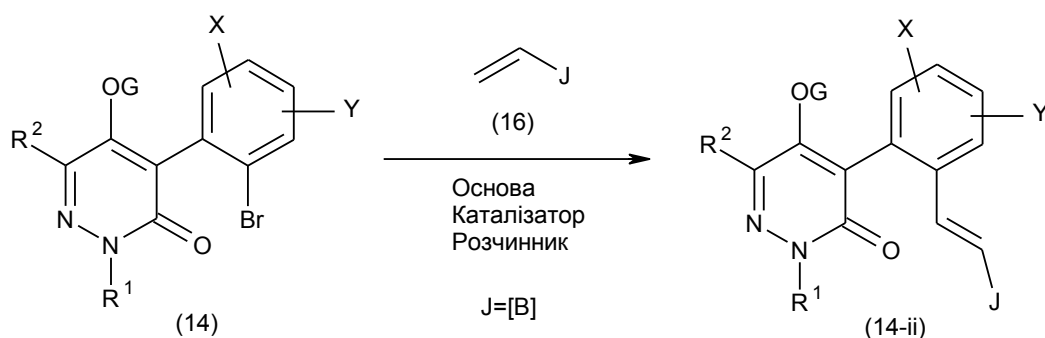
Фахівцю в даній галузі буде зрозуміло, що умови протоколу реакції Сузукі можуть забезпечувати розщеплення естерних груп, отже, схема реакції 13 також може описувати реакцію, де вихідний матеріал (14) містить естерний фрагмент [так що G являє собою ацильну групу], але продукт (2) не містить [так що G являє собою водень].

Протокол реакції Хека

Сполуки (2) можна одержувати шляхом обробки сполук (14) за допомогою сполук (15) у присутності придатної основи та придатного каталізатора за температури від 10 до 150°C. Необов'язково може бути включений додатковий розчинник. Приклади придатних основ включають триетиламін, морфолін, N-метилморфолін, діізопропілетиламін і піридин. Приклади придатних каталізаторів включають тетракіс(трифенілфосфін)паладій(0) [Pd(PPh₃)₄], каталітичну систему, утворену in-situ із суміші ацетату паладію(II) і трифенілфосфіну, каталітичну систему, утворену in-situ із суміші трис(добензиліденацетон)дипаладію(0) і тетрафторборату три-трет-бутилфосфонію, і каталітичну систему, утворену in-situ з паладієвоциклічного передкаталізатора, такого як хлор[(три-трет-бутилфосфін)-2-(2-амінобіфеніл)]паладій(II). Приклади необов'язкового додаткового розчинника включають 1,4-діоксан, тетрагідрофуран, ацетонітрил і толуол. Багато сполук (15) є комерційно доступними або можуть бути одержані за допомогою відомих способів. Приклади сполук (14), що характеризуються особливою застосовністю в протоколі реакції Хека, являють собою ізобутирилові естери (14-i), де G являє собою ізобутирил.

Сполуки (14-ii), де J являє собою борорганічну сполуку, таку як бороновий естер, можна одержувати зі сполук (3) та сполук (16), як показано на схемі реакції 14.

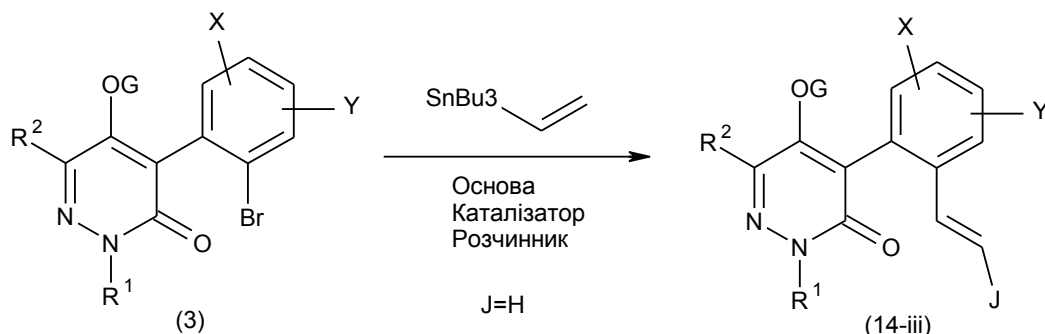
Схема реакції 14



Сполуки (14-ii) можна одержувати шляхом обробки сполук (3) за допомогою сполук (16) у присутності придатної основи та придатного каталізатора за температури від 10 до 150°C. Необов'язково може бути включений додатковий розчинник. Приклади придатних основ включають триетиламін, морфолін, N-метилморфолін, діізопропілетиламін і піридин. Приклади придатних каталізаторів являють собою тетракіс(трифенілфосфін)паладій(0) $[\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4]$, каталітичну систему, утворену *in situ* із суміші ацетату паладію(II) та трифенілфосфіну, і каталітичну систему, утворену *in situ* із суміші трис(добензиліденацетон)дипаладію(0) та тетрафторборату три-трет-бутилфосфонію. Приклади необов'язкового додаткового розчинника включають 1,4-діоксан, тетрагідрофуран, ацетонітрил і толуол. Багато сполук (16) є комерційно доступними, такі як MIDA-естер вінілборонової кислоти або пінаколовий естер вінілборонової кислоти, або можуть бути одержані за допомогою відомих способів. Приклади сполук (3), що характеризуються особливою застосовністю в протоколі реакції Хека, являють собою ізобутирилові естери (3-i), де G являє собою ізобутирил.

Сполуки (14-iii), де J являє собою водень, можна одержувати зі сполук (3), як показано на схемі реакції 15.

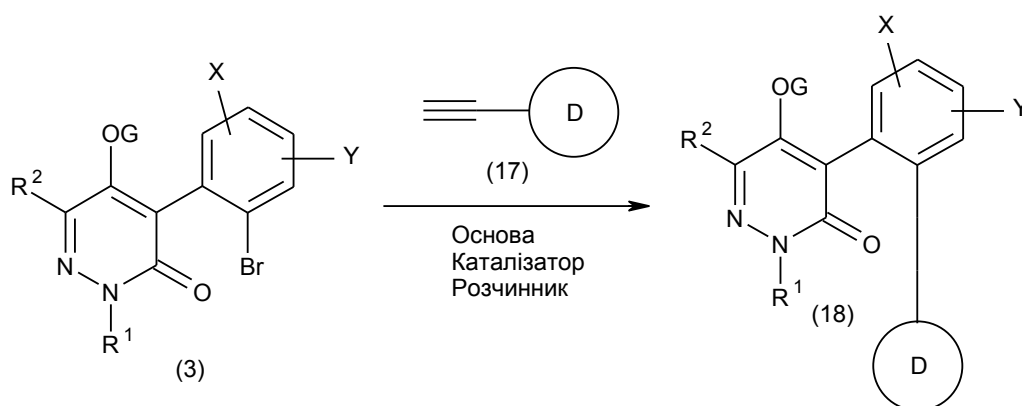
Схема реакції 15



Сполуки (14-iii) можна одержувати шляхом обробки сполук (3) за допомогою трибутил(вініл)станану необов'язково в присутності придатної основи, у присутності придатного каталізатора за температури від 10 до 150°C у придатному розчиннику. Приклади необов'язкових основ включають триетиламін, морфолін, N-метилморфолін, діізопропілетиламін і піридин. Приклади придатних каталізаторів включають комплекс 1,1'-біс(дифенілфосфіно)фероцен]дихлорпаладію(II) та дихлорметану $[\text{PdCl}_2(\text{dppf})\cdot\text{DCM}]$, тетракіс(трифенілфосфін)паладій(0) $[\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4]$, каталітичну систему, утворену *in situ* із суміші ацетату паладію(II) та трифенілфосфіну, каталітичну систему, утворену *in situ* із суміші трис(добензиліденацетон)дипаладію(0) та три-трет-бутилфосфонію тетрафторборату, і каталітичну систему, утворену *in situ* із паладієвоциклічного передкаталізатора, такого як хлор[(три-трет-бутилфосфін)-2-(2-амінобіфеніл)]паладій(II). Приклади придатних розчинників включають 1,4-діоксан, тетрагідрофуран, ацетонітрил і толуол. Приклади сполук (3), що характеризуються особливою застосовністю, являють собою ізобутирилові естери (3-i), де G являє собою ізобутирил.

Сполуки (18) можна одержувати зі сполук (3) за допомогою реакції Соногашири, як показано на схемі реакції 16.

Схема реакції 16

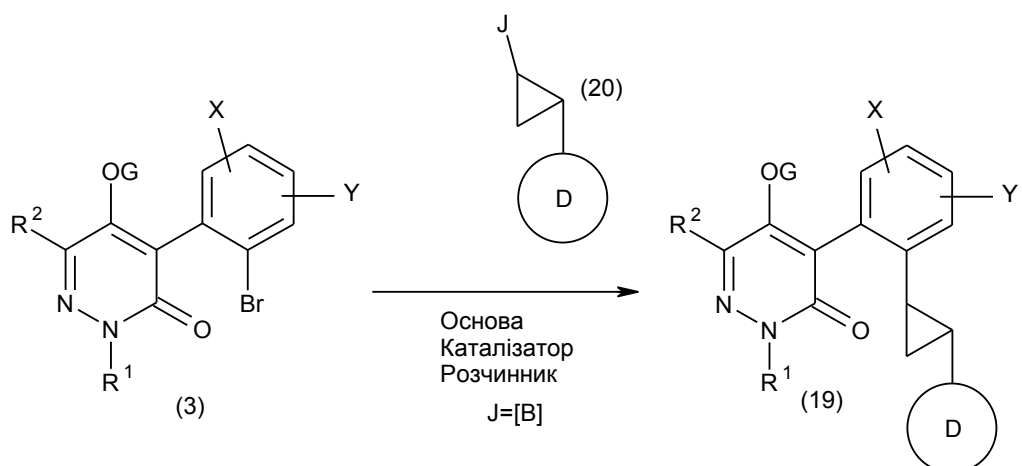


- 5 Сполуки (18) можна одержувати шляхом обробки сполук (3) за допомогою сполук (17) у присутності придатної основи та придатного(-их) каталізатора(-ів) за температури від 10 до 150°C. Необов'язково може бути доданий додатковий розчинник. Приклади придатних основ включають триетиламін, морфолін, N-метилморфолін, діізопропіламін, діізопропілетиламін і піридин. Приклади придатних каталізаторів включають дихлорид
- 10 біс(трифенілфосфін)паладію(II) [Pd(PPh₃)Cl₂], каталітичну систему, утворену in situ із суміші ацетату паладію(II) та трифенілфосфіну, каталітичну систему, утворену in situ із суміші трис(добензиліденацетон)дипаладію(0) та тетрафторборату три-трет-бутилфосфонію, і каталітичну систему, утворену in situ із паладієвоциклічного передкаталізатора, такого як
- 15 хлор[(три-трет-бутилфосфін)-2-(2-амінобіфеніл)]паладій(II). Необов'язково також можуть бути додані мідні каталізатори, такі як йодид міді(I). Прикладами придатних додаткових розчинників є 1,4-діоксан, тетрагідрофуран, ацетонітрил, толуол і N, N-диметилформамід. Приклади сполук (3), що характеризуються особливою застосовністю, являють собою ізобутирилові естери (3-і), де G являє собою ізобутирил.

20 Фахівцю в даній галузі буде зрозуміло, що умови реакції Соногашири можуть забезпечувати розщеплення естерних груп, отже, схема реакції 16 також може описувати реакцію, де вихідний матеріал (3) містить естерний фрагмент [так що G являє собою ацильну групу], але продукт (18) не містить [так що G являє собою водень].

25 Сполуки (19) можна одержувати зі сполук (3) та сполук (20), як показано на схемі реакції 17, за допомогою реакції Сузукі, де сполука (20) являє собою придатні борорганічні сполуки, такі як борна кислота, боронатний естер або сіль, що являє собою трифторборат калію.

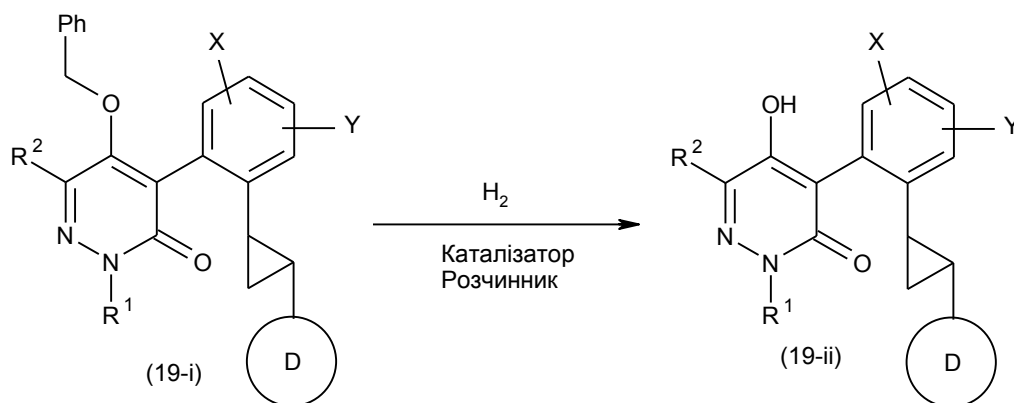
Схема реакції 17



- 30 Сполуки (19) можна одержувати шляхом обробки сполук (3) за допомогою сполук (20) у присутності придатної основи та придатного каталізатора в придатному розчиннику за температури від 10 до 150°C. Приклади придатних основ включають карбонат калію, фосфат калію, карбонат натрію, бікарбонат натрію та фторид калію. Приклади придатних каталізаторів включають комплекс 1,1'-біс(дифенілфосфіно)фероцен]дихлорпаладію(II) та дихлорметану

[PdCl₂(dppf)·DCM], каталітичну систему, утворену in situ із суміші трис(добензиліденацетон)дипаладію(0) та тетрафторборату три-трет-бутилфосфонію, каталітичну систему, утворену in situ із суміші трис(добензиліденацетон)дипаладію(0) та трициклогексилфосфіну, каталітичну систему, утворену in situ із паладієвоциклічного передкаталізатора, такого як хлор[(три-трет-бутилфосфін)-2-(2-амінобіфеніл)]паладій(II), і каталітичну систему, утворену in situ із паладієвоциклічного передкаталізатора, такого як хлор[(трициклогексилфосфін)-2-(2'-амінобіфеніл)]паладій(II). Приклади придатних розчинників включають воду, 1,4-діоксан, тетрагідрофуран, ацетонітрил і толуол. Деякі сполуки (20) є комерційно доступними [наприклад, 4,4,5,5-тетраметил-2-(2-фенілциклопропіл)-[1,3,2]діоксаборолан] або можуть бути одержані за допомогою відомих способів (див., наприклад, способи, описані в Org. Process Res. Dev. 2012, 16, 87-95). Приклади сполук (3), що характеризуються особливою застосовністю в реакції Сузукі, являють собою бензилові естери (3-ii), де G являє собою бензил.

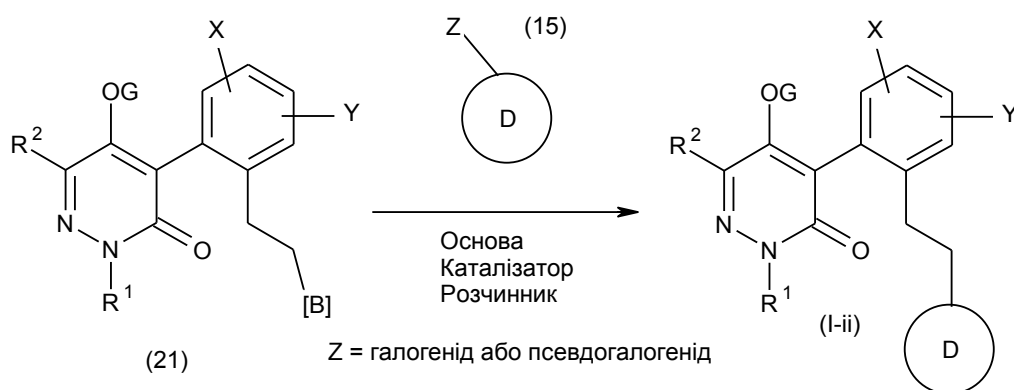
Схема реакції 18



Сполуки (19-ii) можна одержувати шляхом каталітичної гідрогенізації сполук (19-i) за допомогою газоподібного водню в придатному розчиннику [такому як тетрагідрофуран, метанол, етанол, оцтова кислота або етилацетат] у присутності придатного каталізатора [такого як Pd/C, Pd/CaCO₃, Rh/Al₂CO₃ або губчастий нікель] за температури від -10 до 100°C.

Деякі сполуки (1-ii) за даним винаходом можна одержувати зі сполук (21), як показано на схемі реакції 19. Сполуки (1-ii) являють собою сполуки формули (I), в яких W являє собою -CH₂-CH₂-.

Схема реакції 19



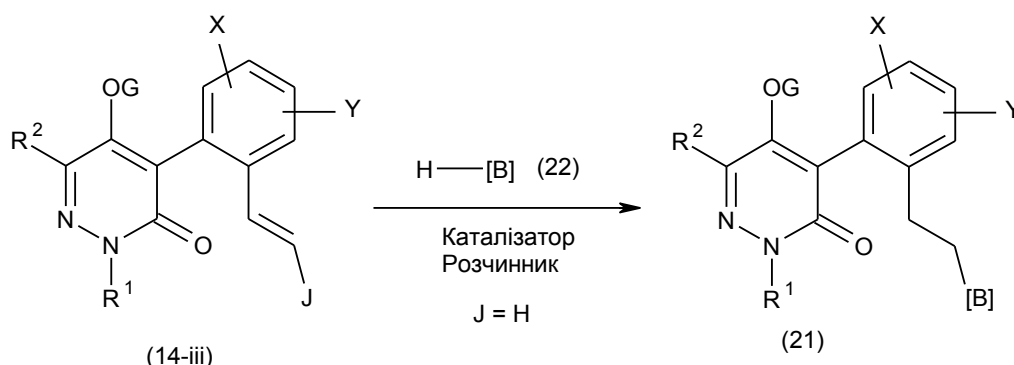
Сполуки (1-ii) можуть бути одержані шляхом обробки сполук (21), де [B] може являти собою триалкілборан, алкілборонову кислоту, естер алкілборонової кислоти або сіль алкілу і трифторборату калію, за допомогою сполук (15) у присутності придатної основи і придатного каталізатора в придатному розчиннику за температури в діапазоні від 10 до 150°C. Приклади придатних основ включають карбонат калію, фосфат калію, карбонат натрію, карбонат цезію, бікарбонат натрію і фторид калію. Приклади придатних каталізаторів включають комплекс 1,1'-біс(дифенілфосфіно)фероцен]-дихлорпаладію(II) і дихлорметану [PdCl₂(dppf)·DCM], [1,3-біс(2,6-ди-3-пентилфеніл)імідазол-2-іліден](3-хлорпіридил)дихлорпаладій(II) [Pd-PEPPSI™-IPent],

каталітичну систему, утворену in-situ з паладієвоциклічного передкаталізатора, такого як хлор(2-дициклогексилфосфіно-2',6'-діізопропокси-1,1'-біфеніл)[2-(2'-аміно-1,1'-біфеніл)]паладій(II) [RuPhos-Pd-G2],

5 [дициклогексил[2',4',6'-трис(1-метилетил)[1,1'-біфеніл]-2-іл]фосфін(метансульфонато-кО)[2'-(метиламіно-кN)[1,1'-біфеніл]-2-іл-кC]паладій [XPhos-Pd-G4] і [(4-(N, N-диметиламіно)феніл)ди-трет-бутилфосфін](метансульфонато-кО)[2'-(метиламіно-кN)[1,1'-біфеніл]-2-іл-кC]паладій [APhos-Pd-G4]. Приклади придатних розчинників включають воду, 1,4-діоксан, тетрагідрофуран, ацетонітрил і толуол. Багато сполук (15) є комерційно доступними або можуть бути одержані за допомогою відомих способів. Прикладами сполук (21), що характеризуються особливою застосовністю в протоколі реакції Сузукі, є ізобутирилові естери (21-і), де G являє собою ізобутирил.

Фахівцю в даній галузі буде зрозуміло, що умови протоколу реакції Сузукі можуть забезпечувати розщеплення естерних груп, отже, схема реакції 19 також може описувати реакцію, де вихідний матеріал (21) містить естерний фрагмент [так що G являє собою ацильну групу], але продукт (I-ii) не містить [так що G являє собою водень].

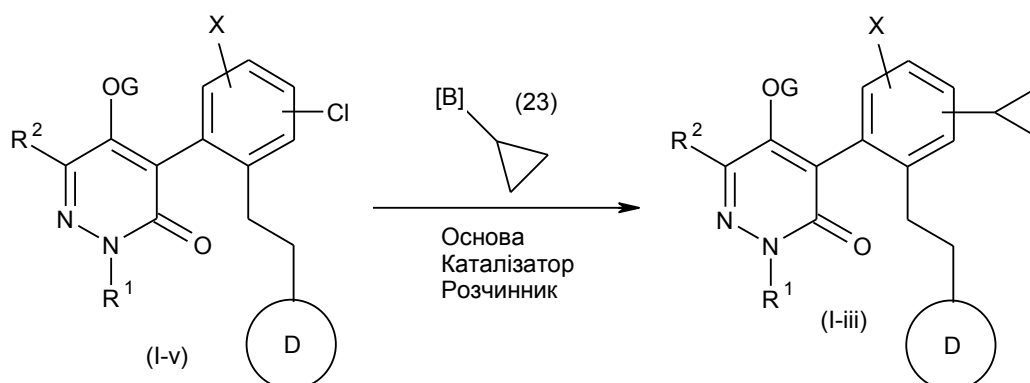
Схема реакції 20



Сполуки (21) можна одержувати шляхом гідроборування алкенів (14-iii) із застосуванням придатного гідроборувального реагенту (22) у придатному розчиннику з необов'язковим додаванням придатного каталізатора за температури від 0 °C до 100 °C. Приклади гідроборувальних реагентів включають боран, дихлорборан, дибромборан, 4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-діоксаборолан [пінаколборан], 1,3,2-бензодіоксаборол [катехолборан] або 9-борилбіцикло[3.3.1]нонан [9-BBN]. Приклади придатних розчинників включають тетрагідрофуран, 2-метилтетрагідрофуран, 1,4-діоксан, 2-метокси-2-метилпропан [MTBE] і діетилетер. Приклади придатних каталізаторів включають каталітичну систему, утворену in situ з дихлориду біс(1,5-циклооктадієн)діїридію(I) [[Ir(COD)Cl]₂], і 4-дифенілфосфанілбутил(дифеніл)фосфан [DPPB] [J. Am. Chem. Soc., 2004, 126, 9200-9201].

Якщо [B] являє собою естер алкілборонової кислоти, його можна перетворити на відповідну боронову кислоту шляхом обробки метилбороною кислотою [MeB(OH)₂] і трифтороцтовою кислотою в придатному розчиннику, такому як дихлорметан [DCM], за значень температури в діапазоні від 0 до 40 °C [Org. Lett., 2019, 21, 3048-3052]. Якщо [B] являє собою алкілборонову кислоту або її естер, його можна перетворити на відповідну трифторборатну сіль алкілкалію шляхом обробки гідрофторидом калію у придатному розчиннику, такому як метанол або ацетон, за значень температури від 0 до 40 °C.

Схема реакції 21



Сполуки (I-iii), де Y являє собою циклопропіл, можна одержувати шляхом обробки сполук (I-v) сполуками (23), де [B] може являти собою триалкілборан, алкілборонову кислоту, алкілбороновий естер або трифторборатну сіль алкілкалію, причому сполуками у присутності придатної основи і придатного каталізатора у придатному розчиннику за температури від 10 до 150°C. Сполуки (I-v) являють собою сполуки формули (I), в яких C являє собою -CH₂-CH₂-, G являє собою C(O)R³, і Y являє собою -Cl. Приклади придатних основ включають карбонат калію, фосфат калію, карбонат натрію, карбонат цезію, бікарбонат натрію і фторид калію. Приклади придатних каталізаторів включають комплекс 1,1'-біс(дифенілфосфіно)фероцен]-дихлорпаладію(II) і дихлорметану [PdCl₂(dppf).DCM], [1,3-біс(2,6-ди-3-пентилфеніл)імідазол-2-іліден](3-хлорпіридил)дихлорпаладій(II) [Pd-PEPPSI™-IPent], каталітичну систему, утворену in situ з паладієвоциклічного передкаталізатора, такого як хлор(2-дициклогексилфосфіно-2',6'-діізопропокси-1,1'-біфеніл)[2-(2'-аміно-1,1'-біфеніл)]паладій(II) [RuPhos-Pd-G2], [дициклогексил[2',4',6'-трис(1-метилетил)[1,1'-біфеніл]-2-іл]фосфін](метансульфонато-кO)[2'-(метиламіно-кN)[1,1'-біфеніл]-2-іл-кC]паладій [XPhos-Pd-G4] і [(4-(N, N-диметиламіно)феніл)дитрет-бутилфосфін](метансульфонато-кO)[2'-(метиламіно-кN)[1,1'-біфеніл]-2-іл-кC]паладій [APhos-Pd-G4]. Приклади придатних розчинників включають воду, 1,4-діоксан, тетрагідрофуран, ацетонітрил і толуол. Приклади сполук (I-v), що характеризуються особливою застосовністю в протоколі реакції Сузукі, являють собою ізобутирилові естери (I-v), де G являє собою ізобутирил.

Фахівцю в даній галузі буде зрозуміло, що умови протоколу реакції Сузукі можуть забезпечувати розщеплення естерних груп, отже, схема реакції 21 може описувати реакцію, де вихідний матеріал (I-v) містить естерний фрагмент [так що G являє собою ацильну групу], але продукт (I-iii) не містить [так що G являє собою водень].

Сполуки формули (I) відповідно до даного винаходу можна застосовувати окремо як гербіциди, але зазвичай їх складають у гербіцидні композиції із застосуванням допоміжних засобів для складання, таких як носії, розчинники та поверхнево-активні засоби (SFA). Отже, у даному винаході додатково передбачена гербіцидна композиція, яка містить гербіцидну сполуку за будь-яким із пунктів формули винаходу та прийнятний з погляду сільського господарства допоміжний засіб для складання. Композиція може бути представлена у формі концентратів, які розводять перед застосуванням, хоча також можна одержувати готові до застосування композиції. Кінцеве розведення зазвичай здійснюють із використанням води, але його також можна виконувати із застосуванням замість води або додатково до води, наприклад, рідких добрив, поживних мікроелементів, біологічних організмів, масла або розчинників.

Гербіцидні композиції зазвичай містять від 0,1 до 99 % за вагою, зокрема від 0,1 до 95 % за вагою, сполук формули I і від 1 до 99,9 % за вагою допоміжного засобу для складання, який переважно включає від 0 до 25 % за вагою поверхнево-активної речовини.

Композиції можна вибрати з низки типів складів, багато з яких відомі з Manual on Development and Use of FAO Specifications for Plant Protection Products, 5th Edition, 1999. Вони включають здатні до розпилення порошки (DP), розчинні порошки (SP), розчинні у воді гранули (SG), гранули, здатні до диспергування у воді (WG), змочувані порошки (WP), гранули (GR) (із повільним або швидким вивільненням), розчинні концентрати (SL), рідини, що змішуються з маслом (OL), рідини, застосовувані в дуже малому об'ємі (UL), здатні до емульгування концентрати (EC), здатні до диспергування концентрати (DC), емульсії (як "масло у воді" (EW), так і "вода в маслі" (EO)), мікроемульсії (ME), суспензійні концентрати (SC), аерозолі, капсульні суспензії (CS) і склади для обробки насіння. Вибраний тип складу у будь-якому випадку буде залежати від конкретного передбачуваного призначення і фізичних, хімічних та біологічних властивостей сполуки формули (I).

Здатні до розпилення порошки (DP) можна одержувати шляхом змішування сполуки формули (I) з одним або декількома твердими розріджувачами (наприклад, природними глинами, каоліном, пірофілітом, бентонітом, глиноземом, монтморилонітом, кізельгуром, крейдою, видами діатомової землі, фосфатами кальцію, карбонатами кальцію та магнію, сіркою, вапном, тонкодисперсними порошками, тальком та іншими органічними та неорганічними твердими носіями) та механічного подрібнення суміші до тонкодисперсного порошку.

Розчинні порошки (SP) можна одержувати шляхом змішування сполуки формули (I) з однією або декількома водорозчинними неорганічними солями (такими як бікарбонат натрію, карбонат натрію або сульфат магнію) або з однією або декількома водорозчинними органічними твердими речовинами (такими як полісахарид) і необов'язково з одним або декількома змочувальними засобами, одним або декількома диспергувальними засобами або сумішшю вказаних засобів для поліпшення диспергованості/розчинності у воді. Потім суміш подрібнюють

до тонкодисперсного порошку. Подібні композиції також можна гранулювати з утворенням водорозчинних гранул (SG).

Змочувані порошки (WP) можна одержувати шляхом змішування сполуки формули (I) з одним або декількома твердими розріджувачами або носіями, одним або декількома змочувальними засобами та переважно одним або декількома диспергувальними засобами, а також необов'язково з одним або декількома суспендувальними засобами для полегшення диспергування в рідинах. Потім суміш подрібнюють до тонкодисперсного порошку. Подібні композиції також можна гранулювати з утворенням гранул, здатних до диспергування у воді (WG).

Гранули (GR) можуть бути утворені або шляхом гранулювання суміші сполуки формули (I) та одного або декількох порошкоподібних твердих розріджувачів або носіїв, або з попередньо утворених порожніх гранул за допомогою абсорбції сполуки формули (I) (або її розчину в придатному засобі) у пористому гранульованому матеріалі (такому як пемза, атапульгітові глини, фулерова земля, кізельгур, види діатомової землі або подрібнені кукурудзяні качани) або за допомогою адсорбції сполуки формули (I) (або її розчину в придатному засобі) на твердому зернистому матеріалі (такому як піски, силікати, мінеральні карбонати, сульфати або фосфати) та сушіння, якщо необхідно. Засоби, які зазвичай застосовують для полегшення абсорбції або адсорбції, включають розчинники (такі як аліфатичні та ароматичні нафтові розчинники, спирти, етери, кетони та естери) та засоби, що сприяють прилипанню (такі як полівінілацетати, полівінілові спирти, декстрини, цукри та рослинні олії). У гранули також можна включати одну або декілька інших добавок (наприклад, емульгувальний засіб, змочувальний засіб або диспергувальний засіб).

Здатні до диспергування концентрати (DC) можна одержувати шляхом розчинення сполуки формули (I) у воді або органічному розчиннику, такому як кетон, спирт або гліколевий етер. Ці розчини можуть містити поверхнево-активний засіб (наприклад, для поліпшення розведення водою або запобігання кристалізації в резервуарі обприскувача).

Здатні до емульгування концентрати (EC) або емульсії типу "масло у воді" (EW) можна одержувати шляхом розчинення сполуки формули (I) в органічному розчиннику (який необов'язково містить один або декілька змочувальних засобів, один або декілька емульгувальних засобів або суміш указаних засобів). Придатні органічні розчинники для застосування в EC включають ароматичні вуглеводні (такі як алкілбензоли або алкілнафталіни, прикладами яких є SOLVESSO 100, SOLVESSO 150 та SOLVESSO 200; SOLVESSO являє собою зареєстровану торговельну марку), кетони (такі як циклогексанон або метилциклогексанон) і спирти (такі як бензиловий спирт, фурфуріловий спирт або бутанол), N-алкілпіролідони (такі як N-метилпіролідон або N-октилпіролідон), диметиламід жирних кислот (такі як диметиламід C₈-C₁₀жирної кислоти) та хлоровані вуглеводні. EC-продукт може самовільно емульгуватися під час додавання у воду з одержанням емульсії з достатньою стабільністю, що дає можливість використовувати її для нанесення розпиленням за допомогою відповідного обладнання.

Одержання EW включає одержання сполуки формули (I) або у вигляді рідини (якщо вона не є рідиною за кімнатної температури, її можна розплавити за помірної температури, зазвичай нижче від 70 °C), або у вигляді розчину (шляхом розчинення її у відповідному розчиннику), а потім емульгування одержаної рідини або розчину у воді, що містить один або декілька SFA, за умов високого зсуву з одержанням емульсії. Придатні розчинники для застосування в EW включають рослинні олії, хлоровані вуглеводні (такі як хлорбензоли), ароматичні розчинники (такі як алкілбензоли або алкілнафталіни) та інші відповідні органічні розчинники, які характеризуються низькою розчинністю у воді.

Мікроемульсії (ME) можна одержувати шляхом змішування води із сумішшю одного або декількох розчинників з одним або декількома SFA із самовільним одержанням термодинамічно стабільного ізотропного рідкого складу. Сполука формули (I) є наявною спочатку або у воді, або у суміші розчинник/SFA. Придатні розчинники для використання в ME включають такі розчинники, що описані в даному документі вище, для застосування в EC або в EW. ME може являти собою систему або типу "масло у воді", або типу "вода в маслі" (при цьому те, яка система є наявною, може бути визначене шляхом вимірювань електричної провідності) і може бути придатною для змішування водорозчинних та розчинних у маслі пестицидів в одному складі. ME є придатною для розведення у воді, при цьому вона або залишається у вигляді мікроемульсії, або утворює звичайну емульсію типу "масло у воді".

Суспензійні концентрати (SC) можуть містити водні або неводні суспензії тонкоподрібнених нерозчинних твердих частинок сполуки формули (I). SC можна одержувати шляхом розмелювання твердої сполуки формули (I) у кульовому або бісерному млині у придатному

середовищі необов'язково з одним або декількома диспергувальними засобами з одержанням тонкодисперсної суспензії сполуки. У композицію можна включати один або декілька змочувальних засобів, а також можна включати суспендувальний засіб для зниження швидкості осідання частинок. Альтернативно сполуку формули (I) можна піддавати сухому розмелюванню та додавати у воду, що містить засоби, описані в даному документі вище, з одержанням необхідного кінцевого продукту.

Аерозольні склади містять сполуку формули (I) та придатний газ-витискувач (наприклад, н-бутан). Сполуку формули (I) також можна розчиняти або диспергувати у придатному середовищі (наприклад, у воді або в рідині, що змішується з водою, такий як н-пропанол) з одержанням композицій для застосування в насосах, що не перебувають під тиском, для обприскування з ручним керуванням.

Капсульні суспензії (CS) можна одержувати аналогічно до одержання складів EW, але з додатковою стадією полімеризації з одержанням водної дисперсії краплинок масла, у якій кожна краплинка масла інкапсулюється полімерною оболонкою та містить сполуку формули (I) та необов'язково її носій або розріджувач. Полімерну оболонку можна одержати або за допомогою здійснення реакції міжфазної поліконденсації, або за допомогою процедури коацервації. Композиції можуть забезпечувати контрольоване вивільнення сполуки формули (I), і їх можна застосовувати для обробки насіння. Сполука формули (I) також може бути складена у біорозкладній полімерній матриці із забезпеченням повільного контрольованого вивільнення сполуки.

Композиція може включати одну або декілька добавок для поліпшення біологічної ефективності композиції, наприклад, шляхом поліпшення змочування, утримання на поверхнях або розподілу по поверхнях; стійкості до змивання дощем з оброблених поверхонь або поглинання або рухливості сполуки формули (I). Такі добавки включають поверхнево-активні засоби (SFA), добавки для обприскування на основі масел, наприклад певних мінеральних масел або природних рослинних олій (таких як соєва та рапсова олія), та їх суміші з іншими допоміжними засобами, що підсилюють біологічну дію (інгредієнтами, які можуть сприяти дії сполуки формули (I) або модифікувати цю дію).

Змочувальні засоби, диспергувальні засоби та емульгувальні засоби можуть являти собою SFA катіонного, аніонного, амфотерного або неіоногенного типу.

Придатні SFA катіонного типу включають сполуки четвертинного амонію (наприклад, бромід цетилтриметиламонію), імідазоліни та солі амінів.

Придатні аніонні SFA включають солі лужних металів жирних кислот, солі аліфатичних моноестерів сірчаної кислоти (наприклад, лаурилсульфат натрію), солі сульфонованих ароматичних сполук (наприклад, додецилбензолсульфонат натрію, додецилбензолсульфонат кальцію, бутилнафталінсульфонат і суміші діізопропіл- і триізопропілнафталінсульфонатів натрію), сульфати етерів, сульфати етерів спиртів (наприклад, лаурет-3-сульфат натрію), етеркарбоксилати (наприклад, лаурет-3-карбоксилат натрію), естери фосфорної кислоти (продукти реакції між одним або декількома жирними спиртами та фосфорною кислотою (переважно моноестери) або пентаоксидом фосфору (переважно діестери), наприклад, під час реакції між лауриловим спиртом і тетрафосфорною кислотою; додатково ці продукти можуть бути етоксировані), сульфосукцинамати, парафін- або олефісульфонати, таурати та лігносульфонати.

Придатні SFA амфотерного типу включають бетаїни, пропіонати та гліцинати.

Придатні SFA неіоногенного типу включають продукти конденсації алкіленоксидів, таких як етиленоксид, пропіленоксид, бутиленоксид або їхні суміші, із жирними спиртами (такими як олеїловий спирт або цетиловий спирт) або з алкілфенолами (такими як октилфенол, нонілфенол або октилкрезол); неповні естери, одержані з довголанцюгових жирних кислот або ангідридів гекситу; продукти конденсації вказаних неповних естерів з етиленоксидом; блок-співполімери (які містять етиленоксид та пропіленоксид); алканоламіди; естери з простою структурою (наприклад, естери жирної кислоти та поліетиленгліколю); аміноксиди (наприклад, лаурилдиметиламіноксид) та лецитини.

Придатні суспендувальні засоби включають гідрофільні колоїди (такі як полісахариди, полівінілпіролідон або карбоксиметилцелюлоза натрію) та глини, що набухають (такі як бентоніт або атапульгіт).

Композиція за даним винаходом може додатково містити щонайменше один додатковий пестицид. Наприклад, сполуки згідно з даним винаходом також можна застосовувати в комбінації з іншими гербіцидами або регуляторами росту рослин. У переважному варіанті здійснення додатковим пестицидом є гербіцид та/або антидот гербіциду. Конкретні приклади таких сумішей включають (де "I" являє собою сполуку формула (I)): I + ацетохлор; I +

- ацифлуорфен (у тому числі ацифлуорфен-натрій); I + аклоніфен; I + аметрин; I + амікарбазон; I + амінопіралід; I + амініотриазол; I + атразин; I + бефлубутамід-М; I + бенквітрион; I + бенсульфурон (у тому числі бенсульфурон-метил); I + бентазон; I + біциклопірон; I + біланафос; I + біспірибак-натрій; I + бікслозон; I + бромацил; I + бромоксиніл; I + бутаклор; I + бутафенацил;
- 5 I + карфентразон (у тому числі карфентразон-етил); I + клорансулам (у тому числі клорансулам-метил); I + хлоримурон (у тому числі хлоримурон-етил); I + хлортолурон; I + хлорсульфурон; I + цинметилін; I + клацифос; I + клетодим; I + клодинафоп (у тому числі клодинафоп-пропаргін); I + кломазон; I + клопіралід; I + циклопіраніл; I + циклопіриморат; I + циклосульфамурон; I + цигалофоп (у тому числі цигалофоп-бутил); I+2,4-D (у тому числі її холінову сіль і 2-етилгексиловий естер); I+2,4-DB; I + десмедифам; I + дикамба (у тому числі алюміній, амінопропіл, біс-амінопропілметил, холін, дихлорпроп, диглікольамін, диметиламін, диметиламоній, калій і її солі натрію); I + диклосулам; I + дифлуфенікан; I + дифлуфензопір; I + диметаклор; I + диметенамід-П; I + диквату дибромід; I + діурон; I + епірифенацил; I + еталфлуралін; I + етофумезат; I + феноксапроп (у тому числі феноксапроп-П-етил); I +
- 10 феноксасульфон; I + фенквінотрион; I + фентразамід; I + флазасульфурон; I + флорасулам; I + флорпірауаксифен (у тому числі флорпірауаксифен-бензил); I + флуазифоп (у тому числі флуазифоп-П-бутил); I + флукарбазон (у тому числі флукарбазон-натрій); I + флуфенацет; I + флуметсулам; I + флуміоксазин; I + флуометурон; I + флупірсульфурон (у тому числі флупірсульфурон-метил-натрій); I + флуороксіпір (у тому числі флуороксіпір-метил); I +
- 20 фомесафен; I + форамсульфурон; I + глюфосинат (у тому числі його амонієву сіль); I + гліфосат (у тому числі його діамонієві, ізопропіламонієві та калієві солі); I + галауксифен (у тому числі галауксифен-метил); I + галоксифоп (у тому числі галоксифоп-метил); I + гексазинон; I + гідантоцидин; I + імазамокс; I + імазапик; I + імазапір; I + імазетапір; I + індазифлам; I + йодосульфурон (у тому числі йодосульфурон-метил-натрій); I + іофенсульфурон (у тому числі іофенсульфурон-натрій); I + іоксиніл; I + ізопротурон; I + ізоксафлютол; I + ланкотрион; I+MCPA; I+MCPB; I + мекопроп-П; I + мезосульфурон (у тому числі мезосульфурон-метил); I + мезотрион; I + метамітрон; I + метазахлор; I + метіозолін; I + метолахлор; I + метосулам; I + метрибузин; I + метсульфурон; I + напропамід; I + нікосульфурон; I + норфлуразон; I + оксадіазон; I + оксасульфурон; I + оксифлуорфен; I + параквату дихлорид; I + пендиметалін; I + пеноксулам; I +
- 30 фенмедифам; I + піклорам; I + піноксаден; I + претилахлор; I + примісульфурон-метил; I + прометрин; I + пропаніл; I + пропаквізафоп; I + пропірисульфурон; I + пропізамід; I + просульфокарб; I + просульфурон; I + піраклоніл; I + пірафлуфен (у тому числі пірафлуфен-етил); I + пірасульфотол; I + піридат; I + пірифталід; I + піримісульфан; I + піроксасульфон; I + піроксулам; I + квінклорак; I + квінмерак; I + квізалофоп (у тому числі квізалофоп-П-етил і квізалофоп-П-тефурил); I + римсульфурон; I + сафлуфенацил; I + сетоксидим; I + симазин; I + С-металохлор; I + сульфентразон; I + сульфосульфурон; I + тебутіурон; I + тефурилтрион; I + темботрион; I + тербутилазин; I + тербутрин; I + тетфлупіролімет; I + тіенкарбазон; I + тифенсульфурон; I + тіафенацил; I + толпіралат; I + топрамезон; I + тралкоксидим; I + триафамон; I + триалат; I + триасульфурон; I + трибенурон (у тому числі трибенурон-метил); I +
- 40 триклопір; I + трифлорисульфурон (у тому числі трифлорисульфурон-натрій); I + трифлудимоксазин; I + трифлуралін; I + трифлусульфурон; I + етиловий естер 3-(2-хлор-4-фтор-5-(3-метил-2,6-діоксо-4-трифторметил-3,6-дигідропіримідин-1(2H)-іл)феніл)-5-метил-4,5-дигідроізоксазол-5-карбонової кислоти; I+4-гідрокси-1-метокси-5-метил-3-[4-(трифторметил)-2-піридил]імідазолідин-2-он; I+4-гідрокси-1,5-диметил-3-[4-(трифторметил)-2-піридил]імідазолідин-2-он; I+5-етокси-4-гідрокси-1-метил-3-[4-(трифторметил)-2-піридил]імідазолідин-2-он; I+4-гідрокси-1-метил-3-[4-(трифторметил)-2-піридил]імідазолідин-2-он; I+4-гідрокси-1,5-диметил-3-[1-метил-5-(трифторметил)піразол-3-іл]імідазолідин-2-он; I + (4R)-1-(5-трет-бутилізоксазол-3-іл)-4-етокси-5-гідрокси-3-метил-імідазолідин-2-он; I+3-[2-(3,4-диметоксифеніл)-6-метил-3-оксо-піридазин-4-карбоніл]біцикло[3.2.1]октан-2,4-діон; I+2-[2-(3,4-диметоксифеніл)-6-метил-3-оксо-піридазин-4-карбоніл]-5-метил-циклогексан-1,3-діон; I+2-[2-(3,4-диметоксифеніл)-6-метил-3-оксо-піридазин-4-карбоніл]циклогексан-1,3-діон; I+2-[2-(3,4-диметоксифеніл)-6-метил-3-оксо-піридазин-4-карбоніл]-5,5-диметил-циклогексан-1,3-діон; I+6-[2-(3,4-диметоксифеніл)-6-метил-3-оксо-піридазин-4-карбоніл]-2,2,4,4-тетраметил-циклогексан-1,3,5-трион; I+2-[2-(3,4-диметоксифеніл)-6-метил-3-оксо-піридазин-4-карбоніл]-5-етил-циклогексан-1,3-діон; I+2-[2-(3,4-диметоксифеніл)-6-метил-3-оксо-піридазин-4-карбоніл]-4,4,6,6-тетраметил-циклогексан-1,3-діон; I+2-[6-циклопропіл-2-(3,4-диметоксифеніл)-3-оксо-піридазин-4-карбоніл]-5-метил-циклогексан-1,3-діон; I+3-[6-циклопропіл-2-(3,4-диметоксифеніл)-3-оксо-піридазин-4-карбоніл]біцикло[3.2.1]октан-2,4-діон; I+2-[6-циклопропіл-2-(3,4-диметоксифеніл)-3-оксо-піридазин-4-карбоніл]-5,5-диметил-циклогексан-1,3-діон; I+6-[6-циклопропіл-2-(3,4-диметоксифеніл)-3-оксо-піридазин-4-карбоніл]-2,2,4,4-тетраметил-циклогексан-1,3,5-трион; I+2-
- 60

[6-циклопропіл-2-(3,4-диметоксифеніл)-3-оксо-піридазин-4-карбоніл]циклогексан-1,3-діон; I+4-[2-(3,4-диметоксифеніл)-6-метил-3-оксо-піридазин-4-карбоніл]-2,2,6,6-тетраметил-тетрагідропіран-3,5-діон; I+4-[6-циклопропіл-2-(3,4-диметоксифеніл)-3-оксо-піридазин-4-карбоніл]-2,2,6,6-тетраметил-тетрагідропіран-3,5-діон; I+4-аміно-3-хлор-5-фтор-6-(7-фтор-1H-індол-6-іл)піридин-2-карбонова кислота (у тому числі її агрохімічно прийнятні естери, наприклад метил-4-аміно-3-хлор-5-фтор-6-(7-фтор-1H-індол-6-іл)піридин-2-карбоксилат, проп-2-ініл-4-аміно-3-хлор-5-фтор-6-(7-фтор-1H-індол-6-іл)піридин-2-карбоксилат і ціанометил-4-аміно-3-хлор-5-фтор-6-(7-фтор-1H-індол-6-іл)піридин-2-карбоксилат); I+3-етилсульфаніл-N-(1,3,4-оксадіазол-2-іл)-5-(трифторметил)-[1,2,4]тріазоло[4,3-а]піридин-8-карбоксамід; I+3-(ізопропілсульфанілметил)-N-(5-метил-1,3,4-оксадіазол-2-іл)-5-(трифторметил)-[1,2,4]тріазоло[4,3-а]піридин-8-карбоксамід; I+3-(ізопропілсульфонілметил)-N-(5-метил-1,3,4-оксадіазол-2-іл)-5-(трифторметил)-[1,2,4]тріазоло[4,3-а]піридин-8-карбоксамід; I+3-(етилсульфонілметил)-N-(5-метил-1,3,4-оксадіазол-2-іл)-5-(трифторметил)-[1,2,4]тріазоло[4,3-а]піридин-8-карбоксамід; I + етил-2-[[3-[[3-хлор-5-фтор-6-[3-метил-2,6-діоксо-4-(трифторметил)піримідин-1-іл]-2-піридил]окси]ацетат; I+6-хлор-4-(2,7-диметил-1-нафтил)-5-гідрокси-2-метил-піридазин-3-он; I+1-[2-хлор-6-(5-хлорпіримідин-2-іл)окси-феніл]-4,4,4-трифтор-бутан-1-он і I+5-[2-хлор-6-(5-хлорпіримідин-2-іл)окси-феніл]-3-(дифторметил)ізоксазол.

Компоненти, змішувані зі сполукою формули (I), можуть також перебувати у формі естерів або солей, як згадується, наприклад, у The Pesticide Manual, Fourteenth Edition, British Crop Protection Council, 2006.

Сполуку формули (I) також можна застосовувати в сумішах з іншими агрохімічними засобами, такими як фунгіциди, нематодциди або інсектициди, приклади яких наведені в The Pesticide Manual.

Співвідношення в суміші сполуки формули (I) та змішуваного з ним компонента переважно становить від 1: 100 до 1000:1.

Суміші переважно можна застосовувати у вказаних вище складах (у цьому разі "активний інгредієнт" стосується відповідної суміші сполуки формули (I) зі змішуванням компонентом).

Сполуки формули (I) за даним винаходом можуть також бути об'єднані з антидотами гербіцидів. Переважні комбінації (де "I" являє собою сполуку формули (I)) включають:

I + беноксакор, I + клоквінтосет (у тому числі клоквінтосет-мексил), I + ципросульфамід, I + дихлормід, I + фенхлоразол (у тому числі фенхлоразол-етил), I + фенклорим, I + флуксофенім, I + фурилазол, I + ізоксадифен (у тому числі ізоксадифен-етил), I + мефенпір (у тому числі мефенпір-діетил), I + меткаміфен і I + оксабетриніл.

Зокрема, переважними є суміші сполуки формули (I) із ципросульфамідом, ізоксадифеном (у тому числі ізоксадифен-етилом), клоквінтосетом (у тому числі клоквінтосет-мексилом) та/або N-(2-метоксибензоїл)-4-[(метиламінокарбоніл)аміно]бензолсульфонамідом.

Антидоти сполуки формули I також можуть перебувати у формі естерів або солей, як згадується, наприклад, у The Pesticide Manual, 14th Edition (BCPC), 2006. Посилання на клоквінтосет-мексил також стосується його солі з літієм, натрієм, калієм, кальцієм, магнієм, алюмінієм, залізом, амонієм, четвертинним амонієм, сульфонієм або фосфонієм, як розкрито у WO 02/34048, а посилання на фенхлоразол-етил також стосується фенхлоразолу тощо.

Співвідношення у суміші сполуки формули (I) та антидоту переважно становить від 100:1 до 1:10, зокрема від 20:1 до 1:1.

Сполуку формули (I) також можна застосовувати в сумішах з іншими агрохімічними засобами, такими як фунгіциди, нематодциди або інсектициди, приклади яких наведені в The Pesticide Manual.

Співвідношення в суміші сполуки формули (I) та змішуваного з ним компонента переважно становить від 1: 100 до 1000:1.

Суміші переважно можна застосовувати у вказаних вище складах (у цьому разі "активний інгредієнт" стосується відповідної суміші сполуки формули I зі змішуванням партнером).

Даний винахід, крім того, додатково передбачає спосіб вибіркового контролю бур'янів у місці зростання культурних рослин та бур'янів, при цьому спосіб включає застосування щодо місця зростання достатньої для контролю бур'янів кількості композиції згідно з даним винаходом. "Контроль" означає знищення, зменшення чи вповільнення росту або попередження чи зниження проростання. Зазвичай рослинами, що підлягають контролю, є небажані рослини (бур'яни). "Місце зростання" означає територію, на якій рослини зростають або будуть зростати.

Норми застосування сполук формули (I) можуть варіюватися в широких межах і залежать від характеру ґрунту, способу застосування (до або після появи сходів; протравлювання насіння; внесення в борозну для насіння; застосування під час безорної обробки тощо), культурної рослини, бур'яну(бур'янів), що підлягає(підлягають) контролю, переважних

кліматичних умов та інших факторів, що визначаються способом застосування, часом застосування та цільовою сільськогосподарською культурою. Сполуки формули I згідно із даним винаходом зазвичай застосовують за норми від 10 до 2000 г/га, зокрема від 50 до 1000 г/га.

Застосування зазвичай здійснюють шляхом розпилювання композиції, зазвичай за допомогою встановленого на тракторі обприскувача для великих площ, але також можна застосовувати й інші способи, такі як обпилювання (для порошків), краплинний полив або зрошення.

Корисні рослини, щодо яких можна застосовувати композицію відповідно до даного винаходу, включають сільськогосподарські культури, такі як зернові, наприклад ячмінь і пшениця, бавовник, олійний ріпак, соняшник, маїс, рис, види сої, цукровий буряк, цукрова тростина та дерновий покрив.

Культурні рослини можуть також включати дерева, такі як плодові дерева, пальмові дерева, кокосові пальми або інші горіхоплідні культури. Також включені виткі рослини, такі як виноград, плодові кущі, плодові рослини та овочеві культури.

Слід розуміти, що сільськогосподарські культури також включають такі сільськогосподарські культури, яким надали толерантності до гербіцидів або класів гербіцидів (наприклад, ALS-, GS-, EPSPS-, PPO-, ACCаза- та HPPD-інгібітори) за допомогою традиційних способів селекції або за допомогою генної інженерії. Прикладом сільськогосподарської культури, якій надали витривалості щодо імідазолінонів, наприклад імазамоксу, за допомогою традиційних способів селекції, є капуста польова Clearfield® (канола). Приклади сільськогосподарських культур, яким надали толерантності до гербіцидів за допомогою способів генної інженерії, включають, наприклад, сорти маїсу, стійкі щодо гліфосату та глюфосинату, комерційно доступні під торговельними знаками RoundupReady® і LibertyLink®. В особливо переважному аспекті культурну рослину модифікували методиками генної інженерії для надекспресії гомогентизатсоланезилтрансферази, як указано, наприклад, у WO 2010/029311.

Під сільськогосподарськими культурами також слід розуміти ті, яким за допомогою способів генної інженерії було надано стійкості до шкідливих комах, наприклад Bt-маїс (стійкий до метелика кукурудзяного), Bt-бавовник (стійкий до довгоносіка бавовняного), а також різновиди Bt-картоплі (стійкі до колорадського жука). Прикладами Bt-маїсу є гібриди Bt-маїсу 176 NK® (Syngenta Seeds). Токсин Bt являє собою білок, який у природі утворюють ґрунтові бактерії *Bacillus thuringiensis*. Приклади токсинів або трансгенних рослин, здатних синтезувати такі токсини, описані в EP-A-451 878, EP-A-374 753, WO 93/07278, WO 95/34656, WO 03/052073 та EP-A-427 529. Прикладами трансгенних рослин, які містять один або декілька генів, що кодують стійкість до комах, та експресують один або декілька токсинів, є KnockOut® (маїс), Yield Gard® (маїс), NuCOTIN33B® (бавовник), Bollgard® (бавовник), NewLeaf® (види картоплі), NatureGard® і Protexcta®. Рослинні культури або їхній насіннєвий матеріал можуть бути стійкими щодо гербіцидів і водночас стійкими щодо поїдання комахами (трансгенні об'єкти з "пакетованими" генами). Наприклад, насінина може мати здатність експресувати інсектицидний білок Cry3, при цьому водночас бути толерантною до гліфосату.

Також слід розуміти, що сільськогосподарські культури включають ті, які одержані за допомогою традиційних способів селекції або генної інженерії та мають так звані привнесені ознаки (наприклад, поліпшену стабільність під час зберігання, вищу поживну цінність та поліпшений смак).

Інші корисні рослини включають газонну траву, наприклад на майданчиках для гольфу, галявинах, у парках і на узбіччях доріг або комерційно вирощувану для газону, і декоративні рослини, такі як квіти або чагарники.

Композиції можна застосовувати для контролю небажаних рослин (узагальнено "бур'янів"). Бур'яни, що підлягають контролю, включають як однодольні види, наприклад *Agrostis*, *Alopecurus*, *Avena*, *Brachiaria*, *Bromus*, *Cenchrus*, *Cyperus*, *Digitaria*, *Echinochloa*, *Eleusine*, *Lolium*, *Monochoria*, *Rottboellia*, *Sagittaria*, *Scirpus*, *Setaria* та *Sorghum*, так і дводольні види, наприклад *Abutilon*, *Amaranthus*, *Ambrosia*, *Chenopodium*, *Chrysanthemum*, *Conyza*, *Galium*, *Ipomoea*, *Nasturtium*, *Sida*, *Sinapis*, *Solanum*, *Stellaria*, *Veronica*, *Viola* та *Xanthium*. Бур'яни також можуть включати рослини, які можна вважати культурними рослинами, але які виростають за межами посівної площі ("втікачі") або які виростають із насіння, що залишилося від попереднього посіву іншої сільськогосподарської культури ("рослини-самосіви"). Такі "рослини-самосіви" або "втікачі" можуть бути витривалими щодо певних інших гербіцидів.

Різні аспекти та варіанти здійснення даного винаходу далі будуть більш докладно проілюстровані за допомогою прикладу. Слід розуміти, що можна здійснювати модифікацію деяких елементів без відхилення від обсягу даного винаходу.

Типові аббревіатури, використовувані в даному документі, включають наступні.

br = широкий Dba

^tBu = трет-бутил

d = дуплет

dba = дибензиліденацетон

5 DCM = дихлорметан

DMSO = диметилсульфоксид

DPPA = дифенілфосфорилазид

Et₂O = діетиловий етер

EtOAc = етилацетат

10 год. = година

m = мультиплет

Me = метил

MeOH = метанол

Ph = феніл

15 ⁱPr = ізопропіл

к. т. = кімнатна температура

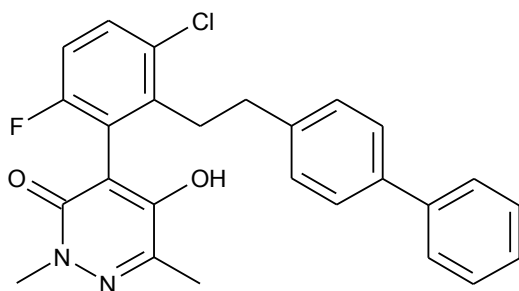
s = синглет

t = триплет

THF = тетрагідрофуран

20 Приклади одержання

Приклад 1. Одержання 4-[3-хлор-6-фтор-2-[2-(4-фенілфеніл)етил]феніл]-5-гідрокси-2,6-диметил-піридазин-3-ону (А-1.027)

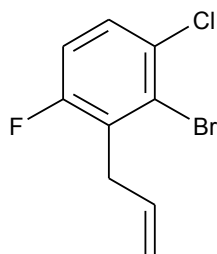


25

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

Розчин діізопропіламіду літію (2 М в тетрагідрофурані, 3,6 мл, 7,2 ммоль) охолоджували до -78°C в атмосфері азоту. Додавали по краплях розчин 2-бром-1-хлор-4-фтор-бензолу (1,0 г, 4,8 ммоль) у тетрагідрофурані при -78°C. Суміш перемішували протягом 45 хвилин за такої самої температури перед обробкою алілбромідом (0,3 мл, 5,7 ммоль). Забезпечували продовження реакції при -78°C протягом 2 год., потім забезпечували нагрівання до кімнатної температури. Реакційну суміш гасили за допомогою насич. розчину NH₄Cl (водн.) та екстрагували етилацетатом. Органічні речовини відокремлювали та залишали, потім промивали сольовим розчином. Органічні речовини висушували над сульфатом натрію та концентрували за зниженого тиску з одержанням 3-аліл-2-бром-1-хлор-4-фтор-бензолу (1,2 г, 100 %) у вигляді масла.

35



40

¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) 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).

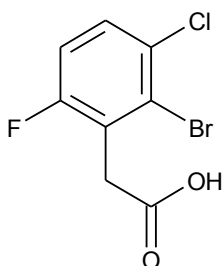
1.2 2-(2-Бром-3-хлор-6-фтор-феніл)оцтова кислота

Розчин 3-аліл-2-бром-1-хлор-4-фтор-бензолу (15,0 г, 60,1 ммоль) у дихлорметані (200 мл) у 2-горлій колбі охолоджували до -78°C. Горло з одного боку з'єднували з пасткою, що містить

водний розчин KI. Через розчин барботували озон, поки вихідний матеріал не був повністю витрачений (5 годин). Через розчин протягом 10 хвилин барботували повітря для видалення надлишку озону. Додавали диметилсульфід (44 мл, 601 ммоль) і забезпечували нагрівання суміші до кімнатної температури. Забезпечували продовження реакції протягом 16 год. за кімнатної температури.

Суміш промивали сольовим розчином (2 × 100 мл) та органічний шар залишали. Органічні речовини висушували над Na₂SO₄, фільтрували та концентрували за зниженого тиску з одержанням неочищеного 2-(2-бром-3-хлор-6-фтор-феніл)ацетальдегіду (15,3 г), який застосовували для наступної стадії без додаткового очищення.

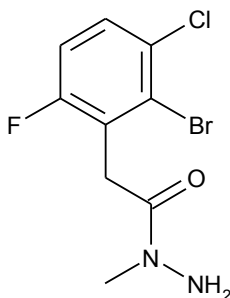
Неочищений 2-(2-бром-3-хлор-6-фтор-феніл)ацетальдегід (15,3 г, 60,8 ммоль) розчиняли в суміші трет-бутанолу (92 мл) та води (46 мл), потім охолоджували до 0°C. Додавали 2-метилбут-2-ен (64,5 мл, 608 ммоль), дигідрофосфат натрію (34,6 г, 243 ммоль) і хлорит натрію (16,5 г, 163 ммоль). Суміш перемішували протягом 2 год., потім розбавляли сольовим розчином (150 мл) та 2 М хлористоводневою кислотою (150 мл). Суміш екстрагували етилацетатом (3 × 100 мл). Об'єднані органічні екстракти промивали насиченим водним розчином метабісульфіту натрію (100 мл), потім висушували над Na₂SO₄, фільтрували та концентрували за зниженого тиску з одержанням блідо-жовтої твердої речовини. Неочищену тверду речовину розчиняли в суміші води (100 мл) і 2,0 М NaOH (30 мл). Водний розчин промивали етилацетатом (100 мл), а органічні речовини видаляли. Водний шар підкислювали шляхом додавання концентрованої хлористоводневої кислоти (20 мл), що викликало утворення білої суспензії. Суміш екстрагували етилацетатом (3 × 200 мл). Об'єднані органічні речовини промивали сольовим розчином, висушували над Na₂SO₄, фільтрували та випарювали з одержанням 2-(2-бром-3-хлор-6-фтор-феніл)оцтової кислоти (8,0 г, 49 %) у вигляді білої твердої речовини.



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-феніл)-N-метил-ацетогідразид

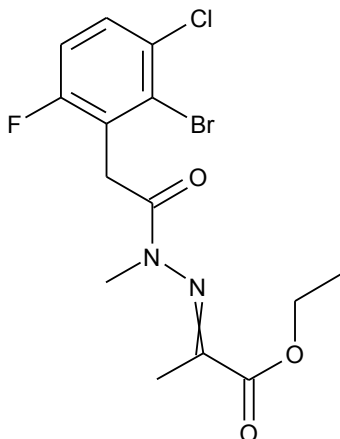
До перемішаного розчину 2-(2-бром-3-хлор-6-фтор-феніл)оцтової кислоти (2,0 г, 7,5 ммоль) у дихлорметані (20 мл) при 0°C додавали N-(3-диметиламінопропіл)-N'-етилкарбодііміду гідрохлорид [EDC.HCl] (1,4 г, 9,0 ммоль) із наступним додаванням по краплях метилгідазину (0,4 мл, 7,5 ммоль). Температуру реакційної суміші підтримували на рівні 0°C протягом 3 год. Потім реакційну суміш гасили за допомогою води та екстрагували в дихлорметан. Органічні речовини відокремлювали, промивали сольовим розчином і висушували над Na₂SO₄. Концентрування за зниженого тиску забезпечувало одержання неочищеного 2-(2-бром-3-хлор-6-фтор-феніл)-N-метил-ацетогідразиду (1,8 г, 81 %), який застосовували на наступній стадії без додаткового очищення.



¹H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ_H: 7,59 (dd, J=8,9 та 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 Етиловий естер 2-[[2-(2-бром-3-хлор-6-фтор-феніл)-ацетил]-метил-гідразоно]-пропіонової кислоти

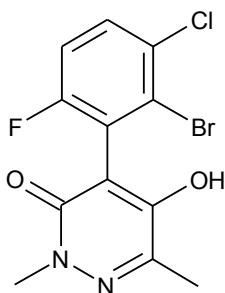
До перемішаного розчину 2-(2-бром-3-хлор-6-фтор-феніл)-N-метил-ацетогідазиду (1,8 г, 6,09 ммоль) в етанолі (5 мл) по краплях додавали етилпіруват (0,7 мл, 6,7 ммоль). Реакційну суміш нагрівали при 80°C протягом 4 год. Потім забезпечували охолодження реакційної суміші до кімнатної температури та випарювали її за зниженого тиску. Залишок очищали за допомогою колонкової хроматографії на силікагелі (градієнтне елювання сумішшю етилацетат/гексан) з одержанням необхідної сполуки - етилового естеру 2-[[2-(2-бром-3-хлор-6-фтор-феніл)-ацетил]-метил-гідразоно]-пропіонової кислоти (1,8 г, 75 %) - у вигляді брудно-білої твердої речовини.



¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) 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-феніл)-5-гідрокси-2,6-диметил-піридазин-3-он

Етиловий естер 2-[[2-(2-бром-3-хлор-6-фтор-феніл)-ацетил]-метилгідразоно]-пропіонової кислоти (500 мг, 1,27 ммоль) розчиняли в ацетонітрилі (2,5 мл) та обробляли 1,8-діазабіцикло[5.4.0]ундец-7-еном [DBU] (0,47 мл, 3,2 ммоль). Суміш нагрівали до 125°C за допомогою мікрохвильового випромінювання протягом 1 год. Потім реакційну суміш випарювали за зниженого тиску. Залишок розчиняли у воді та підкислювали до pH 1 за допомогою 2 н. хлористоводневої кислоти. Суміш екстрагували за допомогою DCM, органічні речовини відокремлювали та промивали сольовим розчином. Органічний розчин висушували над Na₂SO₄ та концентрували за зниженого тиску з одержанням неочищеного продукту. Неочищену речовину очищали за допомогою колонкової хроматографії на силікагелі (градієнтне елювання сумішшю етилацетат/гексан) з одержанням 4-(2-бром-3-хлор-6-фтор-феніл)-5-гідрокси-2,6-диметилпіридазин-3-ону (340 мг, 77,1 %) у вигляді брудно-білої твердої речовини.



¹H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) 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).

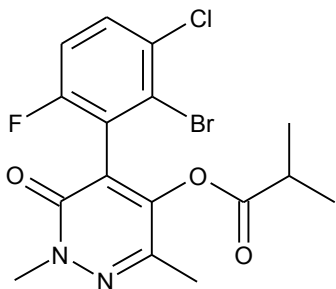
1.6 [5-(2-Бром-3-хлор-6-фтор-феніл)-1,3-диметил-6-оксо-піридазин-4-іл]-2-метилпропаноат

До перемішаного розчину 4-(2-бром-3-хлор-6-фтор-феніл)-5-гідрокси-2,6-диметил-піридазин-3-ону (1,4 г, 4,02 ммоль) у дихлорметані (32 мл) за к. т. додавали триетиламін (1,1 мл, 8,06 ммоль), 4-(диметиламіно)піридин [DMAP] (49 мг, 0,40 ммоль) та ізобутирилхлорид (0,6 мл, 4,83 ммоль).

Після того як реакцію вважали закінченою, реакційну суміш розбавляли дихлорметаном і водою. Органічний шар відокремлювали, висушували над Na₂SO₄ та концентрували за

зниженого тиску з одержанням неочищеного продукту. Неочищену речовину очищали за допомогою колонкової хроматографії на силікагелі (градієнтне елюювання сумішшю етилацетат/гексан) з одержанням [5-(2-бром-3-хлор-6-фтор-феніл)-1,3-диметил-6-оксо-піридазин-4-іл]-2-метилпропаноату (1,47 г, 87 %).

5



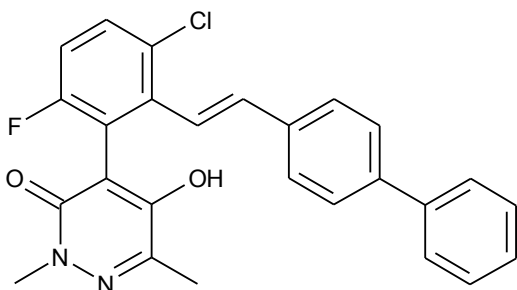
^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ_{H} : 7,51-7,47 (m, 1H), 7,10-7,05 (m, 1H), 3,82 (s, 3H), 2,60-2,55 (m, 1H), 2,25 (s, 3H), 1,02-0,98 (m, 6H).

10 1.7. 4-[3-Хлор-6-фтор-2-[(E)-2-(4-фенілфеніл)вініл]феніл]-5-гідрокси-2,6-диметил-піридазин-3-он (А-2.027)

[5-(2-Бром-3-хлор-6-фтор-феніл)-1,3-диметил-6-оксо-піридазин-4-іл]-2-метилпропаноат (0,54 г, 1,3 ммоль), K_2CO_3 (0,55 г, 3,9 ммоль), транс-2-(4-фенілфеніл)вінілборонову кислоту (0,44 г, 2,00 ммоль), $\text{PdCl}_2(\text{dppf})\cdot\text{DCM}$ (53 мг, 0,065 ммоль), 1,4-діоксан (13 мл) і H_2O (3,3 мл) об'єднували у флаконі для мікрохвильової обробки об'ємом 20 мл, потім нагрівали при 140 °С протягом 30 хв. в умовах мікрохвильового опромінення.

15 Реакційну суміш концентрували in vacuo з видаленням 1,4-діоксану, потім розділяли між 2 н. HCl (водн.) і DCM . Органічний шар відокремлювали і водний шар екстрагували за допомогою додаткових порцій DCM (x2). Об'єднані органічні речовини концентрували in vacuo з одержанням неочищеного залишку, який очищали за допомогою колонкової хроматографії на силікагелі (градієнтне елюювання сумішшю етилацетат/гексан) з одержанням 4-[3-хлор-6-фтор-2-[(E)-2-(4-фенілфеніл)вініл]феніл]-5-гідрокси-2,6-диметил-піридазин-3-ону (343 мг, 53 %, А-2.027)) у вигляді жовтої піни.

20



25

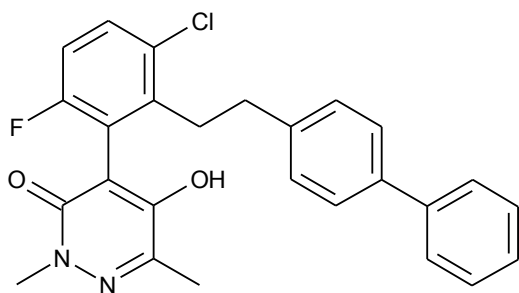
^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,59-7,33 (m, 10H), 7,07 (t, $J=8,6$ Гц, 1H), 7,01 (d, $J=16,4$ Гц, 1H), 6,70 (d, $J=16,5$ Гц, 1H), 5,63 (s, 1H), 3,73 (s, 3H), 2,28 (s, 3H)

30 1.8. 4-(3-Хлор-6-фтор-2-фенетил-феніл)-5-гідрокси-2,6-диметил-піридазин-3-он (А-1.027)

У круглодонну колбу об'ємом 10 мл додавали 5 % Pd/C (73 мг, 0,034 ммоль), потім розчин 4-[3-хлор-6-фтор-2-[(E)-2-(4-фенілфеніл)вініл]феніл]-5-гідрокси-2,6-диметил-піридазин-3-ону (308 мг, 0,69 ммоль) у суміші DCM/MeOH 10:1 (об./об.) (4 мл). Потім додавали $\text{B}_2(\text{OH})_4$ (325 мг, 3,45 ммоль) і реакційну суміш перемішували за кімнатної температури протягом ночі.

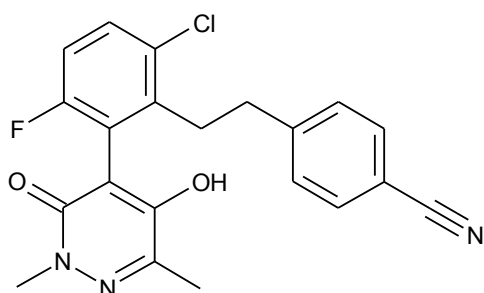
35 Потім реакційну суміш фільтрували через Celite® з елююванням за допомогою суміші DCM/MeOH 10:1 (об./об.). Фільтрат шляхом сухого завантаження переносили на діоксид кремнію та очищали за допомогою колонкової хроматографії на силікагелі (градієнтне елюювання сумішшю етилацетат/гексан) з одержанням 4-[3-хлор-6-фтор-2-[2-(4-фенілфеніл)етил]феніл]-5-гідрокси-2,6-диметил-піридазин-3-ону (299 мг, вихід 97 %, А-1.027) у вигляді жовтого масла, яке тверднуло під час остигання.

40



¹H 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)

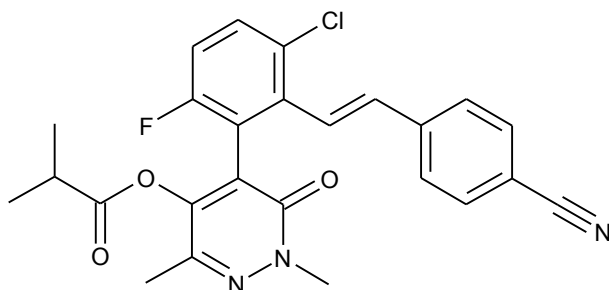
Приклад 2. Одержання 4-[2-[6-хлор-3-фтор-2-(5-гідрокси-2,6-диметил-3-оксо-піридазин-4-іл)феніл]етил]бензонітрилу (А-1.036)



2.1. [5-[3-Хлор-2-[(Е)-2-(4-ціанофеніл)вініл]-6-фтор-феніл]-1,3-диметил-6-оксо-піридазин-4-іл]-2-метилпропаноат (4.036)

[5-(2-Бром-3-хлор-6-фтор-феніл)-1,3-диметил-6-оксо-піридазин-4-іл]-2-метилпропаноат (1,10 г, 2,63 ммоль) [одержаний, як описано у прикладі 1] і хлор[(три-трет-бутилфосфін)-2-(2-амінобіфеніл)]паладій(II) (68 мг, 0,13 ммоль) об'єднували в дегазованому толуолі (12 мл). Потім додавали 4-вінілбензонітрил (408 мг, 3,16 ммоль) та основу Хуніга (0,92 мл, 5,27 ммоль) і реакційну суміш нагрівали до 95° С протягом 2,5 год.

Забезпечували охолодження реакційної суміші до кімнатної температури, потім розбавляли дихлорметаном і фільтрували через целіт, промиваючи за допомогою додаткової кількості дихлорметану. Фільтрат концентрували in vacuo, потім очищали за допомогою колонкової хроматографії на силікагелі (градієнтне елювання сумішшю етилацетат/гексан) з одержанням [5-[3-хлор-2-[(Е)-2-(4-ціанофеніл)вініл]-6-фтор-феніл]-1,3-диметил-6-оксо-піридазин-4-іл]-2-метилпропаноату (781 мг, вихід 64 %, А-4.036) у вигляді білої твердої речовини.



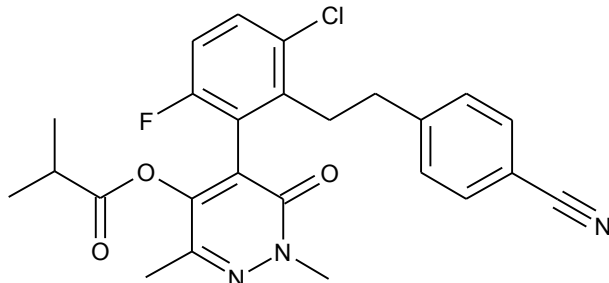
¹H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,62-7,55 (m, 2H), 7,45 (dd, J=5,0, 8,5 Гц, 1H), 7,45-7,40 (m, 1H), 7,13 (d, J=16,5 Гц, 1H), 7,05 (t, J=8,5 Гц, 1H), 6,68 (d, J=16,5 Гц, 1H), 3,69 (s, 3H), 2,65 (spt, J=7,0 Гц, 1H), 2,23 (s, 3H), 1,11 (d, J=7,0 Гц, 3H), 1,07 (d, J=7,0 Гц, 3H).

2.2. [5-[3-Хлор-2-[2-(4-ціанофеніл)етил]-6-фтор-феніл]-1,3-диметил-6-оксо-піридазин-4-іл]-2-метилпропаноат (А-3.036)

[5-[3-Хлор-2-[(Е)-2-(4-ціанофеніл)вініл]-6-фтор-феніл]-1,3-диметил-6-оксо-піридазин-4-іл]-2-метилпропаноат (900 мг, 1,93 ммоль) піддавали каталітичній гідрогенізації в EtOAc (20 мл) у присутності каталізатора 5 % Pd/C (вологість 50 %) (0,82 г) за тиску H₂ 4 бари.

Через 1,5 год. LC/MS показала завершення реакції. Реакційну суміш фільтрували через шар Celite®, промиваючи етилацетатом. Фільтрат концентрували in-vacuo з одержанням неочищеного залишку.

- Залишок адсорбували на діоксид кремнію й очищали за допомогою колонкової хроматографії на силікагелі (градієнтне елювання сумішшю етилацетат/гексан) з одержанням [5-[3-хлор-2-[2-(4-ціанофеніл)етил]-6-фтор-феніл]-1,3-диметил-6-оксо-піридазин-4-іл]-2-метилпропаноату (800 мг, вихід 81 %, A-3.036) у вигляді білої твердої речовини.



10

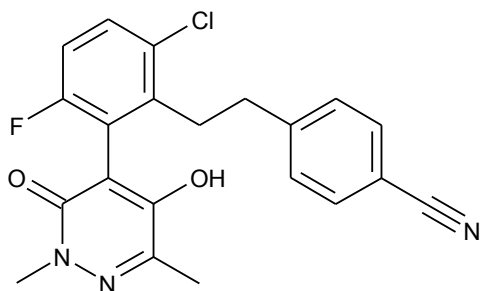
¹H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,56-7,51 (m, 2H), 7,42 (dd, J=5,2, 8,9 Гц, 1H), 7,26-7,21 (m, 2H), 7,00 (t, J=8,9 Гц, 1H), 3,84 (s, 3H), 3,02-2,92 (m, 1H), 2,91-2,80 (m, 2H), 2,75-2,65 (m, 1H), 2,54 (spt, J=7,0 Гц, 1H), 2,25 (s, 3H), 0,98 (d, J=7,0 Гц, 3H), 0,95 (d, J=7,0 Гц, 3H).

- 2.3. 4-[2-[6-Хлор-3-фтор-2-(5-гідрокси-2,6-диметил-3-оксо-піридазин-4-іл)феніл]етил]бензонітрил (A-1.036)

[5-[3-Хлор-2-[2-(4-ціанофеніл)етил]-6-фтор-феніл]-1,3-диметил-6-оксо-піридазин-4-іл]-2-метилпропаноат (400 мг, 0,855 ммоль) розчиняли в етанолі (6 мл). Суміш оброблювали розчином гідроксиду літію (108 мг, 2,56 ммоль) у воді (2 мл). Реакційну суміш перемішували за кімнатної температури протягом 2 год.

- Реакційну суміш концентрували in-vacuo з видаленням етанолу. Решту водного розчину розбавляли водою (15 мл), потім підкислювали до pH ~3 за допомогою 2 М HCl та екстрагували за допомогою DCM (3 × 10 мл). Об'єднані органічні речовини висушували над MgSO₄, фільтрували та концентрували in vacuo з одержанням неочищеного продукту.

- Неочищений продукт очищали за допомогою колонкової хроматографії на силікагелі (градієнтне елювання сумішшю етилацетат/гексан) з одержанням 4-[2-[6-хлор-3-фтор-2-(5-гідрокси-2,6-диметил-3-оксо-піридазин-4-іл)феніл]етил]бензонітрилу (83 мг, вихід 91 %, A-1.036)) у вигляді білої твердої речовини.

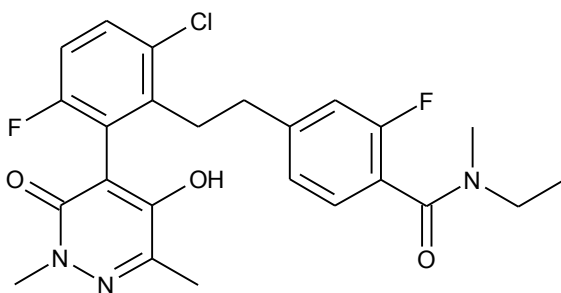


30

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).

- Приклад 4. Одержання 4-[2-[6-хлор-3-фтор-2-(5-гідрокси-2,6-диметил-3-оксо-піридазин-4-іл)феніл]етил]-N-етил-2-фтор-N-метил-бензаміду (A-1.028)

35

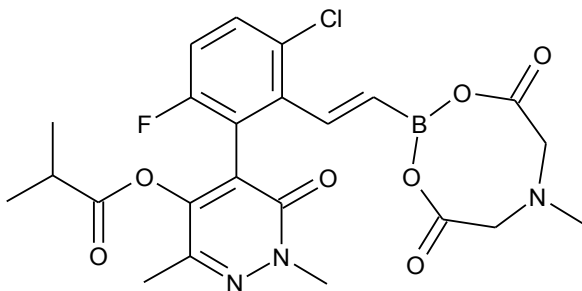


4.1. [5-[3-Хлор-6-фтор-2-[(Е)-2-(6-метил-4,8-діоксо-1,3,6,2-діоксазаборокан-2-іл)вініл]феніл]-1,3-диметил-6-оксо-піридазин-4-іл]-2-метилпропаноат

[5-(2-Бром-3-хлор-6-фтор-феніл)-1,3-диметил-6-оксо-піридазин-4-іл]-2-метил-пропаноат (5,00 г, 11,97 ммоль, 1,0 екв.), 6-метил-2-вініл-1,3,6,2-діоксазаборокан-4,8-діон (2,63 г, 14,36 ммоль, 1,2 екв.) і хлор[три-трет-бутилфосфін]-2-(2-амінобіфеніл)]паладій(II) (307 мг, 0,60 ммоль, 0,05 екв.) завантажували в круглодонну колбу об'ємом 250 мл, оснащену холодильником, якорем магнітної мішалки і барботером для азоту. Додавали THF (100 мл) із наступним додаванням N, N-діізопропілетиламіну (4,2 мл, 23,94 ммоль, 2,0 екв.) проти потоку азоту та суміш нагрівали до температури утворення флегми протягом 3 год.

Забезпечували охолодження реакційної суміші до кімнатної температури, потім її розбавляли в DCM та фільтрували через Celite®, промиваючи додатковими порціями DCM. Елюент потім концентрували до сухого стану.

Неочищений продукт очищали за допомогою колонкової флеш-хроматографії з одержанням [5-[3-хлор-6-фтор-2-[(Е)-2-(6-метил-4,8-діоксо-1,3,6,2-діоксазаборокан-2-іл)вініл]феніл]-1,3-диметил-6-оксопіридазин-4-іл]-2-метилпропаноату (5,91 г, 11,4 ммоль, вихід 95 %) у вигляді брудно-білої твердої речовини.



¹H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) 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)

4.2. [5-[3-Хлор-2-[2-[4-[етил(метил)карбамоїл]-3-фтор-феніл]етил]-6-фтор-феніл]-1,3-диметил-6-оксо-піридазин-4-іл]-2-метилпропаноат (А-3.028)

[5-[3-Хлор-6-фтор-2-[(Е)-2-(6-метил-4,8-діоксо-1,3,6,2-діоксазаборокан-2-іл)вініл]феніл]-1,3-диметил-6-оксо-піридазин-4-іл]-2-метилпропаноат (500 мг, 0,96 ммоль), K₃PO₄ (886 мг, 3,85 ммоль) і комплекс 1,1-біс(дифенілфосфіно)фероцен]дихлорпаладію(II) і дихлорметану [PdCl₂(dppf).DCM] (39 мг, 0,05 ммоль) додавали у флакон для мікрохвильової обробки об'ємом 20 мл. Додавали THF (10 мл), 4-бром-N-етил-2-фтор-N-метил-бензамід (500 мг, 1,92 ммоль) і воду (0,35 мл), потім реакційну суміш нагрівали до 100 °С протягом 2 годин в умовах мікрохвильового опромінення.

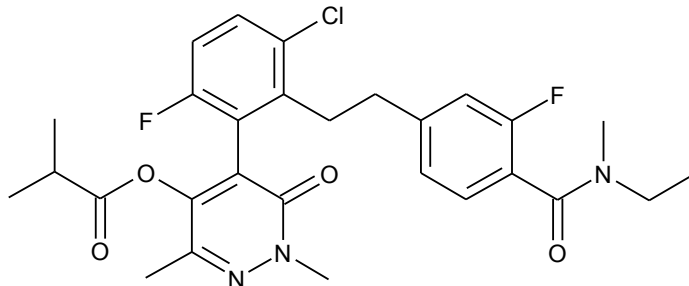
Реакційну суміш концентрували in vacuo з видаленням THF, потім розбавляли за допомогою води (20 мл) і DCM (20 мл). Органічний шар відокремлювали і водний шар екстрагували за допомогою DCM (3 × 5 мл). Об'єднані органічні речовини висушували і концентрували in vacuo з одержанням неочищеного залишку, який очищали за допомогою колонкової хроматографії на силікагелі з градієнтним елююванням сумішшю циклогексан/етилацетат з одержанням [5-[3-хлор-2-[(Е)-2-[4-[етил(метил)карбамоїл]-3-фтор-феніл]вініл]-6-фтор-феніл]-1,3-диметил-6-оксо-піридазин-4-іл]-2-метилпропаноату (397 мг, вихід 76 %, А-4.028) у вигляді брудно-білої твердої речовини.

[5-[3-Хлор-2-[(Е)-2-[4-[етил(метил)карбамоїл]-3-фтор-феніл]вініл]-6-фтор-феніл]-1,3-диметил-6-оксо-піридазин-4-іл]-2-метилпропаноат (300 мг, 0,55 ммоль) піддавали каталітичний

гідрогенізації в EtOAc (6 мл) у присутності каталізатора 5 % Pd/C (вологість 50 %) (0,12 г) за тиску H₂ 3 бари.

Через 5,5 год. LC/MS показала завершення реакції. Реакційну суміш фільтрували через шар Celite®, промиваючи сумішшю етилацетат/метанол. Фільтрат концентрували in-vacuo з одержанням неочищеного залишку.

Залишок адсорбували на діоксид кремнію та очищали за допомогою колонкової хроматографії на силікагелі (градієнтне елювання сумішшю етилацетат/гексан) з одержанням [5-[3-хлор-2-[2-[4-[етил(метил)карбамоїл]-3-фтор-феніл]етил]-6-фтор-феніл]-1,3-диметил-6-оксо-піридазин-4-іл]-2-метилпропаноату (285 мг, вихід 95 %, A-3.028) у вигляді безбарвної смоли.



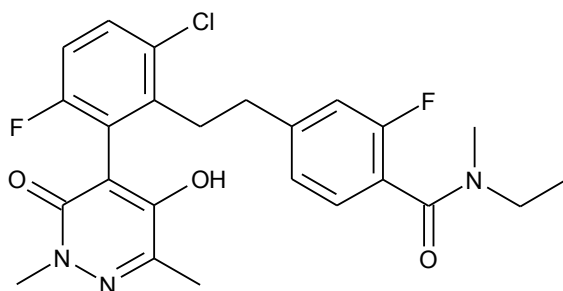
[ЯМР суміші ротамерів] ¹H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 7,42 (dd, J=5,1, 8,9 Гц, 1H), [7,25 (t, J=7,2 Гц, 0,5H), 7,21 (t, J=7,5 Гц, 0,5H)], 6,99 (t, J=8,9 Гц, 1H), 6,96 (dd, J=1,2, 7,5 Гц, 1H), [6,89 (dd, J=1,2, 6,9 Гц, 1H), 6,86 (dd, J=1,2, 6,9 Гц, 1H)], 3,85 (s, 3H), [3,59 (q, J=7,4 Гц, 1H), 3,24 (q, 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-гідрокси-2,6-диметил-3-оксо-піридазин-4-іл)феніл]етил]-N-етил-2-фтор-N-метил-бензамід (A-1.028)

[5-[3-Хлор-2-[2-[4-[етил(метил)карбамоїл]-3-фтор-феніл]етил]-6-фтор-феніл]-1,3-диметил-6-оксо-піридазин-4-іл]-2-метилпропаноат (300 мг, 0,55 ммоль) розчиняли в етанолі (3 мл). Суміш оброблювали розчином гідроксиду літію (69 мг, 1,65 ммоль) у воді (3 мл). Реакційну суміш перемішували за кімнатної температури протягом 2 год.

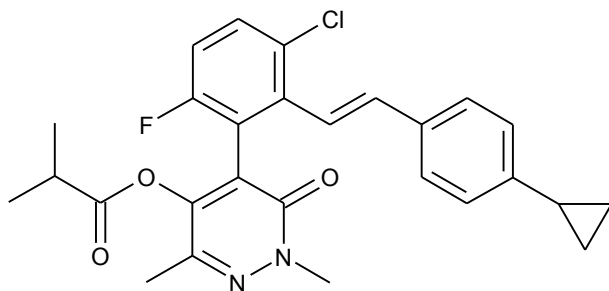
Реакційну суміш концентрували in vacuo з видаленням етанолу. Решту водного розчину розбавляли водою (15 мл), потім підкислювали до pH ~3 за допомогою 2 М HCl та екстрагували за допомогою DCM (3 × 10 мл). Об'єднані органічні речовини висушували і концентрували in-vacuo з одержанням неочищеного продукту.

Неочищений продукт очищали за допомогою колонкової хроматографії на силікагелі (градієнтне елювання сумішшю DCM/метанол) з одержанням 4-[2-[6-хлор-3-фтор-2-(5-гідрокси-2,6-диметил-3-оксо-піридазин-4-іл)феніл]етил]-N-етил-2-фтор-N-метил-бензаміду (224 мг, вихід 86 %, A-1.028) у вигляді білої твердої речовини.

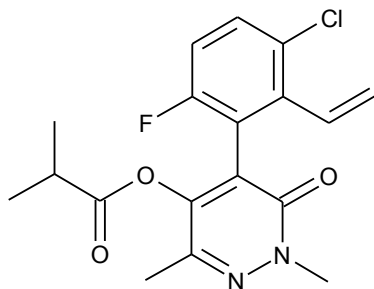


[ЯМР суміші ротамерів] ¹H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ = 10,86 (br s, 1H), 7,55-7,49 (m, 1H), 7,25-7,19 (m, 2H), 6,95-6,89 (m, 2H), 3,61 (s, 3H), 3,46 (q, J=7,1 Гц, 1H), 3,12 (q, J=7,1 Гц, 1H), 2,95 (s, 1,5H), 2,78 (s, 1,5H), 2,78-2,63 (m, 4H), 2,26 (s, 3H), 1,11 (t, J=7,1 Гц, 1,5H), 1,00 (t, J=7,1 Гц, 1,5H).

Приклад 5. Одержання [5-[3-хлор-2-[(E)-2-(4-циклопропілфеніл)вініл]-6-фтор-феніл]-1,3-диметил-6-оксо-піридазин-4-іл]-2-метилпропаноату (A-4.038)



- 5.1. [5-(3-Хлор-6-фтор-2-вініл-феніл)-1,3-диметил-6-оксо-піридазин-4-іл]-2-метилпропаноат
[5-(2-Бром-3-хлор-6-фтор-феніл)-1,3-диметил-6-оксо-піридазин-4-іл]-2-метилпропаноат
5 (4,177 г, 10,00 ммоль, 1,0 екв.) і трибутил(вініл)станан (4,384 мл, 15,00 ммоль, 1,50 екв.)
розчиняли в толуолі (60,00 мл), потім додавали комплекс 1,1-
біс(дифенілфосфіно)фероцен]дихлорпаладію(II) і дихлорметану [PdCl₂(dppf).DCM] (408 мг,
0,50 ммоль, 0,05 екв.). Реакційну суміш нагрівали зі зворотним холодильником протягом ночі.
10 Забезпечували охолодження реакційної суміші до кімнатної температури, потім її
концентрували in vacuo. Потім неочищений продукт очищали за допомогою колонкової флеш-
хроматографії з одержанням [5-(3-хлор-6-фтор-2-вініл-феніл)-1,3-диметил-6-оксо-піридазин-4-
іл]-2-метилпропаноату у вигляді брудно-білої твердої речовини (3,02 г, вихід 83 %).



15

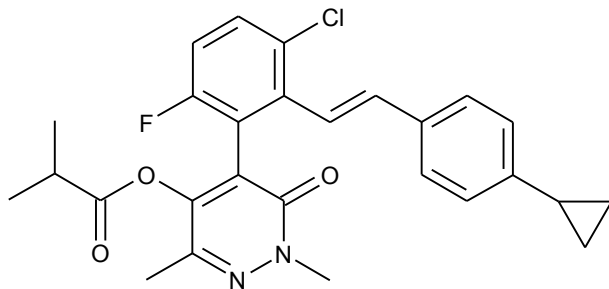
¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ = 7,40 (dd, J=5,1, 8,7 Гц, 1H), 6,99 (t, J=8,7 Гц, 1H), 6,65 (dd, J=11,6, 17,6 Гц, 1H), 5,37-5,30 (m, 2H), 3,79 (s, 3H), 2,59 (spt, J=7,0 Гц, 1H), 2,23 (s, 3H), 1,04 (d, J=7,0 Гц, 4H), 1,03 (d, J=7,0 Гц, 1H)

- 5.2. [5-[3-Хлор-2-[(E)-2-(4-циклопропілфеніл)вініл]-6-фтор-феніл]-1,3-диметил-6-оксо-
20 піридазин-4-іл]-2-метилпропаноат (A-4.038)

Перемішувану суміш [5-(3-хлор-6-фтор-2-вініл-феніл)-1,3-диметил-6-оксо-піридазин-4-іл]-2-
метилпропаноату (300 мг, 1,0 екв.), хлор[(три-трет-бутилфосфін)-2-(2-амінобіфеніл)]паладію(II)
(21 мг, 0,05 екв.), 1-бром-4-циклопропілбензолу (243 мг, 1,5 екв.) і N, N-діізопропілетиламіну
(0,29 мл, 2,0 екв.) у толуолі (5 мл) в атмосфері азоту нагрівали зі зворотним холодильником
25 протягом 3 год.

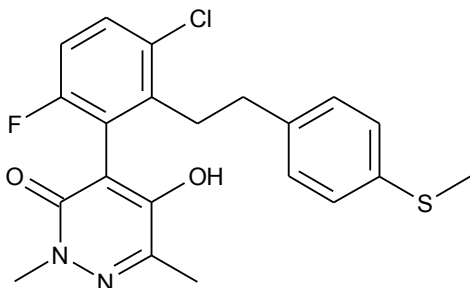
Забезпечували охолодження реакційної суміші до кімнатної температури, потім її
розбавляли за допомогою DCM та фільтрували через шар целіту, елюючи додатковими
порціями DCM. Фільтрат концентрували in vacuo з одержанням неочищеного продукту.

- Неочищений продукт очищали за допомогою колонкової флеш-хроматографії з одержанням
30 [5-[3-хлор-2-[(E)-2-(4-циклопропілфеніл)вініл]-6-фтор-феніл]-1,3-диметил-6-оксопіридазин-4-іл]-
2-метилпропаноату (285 мг, вихід 72 %) у вигляді блідо-жовтої смоли.



^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ = 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).

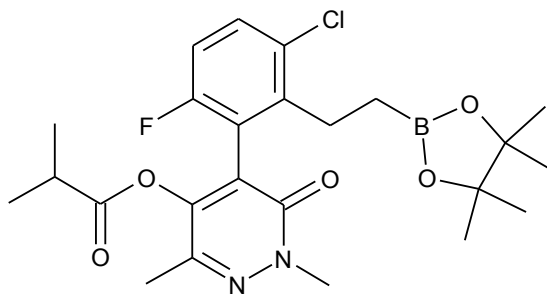
5 Приклад 6. Одержання 4-[3-хлор-6-фтор-2-[2-(4-метилсульфанілфеніл)етил]-феніл]-5-гідрокси-2,6-диметил-піридазин-3-ону (А-1.039)



10 6.1. [5-[3-Хлор-6-фтор-2-[2-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-діоксаборолан-2-іл)етил]феніл]-1,3-диметил-6-оксо-піридазин-4-іл]-2-метилпропаноат

Потім у висушену в печі круглодонну колбу завантажували $\text{Ir}(\text{COD})\text{Cl}_2$ (299 мг, 0,45 ммоль) і 4-дифенілфосфанілбутил(дифеніл)фосфан (0380 мг, 0,89 ммоль). Із колби викачували повітря і її знову заповнювали азотом (х 3), потім додавали THF (75 мл) і реакційну суміш перемішували за кімнатної температури протягом 30 хв. Додавали по краплях розчин [5-(3-хлор-6-фтор-2-вініл-феніл)-1,3-диметил-6-оксо-піридазин-4-іл]-2-метилпропаноату [одержаного, як описано в прикладі 4] (6,7 г, 17,8 ммоль) у THF і суміш перемішували протягом 10 хв. із наступним додаванням по краплях 4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-діоксаборолану (3,02 мл, 20,8 ммоль). Реакційну суміш перемішували при 60°C протягом ночі.

20 Через 24 год. забезпечували охолодження реакційної суміші до кімнатної температури, потім її концентрували in vacuo. Неочищений продукт очищали за допомогою колонкової хроматографії на силікагелі з градієнтним елюванням сумішшю циклогексан/етилацетат з одержанням [5-[3-хлор-6-фтор-2-[2-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-діоксаборолан-2-іл)етил]феніл]-1,3-диметил-6-оксо-піридазин-4-іл]-2-метилпропаноату (4,50 г, вихід 51 %) у вигляді жовтої твердої речовини.



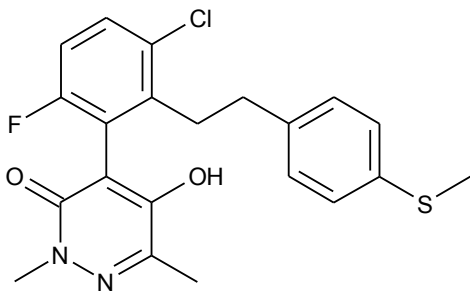
30 ^1H ЯМР (500 МГц, хлороформ) δ = 7,35 (dd, $J=5,2, 8,9$ Гц, 1H), 6,90 (t, $J=8,6$ Гц, 1H), 3,81 (s, 3H), 2,59 (t, $J=8,5$ Гц, 2H), 2,53 (spt, $J=7,0$ Гц, 1H), 2,24 (s, 3H), 1,32-1,16 (m, 12H), 1,08-1,00 (m, 2H), 0,98 (d, $J=7,0$ Гц, 3H), 0,94 (d, $J=7,0$ Гц, 3H).

6.2. 4-[3-Хлор-6-фтор-2-[2-(4-метилсульфанілфеніл)етил]феніл]-5-гідрокси-2,6-диметил-піридазин-3-он (А-1.039)

35 [5-[3-Хлор-6-фтор-2-[2-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-діоксаборолан-2-іл)етил]феніл]-1,3-диметил-6-оксо-піридазин-4-іл]-2-метилпропаноат (100 мг, 0,20 ммоль), 1-бром-4-метилсульфаніл-бензол (62 мг, 0,30 ммоль), хлор(2-дициклогексилфосфіно-2'',6'-діізопропокси-1,1'-біфеніл)[2-(2'-аміно-1,1'-біфеніл)]паладій(II) (24 мг, 0,03 ммоль), K_2CO_3 (84 мг, 0,61 ммоль), 1,4-діоксан (2 мл) і воду (0,2 мл) об'єднували у флаконі для мікрохвильової обробки об'ємом 5 мл. Потім реакційну суміш нагрівали при 140°C протягом 90 хвилин в умовах мікрохвильового опромінення.

40 Забезпечували охолодження реакційної суміші до кімнатної температури, потім розбавляли водою (10 мл), підкислювали до pH ~3 за допомогою 2 M HCl та екстрагували за допомогою DCM (4x). Об'єднані органічні речовини концентрували in vacuo з одержанням неочищеного

продукту, який очищали за допомогою мас-направленої HPLC з оберненою фазою з одержанням 4-[3-хлор-6-фтор-2-[2-(4-метилсульфанілфеніл)етил]феніл]-5-гідрокси-2,6-диметил-піридазин-3-ону у вигляді білої твердої речовини (22 мг, вихід 22 %, А-1.039).

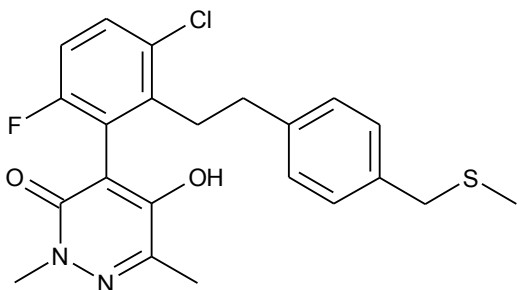


5

^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).

Приклад 7. Одержання 4-[3-хлор-6-фтор-2-[2-[4-(метилсульфанілметил)феніл]етил]феніл]-5-гідрокси-2,6-диметил-піридазин-3-ону (А-1.388)

10



7.1. 4-[3-Хлор-6-фтор-2-[(E)-2-[4-(метилсульфанілметил)феніл]вініл]феніл]-5-гідрокси-2,6-диметил-піридазин-3-он

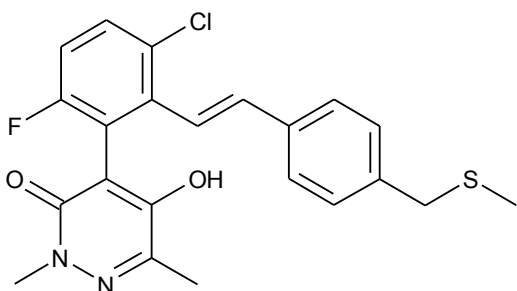
15

[5-[3-Хлор-6-фтор-2-[(E)-2-(6-метил-4,8-діоксо-1,3,6,2-діоксазаборокан-2-іл)вініл]феніл]-1,3-диметил-6-оксо-піридазин-4-іл]-2-метилпропаноат (500 мг, 0,96 ммоль), 1-бром-4-(метилсульфанілметил)бензол (324 мг, 1,44 ммоль), комплекс 1,1-біс(дифенілфосфіно)фероцен]дихлорпаладію(II) і дихлорметану $[\text{PdCl}_2(\text{dppf})\cdot\text{DCM}]$ (41 мг, 0,05 ммоль) і КАРБОНАТ КАЛІЮ (417 мг, 2,89 ммоль) додавали у флакон для мікрохвильової обробки об'ємом 10-20 мл в атмосфері азоту. Додавали дегазований ацетонітрил (11,5 мл) і воду (2,9 мл) і суміш нагрівали до 150°C протягом 20 хв. в умовах мікрохвильового опромінення.

20

Реакційну суміш концентрували до сухого стану. Залишок оброблювали водою (20 мл) і водну фазу підкислювали до pH 3 шляхом додавання 2 М HCl, що зумовлювало утворення осаду. Додавали DCM (20 мл) для поглинання осаду. Додавали сольовий розчин (20 мл) і фази розділяли. Водну фазу екстрагували двома додатковими порціями DCM, потім об'єднані органічні екстракти висушували і концентрували безпосередньо на діоксид кремнію. Неочищений матеріал очищали за допомогою автоматизованої системи флеш-хроматографії на силікагелі з градієнтним елюванням сумішшю циклогексан/етилацетат з одержанням 4-[3-хлор-6-фтор-2-[(E)-2-[4-(метилсульфанілметил)феніл]вініл]феніл]-5-гідрокси-2,6-диметил-піридазин-3-ону (341 мг, вихід 82 %) у вигляді брудно-білої твердої речовини.

30

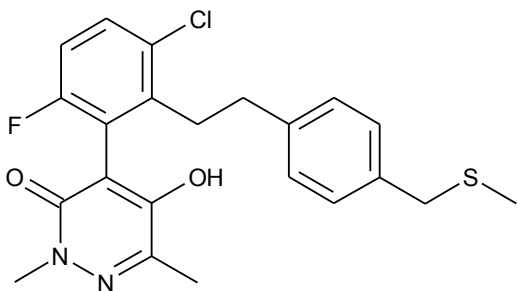


¹H ЯМР (500 МГц, DMSO-d₆) δ = 10,78 (br s, 1H), 7,60 (dd, J=5,2, 8,7 Гц, 1H), 7,30-7,24 (m, 5H), 6,93 (d, J=16,5 Гц, 1H), 6,56 (d, J=16,5 Гц, 1H), 3,67 (s, 2H), 3,54 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 1,94 (s, 3H)

7.2. 4-[3-Хлор-6-фтор-2-[2-[4-(метилсульфанілметил)феніл]етил]феніл]-5-гідрокси-2,6-диметил-піридазин-3-он (А-1.388)

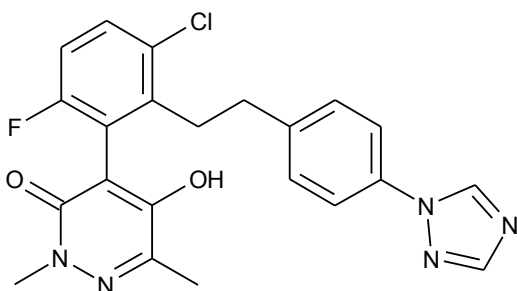
До розчину 4-[3-хлор-6-фтор-2-[(Е)-2-[4-(метилсульфанілметил)феніл]вініл]феніл]-5-гідрокси-2,6-диметил-піридазин-3-ону (335 мг, 0,78 ммоль) у тетрагідрофурані (12 мл) в атмосфері азоту додавали N, N-діізопропілетиламін (1,08 мл, 6,20 ммоль). Перемішувану реакційну суміш нагрівали до 70 °С і додавали порціями 2,4,6-триізопропілбензолсульфонілгідразид (2,06 г, 6,21 ммоль) протягом 6 год., потім суміш нагрівали до температури утворення флегми протягом 16 год. До реакційної суміші додавали додаткову кількість N, N-діізопропілетиламіну (0,68 мл, 3,89 ммоль), потім 2,4,6-триізопропілбензолсульфонілгідразид (1,29 г, 3,89 ммоль) і суміш нагрівали до температури утворення флегми протягом додаткових 6 год.

Забезпечували охолодження реакційної суміші до кімнатної температури, потім концентрували безпосередньо на діоксид кремнію. Неочищений матеріал частково очищали за допомогою автоматизованої системи флеш-хроматографії на силікагелі з градієнтним елюванням сумішшю циклогексан/етилацетат. Одержаний матеріал додатково очищали за допомогою мас-спрямованої HPLC з оберненою фазою з одержанням 4-[3-хлор-6-фтор-2-[2-[4-(метилсульфанілметил)феніл]етил]феніл]-5-гідрокси-2,6-диметил-піридазин-3-ону у вигляді білої твердої речовини (208 мг, вихід 62 %, А-1.388).



¹H ЯМР (400 МГц, d₆-DMSO), δ = 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)

Приклад 8. 4-[3-Хлор-6-фтор-2-[2-[4-(1,2,4-триазол-1-іл)феніл]етил]феніл]-5-гідрокси-2,6-диметил-піридазин-3-он (А-1.385)



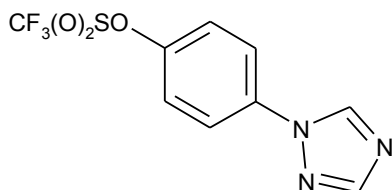
8.1. [4-(1,2,4-Триазол-1-іл)феніл]трифторметансульфонат

4-(1,2,4-Триазол-1-іл)фенол (1,22 г, 7,57 ммоль) розчиняли в дихлорметані (10 мл) в атмосфері азоту та охолоджували до ~0 °С. Додавали по краплях розчин піридину (1,22 мл, 15,1 ммоль) у дихлорметані (5 мл) протягом ~2 хвилин. Суміш перемішували 5 хвилин, потім додавали по краплях розчин трифторметансульфонового ангідриду (1,53 мл, 9,08 ммоль) у дихлорметані (5 мл) протягом ~2 хвилин. Охолодження припиняли і забезпечували нагрівання реакційної суміші до кімнатної температури, потім перемішували за кімнатної температури протягом 16 год.

Реакційну суміш гасили шляхом додавання 2 М водн. розчину HCl (20 мл), потім органічну фазу відокремлювали. Водну фазу додатково екстрагували дихлорметаном (2 × 20 мл). Об'єднані органічні речовини промивали водою (20 мл), висушували, потім концентрували за

зниженого тиску з одержанням твердої речовини кремового кольору. Неочищений матеріал очищали за допомогою автоматизованої системи флеш-хроматографії на діоксиді кремнію з градієнтним елюванням сумішшю циклогексан/етилацетат з одержанням [4-(1,2,4-триазол-1-іл)феніл]трифторметансульфонату у вигляді білої твердої речовини (2,02 г, вихід 91 %).

5



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).

10 8.2. [5-[3-Хлор-6-фтор-2-[(E)-2-[4-(1,2,4-триазол-1-іл)феніл]вініл]феніл]-1,3-диметил-6-оксо-піридазин-4-іл]-2-метилпропаноат

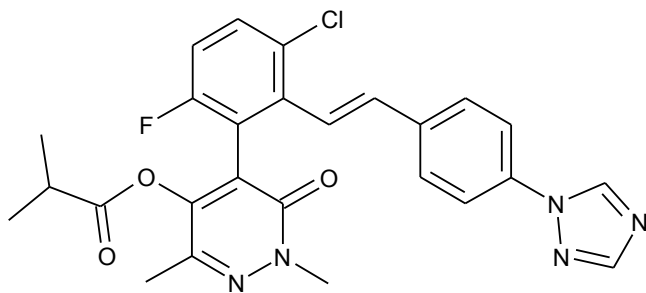
[5-[3-Хлор-6-фтор-2-[(E)-2-(6-метил-4,8-діоксо-1,3,6,2-діоксазаборокан-2-іл)вініл]феніл]-1,3-диметил-6-оксо-піридазин-4-іл]-2-метилпропаноат (500 мг, 0,96 ммоль), комплекс 1,1-біс(дифенілфосфіно)фероцен]дихлорпаладію(II) і дихлорметану [PdCl₂(dppf).DCM] (39 мг, 0,048 ммоль), [4-(1,2,4-триазол-1-іл)феніл]трифторметансульфонат (367 мг, 1,25 ммоль) і фосфат калію (834 мг, 3,85 ммоль) додавали у флакон для мікрохвильової обробки об'ємом 10-20 мл.

Додавали тетрагідрофуран (10 мл) і воду (0,5 мл), потім реакційну суміш дегазували шляхом перемішування під вакуумом, потім знову заповнювали азотом (ХЗ). Реакційну суміш нагрівали в мікрохвильовому реакторі при 120 °С протягом 60 хв. в умовах мікрохвильового опромінення.

20 Реакційну суміш фільтрували через шар Celite®, промиваючи за допомогою EtOAc і EtOH. Фільтрат концентрували за зниженого тиску з одержанням коричневої смоли (840 мг). Неочищений матеріал очищали за допомогою автоматизованої системи флеш-хроматографії на силікагелі з градієнтним елюванням сумішшю циклогексан/етилацетат з одержанням блідо-жовтої смоли (389 мг). Очищений матеріал розчиняли в ацетонітрилі (10 мл) і оброблювали тіоловою (SH) смолою, що поглинає метал, SiliCycle SiliaMetS® (365 мг) за кімнатної температури. Суспензію перемішували за кімнатної температури протягом 3 год., потім фільтрували з видаленням смоли, промиваючи додатковою кількістю ацетонітрилу. Фільтрат концентрували in vacuo з одержанням [5-[3-хлор-6-фтор-2-[(E)-2-[4-(1,2,4-триазол-1-іл)феніл]вініл]феніл]-1,3-диметил-6-оксо-піридазин-4-іл]-2-метилпропаноату у вигляді безбарвної смоли (361 мг, вихід 73 %).

25

30



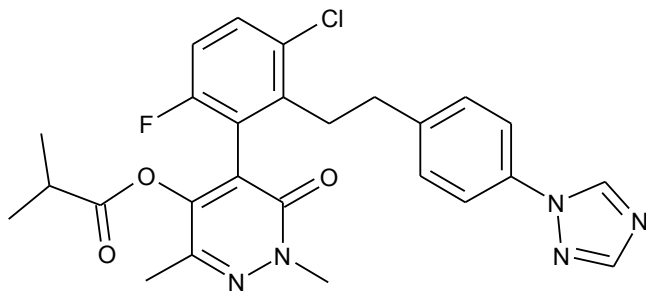
35 ¹H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ ppm 8,55 (s, 1H), 8,11 (s, 1H), 7,60-7,66 (m, 2H), 7,42-7,53 (m, 3H), 7,01-7,10 (m, 2H), 6,69 (d, J=16,5 Гц, 1H), 3,70 (s, 3H), 2,66 (spt, J=7,0 Гц, 1H), 2,23 (s, 3H), 1,11 (d, J=7,0 Гц, 1H), 1,08 (d, J=7,1 Гц, 1H)

8.3. [5-[3-Хлор-6-фтор-2-[2-[4-(1,2,4-триазол-1-іл)феніл]етил]феніл]-1,3-диметил-6-оксо-піридазин-4-іл]-2-метилпропаноат (A-3.385)

40 [5-[3-Хлор-6-фтор-2-[(E)-2-[4-(1,2,4-триазол-1-іл)феніл]вініл]феніл]-1,3-диметил-6-оксо-піридазин-4-іл]-2-метилпропаноат (365 мг, 0,72 ммоль) піддавали каталітичній гідрогенізації в EtOAc (10 мл) у присутності каталізатора 5 % Pd/C (вологість 50 %) (0,15 г) за тиску H₂ 3 бари протягом 24 год.

45 Реакційну суміш фільтрували через шар Celite®, промиваючи етилацетатом. Фільтрат концентрували in vacuo з одержанням неочищеного залишку (350 мг), який адсорбували на діоксид кремнію та очищали за допомогою автоматизованої системи флеш-хроматографії на

силікагелі з градієнтним елюванням сумішшю циклогексан/етилацетат. [5-[3-Хлор-6-фтор-2-[2-[4-(1,2,4-триазол-1-іл)феніл]етил]феніл]-1,3-диметил-6-оксо-піридазин-4-іл]-2-метилпропаноат (А-3.385) одержували у вигляді безбарвної смоли (321 мг, вихід 88 %).



5

^1H ЯМР (400 МГц, хлороформ) δ = 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)

10

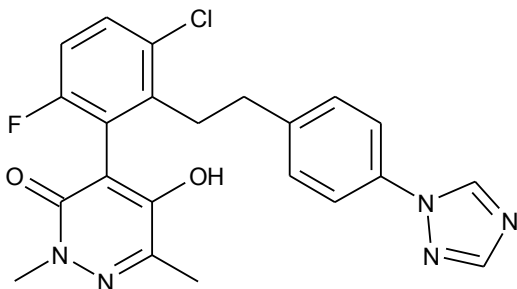
8.4. 4-[3-Хлор-6-фтор-2-[2-[4-(1,2,4-триазол-1-іл)феніл]етил]феніл]-5-гідрокси-2,6-диметил-піридазин-3-он (А-1.385)
[5-[3-Хлор-6-фтор-2-[2-[4-(1,2,4-триазол-1-іл)феніл]етил]феніл]-1,3-диметил-6-оксо-піридазин-4-іл]-2-метилпропаноат (320 мг, 0,63 ммоль) перемішували в етанолі (5 мл) за кімнатної температури.

15

Додавали по краплях розчин моногідрату гідроксиду літію (81 мг, 1,88 ммоль) у воді (2 мл) і реакційну суміш перемішували за кімнатної температури протягом 1 год.

Розчинник, що являє собою етанол, видаляли за зниженого тиску, потім залишок розбавляли водою (20 мл). Водну фазу підкислювали до $\sim\text{pH}$ 3-4 шляхом додавання 2М HCl (водн.), потім екстрагували за допомогою EtOAc (3 $\times$ 10 мл). Об'єднані органічні екстракти концентрували за зниженого тиску з одержанням білої твердої речовини (292 мг). Неочищений залишок очищали за допомогою автоматизованої системи флеш-хроматографії на діоксиді кремнію з градієнтним елюванням сумішшю циклогексан/етилацетат та етилацетат/етанол з одержанням 4-[3-хлор-6-фтор-2-[2-[4-(1,2,4-триазол-1-іл)феніл]етил]феніл]-5-гідрокси-2,6-диметил-піридазин-3-ону (А-1.365) у вигляді білої твердої речовини (260 мг, вихід 94 %).

25



^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)

30

Приклад 9. 4-[3-Циклопропіл-6-фтор-2-[2-(2-фтор-4-піридил)етил]феніл]-5-гідрокси-2,6-диметил-піридазин-3-он (С-1.013)

[5-[3-Хлор-6-фтор-2-[2-(2-фтор-4-піридил)етил]феніл]-1,3-диметил-6-оксо-піридазин-4-іл]-2-метилпропаноат (250 мг, 0,54 ммоль), моногідрат фосфату трикалію (374 мг, 1,62 ммоль) і RuPhos Pd G2 (42 мг, 0,05 ммоль) завантажували у флакон для мікрохвильової обробки об'ємом 2-5 мл, оснащений якорем магнітної мішалки. Із реакційної посудини відкачували повітря і її знову заповнювали азотом (ХЗ). Додавали 1,4-діоксан (4 мл), потім циклопропілборонову кислоту (139 мг, 1,62 ммоль) і воду (1 мл) (обидва розчинника дегазували). Потім суміш нагрівали до 120 $^{\circ}\text{C}$ протягом 1 год. в умовах мікрохвильового опромінення.

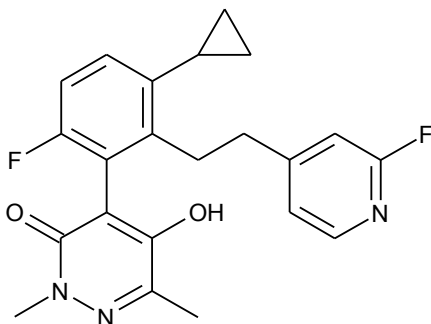
35

Реакційну суміш охолоджували до кімнатної температури, потім додавали додаткову кількість циклопропілборонової кислоти (139 мг, 1,62 ммоль) і RuPhos Pd G2 (42 мг, 0,05 ммоль) і реакційну суміш нагрівали до 120 $^{\circ}\text{C}$ протягом ще 2,5 годин.

40

Реакційну суміш концентрували in vacuo з видаленням діоксану. Залишок розбавляли водою (20 мл) і DCM (20 мл) і шари розділяли. Водну фазу екстрагували додатковими порціями DCM (3 × 5 мл), потім об'єднані органічні екстракти висушували і концентрували з одержанням твердої речовини темного кольору (331 мг).

- 5 Неочищений залишок очищали за допомогою мас-спрямованої HPLC з оберненою фазою з одержанням 4-[3-циклопропіл-6-фтор-2-[2-(2-фтор-4-піридил)етил]феніл]-5-гідрокси-2,6-диметил-піридазин-3-ону (C-1.013) у вигляді білої твердої речовини.



10

^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)

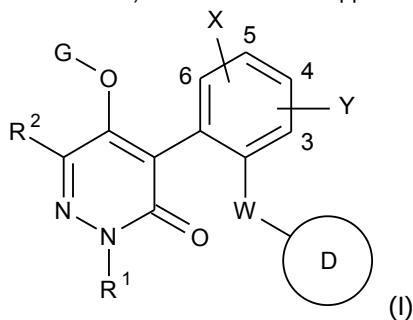
15

Сполуки 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. 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 та A-1,392 одержували із застосуванням загальних способів, описаних вище. У таблиці 4 нижче показана структура цих сполук і дані ЯМР, що характеризують їх.

20

Таблиця 4

Приклади одержання сполук формули (I). Система нумерації, використовувана для опису положень X та Y, показана лише для ясності.



Сполука	R ¹	R ²	G	X	Y	W	D	Докладні дані ЯМР
A-1,023	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-Оксазол-5-ілфеніл-	^1H 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).

Таблиця 4 (продовження)

Сполука	R ¹	R ²	G	X	Y	W	D	Докладні дані ЯМР
A-1,024	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-Ацетамідофеніл-	¹ H ЯМР (400 МГц, метанол) д = 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-(Диметилсульфам оїл)феніл-	¹ H ЯМР (500 МГц, DMSO-d6) д = 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)
A-1,026	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-трет-Бутилфеніл-	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) д = 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-Біфеніл-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) д = 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)

Таблиця 4 (продовження)

Сполука	R ¹	R ²	G	X	Y	W	D	Докладні дані ЯМР
A-1,028	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4- [Етил(метил)карба моїл]-3-фтор- феніл-	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO-d6) д = 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-Ціанофеніл-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) д = 7,51-7,44 (m, 2H), 7,33-7,24 (m, 3H+CHCl3 пік), 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-Ціанофеніл-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) д = 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).

Таблиця 4 (продовження)

Сполука	R ¹	R ²	G	X	Y	W	D	Докладні дані ЯМР
A-1,031	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-Аміно-3-метилфеніл-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) д 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-Метилсульфонілфеніл-	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) д = 10,86 (br s, 1H), 7,81 (що здається. d, J=8,3 Гц, 2H), 7,56 (dd, J=5,2, 8,6 Гц, 1H), 7,29 (що здається. 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-Диметиламінофеніл-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) д 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)

Таблиця 4 (продовження)

Сполука	R ¹	R ²	G	X	Y	W	D	Докладні дані ЯМР
A-1,034	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-Метиламінофеніл-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) д 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-Бутоксифеніл-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) д = 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-Ціанофеніл-	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) д 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)
A-1,037	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-Гідроксифеніл-	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) д = 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)

Таблиця 4 (продовження)

Сполука	R ¹	R ²	G	X	Y	W	D	Докладні дані ЯМР
A-1,038	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-Циклопропілфеніл-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) д = 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-(Метилсульфаніл) феніл-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) д = 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-Карбоксифеніл-	¹ H ЯМР (400 МГц, метанол) д = 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)

Таблиця 4 (продовження)

Сполука	R ¹	R ²	G	X	Y	W	D	Докладні дані ЯМР
A-1,041	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-Метоксикарбонілфеніл-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) д = 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)
A-1,042	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-(трет-Бутоксикарбоніламіно)-3-фтор-феніл-	¹ H ЯМР (400 МГц, метанол) д = 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-(Метилсульфаніл)-4-піридил-	¹ H ЯМР (500 МГц, хлороформ) д 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)

Таблиця 4 (продовження)

Сполука	R ¹	R ²	G	X	Y	W	D	Докладні дані ЯМР
A-1,044	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	2-Ацетамідо-4-піридил-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) д 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-Біфеніл-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) д = 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-Ціанофеніл-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) д = 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).
A-2,037	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	(E) -CH=CH-	4-Гідроксифеніл-	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) д = 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)

Таблиця 4 (продовження)

Сполука	R ¹	R ²	G	X	Y	W	D	Докладні дані ЯМР
A-3,028	-Me	-Me	- (C=O)i Pr	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4- [Етил(метил)карба моїл]-3-фтор- феніл-	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)
A-3,029	-Me	-Me	- (C=O)i Pr	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	2-Ціанофеніл-	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 пік), 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).

Таблиця 4 (продовження)

Сполука	R ¹	R ²	G	X	Y	W	D	Докладні дані ЯМР
A-3,030	-Me	-Me	- (C=O)i Pr	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	3-Ціанофеніл-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) д = 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)i Pr	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-трет- Бутоксифеніл-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) д = 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)i Pr	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-Ціанофеніл-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) д = 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)

Таблиця 4 (продовження)

Сполука	R ¹	R ²	G	X	Y	W	D	Докладні дані ЯМР
A-3,038	-Me	-Me	- (C=O)i Pr	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4- Циклопропілфеніл-	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)
A-4,029	-Me	-Me	- (C=O)i Pr	6-F	3-Cl	(E) -CH=CH-	2-Ціанофеніл-	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).

Таблиця 4 (продовження)

Сполука	R ¹	R ²	G	X	Y	W	D	Докладні дані ЯМР
A-4,030	-Me	-Me	- (C=O)i Pr	6-F	3-Cl	(E) -CH=CH-	3-Ціанофеніл-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) д = 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)i Pr	6-F	3-Cl	(E) -CH=CH-	4-трет- Бутоксифеніл-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) д = 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)i Pr	6-F	3-Cl	(E) -CH=CH-	4-Ціанофеніл-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) д = 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)

Таблиця 4 (продовження)

Сполука	R ¹	R ²	G	X	Y	W	D	Докладні дані ЯМР
A-1,373	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-(1-Метилпіразол-3-іл)феніл-	¹ H ЯМР (400 МГц, метанол) д ppm 7,62 (d, J=8,3 Гц, 2H), 7,57 (d, J=2,3 Гц, 1 H) 7,48-7,54 (m, 1H), 7,07-7,17 (m, 1H), 7,03 (d, J=8,3 Гц, 2 H), 6,56 (d, J=2,3 Гц, 1 H), 3,91 (s, 3 H,) 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-іл)феніл-	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) д 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-Морфолінофеніл-	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) д 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)

Таблиця 4 (продовження)

Сполука	R ¹	R ²	G	X	Y	W	D	Докладні дані ЯМР
A-1,376	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-(3-Метилпіразол-1-іл)феніл-	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) д = 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-Диметилпіразол-1-іл)феніл-	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) д = 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)
A-1,378	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-Піразол-1-ілфеніл-	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) д = 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)

Таблиця 4 (продовження)

Сполука	R ¹	R ²	G	X	Y	W	D	Докладні дані ЯМР
A-1,379	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-Пірол-1-ілфеніл-	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) д = 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-Метилтетрагідрофуран-2-іл)феніл-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) д = 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)феніл-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) д 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)

Таблиця 4 (продовження)

Сполука	R ¹	R ²	G	X	Y	W	D	Докладні дані ЯМР
A-1,382	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-Оксазол-2-ілфеніл-	¹ H ЯМР (400 МГц, хлороформ) д 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-Метилтіазол-4-іл)феніл-	¹ H ЯМР (400 МГц, метанол) д 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-Тієніл)феніл-	¹ H ЯМР (400 МГц, метанол) д 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)

Таблиця 4 (продовження)

Сполука	R ¹	R ²	G	X	Y	W	D	Докладні дані ЯМР
A-1,386	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	1-Феніл-4-піразоліл-	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) д 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-Циклопропіл-4-піразоліл-	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) д = 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)
A-1,389	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-(Ізопропілсульфанілметил)феніл-	¹ H ЯМР (400 МГц, d ₆ -DMSO), д 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)

Таблиця 4 (продовження)

Сполука	R ¹	R ²	G	X	Y	W	D	Докладні дані ЯМР
A-1,390	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -CH ₂ -	4-(Метилсульфамойл)феніл-	¹ H ЯМР (500 МГц, хлороформ) д 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-Сульфамойлфеніл-	¹ H ЯМР (500 МГц, хлороформ) д 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-Карбамоїлфеніл-	¹ H ЯМР (400 МГц, DMSO-d ₆) д 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 Післясходова ефективність - тест 1

- Насіння ряду тестованих видів висівали в стандартний ґрунт у горщиках:- *Solanum nigrum* (SOLNI), *Amaranthus retroflexus* (AMARE), *Setaria faberi* (SETFA), *Echinochloa crus-galli* (ECHCG), *Ipomoea hederacea* (IPOHE), *Lolium perenne* (LOLPE). Після культивування протягом 8 днів (після появи сходів) за контрольованих умов у теплиці (при 24/16 °С, день/ніч; 14-годинний світловий період; вологість 65 %) рослини обприскували водним розчином для обприскування, одержаним зі складу на основі технічного активного інгредієнта в розчині ацетон/вода (50:50), що містить 0,5 % Tween 20 (поліоксиетиленсорбітанмонолаурат, реєстр. № згідно з CAS 9005-64-5). Сполуки застосовували з розрахунку 1000 г/га. Потім тестовані рослини вирощували в теплиці у контрольованих тепличних умовах (при 24/16 °С, день/ніч; 14-годинний світловий період; вологість 65 %) та поливали двічі на добу. Через 13 днів у тесті проводили оцінку пошкодження, вираженого у відсотках, яке було завдане рослині. Значення біологічної активності визначали за п'ятибальною шкалою (5=80-100 %; 4=60-79 %; 3=40-59 %; 2=20-39 %;

1=0-19 %). Відсутність значення в таблиці вказує на те, що сполуку не тестували щодо даного виду.

Таблиця 5

Контроль деяких видів бур'янів за допомогою сполук формули (I) після післясходового застосування

Сполука	AMARE	SOLNI	SETFA	LOLPE	ECHCG	IPOHE
A-1,036	5	5	5	5	5	5

5 B2 Післясходова ефективність - тест 2

Насіння ряду тестованих видів висівали в стандартний ґрунт у горщиках: - *Solanum nigrum* (SOLNI), *Amaranthus retroflexus* (AMARE), *Setaria faberi* (SETFA), *Echinochloa crus-galli* (ECHCG), *Ipomoea hederacea* (IPOHE), *Lolium perenne* (LOLPE). Після культивування протягом 8 днів (після появи сходів) за контрольованих умов у теплиці (при 24/16 °С, день/ніч; 14-годинний світловий період; вологість 65 %) рослини обприскували водним розчином для обприскування, одержаним зі складу на основі технічного активного інгредієнта в розчині ацетон/вода (50:50), що містить 0,5 % Tween 20 (поліоксиетиленсорбітанмонолаурат, реєстр. № згідно з CAS 9005-64-5). Сполуки застосовували з розрахунку 250 г/га. Потім тестовані рослини вирощували в теплиці у контрольованих тепличних умовах (при 24/16 °С, день/ніч; 14-годинний світловий період; вологість 65 %) та поливали двічі на добу. Через 13 днів у тесті проводили оцінку пошкодження, вираженого у відсотках, яке було завдане рослині. Значення біологічної активності визначали за п'ятибальною шкалою (5=80-100 %; 4=60-79 %; 3=40-59 %; 2=20-39 %; 1=0-19 %). Відсутність значення в таблиці вказує на те, що сполуку не тестували щодо даного виду.

20

Таблиця 6

Контроль деяких видів бур'янів за допомогою сполук формули (I) після післясходового застосування

Сполука	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

Таблиця 6 (продовження)

Сполука	AMARE	SOLNI	SETFA	LOLPE	ECHCG	IPOHE
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 Післясходова ефективність - тест 3

- Насіння ряду тестованих видів висівали в стандартний ґрунт у горщиках: 5 *Amaranthus retroflexus* (AMARE), *Setaria faberi* (SETFA), *Echinochloa crus-galli* (ECHCG), *Ipomoea hederacea* (IPOHE), *Zea Mays* (ZEAMX), *Abutilon theophrasti* (ABUTH). Після культивування протягом 8 днів (після появи сходів) за контрольованих умов у теплиці (при 24/16 °С, день/ніч; 14-годинний світловий період; вологість 65 %) рослини обприскували водним розчином для обприскування, одержаним зі складу на основі технічного активного інгредієнта в розчині ацетон/вода (50:50), 10 що містить 0,5 % Tween 20 (поліоксиетиленсорбітанмонолаурат, реєстр. № згідно з CAS 9005-64-5). Сполуки застосовували з розрахунку 250 г/га. Потім тестовані рослини вирощували в теплиці у контрольованих тепличних умовах (при 24/16 °С, день/ніч; 14-годинний світловий період; вологість 65 %) та поливали двічі на добу. Через 13 днів у тесті проводили оцінку пошкодження, вираженого у відсотках, яке було завдане рослині. Значення біологічної 15 активності визначали за п'ятибальною шкалою (5=80-100 %; 4=60-79 %; 3=40-59 %; 2=20-39 %; 1=0-19 %). Відсутність значення в таблиці вказує на те, що сполуку не тестували щодо даного виду.

Таблиця 7

Контроль деяких видів бур'янів за допомогою сполук формули (I) після післясходового застосування

Сполука	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 Досходова ефективність - тест 1

- Насіння ряду тестованих видів висівали у стандартний ґрунт у горщиках: 20 *Solanum nigrum* (SOLNI), *Amaranthus retroflexus* (AMARE), *Setaria faberi* (SETFA), *Echinochloa crus-galli* (ECHCG), *Ipomoea hederacea* (IPOHE), *Lolium perenne* (LOLPE). Після культивування протягом одного дня (до появи сходів) за контрольованих умов у теплиці (при 24/16°С, день/ніч, 14-годинний світловий період, вологість 65 %) рослини обприскували водним розчином для обприскування, одержаним зі складу технічного активного інгредієнта в розчині ацетон/вода (50:50), що містить 0,5 % Tween 20 (поліоксиетиленсорбітанмонолаурат, реєстр. № згідно з CAS 9005-64-5). 25 Сполуки застосовували з розрахунку 1000 г/га. Потім тестовані рослини вирощували у теплиці

- за контрольованих умов (при 24/16°C, день/ніч, 14-годинний світловий період, вологість 65 %) та поливали двічі на день. Через 13 днів у тесті проводили оцінку пошкодження, вираженого у відсотках, яке було завдане рослині. Значення біологічної активності визначали за п'ятибальною шкалою (5=80-100 %; 4=60-79 %; 3=40-59 %; 2=20-39 %; 1=0-19 %). Відсутність значення в таблиці вказує на те, що сполуку не тестували щодо даного виду.

Таблиця 8

Контроль деяких видів бур'янів за допомогою сполук формули (I) після досхового застосування

Сполука	AMARE	SOLNI	SETFA	LOLPE	ECHCG	IPOHE
A-1,036	5	5	5	5	5	5

B5 Досходова ефективність - тест 2

- Насіння ряду тестованих видів висівали у стандартний ґрунт у горщиках: *Solanum nigrum* (SOLNI), *Amaranthus retroflexus* (AMARE), *Setaria faberi* (SETFA), *Echinochloa crus-galli* (ECHCG), *Ipomoea hederacea* (IPOHE), *Lolium perenne* (LOLPE). Після культивування протягом одного дня (до появи сходів) за контрольованих умов у теплиці (при 24/16°C, день/ніч, 14-годинний світловий період, вологість 65 %) рослини обприскували водним розчином для обприскування, одержаним зі складу технічного активного інгредієнта в розчині ацетон/вода (50:50), що містить 0,5 % Tween 20 (поліоксиетиленсорбітанмонолаурат, реєстр. № згідно з CAS 9005-64-5). Сполуки застосовували з розрахунку 250 г/га. Потім тестовані рослини вирощували у теплиці за контрольованих умов (при 24/16°C, день/ніч, 14-годинний світловий період, вологість 65 %) та поливали двічі на день. Через 13 днів у тесті проводили оцінку пошкодження, вираженого у відсотках, яке було завдане рослині. Значення біологічної активності визначали за п'ятибальною шкалою (5=80-100 %; 4=60-79 %; 3=40-59 %; 2=20-39 %; 1=0-19 %). Відсутність значення в таблиці вказує на те, що сполуку не тестували щодо даного виду.

Таблиця 9

Контроль деяких видів бур'янів за допомогою сполук формули (I) після досхового застосування

Сполука	AMARE	SOLNI	SETFA	LOLPE	ECHCG	IPOHE
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

Таблиця 9 (продовження)

Сполука	AMARE	SOLNI	SETFA	LOLPE	ECHCG	IPOHE
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 Ефективність до появи сходів - тест 3

- Насіння ряду тестованих видів висівали у стандартний ґрунт у горщиках: *Amaranthus retroflexus* (AMARE), *Setaria faberi* (SETFA), *Echinochloa crus-galli* (ECHCG), *Ipomoea hederacea* (IPOHE), *Zea Mays* (ZEAMX), *Abutilon theophrasti* (ABUTH). Після культивування протягом одного дня (до появи сходів) за контрольованих умов у теплиці (при 24/16°C, день/ніч, 14-годинний світловий період, вологість 65 %) рослини обприскували водним розчином для обприскування, одержаним зі складу технічного активного інгредієнта в розчині ацетон/вода (50:50), що містить 0,5 % Tween 20 (поліоксиетиленсорбітанмонолаурат, реєстр. № згідно з CAS 9005-64-5).
- Сполуки застосовували з розрахунку 250 г/га. Потім тестовані рослини вирощували у теплиці за контрольованих умов (при 24/16°C, день/ніч, 14-годинний світловий період, вологість 65 %) та поливали двічі на день. Через 13 днів у тесті проводили оцінку пошкодження, вираженого у відсотках, яке було завдане рослині. Значення біологічної активності визначали за п'ятибальною шкалою (5=80-100 %; 4=60-79 %; 3=40-59 %; 2=20-39 %; 1=0-19 %). Відсутність значення в таблиці вказує на те, що сполуку не тестували щодо даного виду.

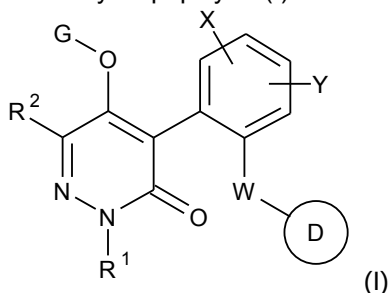
Таблиця 10

Контроль деяких видів бур'янів за допомогою сполук формули (I) після досходового застосування

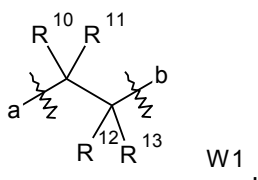
Сполука	AMARE	ZEAMX	SETFA	ABUTH	ECHCG	IPOHE
A-1,380	5	2	1	4	0	4
A-1,381	3	1	0	1	0	3
A-1,382	5	4	5	4	5	5
A-3,386	5	5	5	5	5	5
C-1,013	5	4	5	5	5	5
A-1,386	2	2	5	2	5	4
A-1,387	5	4	5	4	5	5
A-1,388	5	4	5	5	5	5
A-1,389	5	4	5	3	5	5
A-1,390	5	1	5	5		5
A-1,391	5	0	5	2		2
A-1,392	5	2	5	5	5	5

ФОРМУЛА ВИНАХОДУ

1. Сполука формули (I)



- або її сіль, або N-оксид,
де
R¹ являє собою метил, етил, циклопропіл, пропаргіл або C₁фторалкіл;
R² являє собою хлор, циклопропіл, трифторметил або метил;
G являє собою водень або -C(O)-R³, де R³ являє собою ізопропіл, трет-бутил, метил, етил,
пропаргіл, метокси, етокси або трет-бутокс;
X являє собою фтор, хлор або C₁-галогеналкіл і знаходиться в орто-положенні відносно
піридазинового/піридазиндіонового фрагмента;
Y являє собою водень, хлор, фтор або бром і знаходиться в орто-положенні відносно
фрагмента -W-D;
D являє собою 5- або 6-членне моноциклічне гетероарильне кільце, яке містить 1, 2 або 3
гетероатоми, незалежно вибрані з кисню, азоту і сірки, або заміщене за атомом вуглецю в кільці
щонайменше одним R⁸, вибраним із групи, яка складається з: C₁-C₆галогеналкілкарбоніл-, C₃-
C₆циклоалкілкарбоніл-, -S(O)_m-C₁-C₆галогеналкілу,
-S(O)_m-C₃-C₆циклоалкілу, -O-S(O)₂C₁-C₃алкілу, -C₁-C₃алкіл-S(O)_m-C₁-C₆алкілу, -C₁-C₃алкіл-S(O)_m-
C₁-C₆галогеналкілу, -C₁-C₃алкіл-S(O)_m-C₃-C₆циклоалкілу, ціано-C₁-C₆-алкіл-, NR^{4a}R^{5a}, -
C(S)NR^{4a}R^{5a}, -S(O)₂NHC(O)C₁-C₃алкілу, -S(O)₂NR^{4a}R^{5a}, -C(O)OH,
-C(O)OC₁-C₆алкілу, -C(O)NHS-(O)₂C₁-C₆алкілу, -C(O)NR^{4a}R^{5a}, -NR⁴C(O)NR^{4a}R^{5a}, C₁-
C₆алкілкарбоніл(C₁-C₆алкіл)аміно-, C₁-C₆галогеналкілкарбоніламіно-, C₁-
C₆галогеналкілкарбоніл(C₁-C₆алкіл)аміно-, C₁-C₆алкілсульфоніламіно-, C₁-C₆алкілсульфоніл(C₁-
C₆алкіл)аміно-, C₁-C₆галогеналкілсульфоніламіно-, C₁-C₆галогеналкілсульфоніл(C₁-
C₆алкіл)аміно-, C₃-C₆циклоалкілсульфоніламіно-, C₃-C₆циклоалкілсульфоніл(C₁-C₆алкіл)аміно-,
гідроксіаміно-, гідроксі(C₁-C₆алкіл)аміно, C₁-C₆алкоксіаміно, C₁-C₆алкоксі(C₁-C₆алкіл)аміно, C₁-
C₆галогеналкоксіаміно, C₁-C₆галогеналкоксі(C₁-C₆алкіл)аміно; і кільцевої системи, вибраної із
групи, яка складається з: фенільного кільця, 5-6-членного гетероарильного кільця і 3-6-членного
гетероциклічного кільця, де вказана кільцева система заміщена за допомогою 0-5 R¹⁶;
та
будь-який додатковий замісник R⁸ може бути вибраний із групи, яка складається з: гідроксилу,
галогену, ціано, C₁-C₆алкілу, C₁-C₆галогеналкілу, C₃-C₆циклоалкілу, C₁-C₆алкокси, C₂-C₆алкенілу
і C₂-C₆алкінілу; і/або D заміщене за атомом азоту в кільці щонайменше одним R⁹, вибраним із
групи, яка складається з: C₅-C₆алкілу, C₅-C₆галогеналкілу, C₃-C₆-циклоалкілу, C₁-C₃алкоксі-
C₃алкіл-, C₃алкоксі-C₁-C₂алкіл-, C₁-C₃галогеналкоксі-C₁-C₃алкіл-, C₁-C₃алкоксі-C₁-C₃алкоксі-C₁-
C₃алкіл-, C₁-C₆гідроксіалкіл-, -C₁-C₃алкіл-S(O)_m-C₁-C₆алкілу, -C₁-C₃алкіл-S(O)_m-C₁-
C₆галогеналкілу, -C₁-C₃алкіл-S(O)_m-C₃-C₆циклоалкілу, ціано-C₁-C₆-алкіл-, і кільцевої системи,
вибраної із групи, яка складається з: фенільного кільця, 5-6-членного гетероарильного кільця і
3-6-членного гетероциклічного кільця, де вказана кільцева система заміщена за допомогою 0-5
R¹⁶;
кожний з R⁴ і R⁵, незалежно, являє собою водень, C₁-C₃алкіл, C₁-C₃алкокси або C₃-C₆циклоалкіл;
m дорівнює цілому числу 0, 1 або 2 (переважно 0 або 2);
кожний з R^{4a} і R^{5a}, незалежно, вибраний із групи, яка складається з C₁-C₆алкокси і C₃-
C₆циклоалкілу, або R^{4a} і R^{5a} разом можуть утворювати морфолінільне кільце; і
кожний R¹⁶, незалежно, являє собою галоген, ціано, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галогеналкіл, C₁-C₆алкокси
або C₁-C₆галогеналкокси;
або D являє собою фенільне кільце, заміщене щонайменше одним R⁸;
W являє собою



де:

"a" означає точку приєднання до фенілпіридазиндіонового/фенілпіридазинонового фрагмента, "b" означає точку приєднання до кільця D; і

5 всі з R^{10} , R^{11} , R^{12} і R^{13} являють собою водень.

2. Сполука за п. 1, де X являє собою фтор і знаходиться в орто-положенні відносно піридазинонового/піридазиндіонового фрагмента.

3. Сполука за п. 1, де Y являє собою хлор і знаходиться в орто-положенні відносно фрагмента - W-D.

10 4. Сполука за п. 1, де R^1 являє собою метил.

5. Сполука за п. 1, де R^2 являє собою метил.

6. Сполука за п. 1, де D являє собою 5- або 6-членне моноциклічне гетероарильне кільце, яке містить 1, 2 або 3 гетероатоми, незалежно вибрані з кисню, азоту і сірки.

7. Сполука за п. 1, де D являє собою фенільне кільце, заміщене щонайменше одним R^8 .

15 8. Гербіцидна композиція, яка містить гербіцидну сполуку за п. 1 і прийнятний із погляду сільського господарства допоміжний засіб для складання.

9. Гербіцидна композиція за п. 8, яка додатково містить щонайменше один додатковий пестицид.

20 10. Гербіцидна композиція за п. 9, де додатковий пестицид являє собою гербіцид або антидот гербіциду.

11. Спосіб контролю росту небажаних рослин, відповідно до якого сполуку формули (I) за будь-яким із пп. 1-7 або гербіцидну композицію за будь-яким із пп. 8-10 застосовують щодо небажаних рослин або місця зростання небажаних рослин.