



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(51) МПК

C07D 401/04 (2006.01)

C07C 311/21 (2006.01)

C07C 311/16 (2006.01)

C07C 237/20 (2006.01)

A01N 43/56 (2006.01)

A01N 41/06 (2006.01)

A01P 7/04 (2006.01)

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ

(21), (22) Заявка: 2004107486/04, 13.08.2002

(24) Дата начала отсчета срока действия патента:
13.08.2002(30) Конвенционный приоритет:
15.08.2001 US 60/312,423

(43) Дата публикации заявки: 27.03.2005

(45) Опубликовано: 20.09.2006 Бюл. № 26

(56) Список документов, цитированных в отчете о
поиске: WO 9747589 A1, 18.12.1997. EP 289879
A1, 09.11.1988. US 4565875, 21.01.1986. NL
9202078, 16.06.1994. WO 9803508 A2,
29.01.1998. WO 9605170 A1, 23.02.1996. NL
6603319, 18.09.1967.(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную фазу:
15.03.2004(86) Заявка РСТ:
US 02/26959 (13.08.2002)(87) Публикация РСТ:
WO 03/016300 (27.02.2003)

Адрес для переписки:
129010, Москва, ул. Б.Спасская, 25, стр.3,
ООО "Юридическая фирма Городисский и
Партнеры", пат.пов. Е.Е.Назиной

(72) Автор(ы):

ФИНКЕЛЬСТЕЙН Брюс Лоренс (US),
ЛЭМ Джордж Филип (US),
СЕЛБИ Томас Пол (US),
СТИВЕНСОН Томас Мартин (US)

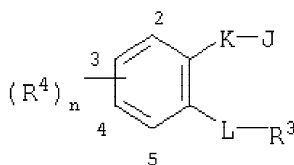
(73) Патентообладатель(и):

Е.И.ДЮПОН ДЕ НЕМУР ЭНД КОМПАНИ (US)

(54) ОРТОЗАМЕЩЕННЫЕ АРИЛАМИДЫ, СПОСОБ БОРЬБЫ С НАСЕКОМЫМИ, КОМПОЗИЦИЯ
ДЛЯ БОРЬБЫ С НАСЕКОМЫМИ, ПРОМЕЖУТОЧНОЕ СОЕДИНЕНИЕ

(57) Реферат:

Описываются орто-замещенные ариламины
формулы I



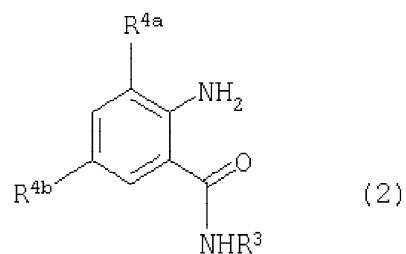
I

где J - фенильное кольцо или пиразольное
кольцо, где каждое кольцо замещено одним-двумя
заместителями, независимо выбранными из R⁵; K
представляет собой -NR¹C(=A)- или -NR¹SO₂-; L

представляют собой -C(=B)NR²-, -SO₂NR²-
или -C(=B)-; A и B представляют собой O;
R¹, R² представляют H; R³ представляет
собой C₁-C₆ алкил, необязательно замещенный
одним или несколькими заместителями,
независимо выбранными из группы, включающей
CN, NO₂, C₁-C₄ алкилсульфонил
и C₂-C₆ алкоксикарбонил; каждый R⁴ независимо
представляет собой C₁-C₆ алкил, галоген или CN;
каждый R⁵ независимо представляет
собой C₁-C₆ галогеналкил, галоген
или C₁-C₄ галогеналкокси; или
каждый R⁵ независимо представляет собой
пиридинил, необязательно замещенный одним

заместителем, независимо выбранным из R^9 , R^9 - галоген, n имеет значение от 1 до 2, при условии, что когда K представляет собой $-NR^1C(=A)-$, тогда L является отличным от $C(=O)NR^2-$, и его соли, способ борьбы с насекомыми и композиция для борьбы с насекомыми, использующие указанные выше соединения. Описывается также соединение формулы (2), являющееся промежуточным соединением для получения соединения формулы

(1).



Технический результат - соединения обладают инсектицидными свойствами, что позволяет использовать их для борьбы с насекомыми. 4 н. и 11 з.п. ф-лы, 21 табл.



FEDERAL SERVICE
FOR INTELLECTUAL PROPERTY,
PATENTS AND TRADEMARKS

(51) Int. Cl.

C07D 401/04 (2006.01)

C07C 311/21 (2006.01)

C07C 311/16 (2006.01)

C07C 237/20 (2006.01)

A01N 43/56 (2006.01)

A01N 41/06 (2006.01)

A01P 7/04 (2006.01)

(12) ABSTRACT OF INVENTION

(21), (22) Application: 2004107486/04, 13.08.2002

(24) Effective date for property rights: 13.08.2002

(30) Priority:
15.08.2001 US 60/312,423

(43) Application published: 27.03.2005

(45) Date of publication: 20.09.2006 Bull. 26

(85) Commencement of national phase: 15.03.2004

(86) PCT application:
US 02/26959 (13.08.2002)(87) PCT publication:
WO 03/016300 (27.02.2003)

Mail address:
129010, Moskva, ul. B.Spasskaja, 25, str.3,
OOO "Juridicheskaja firma Gorodisskij i
Partnery", pat.pov. E.E.Nazinoj

(72) Inventor(s):

FINKEL'STEJN Brjus Lorens (US),
LEhM Dzhordzh Filip (US),
SELBI Tomas Pol (US),
STIVENSON Tomas Martin (US)

(73) Proprietor(s):

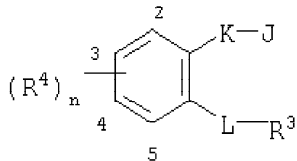
E.I.DJuPON DE NEMUR EhND KOMPANI (US)

(54) ORTHO-SUBSTITUTED ARYLAMIDES, METHOD FOR PEST CONTROLLING, COMPOSITION FOR PEST CONTROLLING, AND INTERMEDIATE

(57) Abstract:

FIELD: organic chemistry, agriculture.

SUBSTANCE: invention relates to ortho-substituted arylamides of formula I, wherein J

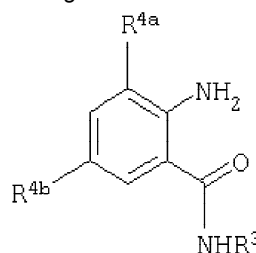


I

represents phenyl ring or pyrazole ring each substituted with one or two substitutes independently selected from R⁵; K represents -NR¹C(=A)- or -NR¹SO₂-; L represents -C(=B)NR²-, -SO₂NR²- or -C(=B)-; A and B represent O; R¹ and R² represent H; R³ represents C₁-C₆-alkyl optionally substituted with one or more substitutes, independently selected from group containing CN, NO₂, C₁-C₄-alkylsulfonyl and C₂-C₆-alkoxycarbonyl; each R⁴ independently represents C₁-C₆-alkyl, halogen or CN;

each R⁵ independently represents C₁-C₆-alkyl, halogen or C₁-C₄-haloalkoxy or pyridinyl optionally substituted with one substitute independently selected from R⁹; wherein R⁹ represents halogen; n = 1-2; with the proviso, that when K represents -NR¹C(=A)- L is not -C(=B)NR²-, and salts thereof, method for insect controlling by using abovementioned compounds. Intermediate for synthesis of target compounds having formula 2

also is



(2)

disclosed.

EFFECT: compounds with insecticide activity, useful in insect controlling.

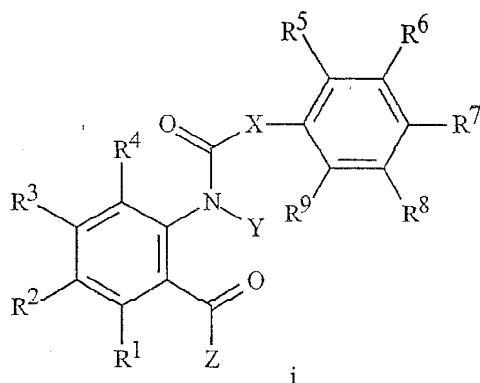
15 cl, 21 tbl, 9 ex

Предпосылки изобретения

Настоящее изобретение относится к некоторым орто-замещенным ариламидам, их N-оксидам, солям и композициям, подходящим для сельскохозяйственного или несельскохозяйственного применения, включая соединения, перечисленные ниже, и к способам их применения для борьбы с беспозвоночными вредителями как в сфере сельского хозяйства, так и в несельскохозяйственной сфере.

Контроль беспозвоночных вредителей чрезвычайно важен для достижения высокой урожайности культур. Вред, наносимый насекомыми-вредителями выращиваемым и хранимым сельскохозяйственным культурам, приводит к значительному снижению продуктивности и, таким образом, к повышению цен для потребителя. Контроль беспозвоночных насекомых-вредителей в таких отраслях как лесоводство, выращивание тепличных культур, декоративных растений, растений, высаживаемых для защиты других культур, хранение пищевых продуктов и продуктов, полученных из волокнистых культур, разведение домашнего скота, домашнее хозяйство, а также здравоохранение и ветеринария, также является важным. Многие продукты являются коммерчески доступными для этих целей, но остается потребность в новых соединениях, являющихся более эффективными, более дешевыми, менее токсичными, экологически более безопасными и с другим типом действия.

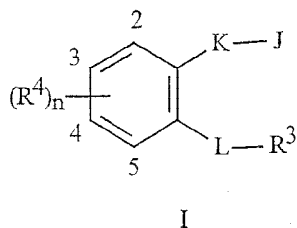
NL 9202078 раскрывает производные N-ацилантраниловой кислоты Формулы I в качестве инсектицидов



где, inter alia, X представляет собой простую связь; Y представляет собой H или C₁-C₆ алкил; Z представляет собой NH₂, NH(C₁-C₃ алкил) или N(C₁-C₃ алкил)₂; и R¹ по R⁹ независимо представляют собой H, галоген, C₁-C₆ алкил, фенил, гидроксигруппу, C₁-C₆ алкокси или C₁-C₇ ацилокси.

Краткое описание изобретения

Настоящее изобретение относится к соединениям Формулы I и к их N-оксидам и солям



где

J представляет собой фенильное кольцо, 5- или 6-членное гетероароматическое кольцо или ароматическое 8-, 9- или 10-членную конденсированную карбобиклическую или гетеробиклическую кольцевую систему, при этом каждое кольцо или кольцевая система замещены одним-четырьмя заместителями, независимо выбранными из R⁵;

K представляет собой -NR¹C(=A)-, -N=C(GR⁶)- или -NR¹SO₂-;

L представляет собой -C(=B)NR²-, -C(GR⁶)=N-, -SO₂NR²-, -C(=B)O- или -C(=B)-;

A и B независимо представляют собой O, S, NR⁸, NOR⁸, NN(R⁸)₂, S=O, N-CN или N-NO₂; каждый G независимо представляет собой O, S или NR⁸;

R¹ представляет собой H; или C₁-C₆ алкил, C₂-C₆ алкенил, C₂-C₆ алкинил или C₃-C₆ циклоалкил, каждый необязательно замещенный одним или несколькими заместителями, независимо выбранными из группы, включающей галоген, CN, NO₂, гидроксиль, C₁-C₄ алкокси,

C₁-C₄ алкилтио, C₁-C₄ алкилсульфинил, C₁-C₄ алкилсульфонил, C₂-C₄ алкоксикарбонил, C₁-C₄ алкиламино, C₂-C₈ диалкиламино и C₃-C₆ циклоалкиламино; или

R¹ представляет собой C₂-C₆ алкилкарбонил, C₂-C₆ алкоксикарбонил, C₂-C₆ алкиламинокарбонил или C₃-C₈ диалкиламинокарбонил;

R² представляет собой H, C₁-C₆ алкил, C₂-C₆ алкенил, C₂-C₆ алкинил, C₃-C₆ циклоалкил, C₁-C₄ алкокси, C₁-C₄ алкиламино, C₂-C₈ диалкиламино, C₃-C₆ циклоалкиламино, C₂-C₆ алкоксикарбонил или

C₂-C₆ алкилкарбонил;

R³ представляет собой H; C₁-C₄ алкокси; C₁-C₄ алкиламино;

C₂-C₈ диалкиламино; C₃-C₆ циклоалкиламино; C₂-C₆ алкоксикарбонил или C₂-C₆ алкилкарбонил; или C₁-C₆ алкил, C₂-C₆ алкенил, C₂-C₆ алкинил

или C₃-C₆ циклоалкил, каждый необязательно замещенный одним или несколькими заместителями, независимо выбранными из группы, включающей галоген, CN, NO₂, гидроксиль, C₁-C₄ алкокси, C₁-C₄ галогеналкокси, C₁-C₄ алкилтио, C₁-C₄ алкилсульфинил, C₁-C₄ алкилсульфонил, C₂-C₆ алкоксикарбонил, C₂-C₆ алкилкарбонил, C₃-C₆ триалкилсилил, и фенильное, фенокси или 5- или 6-членное гетероароматическое кольцо, при этом каждое кольцо необязательно замещено одним-тремя заместителями, независимо выбранными из R⁹; или

R² и R³ могут быть объединены с азотом, с которым они связаны, с образованием кольца, содержащего 2-6 атомов углерода и, необязательно, один дополнительный атом, выбранный из группы, включающей азот, серу и кислород, при этом указанное кольцо необязательно замещено одним-четырьмя заместителями, независимо выбранными из группы, включающей C₁-C₂ алкил, галоген, CN, NO₂ и C₁-C₂ алкокси;

каждый R⁴ независимо представляет

собой C₁-C₆ алкил, C₂-C₆ алкенил, C₂-C₆ алкинил, C₃-C₆ циклоалкил, C₁-C₆ галогеналкил, C₂-C₆ галогеналкенил, C₂-C₆ галогеналкинил, C₃-C₆ галогенциклоалкил, галоген, CN, NO₂, гидроксиль, C₁-C₄ алкокси, C₁-C₄ галогеналкокси, C₁-C₄ алкилтио, C₁-C₄ алкилсульфинил, C₁-C₄ алкилсульфонил, C₁-C₄ галогеналкилтио, C₁-C₄ галогеналкилсульфинил, C₁-C₄ галогеналкилсульфонил, C₁-C₄ алкиламино, C₂-C₈ диалкиламино, C₃-C₆ циклоалкиламино или C₃-C₆ триалкилсилил; или

каждый R⁴ независимо представляет собой фенильное, бензильное или фенокси кольцо, при этом каждое кольцо необязательно замещено одним-тремя заместителями, независимо выбранными из R⁹;

каждый R⁵ независимо представляет собой

H, C₁-C₆ алкил, C₂-C₆ алкенил, C₂-C₆ алкинил, C₃-C₆ циклоалкил, C₁-C₆ галогеналкил, C₂-C₆ галогеналкенил, C₂-C₆ галогеналкинил, C₃-C₆ галогенциклоалкил, галоген, CN, CO₂H, CONH₂, NO₂,

гидроксиль, C₁-C₄ алкокси, C₁-C₄ галогеналкокси, C₁-C₄ алкилтио, C₁-C₄ алкилсульфинил, C₁-C₄ алкилсульфонил, C₁-C₄ галогеналкилтио, C₁-C₄ галогеналкилсульфинил, C₁-C₄ галогеналкилсульфонил, C₁-C₄ алкиламино, C₂-C₈ диалкиламино, C₃-C₆ циклоалкиламино, C₂-C₆ алкилкарбонил, C₂-C₆ алкоксикарбонил, C₂-C₆ алкиламинокарбонил, C₃-C₆ диалкиламинокарбонил, C₃-C₆ триалкилсилил; или

каждый R⁵ независимо представляет собой фенильное, бензильное, бензоильное, фенокси или 5- или 6-членное гетероароматическое кольцо, или ароматическую 8-, 9- или

10-членную конденсированную гетеробициклическую кольцевую систему, причем каждое кольцо или кольцевая система необязательно замещены одним-тремя заместителями, независимо выбранными из R^9 ; или

$(R^5)_2$, вместе со смежными атомами углерода, с которыми они связаны, могут образовывать $-OCF_2O-$, $-CF_2CF_2O-$ или $-OCF_2CF_2O-$;

каждый R^6 независимо представляет собой C_1-C_6 алкил, C_2-C_6 алкенил, C_2-C_6 алкинил, каждый необязательно замещенный одним или несколькими заместителями, независимо выбранными из группы включающей, галоген,

CN, C_1-C_4 алкокси, C_2-C_6 алкоксиалкокси, C_1-C_4 алкилтио,

$(C_3-C_6$ триалкилсилил) C_1-C_2 алкокси или R^7 ; C_3-C_6 циклоалкил; C_2-C_6 алкилкарбонил;

C_2-C_6 алкоксикарбонил; C_2-C_6 алкиламинокарбонил; C_3-C_8 диалкиламинокарбонил;

C_1-C_4 алкилсульфонил; C_1-C_4 галогеналкилсульфонил или C_3-C_9 триалкилсилил; или

каждый R^6 независимо представляет собой фенильное кольцо или 5- или 6-членное гетероароматическое кольцо, при этом каждое кольцо необязательно замещено одним-тремя заместителями, независимо выбранными из R^9 ;

каждый R^7 независимо представляет собой фенильное, бензилокси или 5- или 6-членное гетероароматическое кольцо, при этом каждое кольцо необязательно замещено одним-тремя заместителями, независимо выбранными из R^9 ;

каждый R^8 независимо представляет собой H;

C_1-C_6 алкил, C_2-C_6 алкенил, C_2-C_6 алкинил, каждый необязательно замещенный одним или несколькими заместителями, независимо выбранными из группы, включающей галоген, CN, C_1-C_4 алкокси, C_1-C_4 алкилтио или R^7 ; C_3-C_6 циклоалкил; C_2-C_6 алкилкарбонил;

C_2-C_6 алкоксикарбонил; C_2-C_6 алкиламинокарбонил; C_3-C_8 диалкиламинокарбонил

или C_3-C_9 триалкилсилил; или

каждый R^8 независимо представляет собой фенильное кольцо или 5- или 6-членное гетероароматическое кольцо, при этом каждое кольцо необязательно замещено одним-тремя заместителями, независимо выбранными из R^9 ;

каждый R^9 независимо представляет

собой C_1-C_4 алкил, C_2-C_4 алкенил, C_2-C_4 алкинил, C_3-C_6 циклоалкил, C_1-C_4 галогеналкил, C_2-C_4 галогеналкенил, C_2-C_4 галогеналкинил, C_3-C_6 галогенциклоалкил, галоген, CN,

NO_2 , C_1-C_4 алкокси, C_1-C_4 галогеналкокси, C_1-C_4 алкилтио, C_1-C_4 алкилсульфинил, C_1-C_4 алкилсульфонил, C_1-C_4 алкиламино, C_2-C_8 диалкиламино, C_3-C_6 циклоалкиламино, C_4-C_8

(алкил)циклоалкиламино, C_2-C_4 алкилкарбонил, C_2-C_6 алкоксикарбонил, C_2-C_6 алкиламинокарбонил, C_3-C_8 диалкиламинокарбонил или C_3-C_6 триалкилсилил; и n имеет значение от 1 до 4;

при условии, что когда K представляет собой $-NR^1C(=A)-$ и A представляет собой O или S, тогда L является отличным от $-C(-O)NR^2-$ или $-C(=S)NR^2-$.

Настоящее изобретение также относится к способу борьбы с беспозвоночными вредителями, включающему контактирование беспозвоночного вредителя или среды его обитания с биологически эффективным количеством соединения Формулы I, его N-оксидом или подходящей солью такого соединения (например, в виде композиции, описанной в данной заявке). Настоящее изобретение также относится к способу, включающему контактирование беспозвоночного вредителя или среды его обитания с биологически эффективным количеством соединения Формулы I, его N-оксидом или подходящей солью или композицией, включающей соединение Формулы I, его N-оксид или подходящую соль и биологически эффективное количество по меньшей мере, одного дополнительного соединения или вещества для борьбы с беспозвоночными вредителями.

Настоящее изобретение также относится к композиции для борьбы с беспозвоночными вредителями, включающей биологически эффективное количество соединения Формулы I, его N-оксида или подходящей соли такого соединения и, по меньшей мере, один дополнительный компонент, выбранный из группы, включающей поверхностно-активные

вещества, твердые разбавители и жидкие разбавители. Настоящее изобретение также относится к композиции, включающей биологически эффективное количество соединения Формулы I, его N-оксида или подходящей соли такого соединения и эффективное количество, по меньшей мере, одного дополнительного биологически активного

соединения или вещества.

Подробное описание изобретения

В указанных выше определениях, термин "алкил", используемый либо отдельно, либо в сложных словах, таких как "алкилтио" или "галогеналкил", включает алкил с прямой или разветвленной цепью, такой как метил, этил, н-пропил, изопропил, или различные изомеры бутила, пентила или гексила. "Алкенил" включает алкены с прямой или разветвленной цепью, такие как 1-пропенил, 2-пропенил и различные изомеры бутенила, пентенила и гексенила. "Алкинил" включает алкины с прямой или разветвленной цепью, такие как 1-пропинил, 2-пропинил, и различные изомеры бутинила, пентинила и гексинила.

"Алкинил" также может включать фрагменты с несколькими тройными связями, такие как 2,5-гексадиинил. "Алкокси" включает, например, метокси, этокси, н-пропилокси, изопропилокси и различные изомеры бутокси, пентокси и гексилокси. "Алкилтио" включает алкилтио группы с прямой или разветвленной цепью, такие как метилтио, этилтио и различные изомеры пропилилокси и бутилтио. "Циклоалкил" включает, например, циклопропил, циклобутил, циклопентил и циклогексил. "Триалкилсилил" включает $(\text{CH}_3)_3\text{Si}$, $(\text{CH}_3\text{CH}_2)_3\text{Si}$ и $[(\text{CH}_3)_3\text{C}](\text{CH}_3)_2\text{Si}$.

Термин "ароматический" означает, что каждый из кольцевых атомов находится по существу в той же плоскости и имеет p-орбиталь, перпендикулярную плоскости кольца, и где $(4n+2)\pi$ электроны, когда n означает 0 или целое положительное число, связаны с кольцом, в соответствии с требованиями правила Хюккеля. Термин "ароматическая кольцевая система" означает полностью ненасыщенные карбоциклы и гетероциклы, в которых, по меньшей мере, одно кольцо полициклической кольцевой системы является ароматическим. Ароматические карбоциклические кольца или конденсированные карбобициклические кольцевые системы включают полностью ароматические карбоциклы и карбоциклы, в которых, по меньшей мере, одно кольцо полициклической кольцевой системы является ароматическим (например, фенил, нафтил и 1,2,3,4-тетрагидронафтил). Термин "неароматическое карбоциклическое кольцо" означает полностью насыщенные карбоциклы, а также частично или полностью ненасыщенные карбоциклы, где кольцо не соответствует требованиям правила Хюккеля. Термин "гетеро", в применении к кольцам или кольцевым системам, относится к кольцу или кольцевой системе, в которых, по меньшей мере, один кольцевой атом не является атомом углерода и которые могут содержать от 1 до 4 гетероатомов, независимо выбранных из группы, включающей азот, кислород и серу, при условии, что каждое кольцо содержит не более 4 атомов азота, не более 2 атомов кислорода и не более 2 атомов серы. Термины "гетероароматическое кольцо или кольцевая система" и "ароматическая конденсированная гетеробициклическая кольцевая система" включают полностью ароматические гетероциклы и гетероциклы, в которых, по меньшей мере, одно кольцо полициклической кольцевой системы является ароматическим (где "ароматический" означает соответствие требованиям правила Хюккеля). Термин "неароматическое гетероциклическое кольцо или кольцевая система" означает полностью насыщенные гетероциклы, а также частично или полностью ненасыщенные гетероциклы, где ни одно из колец кольцевой системы не соответствует требованиям правилу Хюккеля. Гетероциклическое кольцо или кольцевая система могут связываться через доступный атом углерода или азота путем замещения водорода по указанному углероду или азоту.

Термин "галоген", отдельно или как часть сложных слов, таких как "галогеналкил", включает фтор, хлор, бром или иод. Кроме того, при использовании в сложных словах, таких как "галогеналкил", указанный алкил может быть частично или полностью замещен атомами галогенов, которые могут быть одинаковыми или разными. Примеры

"галогеналкила" включают F_3C , $ClCH_2$, CF_3CH_2 и CF_3CCl_2 . Термины "галогеналкенил", "галогеналкинил", "галогеналкокси" и подобные определяются аналогично термину "галогеналкил". Примеры "галогеналкенила" включают $(Cl)_2C=CHCH_2$ и $CF_3CH_2CH=CHCH_2$. Примеры "галогеналкинила" включают $HCCCHCl$, CF_3CC , CCl_3CC и FCH_2CCSCH_2 .

5 Примеры "галогеналкокси" включают CF_3O , CCl_3CH_2O , $HCF_2CH_2CH_2O$ и CF_3CH_2O .

Примеры "алкилкарбонила" включают $C(O)CH_3$, $C(O)CH_2CH_2CH_3$ и

$C(O)CH(CH_3)_2$. Примеры "алкоксикарбонила" включают $CH_3OC(=O)$, $CH_3CH_2OC(=O)$, $CH_3CH_2CH_2OC(=O)$, $(CH_3)_2CHOC(=O)$ и различные бутокси- или пентоксикарбонильные изомеры. Примеры "алкиламинокарбонила" включают $CH_3NHC(=O)$, $CH_3CH_2NHC(=O)$,
10 $CH_3CH_2CH_2NHC(=O)$, $(CH_3)_2CHNHC(=O)$ и различные изомеры бутиламино- или пентиламинокарбонила. Примеры "диалкиламинокарбонила" включают $(CH_3)_2NC(=O)$, $(CH_3CH_2)_2NC(=O)$, $CH_3CH_2(CH_3)NC(=O)$, $CH_3CH_2CH_2(CH_3)NC(=O)$ и $(CH_3)_2CHN(CH_3)C(=O)$.

Общее количество атомов углерода в группе заместителя указано нижними индексами " C_i-C_j ", где i и j означают целые числа от 1 до 8. Например, C_1-C_3 алкилсульфонил включает
15 значения от метилсульфонил до пропилсульфонил; C_2 алкоксиалкил означает CH_3OCH_2 ; C_3 алкоксиалкил означает, например, $CH_3CH(OCH_3)$, $CH_3OCH_2CH_2$ или $CH_3CH_2OCH_2$; и C_4 алкоксиалкил означает различные изомеры алкильной группы, замещенной алкоксигруппой, где общее количество атомов углерода равно четырем, примеры которых включают $CH_3CH_2CH_2OCH_2$ и $CH_3CH_2OCH_2CH_2$.

20 В указанных выше определениях, когда соединение Формулы I содержит гетероциклическое кольцо, все заместители связаны с этим кольцом через любой доступный атом углерода или азота путем замещения водорода по указанному углероду или азоту.

Когда соединение замещено заместителем и указано, что количество таких
25 заместителей может превышать 1, указанные заместители (когда их количество превышает 1) независимо выбраны из группы определенных заместителей. Кроме того, когда указаны пределы, например, $(R)_{i-j}$, тогда количество заместителей может быть выбрано из целых чисел от i до j , включительно.

Термин "необязательно замещенный" означает, что группа является либо
30 незамещенной, либо замещенной. Термин "необязательно замещенный одним-тремя заместителями" и т.п. означает, что от одного до трех доступных положений в группе могут быть замещены. Когда группа содержит заместитель, который может быть водородом, например, R^1 или R^5 , тогда, если этот заместитель означает водород, должно быть понятно, что это эквивалентно тому, что указанная группа является
35 незамещенной.

Соединения по настоящему изобретению могут существовать в виде одного или нескольких стереоизомеров. Различные стереоизомеры включают энантимеры, диастереомеры, антропизомеры и геометрические изомеры. Специалисту в данной области должно быть понятно, что один стереоизомер может быть более активным и/или
40 может демонстрировать лучшее действие при обогащении им по сравнению с другим(и) стереоизомером(ами) или при его отделении от другого(их) стереоизомера(ов). Кроме того, специалисту должны быть известны способы разделения, обогащения и/или избирательного получения стереоизомеров. Следовательно, соединения по настоящему изобретению могут присутствовать в виде смеси стереоизомеров, индивидуальных
45 стереоизомеров или в виде оптически активной формы. Некоторые соединения по настоящему изобретению могут существовать в виде одного или нескольких таутомеров, и все таутомерные формы таких соединений являются частью настоящего изобретения. Следовательно, соединения по настоящему изобретению могут присутствовать в виде смеси таутомеров или в виде индивидуальных таутомеров.

50 Настоящее изобретение включает соединения, выбранные из соединений Формулы I, их N-оксидов и подходящих солей. Специалисту в данной области должно быть понятно, что не все азотсодержащие гетероциклы могут образовывать N-оксиды, поскольку азоту требуется доступная отдельная пара электронов для окисления в оксид; специалист может

отличать те азотсодержащие гетероциклы, которые могут образовывать N-оксиды. Специалисту в данной области также должно быть понятно, что третичные амины могут образовывать N-оксиды. Способы синтеза для получения N-оксидов из гетероциклов и третичных аминов хорошо известны специалистам в данной области, включая окисление

5 гетероциклов и третичных аминов перокси кислотами, так как перуксусная и м-хлорпербензойная кислота (MCPBA), пероксидом водорода, алкилгидропероксидами, такими как трет-бутилгидропероксид, перборатом натрия и диоксиранами, такими как диметидиоксиран. Такие способы получения N-оксидов были подробно описаны и рассмотрены в литературе, см. например: T. L. Gilchrist in *Comprehensive organic*
 10 *Synthesis*, vol. 7, pp 748-750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press; M. Tisler and B. Stanovnik in *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, Vol. 3, pp 18-19, A. J. Boulton and A. McKillop, Eds., Pergamon Press; M. R. Grimmett and B. R. T. Keene in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, Vol. 43, pp 139-151, A. R. Katritzky, Ed., Academic Press; M. Tisler and B. Stanovnik in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, Vol. 9, pp 285-291,
 15 A. R. Katritzky и A. J. Boulton, Eds., Academic Press; and G. W. H. Cheeseman and E. S. G. Werstiuk in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, Vol. 22, pp 390-392, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press.

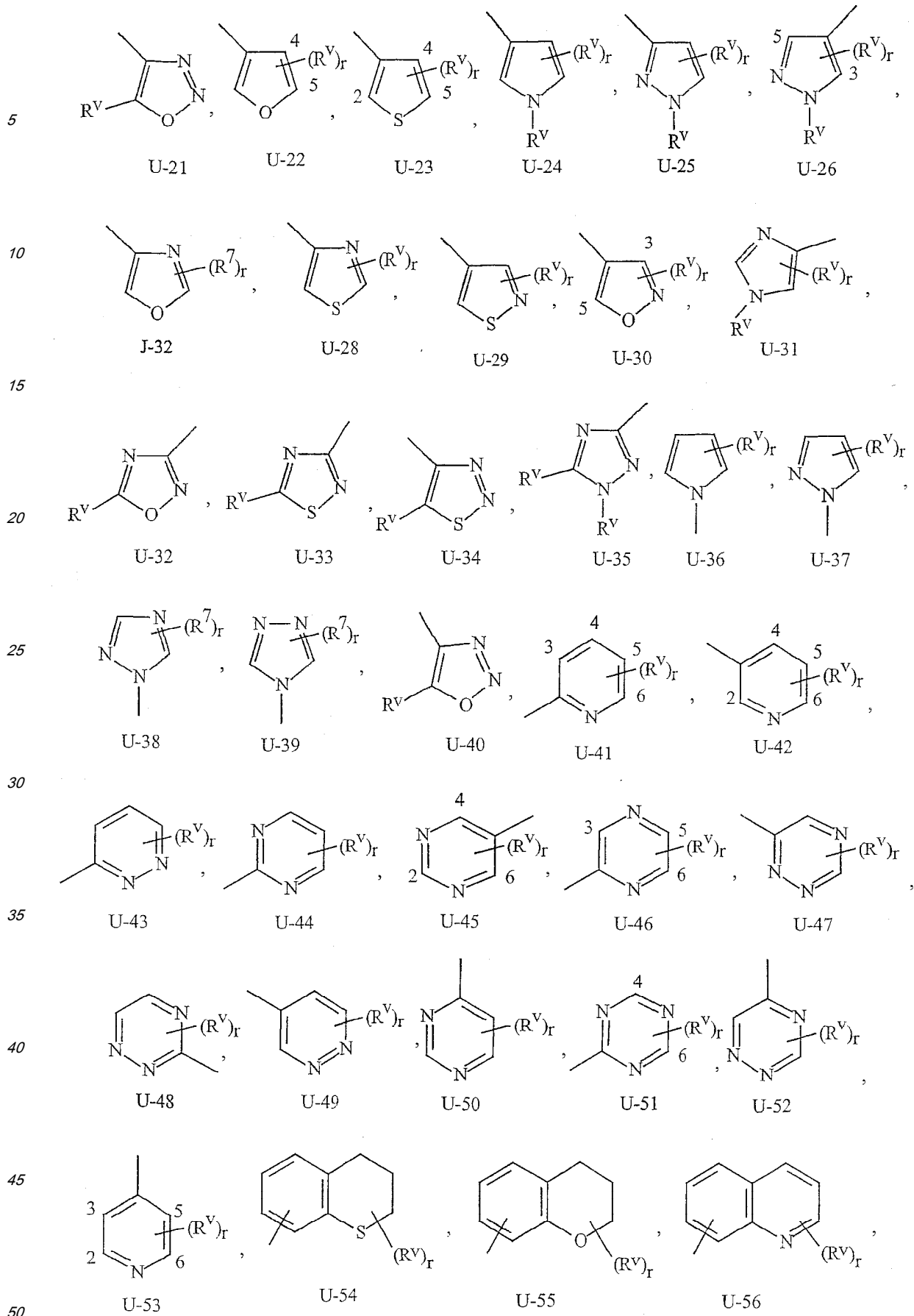
Соли соединения по настоящему изобретению включают кислотно-аддитивные соли неорганической или органической кислоты, такой как бромистоводородная,
 20 хлористоводородная, азотная, фосфорная, серная, уксусная, масляная, фумаровая, молочная, малеиновая, малоновая, щавелевая, пропионовая, салициловая, винная, 4-толуолсульфоновая или валериановая кислота. Соли соединений по настоящему изобретению также включают соли, образованные с органическими основаниями (например, пиридином, аммиаком и триэтиламином), или соли, образованные с
 25 неорганическими основаниями (например, гидриды, гидроксиды или карбонаты натрия, калия, лития, кальция, магния или бария), когда соединение содержит кислотную группу, такую как карбоновая кислота или фенол.

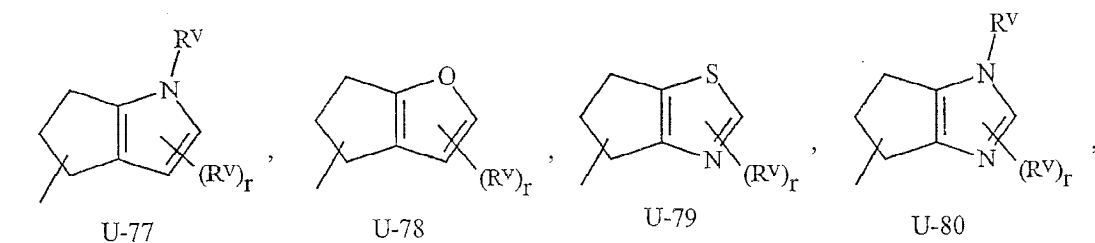
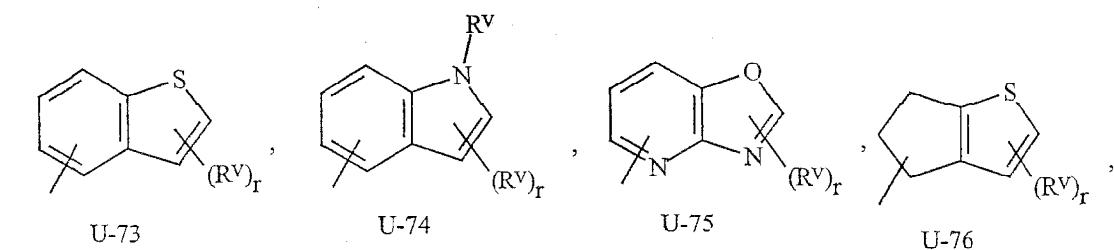
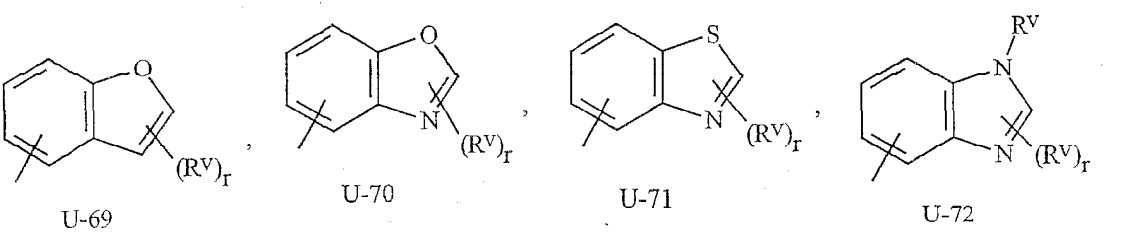
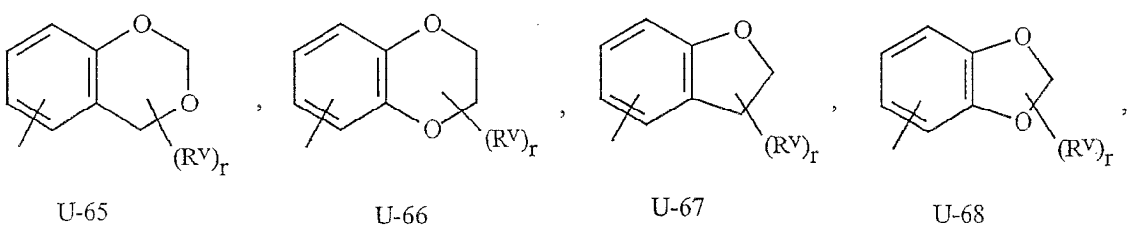
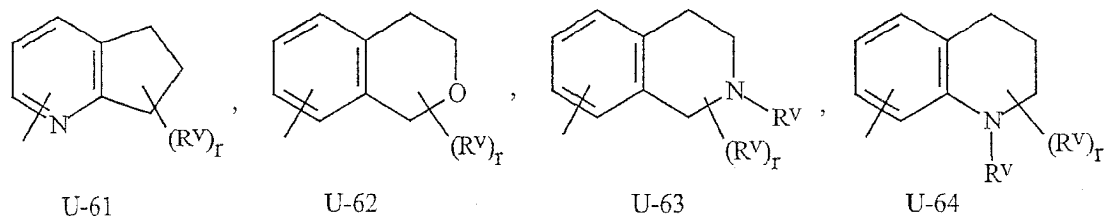
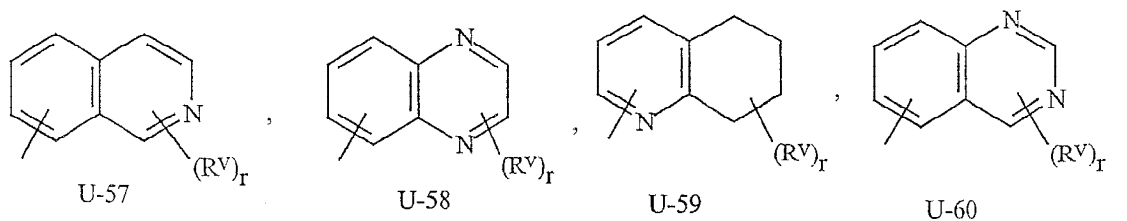
Как указано выше, каждый J независимо представляет собой фенильное кольцо, 5- или 6-членное гетероароматическое кольцо или ароматическую 8-, 9- или 10-членную
 30 конденсированную карбобициклическую или гетеробициклическую кольцевую систему, где каждое кольцо или кольцевая система замещены одним-четырьмя R⁵. Примером фенила, замещенного одним-четырьмя R⁵, является кольцо, показанное как U-I в Представлении 1 ниже, где R^v представляет собой R⁵ и r означает целое число от 1 до 4. Примеры ароматической 8-, 9- или 10-членной конденсированной карбобициклической кольцевой
 35 системы, замещенной одним-четырьмя R⁵, включают нафтильную группу, показанную как U-85 в Представлении 1, и 1,2,3,4-тетрагидронафтильную группу, показанную как U-89 в Представлении 1, где R^v представляет собой R³ и r означает целое число от 1 до 4. Примеры 5- или 6-членного гетероароматического кольца, замещенного одним-
 40 четырьмя R⁵, включают кольца U-2 по U-53, показанные в Представлении 1, где R^v представляет собой R⁵ и r означает целое число от 1 до 4. Необходимо отметить, что проиллюстрированные ниже J-I по J-4 также означают 5- или 6-членные гетероароматические кольца. Необходимо отметить, что U-2 по U-20 являются примерами J-I, U-21 по U-35 и U-40 являются примерами J-2, U-41 по U-48 являются примерами J-3
 45 и U-49 по U-53 являются примерами J-4. Примеры ароматических 8-, 9- или 10-членных конденсированных гетеробициклических кольцевых систем, замещенных одним-четырьмя R⁵, включают U-54 по U-84, показанные в Представлении 1, где R^v представляет собой R⁵ и r означает целое число от 1 до 4.

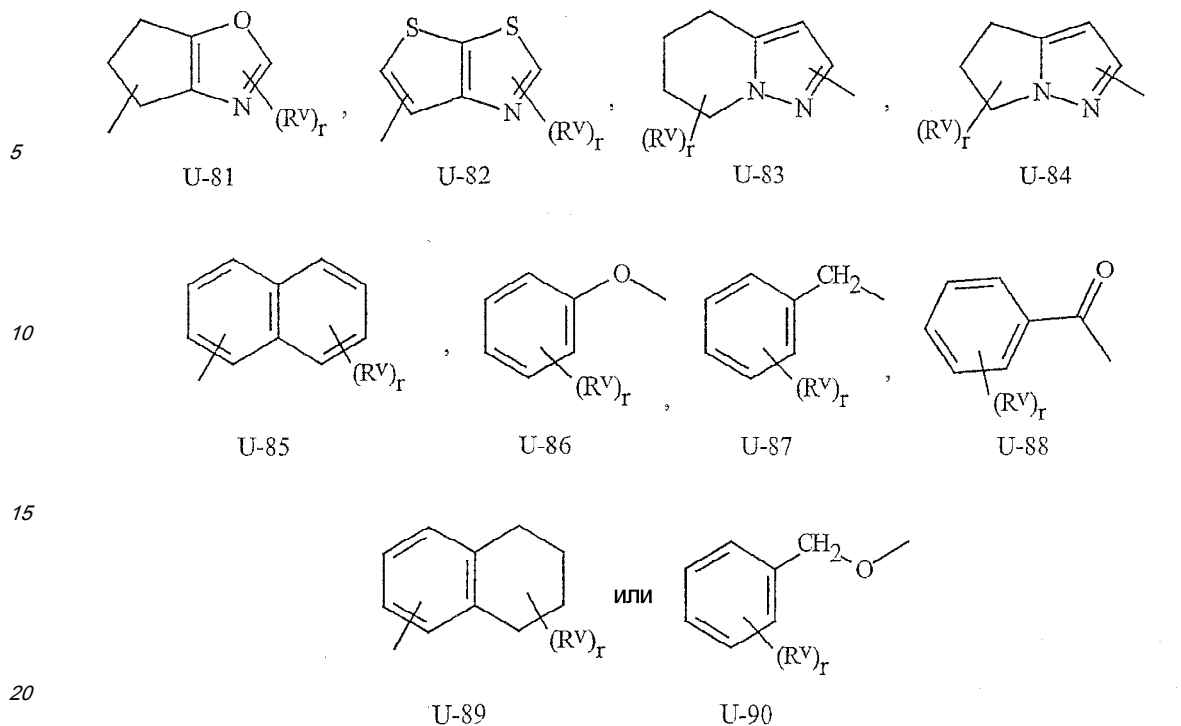
Несмотря на то, что группы R^v показаны в структурах с U-I по U-90, необходимо
 50 отметить, что когда они являются необязательными заместителями, они необязательно должны присутствовать. Необходимо отметить, что когда R^v представляет собой H, при его присоединении к атому это аналогично тому, что указанный атом является назамещенным. Атомы азота, для которых необходимо замещение для заполнения их

10

Exhibit 1







Как указано выше, некоторые группы R^1 , R^3 , R^6 и R^8 необязательно могут быть замещенными одним или несколькими заместителями. Термин "необязательно замещенный" в связи с этими R^w группами (где w имеет значение 1, 3, 6 или 8) относится к R группам, которые не замещены или имеют, по меньшей мере, один неводородный заместитель. Примерами необязательно замещенных R^w групп являются группы, необязательно замещенные путем замены водорода у атома углерода группы R^w одним или несколькими (до общего количества атомов водорода, доступных для замещения в любой конкретной R^w группе) заместителями, независимо выбранными из заместителей, перечисленных в разделе "Краткое описание изобретения" выше. Хотя такие заместители и перечислены, следует заметить, что они необязательно должны присутствовать, поскольку являются необязательными заместителями. Особенно следует отметить R^w группы, которые являются незамещенными. Важными также являются R^v группы, замещенные заместителями от одного до пяти. Также важными являются R^w группы, замещенные одним заместителем.

Как указано выше, R^3 может представлять C_1 - C_6 алкил, C_2 - C_6 алкенил, C_2 - C_6 алкинил или C_3 - C_6 циклоалкил, каждый необязательно замещенный (среди прочего) фенилом, фенокси или 5- или 6-членным гетероароматическим кольцом, при этом каждое кольцо необязательно замещено одним-тремя заместителями, независимо выбранными из R^9 . Примеры таких колец, являющихся заместителями, включают кольца, представленные как кольца U-1 (фенил), U-2 по U-53 (5- или 6-членные гетероароматические кольца) и U-86 (фенокси), показанные в Представлении 1 выше, где R^v представляет собой R^9 и r представляет собой целое число от 1 до 3.

Как указано выше, каждый R^4 может независимо представлять (среди прочего) фенильное, бензильное или фенокси кольцо, при этом каждое кольцо необязательно замещено одним-тремя заместителями, независимо выбранными из R^9 . Примеры таких колец, являющихся заместителями, включают кольца, представленные как кольца U-1 (фенил), U-87 (бензил) и U-86 (фенокси), показанные в Представлении 1 выше, где R^v представляет собой R^9 и r представляет собой целое число от 1 до 3.

Как указано выше, каждый R^5 может независимо представлять (среди прочего) фенильное, бензильное, бензоильное, фенокси или 5- или 6-членное гетероароматическое

кольцо, или ароматическую 8-, 9- или 10-членную конденсированную гетеробициклическую кольцевую систему, при этом каждое кольцо или кольцевая система необязательно замещены одним-тремя заместителями, независимо выбранными из R^9 . Примеры таких колец, являющихся заместителями, включают кольца, представленные как кольца U-I (фенил), U-87 (бензил), U-8S (бензоил), U-86 (фенокси), U-2 по U-53 (5- или 6-членные гетероароматические кольца) и U-54 по U-84 (ароматическая 8-, 9- или 10-членная конденсированная гетеробициклическая кольцевая система), показанные в Представлении 1 выше, где R^v представляет собой R^9 и r представляет собой целое число от 1 до 3.

Как указано выше, каждый R^6 и каждый R^8 могут независимо представлять (среди прочего) фенильное кольцо или 5- или 6-членное гетероароматическое кольцо, при этом каждое кольцо необязательно замещено одним-тремя заместителями, независимо выбранными из R^9 . Примеры таких R^6 и R^8 групп включают кольца, показанные как кольца U-I (фенил) и U-2 по U-53 (5- или 6-членные гетероароматические кольца), показанные в Представлении 1 выше, где R^v представляет собой R^9 и r представляет собой целое число от 1 до 3.

Как указано выше, каждый R^7 может независимо представлять фенильное, бензилокси или 5- или 6-членное гетероароматическое кольцо, при этом каждое кольцо необязательно замещено одним-тремя заместителями, независимо выбранными из R^9 . Примеры таких R^7 групп включают кольца, представленные как кольца U-I (фенил), U-90 (бензилокси) и U-2 по U-53 (5- или 6-членные гетероароматические кольца), показанные в Представлении 1 выше, где R^v представляет собой R^9 и r представляет собой целое число от 1 до 3.

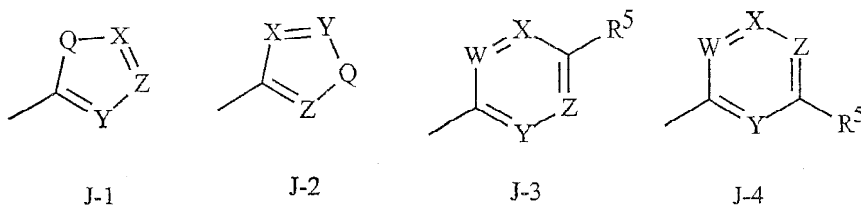
Предпочтительными соединениями, в силу их лучшей активности и/или простоты синтеза, являются следующие:

Предпочтительная группа 1. Соединения формулы I, где K представляет собой $-NR^1C(=A)-$ и A представляет собой O.

Предпочтительная группа 2. Соединения формулы I, где L представляет собой $-C(=B)NR^2-$ и B представляет собой O.

Предпочтительная группа 3. Соединения Предпочтительной группы 1 или предпочтительной группы 2, где

J представляет собой фенильное кольцо или 5- или 6-членное гетероароматическое кольцо, выбранное из группы, включающей J-1, J-2, J-3 и J-4, при этом каждое кольцо замещено одним-четырьмя заместителями, независимо выбранными из R^5



Q представляет собой O, S или NR^5 ;

W, X, Y и Z независимо представляют собой N или CR^5 , при условии что в J-3 и J-4 по меньшей мере один из W, X, Y или Z представляет собой N;

R^1 представляет собой H, C_1-C_4 алкил, C_2-C_4 алкенил, C_2-C_4 алкинил, C_3-C_6 циклоалкил, C_2-C_6 алкилкарбонил или C_2-C_6 алкоксикарбонил;

R^2 представляет собой H, C_1-C_4 алкил, C_2-C_4 алкенил, C_2-C_4 алкинил, C_3-C_6 циклоалкил, C_2-C_6 алкилкарбонил или C_2-C_6 алкоксикарбонил;

R^3 представляет собой H; или C_1-C_6 алкил, C_2-C_6 алкенил, C_2-C_6 алкинил или C_3-C_6 циклоалкил, каждый необязательно замещенный одним или несколькими заместителями, независимо выбранными из группы, включающей галоген, CN, C_1-C_6 алкокси, C_1-C_2 алкилтио, C_1-C_2 алкилсульфинил и C_1-C_2 алкилсульфонил;

одна из групп R^4 присоединена к остальной части формулы I либо по положению 2, либо по положению 5 фенильного кольца, и указанный R^4 представляет

собой C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, галоген, CN,

NO₂, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_4 галогеналкокси, C_1 - C_4 алкилтио, C_1 - C_4 алкилсульфинил, C_1 - C_4 алкилсульфонил, C_1 - C_4 галогеналкилтио, C_1 - C_4 галогеналкилсульфинил или C_1 - C_4 галогеналкилсульфонил;

каждый R^5 независимо представляет собой H, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, галоген, CN,

NO₂, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_4 галогеналкокси, C_1 - C_4 алкилтио, C_1 - C_4 алкилсульфинил, C_1 - C_4 алкилсульфонил, C_1 - C_4 галогеналкилтио, C_1 - C_4 галогеналкилсульфинил, C_1 - C_4 галогеналкилсульфонил, C_2 - C_6 алкоксикарбонил, C_2 - C_6 алкиламинокарбонил или C_3 - C_8 диалкиламинокарбонил; или

каждый R^5 независимо представляет собой фенильное, бензильное или 5- или 6-членное гетероароматическое кольцо, при этом каждое кольцо необязательно замещено одним-тремя заместителями, независимо выбранными из R^9 ; или

$(R^5)_2$, вместе со смежными атомами углерода, с которыми они связаны, образуют -OCF₂O-, -CF₂CF₂O- или -OCF₂CF₂O-;

каждый R^6 независимо представляет собой C_1 - C_6 алкил, C_2 - C_6 алкенил, C_2 - C_6 алкинил, каждый необязательно замещенный одним или несколькими заместителями, независимо выбранными из группы, включающей галоген, CN, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_4 алкилтио и R^7 ; и n имеет значение 1 или 2.

Из Предпочтительной группы 3 особое значение имеют соединения, где K представляет собой -NR¹C(=O)- и L представляет собой -C(GR⁶)=N- или -SO₂NR²-. Также особое значение имеют соединения Предпочтительной группы 3, где K представляет собой -NR¹C(=O)- и L представляет собой -C(=O)-. Также особое значение имеют соединения Предпочтительной группы 3, где L представляет собой -C(=O)NR²- и K представляет собой -N=C(GR⁶)- или -NR¹SO₂-.

Предпочтительная группа 4. Соединения Предпочтительной группы 3, где R^1 и R^2 , каждый, независимо, представляет собой H или C_1 - C_4 алкил;

R^3 представляет собой C_1 - C_4 алкил, необязательно замещенный галогеном, CN, OCH₃, или S(O)_pCH₃;

каждый R^5 независимо представляет собой H, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, галоген, CN,

NO₂, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_4 галогеналкокси, C_1 - C_4 алкилтио, C_1 - C_4 алкилсульфинил, C_1 - C_4 алкилсульфонил, C_1 - C_4 галогеналкилтио, C_1 - C_4 галогеналкилсульфинил, C_1 - C_4 галогеналкилсульфонил или C_2 - C_4 алкоксикарбонил, C_2 - C_6 алкиламинокарбонил или C_3 - C_8 диалкиламинокарбонил; или фенильное, бензильное, или 5- или 6-членное

гетероароматическое кольцо, при этом каждое кольцо необязательно замещено галогеном, CN,

NO₂, C_1 - C_4 алкилом, C_2 - C_4 алкенилом, C_2 - C_4 алкинилом, C_3 - C_6 циклоалкилом, C_1 - C_4 галогеналкилом, C_1 - C_4 алкокси или C_1 - C_4 галогеналкокси; при условии что один R^5 с J в положении орто к K и, по меньшей мере, один R^5 является отличным от H, G представляет собой O или S; и

r имеет значение 0, 1 или 2.

Предпочтительная группа 5. Соединения Предпочтительной группы 4, где J представляет собой фенильное, пиразольное, пиррольное, пиридиновое или пиримидиновое кольцо, каждое замещенное одним R^5 , связанным с J в положении орто к K, и, необязательно, одним или двумя дополнительными R^5 .

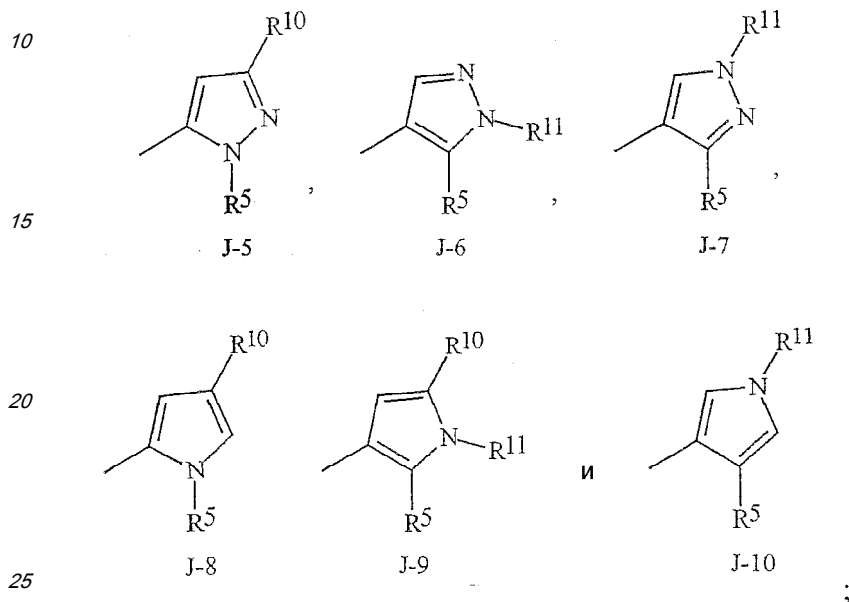
Предпочтительная группа 6. Соединения Предпочтительной группы 5, где

R^1 и R^2 оба представляют собой H;

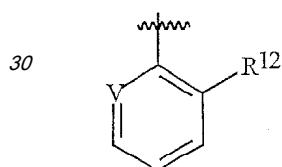
один R^4 присоединен к остальной части формулы I в положении 2 фенильного кольца,

орто относительно К-Ј фрагмента и выбран из группы, включающей C_1 - C_3 алкил, CF_3 , OCF_3 , $OCHF_2$, $S(O)_pCF_3$, $S(O)_pCHF_2$ и галоген, и, необязательно, второй R^4 присоединен в положении 4 фенильного кольца, пара относительно К-Ј фрагмента и выбран из группы, включающей галоген, C_1 - C_3 алкил и C_1 - C_3 галогеналкил.

- Предпочтительная группа 7. Соединения Предпочтительной группы 6, где
 J представляет собой пиразольное или пиррольное кольцо, выбранное из группы, включающей J-5, J-6, J-7, J-8, J-9 и J-10, при этом каждое кольцо замещено R^5 и, необязательно, замещено R^{10} и R^{11} ;



R^5 представляет собой H, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, или



- 35 V представляет собой N, CH, CF, CCl , CBr или Cl;
 каждый R^{10} и каждый R^{12} независимо представляют собой
 H, C_1 - C_6 алкил, C_3 - C_6 циклоалкил, C_1 - C_6 галогеналкил, галоген,
 CN, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_4 галогеналкокси или C_1 - C_4 галогеналкилтио; и
 R^{11} представляет собой

- 40 H, C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 галогеналкил, C_3 - C_6 алкенил, C_3 - C_6 галогеналкенил, C_3 - C_6 алкинил
 или C_3 - C_6 галогеналкинил.

Необходимо учесть, что R^{10} и R^{11} являются подгруппами группы заместителей R^5 .

- Также необходимо учесть, что когда R^{12} является отличным от H, он является подгруппой
 45 группы заместителей R^9 , и что атомы F, Cl, Br или I, входящие в определение группы
 V, также являются подгруппой группы заместителей R^9 . Необходимо отметить, что группа,
 определенная для R^5 , связана с J посредством связи, обозначенной волнистой линией.

Предпочтительная группа 8. Соединения Предпочтительной группы 7, где V
 представляет собой N.

- 50 Предпочтительная группа 9. Соединения Предпочтительной группы 7, где V
 представляет собой CH, CF, CCl или CBr.

Предпочтительная группа 10. Соединения Предпочтительной группы 8 или
 Предпочтительной группы 9, где

R^{12} представляет собой H, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, галоген или CN;

R^{10} представляет собой H, CH_3 , CF_3 , OCH_2CF_3 , $OCHF_2$ или галоген; и

R^{11} представляет собой CH_2CF_3 , CHF_2 или CF_3 .

Предпочтительная группа 11. Соединения Предпочтительной группы 10, где J, замещенный R^5 и необязательно замещенный R^{10} , представляет собой J-5; R^{12} представляет собой Cl или Br; и R^{10} представляет собой галоген, OCH_2CF_3 , $OCHF_2$ или CF_3 .

Предпочтительная группа 12. Соединения Предпочтительной группы 10, где J, замещенный R^5 и необязательно замещенный R^{11} , представляет собой J-6;

R^{12} представляет собой Cl или Br; и R^{11} представляет собой CH_2CF_3 , CHF_2 или CF_3 .

Предпочтительная группа 13. Соединения Предпочтительной группы 10, где J, замещенный R^5 и необязательно замещенный R^{11} , представляет собой J-7;

R^{12} представляет собой Cl или Br; и R^{11} представляет собой CH_2CF_3 , CHF_2 или CF_3 .

Предпочтительная группа 14. Соединения Предпочтительной группы 10, где J, замещенный R^5 и необязательно замещенный R^{10} , представляет собой J-8;

R^{12} представляет собой Cl или Br; и R^{10} представляет собой галоген, OCH_2CF_3 , $OCHF_2$ или CF_3 .

Предпочтительная группа 15. Соединения Предпочтительной группы 10, где J, замещенный R^5 и необязательно замещенный R^{10} и R^{11} , представляет собой J-9;

R^{12} представляет собой Cl или Br; R^{10} представляет собой галоген, OCH_2CF_3 , $OCHF_2$ или CF_3 ; и R^{11} представляет собой CH_2CF_3 , CHF_2 или CF_3 .

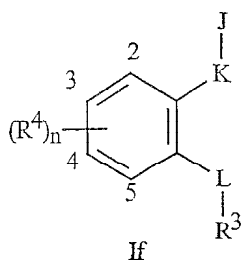
Предпочтительная группа 16. Соединения Предпочтительной группы 10, где J, замещенный R^5 и необязательно замещенный R^{11} , представляет собой J-10;

R^{12} представляет собой Cl или Br; и R^{11} представляет собой CH_2CF_3 , CHF_2 или CF_3 .

Наиболее предпочтительным является соединение формулы I, которое представляет собой

1-(3-Хлор-2-пиридирил)-N-[2-метил-6-[(1-метилэтил)амино]-сульфонил]фенил]-3-(трифторметил)-1Н-пиразол-5-карбоксамид.

Важное значение имеют соединения формулы If, их N-оксиды и сельскохозяйственно приемлемые соли



где

J представляет собой фенильное кольцо, нафтильную кольцевую систему, 5- или 6-членное гетероароматическое кольцо или ароматическую 8-, 9- или 10-членную конденсированную гетеробикалическую кольцевую систему, где каждое кольцо или кольцевая система являются необязательно замещенными 1-4 заместителями R^5 ;

K представляет собой $-NR^1C(=A)-$, $-N=C(GR^6)-$ или $-NR^1SO_2-$;

L представляет собой $-C(-B)NR^2-$, $-C(GR^6)=N-$, $-SO_2NR^2-$, или $-C(=O)-$;

A и B независимо представляют собой O, S, NR^6 , NOR^6 , $NN(R^6)_2$, S=O, N-CN или N- NO_2 ; каждый G независимо представляет собой O, S или NR^6 ;

R^1 представляет собой H; или C_1 - C_6 алкил, C_2 - C_6 алкенил, C_2 - C_6 алкинил или C_3 - C_6 циклоалкил, каждый необязательно замещенный одним или несколькими

заместителями, выбранными из группы, включающей галоген, CN, NO₂, гидроксигруппы, C₁-C₄ алкокси, C₁-C₄ алкилтио, C₁-C₄ алкилсульфинил, C₁-C₄ алкилсульфонил, C₂-C₄ алкоксикарбонил, C₁-C₄ алкиламино, C₂-C₈ диалкиламино и C₃-C₆ циклоалкиламино; или

R¹ представляет

5 собой C₂-C₆ алкилкарбонил, C₂-C₆ алкоксикарбонил, C₂-C₆ алкиламинокарбонил или C₃-C₈ диалкиламинокарбонил;

R² представляет собой H, C₁-C₆ алкил, C₂-C₆ алкенил, C₂-C₆ алкинил, C₃-C₆ циклоалкил, C₁-C₄ алкокси, C₁-C₄ алкиламино, C₂-C₈ диалкиламино, C₃-C₆ циклоалкиламино, C₂-C₆ алкоксикарбонил или C₂-C₆ алкилкарбонил;

10 R³ представляет собой H; C₁-C₆ алкил, C₂-C₆ алкенил, C₂-C₆ алкинил, C₃-C₆ циклоалкил, каждый необязательно замещенный одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, включающей галоген, CN, NO₂,

гидроксигруппы, C₁-C₄ алкокси, C₁-C₄ галогеналкокси, C₁-C₄ алкилтио, C₁-C₄ алкилсульфинил, C₁-C₄ алкилсульфонил, C₂-C₆ алкоксикарбонил, C₂-C₆ алкилкарбонил, C₃-C₆ триалкилсилил, 15 или фенильное, фенокси или 5- или 6-членное гетероароматическое кольцо, при этом каждое кольцо необязательно замещено одним-тремь заместителями, независимо выбранными из группы,

включающей C₁-C₄ алкил, C₂-C₄ алкенил, C₂-C₄ алкинил, C₃-C₆ циклоалкил, C₁-C₄ галогеналкил, C₂-C₄ галогеналкенил, C₂-C₄ галогеналкинил, C₃-C₆ галогенциклоалкил, 20 галоген, CN,

NO₂, C₁-C₄ алкокси, C₁-C₄ галогеналкокси, C₁-C₄ алкилтио, C₁-C₄ алкилсульфинил, C₁-C₄ алкилсульфонил, C₁-C₄ алкиламино, C₂-C₈ диалкиламино, C₃-C₆ циклоалкиламино, C₃-C₆ (алкил)циклоалкиламино, C₂-C₄ алкилкарбонил, C₂-C₆ алкоксикарбонил, C₂-C₆ алкиламинокарбонил, C₃-C₈ диалкиламинокарбонил или C₃-C₆ триалкилсилил;

25 C₁-C₄ алкокси; C₁-C₄ алкиламино; C₂-C₈ диалкиламино; C₃-C₆ циклоалкиламино; C₂-C₆ алкоксикарбонил или C₂-C₆ алкилкарбонил; или

R² и R³, взятые вместе с атомом азота, с которым они связаны, образуют кольцо, содержащее от 2 до 6 атомов углерода и, необязательно, один дополнительный атом азота, серы или кислорода, при этом указанное кольцо является необязательно 30 замещенным 1-4 заместителями, выбранными из группы, включающей C₁-C₂ алкил, галоген, CN, NO₂ и C₁-C₂ алкокси;

каждый R⁴ независимо представляет собой

35 H, C₁-C₆ алкил, C₂-C₆ алкенил, C₂-C₆ алкинил, C₃-C₆ циклоалкил, C₁-C₆ галогеналкил, C₂-C₆ галогеналкенил, C₂-C₆ галогеналкинил, C₃-C₆ галогенциклоалкил, галоген, CN, NO₂, гидроксигруппы, C₁-C₄ алкокси, C₁-C₄ галогеналкокси, C₁-C₄ алкилтио, C₁-C₄ алкилсульфинил, C₁-C₄ алкилсульфонил, C₁-C₄ галогеналкилтио, C₁-C₄ галогеналкилсульфинил, C₁-C₄ галогеналкилсульфонил, C₁-C₄ алкиламино, C₂-C₈ диалкиламино, C₃-C₆ циклоалкиламино, 40 или C₃-C₆ триалкилсилил; или

каждый R⁴ независимо представляет собой фенил, бензил или фенокси, каждый 45 необязательно

замещенный C₁-C₄ алкилом, C₂-C₄ алкенилом, C₂-C₄ алкинилом, C₃-C₆ циклоалкилом, C₁-C₄ галогеналкилом, C₂-C₄ галогеналкенилом, C₂-C₄ галогеналкинилом, C₃-C₆ галогенциклоалкилом, галогеном, CN,

45 NO₂, C₁-C₄ алкокси, C₁-C₄ галогеналкокси, C₁-C₄ алкилтио, C₁-C₄ алкилсульфинилом, C₁-C₄ алкилсульфонилом, C₁-C₄ алкиламино, C₂-C₈ диалкиламино, C₃-C₆ циклоалкиламино, C₃-C₆ (алкил)циклоалкиламино, C₂-C₄ алкилкарбонилом, C₂-C₆ алкоксикарбонилом, C₂-C₆ алкиламинокарбонилом, C₃-C₈ диалкиламинокарбонилом или C₃-C₆ триалкилсилилом;

каждый R⁵ независимо представляет собой

50 H, C₁-C₆ алкил, C₂-C₆ алкенил, C₂-C₆ алкинил, C₃-C₆ циклоалкил, C₁-C₆ галогеналкил, C₂-C₆ галогеналкенил, C₂-C₆ галогеналкинил, C₃-C₆ галогенциклоалкил, галоген, CN, CO₂H, CONH₂, NO₂,

гидроксигруппы, C₁-C₄ алкокси, C₁-C₄ галогеналкокси, C₁-C₄ алкилтио, C₁-C₄ алкилсульфинил, C₁-C₄ алкилсульфонил, C₁-C₄ галогеналкилтио, C₁-C₄ галогеналкилсульфинил, C₁-C₄ галогеналкилсульфонилом, C₁-C₄ алкиламино, C₂-C₈ диалкиламино, C₃-C₆ циклоалкиламино, C₃-C₆ (алкил)циклоалкиламино, C₂-C₄ алкилкарбонилом, C₂-C₆ алкоксикарбонилом, C₂-C₆ алкиламинокарбонилом, C₃-C₈ диалкиламинокарбонилом или C₃-C₆ триалкилсилилом;

-C₄ алкилсульфонил, C₁-C₄ галогеналкилтио, C₁-C₄ галогеналкилсульфинил, C₁-C₄ галогеналкилсульфонил, C₁-C₄ алкиламино, C₂-C₈ диалкиламино, C₃-C₆ циклоалкиламино, C₂-C₆ алкилкарбонил, C₂-C₆ алкоксикарбонил, C₂-C₆ алкиламинокарбонил, C₃-C₈ диалкиламинокарбонил, C₃-C₆ триалкилсилил; или

каждый R⁵ независимо представляет собой фенильное, бензильное, бензоильное, фенокси, 5- или 6-членное гетероароматическое кольцо или ароматическую 8-, 9- или 10-членную конденсированную гетеробикарбоническую кольцевую систему, при этом каждое кольцо необязательно замещено одним-тремя заместителями, независимо выбранными из группы,

включающей C₁-C₄ алкил, C₂-C₄ алкенил, C₂-C₄ алкинил, C₃-C₆ циклоалкил, C₁-C₄ галогеналкил, C₂-C₄ галогеналкенил, C₂-C₄ галогеналкинил, C₃-C₆ галогенциклоалкил, галоген, CN, NO₂, C₁-C₄ алкокси, C₁-C₄ галогеналкокси, C₁-C₄ алкилтио, C₁-C₄ алкилсульфинил, C₁-C₄ алкилсульфонил, C₁-C₄ алкиламино, C₂-C₈ диалкиламино, C₃-C₆ циклоалкиламино, C₃-C₆ (алкил)циклоалкиламино, C₂-C₄ алкилкарбонил, C₂-C₆ алкоксикарбонил, C₂-C₆ алкиламинокарбонил, C₃-C₈ диалкиламинокарбонил или C₃-C₈ триалкилсилил; или

(R⁵)₂, вместе со смежными атомами углерода, с которыми они связаны, образуют -OCF₂O-, -CF₂CF₂O- или -OCF₂CF₂O-;

каждый R⁶ независимо представляет собой C₁-C₆ алкил, C₂-C₆ алкенил, C₂-C₆ алкинил, необязательно замещенный галогеном, CN, C₁-C₄ алкокси, C₁-C₄ алкилтио

или R⁷; C₃-C₆ циклоалкил; или C₂-C₄ алкоксикарбонил; или

каждый R⁶ независимо представляет собой фенильное кольцо или 5- или 6-членное гетероароматическое кольцо, при этом каждое кольцо необязательно замещено одним-тремя заместителями, независимо выбранными из группы,

включающей C₁-C₄ алкил, C₂-C₄ алкенил, C₂-C₄ алкинил, C₃-C₆ циклоалкил, C₁-C₄ галогеналкил, C₂-C₄ галогеналкенил, C₂-C₄ галогеналкинил, C₃-C₆ галогенциклоалкил, галоген, CN, NO₂, C₁-C₄ алкокси, C₁-C₄ галогеналкокси, C₁-C₄ алкилтио, C₁-C₄ алкилсульфинил, C₁-C₄ алкилсульфонил, C₁-C₄ алкиламино, C₂-C₈ диалкиламино, C₃-C₆ циклоалкиламино, C₃-C₆ (алкил)циклоалкиламино, C₂-C₄ алкилкарбонил, C₂-C₆ алкоксикарбонил, C₂-C₆ алкиламинокарбонил, C₃-C₈ диалкиламинокарбонил или C₃-C₆ триалкилсилил;

каждый R⁷ независимо представляет собой фенильное кольцо или 5- или 6-членное гетероароматическое кольцо, при этом каждое кольцо необязательно замещено одним-тремя заместителями, независимо выбранными из группы,

включающей C₁-C₄ алкил, C₂-C₄ алкенил, C₂-C₄ алкинил, C₃-C₆ циклоалкил, C₁-C₄ галогеналкил, C₂-C₄ галогеналкенил, C₂-C₄ галогеналкинил, C₃-C₆ галогенциклоалкил, галоген, CN, NO₂, C₁-C₄ алкокси, C₁-C₄ галогеналкокси, C₁-C₄ алкилтио, C₁-C₄ алкилсульфинил, C₁-C₄ алкилсульфонил, C₁-C₄ алкиламино, C₂-C₈ диалкиламино, C₃-C₆ циклоалкиламино, C₃-C₆ (алкил)циклоалкиламино, C₂-C₄ алкилкарбонил, C₂-C₆ алкоксикарбонил, C₂-C₆ алкиламинокарбонил, C₃-C₈ диалкиламинокарбонил или C₃-C₆ триалкилсилил; и

n имеет значение от 1 до 4;

при условии, что когда K представляет собой -NR¹C(=A)- и A представляет собой O или S, тогда L является отличным от

-C(=O)NR²- или -C(=S)NR²-.

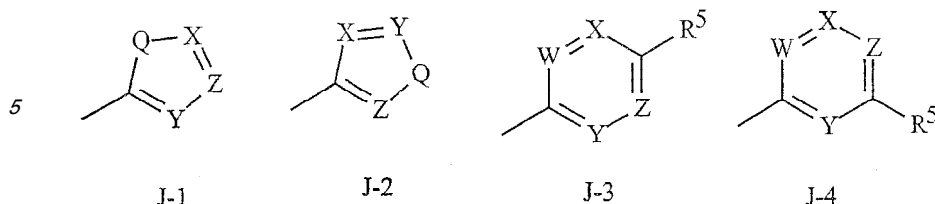
Также важными являются выбранные соединения формулы I.

Выбранная группа A. Соединения формулы I, где K представляет собой -NR¹C(=A)- и A представляет собой O.

Выбранная группа B. Соединения формулы I, где L представляет собой -C(=B)NR²- и B представляет собой O.

Выбранная группа C. Соединения Выбранной группы B или Выбранной группы C, где J представляет собой фенильное кольцо или 5- или 6-членное гетероароматическое кольцо, выбранное из группы, включающей J-1, J-2, J-3 и J-4, при этом каждое кольцо J

необязательно замещено 1-3 заместителями R⁵



Q представляет собой O, S или NR⁵;

W, X, Y и Z независимо представляют собой N или CR⁵, при условии что в J-3 и J-4 по меньшей мере один из W, X, Y или Z представляет собой N;

R¹ представляет собой H, C₁-C₄ алкил, C₂-C₄ алкенил, C₂-C₄ алкинил, C₃-C₆ циклоалкил, C₂-C₆ алкилкарбонил или C₂-C₆ алкоксикарбонил;

R² представляет собой H, C₁-C₄ алкил, C₂-C₄ алкенил, C₂-C₄ алкинил, C₃-C₆ циклоалкил, C₂-C₆ алкилкарбонил или C₂-C₆ алкоксикарбонил;

R³ представляет собой C₁-C₆ алкил, C₂-C₆ алкенил, C₂-C₆ алкинил или C₃-C₆ циклоалкил, каждый необязательно замещенный одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, включающей галоген,

CN, C₁-C₂ алкокси, C₁-C₂ алкилтио, C₁-C₂ алкилсульфинил и C₁-C₂ алкилсульфонил;

одна из групп R⁴ присоединена к фенильному кольцу в положении 2 или положении 5, и указанный R⁴ представляет собой C₁-C₄ алкил, C₁-C₄ галогеналкил, галоген, CN, NO₂, C₁-C₄ алкокси, C₁-C₄ галогеналкокси, C₁-C₄ алкилтио, C₁-C₄ алкилсульфинил, C₁-C₄ алкилсульфонил, C₁-C₄ галогеналкилтио, C₁-C₄ галогеналкилсульфинил или C₁-C₄ галогеналкилсульфонил;

каждый R⁵ независимо представляет собой H, C₁-C₄ алкил, C₁-C₄ галогеналкил, галоген, CN,

NO₂, C₁-C₄ алкокси, C₁-C₄ галогеналкокси, C₁-C₄ алкилтио, C₁-C₄ алкилсульфинил, C₁-C₄ алкилсульфонил, C₁-C₄ галогеналкилтио, C₁-C₄ галогеналкилсульфинил, C₁-C₄ галогеналкилсульфонил или C₂-C₄ алкоксикарбонил, C₃-C₈ диалкиламинокарбонил; или

каждый R⁵ независимо представляет собой фенильное, бензильное или 5- или 6-членное гетероароматическое кольцо, при этом каждое кольцо необязательно замещено C₁-C₄ алкилом, C₂-C₄ алкенилом, C₂-C₄ алкинилом, C₃-C₆ циклоалкилом, C₁-C₄ галогеналкилом, C₂-C₄ галогеналкенилом, C₂-C₄ галогеналкинилом, C₃-C₆ галогенциклоалкилом, галогеном, CN,

NO₂, C₁-C₄ алкокси, C₁-C₄ галогеналкокси, C₁-C₄ алкилтио, C₁-C₄ алкилсульфинилом, C₁-C₄ алкилсульфонилом, C₁-C₄ алкиламино, C₂-C₈ диалкиламино, C₃-C₆ циклоалкиламино, C₃-C₆ (алкил)циклоалкиламино, C₂-C₄ алкилкарбонилом, C₂-C₆ алкоксикарбонилом, C₂-C₆ алкиламинокарбонилом, C₃-C₈ диалкиламинокарбонилом или C₃-C₆ триалкилсилилол; или

(R⁵)₂, вместе со смежными атомами углерода, с которыми они связаны, образуют -OCF₂O-, -CF₂CF₂O- или -OCF₂CF₂O-;

каждый R⁶ независимо представляет собой C₁-C₆ алкил, C₂-C₆ алкенил, C₂-C₆ алкинил, необязательно замещенный галогеном, CN, C₁-C₄ алкокси, C₁-C₄ алкилтио или R⁷; и

n имеет значение от 1 до 2.

Важными являются соединения Выбранной группы C, где K представляет собой -NR¹C(=O)- и L представляет собой -C(GR⁶)=N- или -SO₂NR²-. Также важными являются соединения Выбранной группы C, где L представляет собой -C(=O)NR²- и K представляет собой -N=C(GR⁶)- или -NR¹SO₂-.

Выбранная группа D. Соединения Выбранной группы C, где

R¹ представляет собой H или C₁-C₄ алкил;

R² представляет собой H или C₁-C₄ алкил;

R³ представляет собой C₁-C₄ алкил, необязательно замещенный галогеном, CN,

OCH_3 или $\text{S(O)}_p\text{CH}_3$;

одна группа R^5 присоединена к J в положении орто относительно K, и указанный R^5 представляет собой $\text{C}_1\text{-C}_4$ алкил, $\text{C}_1\text{-C}_4$ галогеналкил, галоген, CN, NO_2 , $\text{C}_1\text{-C}_4$ алкокси, $\text{C}_1\text{-C}_4$ галогеналкокси, $\text{C}_1\text{-C}_4$ алкилтио, $\text{C}_1\text{-C}_4$ алкилсульфинил, $\text{C}_1\text{-C}_4$ алкилсульфонил, $\text{C}_1\text{-C}_4$ галогеналкилтио, $\text{C}_1\text{-C}_4$ галогеналкилсульфинил, $\text{C}_1\text{-C}_4$ галогеналкилсульфонил или $\text{C}_2\text{-C}_4$ алкоксикарбонил; $\text{C}_3\text{-C}_8$ диалкиламинокарбонил или фенильное, бензильное, или 5- или 6-членное гетероароматическое кольцо, при этом каждое кольцо необязательно замещено галогеном, CN, NO_2 , $\text{C}_1\text{-C}_4$ алкилом, $\text{C}_2\text{-C}_4$ алкенилом, $\text{C}_2\text{-C}_4$ алкинилом, $\text{C}_3\text{-C}_6$ циклоалкилом, $\text{C}_1\text{-C}_4$ галогеналкилом, $\text{C}_1\text{-C}_4$ алкокси или $\text{C}_1\text{-C}_4$ галогеналкокси;

и необязательная вторая группа R^5 независимо представляет собой $\text{C}_1\text{-C}_4$ алкил, $\text{C}_1\text{-C}_4$ галогеналкил, галоген, CN, NO_2 , $\text{C}_1\text{-C}_4$ алкокси, $\text{C}_1\text{-C}_4$ галогеналкокси, $\text{C}_1\text{-C}_4$ алкилтио, $\text{C}_1\text{-C}_4$ алкилсульфинил, $\text{C}_1\text{-C}_4$ алкилсульфонил, $\text{C}_1\text{-C}_4$ галогеналкилтио, $\text{C}_1\text{-C}_4$ галогеналкилсульфинил, $\text{C}_1\text{-C}_4$ галогеналкилсульфонил или $\text{C}_2\text{-C}_4$ алкоксикарбонил; $\text{C}_3\text{-C}_8$ диалкиламинокарбонил или фенильное, бензильное или 5- или 6-членное гетероароматическое кольцо, при этом каждое кольцо необязательно замещено галогеном, CN, NO_2 , $\text{C}_1\text{-C}_4$ алкилом, $\text{C}_2\text{-C}_4$ алкенилом, $\text{C}_2\text{-C}_4$ алкинилом, $\text{C}_3\text{-C}_6$ циклоалкилом, $\text{C}_1\text{-C}_4$ галогеналкилом, $\text{C}_1\text{-C}_4$ алкокси или $\text{C}_1\text{-C}_4$ галогеналкокси;

G представляет собой O или S; и

r имеет значение 0, 1 или 2.

Выбранная группа E. Соединения Выбранной группы D, где J представляет собой фенил, пиразол, пиррол, пиридин или пиримидин, каждый замещенный одним R^5 , связанным с J в положении орто относительно K, и вторым, необязательным R^5 .

Выбранная группа F. Соединения Выбранной группы E, где R^1 и R^2 , каждый, представляет собой H;

один R^4 присоединен в положении 2 орто относительно K-J фрагмента и выбран из группы, включающей $\text{C}_1\text{-C}_3$ алкил, CF_3 , OCF_3 , OCHF_2 , $\text{S(O)}_p\text{CF}_3$, $\text{S(O)}_p\text{CHF}_2$ и галогена, и необязательный второй R^4 присоединен в положении 4 пара относительно K-J фрагмента и выбран из группы, включающей галоген, $\text{C}_1\text{-C}_3$ алкил и $\text{C}_1\text{-C}_3$ галогеналкил.

Выбранная группа F. Соединения Выбранной группы E, где

J представляет собой J-1;

Q представляет собой NR^{5a} ;

X представляет собой N или CH;

Y представляет собой CH;

Z представляет собой CR^{5b} ;

R^{5a} представляет собой фенильное или 2-пиридинильное кольцо, замещенное одним или двумя заместителями, выбранными из группы, включающей галоген, $\text{C}_1\text{-C}_4$ алкил, $\text{C}_1\text{-C}_4$ галогеналкил или $\text{C}_1\text{-C}_4$ галогеналкокси; и

R^{5b} представляет собой галоген или CF_3 .

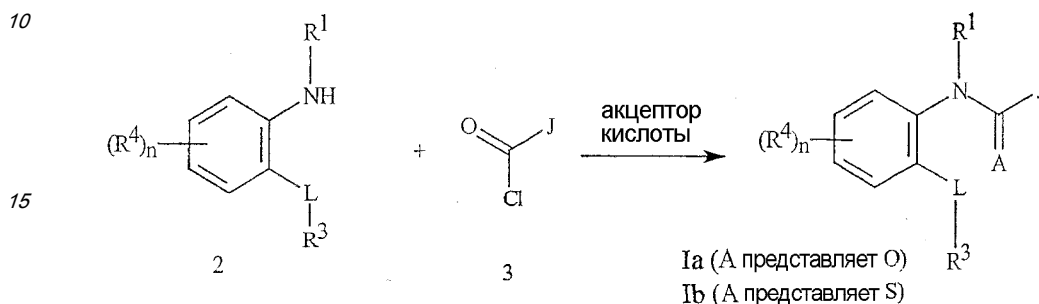
Для получения соединений Формулы I можно использовать один или несколько из следующих способов и вариантов, проиллюстрированных на схемах 1-33. Значения A, B, J, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 и n в представленных ниже Формулах 1-88 указаны выше в разделе "Краткое описание изобретения". Соединения формул Ia-e, 2a-b, 4a-s, 5a-d являются подгруппами соединений Формул 1, 2, 4 и 5.

Соединения формулы Ia (где K представляет собой $\text{NR}^1\text{C(=O)}$) можно получить путем сочетания амина Формулы 2 с хлорангидридом кислоты Формулы 3 в присутствии акцептора кислоты, в результате чего получают соединение Формулы Ia. Типичные акцепторы кислоты включают аминовые основания, такие как триэтиламин, диизопропилэтиламин и пиридин; другие акцепторы включают гидроксиды, такие как гидроксид натрия или калия, и карбонаты, такие как карбонат натрия или калия. B

некоторых случаях полезно использовать акцепторы кислоты на полимерной подложке, такие как связанный с полимером диизопропилэтиламин и связанный с полимером диметиламинопиридин. Реакцию сочетания осуществляют в подходящем инертном растворителе, таком как тетрагидрофуран, диоксан, диэтиловый эфир или дихлорметан, с

5 получением анилада Формулы Ia. На следующей стадии амиды Формулы Ia могут быть преобразованы в тиамиды Формулы Ib при помощи различных стандартных агентов переноса тиогруппы, включающих пентасульфид фосфора и реагент Лавессона.

Схема 1

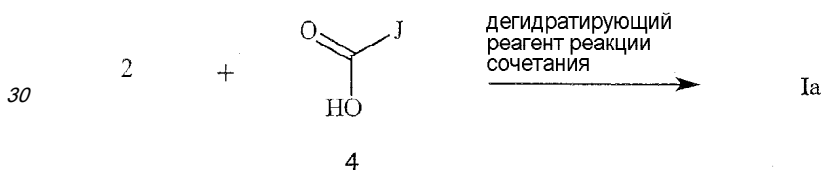


Альтернативный способ получения соединений Формулы Ia включает сочетание амина

20 Формулы 2 с кислотой Формулы 4 в присутствии агента дегидратирования, такого как дициклогексилкарбодиимид (DCC). Реагенты на полимерной подложке также полезны в этом способе, например, связанный с полимером циклогексилкарбодиимид. Методики синтеза, проиллюстрированные на Схемах 1 и 2, являются лишь репрезентативными примерами способов, используемых для получения соединений Формулы I, поскольку в

25 литературе по синтезу чрезвычайно широко описан такой тип реакции.

Схема 2



Специалисту в данной области должно быть понятно, что хлорангидриды кислоты Формулы 3 можно получить из кислот Формулы 4 различными хорошо известными

35 способами. Например, хлорангидриды кислоты Формулы 3 можно легко получить из карбоновых кислот Формулы 4 путем взаимодействия карбоновой кислоты 4 с тионилхлоридом или оксалилхлоридом в инертном растворителе, таком как толуол или дихлорметан, в присутствии каталитического количества N,N-диметилформамида.

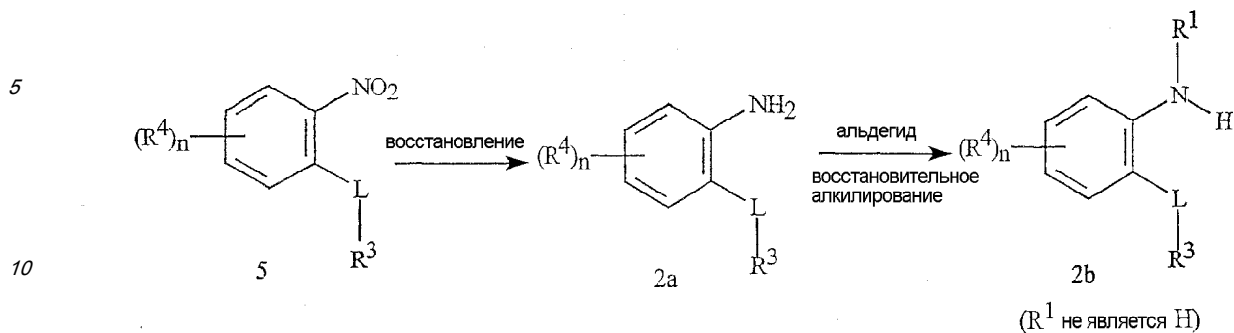
Амины Формулы 2 обычно легко получают из соответствующих нитросоединений Формулы 5 путем каталитического гидрирования нитрогруппы. Типичные методики включают восстановление при помощи водорода в присутствии металлического катализатора, такого как палладий на угле или оксид палладия, и в гидроксильном растворителе, таком как этанол или изопропанол. Их также можно получить путем

40 восстановления с использованием цинка в уксусной кислоте. Такие методики хорошо описаны в химической литературе. Заместители R¹, такие как алкил, замещенный алкил и т.п., как правило, можно вводить на этой стадии посредством обычно предпочтительного способа восстановительного алкилирования амина. Обычно используемая процедура представляет собой объединение анилина 2a с альдегидом в присутствии восстановителя,

45 такого как цианоборгидрид натрия, с получением соединений Формулы 2B, где R¹ представляет собой алкил, алкенил, алкинил или их замещенные производные.

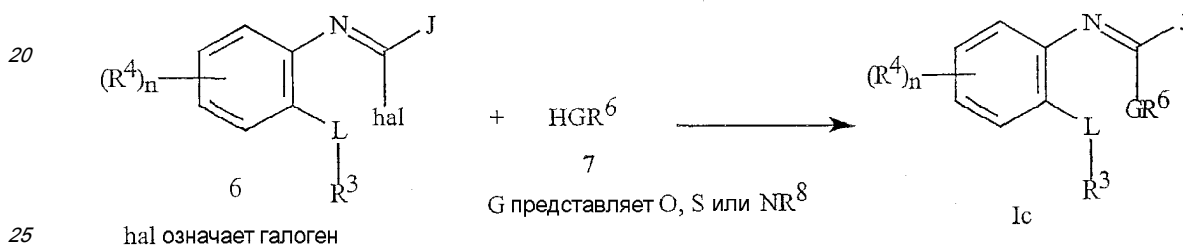
50

Схема 3



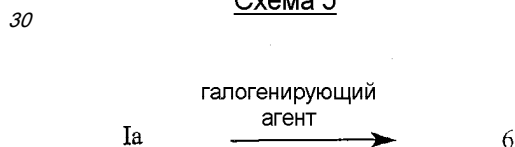
Соединения формулы Ic (где К представляет собой N=C(GR⁶)) можно получить взаимодействием имидоилгалогенидов Формулы 6 с серными, кислородными и азотными нуклеофилами Формулы 7. Типично реакцию осуществляют в присутствии основания, такого как третичный амин или гидроксид щелочного металла.

Схема 4



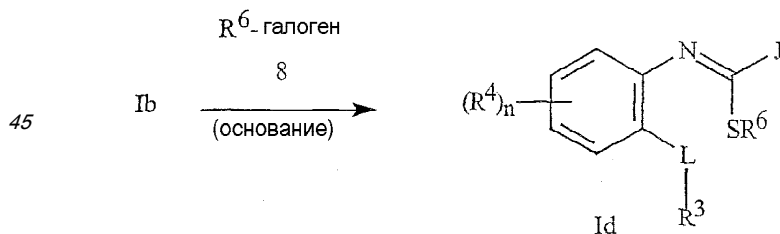
Соединения Формулы 6 можно получить из соединений Формулы Ia путем взаимодействия подходящего галогенирующего агента, такого как пентахлорид фосфора, оксихлорид фосфора, тионилхлорид или трифенилфосфин, и тетрахлорида углерода.

Схема 5



Альтернативно, соединения Формулы Id (где К представляет собой N=C(SR⁶)), где R⁶ представляет собой алкильную или замещенную алкильную группу, можно получить из соединений Формулы Ib взаимодействием с алкилгалогенидом формулы 8, необязательно в присутствии основания, такого как третичный амин или алкоксид щелочного металла.

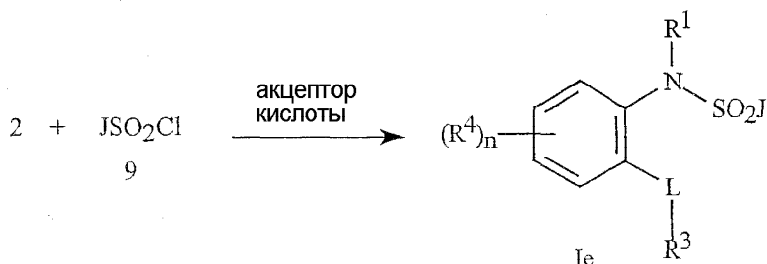
Схема 6



Соединения формулы 1e (где К представляет собой NR¹SO₂) можно получить путем взаимодействия амина Формулы 2 с сульфонилхлоридом Формулы 9 в присутствии акцептора кислоты. Типичные акцепторы кислоты включают аминовые основания, такие как триэтиламин, диизопропилэтиламин и пиридин; другие акцепторы включают гидроксиды, такие как гидроксид натрия или калия, и карбонаты, такие как карбонат натрия или

калия. В некоторых случаях полезно использовать акцепторы кислоты на полимерной подложке, такие как связанный с полимером диизопропилэтиламин и связанный с полимером диметиламинопиридин.

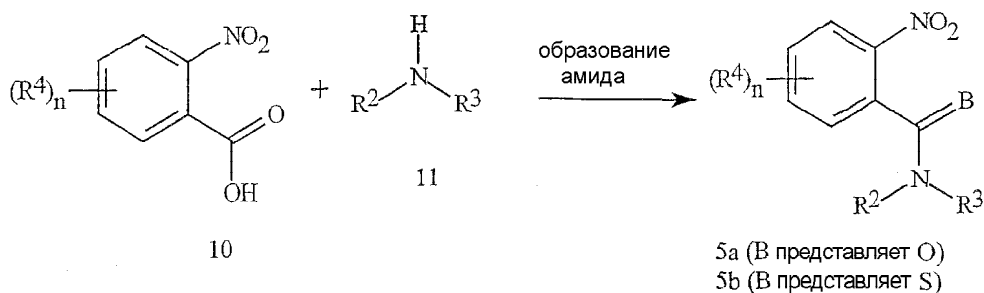
Схема 7



15 Нитросоединения Формулы 5a (где L представляет собой C(=O)NR²) можно легко получить из коммерчески доступных 2-нитробензойных кислот (Схема 8). Здесь можно применять типичные способы образования амидов. Такие способы включают прямое дегидративное сочетание кислот Формулы 10 с аминами Формулы 11 с использованием, например, DCC, и преобразование кислот в активированную форму, такую как

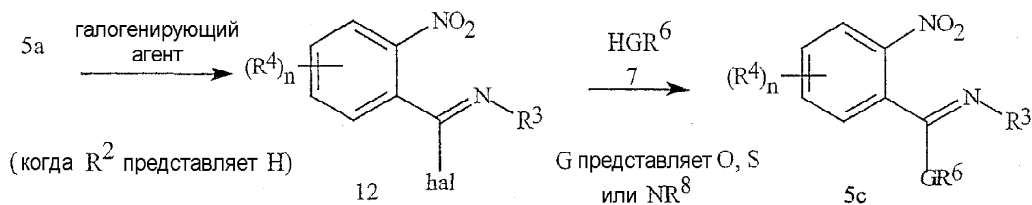
20 хлорангидриды или ангидриды кислот с последующим соединением с аминами с получением амидов Формулы 5a. В химической литературе подробно описан такой тип реакции. Амиды Формулы 5a могут быть легко преобразованы в тиамины Формулы 5b при помощи коммерчески доступных агентов переноса тиогруппы, таких как пентасульфид фосфора и реагент Лавессона.

Схема 8



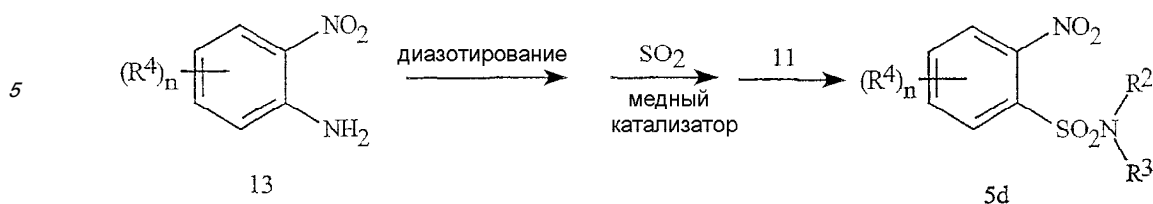
35 Нитросоединения Формулы 5c (где L представляет собой C(GR⁶)=N) можно получить из соединений Формулы 5a через имидоилгалогениды Формулы 12 способами, подобными проиллюстрированным на Схемах 4 и 5.

Схема 9



50 Нитросоединения Формулы 5D (где L представляет собой SO₂NR²) можно получить из аминов Формулы 13 диазотированием с использованием таких реагентов, как нитрит натрия или алкилнитрит, и взаимодействием с диоксидом серы в присутствии медного катализатора (см., например, Courtin, A. Helv.Chim.Acta, 1976, 59, 379-387) с последующим взаимодействием с аминами Формулы 11 (см. Схему 8). Синтез аминов Формулы 13 хорошо известен из уровня техники.

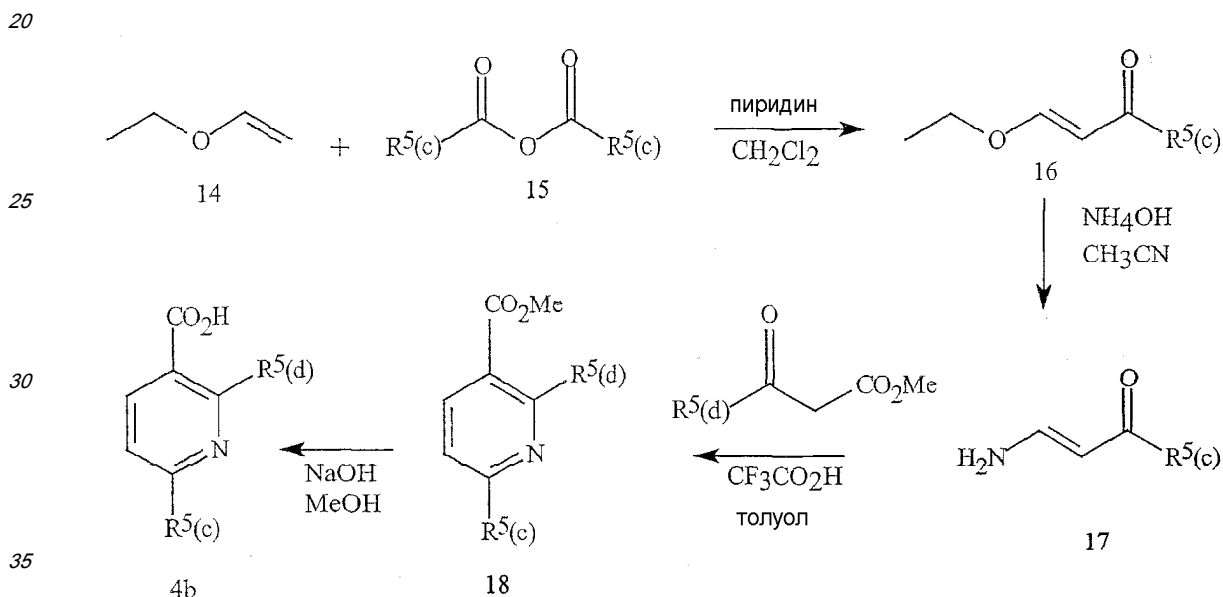
Схема 10



10 Бензойные кислоты Формулы 4а (соединения Формулы 4, где J представляет собой необязательно замещенное фенильное кольцо) хорошо известны из уровня техники. Получение некоторых гетероциклических кислот Формулы 4 проиллюстрировано на Схемах 11-16. Различные гетероциклические кислоты и способы их получения описаны в

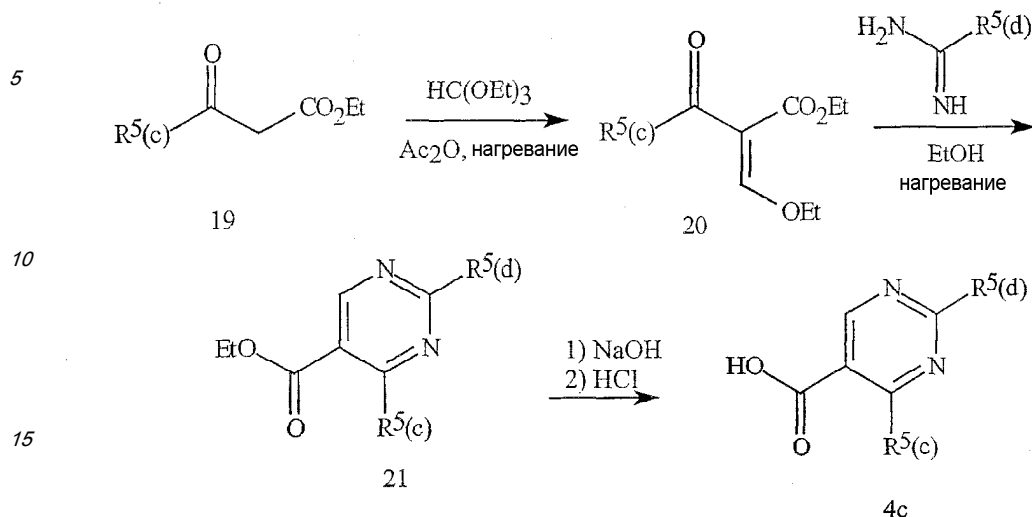
15 Международной патентной заявке WO 98/57397. Синтез репрезентативных пиридиновых кислот (4b) представлен на Схеме 11. Эта процедура включает известный синтез пиридинов из сложных β-кетозэфиров и 4-аминобутенонов (17). Группы заместителей R⁵(c) и R⁵(d) включают, например, алкил и галогеналкил.

Схема 11



40 Синтез репрезентативных пиримидиновых кислот (4с) представлен на Схеме 12. Эта процедура включает известный синтез пиримидинов из винилиден-β-кетозэфиров (20) и амидинов. Группы заместителей R⁵(c) и R⁵(d) включают, например, алкил и галогеналкил.

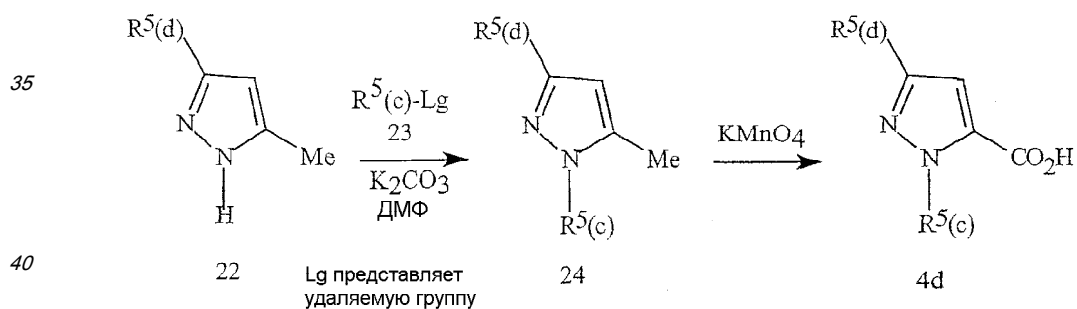
Схема 12



Синтез репрезентативных пиразоловых кислот (4d-g) представлен на Схемах 13-16.

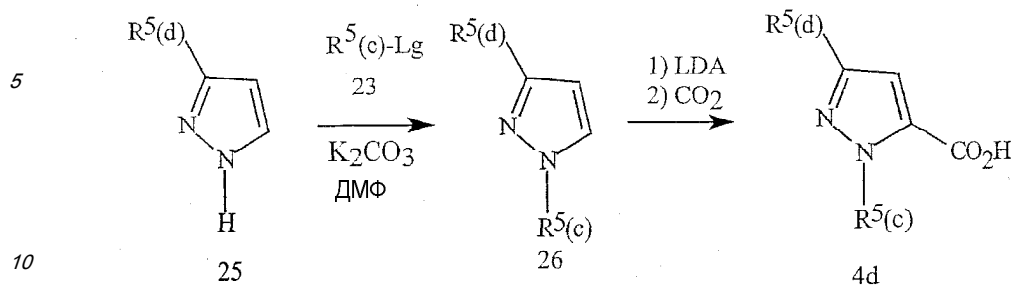
Синтез 4d на Схеме 13 включает в качестве ключевой стадии введение заместителя $R^5(c)$ через алкилирование пиразола. Агент алкилирования $R^5(c)$ -Lg (где Lg представляет собой удаляемую группу, такую как Cl, Br, I, сульфонаты, такие как п-толуолсульфонат или метансульфонат, или сульфаты, такие как $-SO_2OR^5(c)$) включает группы $R^5(c)$, такие как C_1 - C_6 алкил, C_2 - C_6 алкенил, C_2 - C_6 алкинил, C_3 - C_6 циклоалкил, C_1 - C_6 галогеналкил, C_2 - C_6 галогеналкенил, C_2 - C_6 галогеналкинил, C_3 - C_6 галогенциклоалкил, C_2 - C_6 алкилкарбонил, C_2 - C_6 алкоксикарбонил, C_3 - C_8 диалкиламинокарбонил, C_3 - C_6 триалкилсилил; или фенильное, бензильное, бензоильное, 5- или 6-членное гетероароматическое кольцо или ароматическую 8-, 9- или 10-членную конденсированную гетеробикалическую кольцевую систему, при этом каждое кольцо или кольцевая система являются необязательно замещенными. В результате окисления метильной группы получают пиразолкарбоновую кислоту. Некоторые более предпочтительные $R^5(d)$ группы включают галогеналкил.

Схема 13



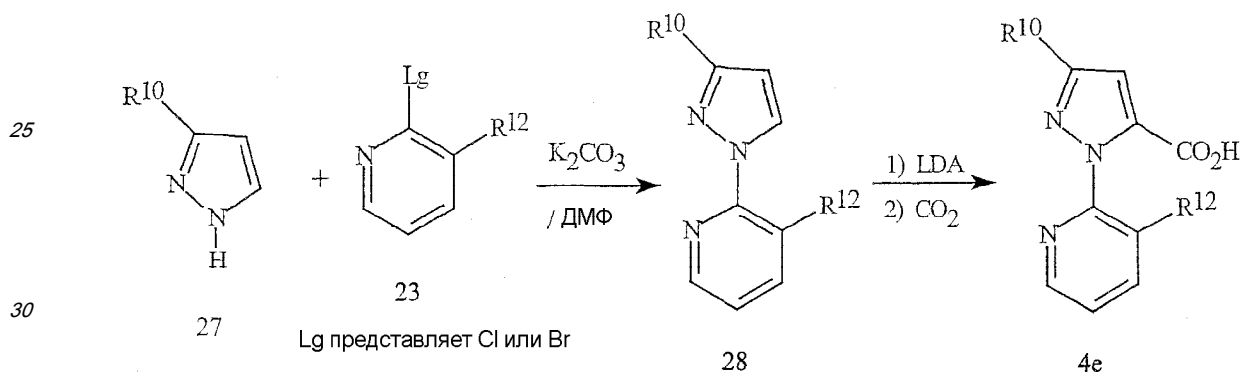
Некоторые пиразоловые кислоты Формулы 4d можно получить через металлизирование и карбоксилирование пиразолов формулы 26, как ключевой стадии (Схема 14). $R^5(c)$ группу вводят способом, подобным описанному на Схеме 13, т.е. через алкилирование при помощи агента алкилирования $R^5(c)$. Репрезентативные $R^5(d)$ группы включают, например, циано и галогеналкил.

Схема 14



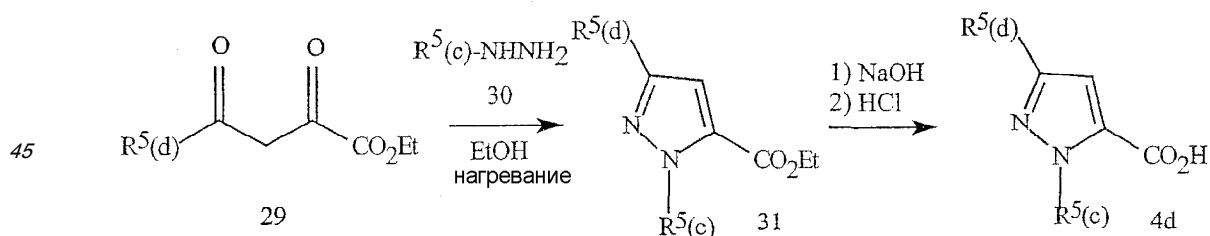
Эта процедура особенно полезна для получения 1-(2-пиридинил)пиразолкарбоновых кислот Формулы 4е, относящихся к предпочтительной группе J-5, где R⁵ представляет собой замещенное 2-пиридинильное кольцо, как показано на Схеме 15. Взаимодействие пиразола Формулы 27 с 2,3-дигалогенпиридином Формулы 23 обеспечивает хороший выход 1-пиридинилпиразола Формулы 28 с хорошей специфичностью в отношении желаемой стереохимии. В результате металлирования 28 диизопропиламидом лития (LDA) с последующим гашением литиевой соли диоксидом углерода получают 1-(2-пиридинил)пиразолкарбоновую кислоту Формулы 4е.

Схема 15



Другие пиразолы Формулы 4d можно получить посредством реакции необязательно замещенного фенилгидразина Формулы 30 с пируватом Формулы 29 с образованием сложных пиразоловых эфиров Формулы 31 (Схема 16). В результате гидролиза сложного эфира получают пиразоловые кислоты 4D. Эта процедура особенно полезна для получения соединений, где R⁵(c) является необязательно замещенным фенилом и R⁵(d) представляет собой галогеналкил.

Схема 16

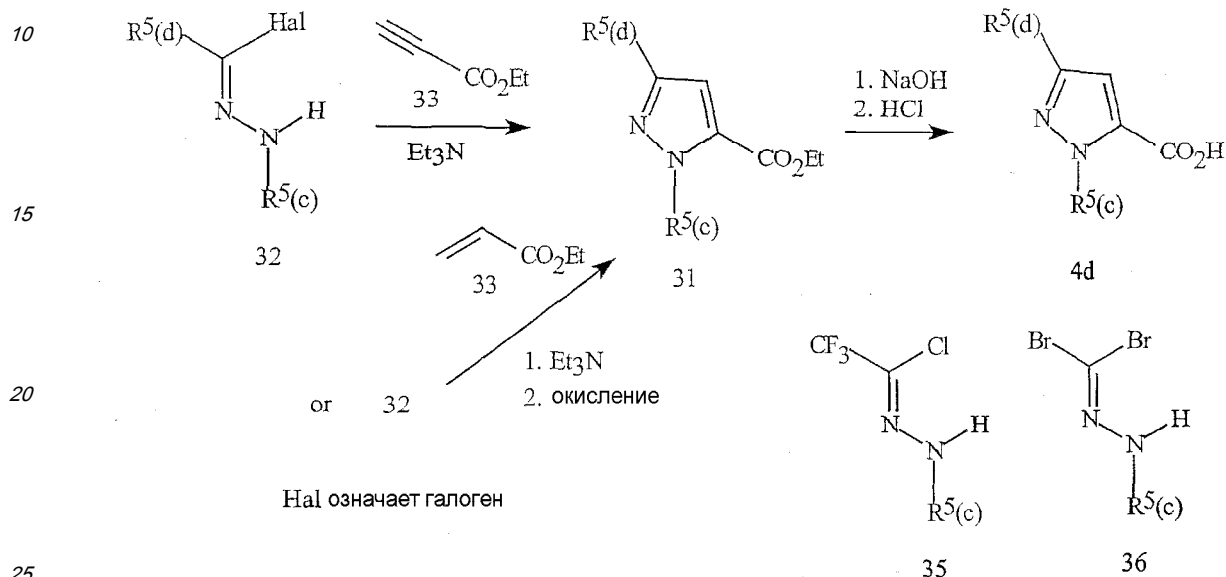


Пиразоловые кислоты Формулы 4d можно получить через 3+2 циклоприсоединение подходяще замещенного нитрилимина Формулы 32 либо с замещенными пропиолатами Формулы 33, либо акрилатами Формулы 34 (Схема 17). Циклоприсоединение с акрилатами требует дополнительного окисления промежуточного пиразолина до пиразола. Гидролиз сложного эфира Формулы 31 дает пиразоловые кислоты 4d. Предпочтительные

иминогалогениды для этой реакции включают трифторметилиминохлорид (35) и иминодибромид (36). Такие соединения, как 35, являются известными (J.Heterocycl.Chem. 1985, 22(2), 565-8). Такие соединения, как 36, могут быть легко получены известными методами (Tetrahedron Letters 1999, 40, 2605). Эти методики особенно полезны для

5 получения соединений, где $R^5(c)$ является необязательно замещенным фенилом и $R^5(d)$ представляет собой галогеналкил или бром.

Схема 17

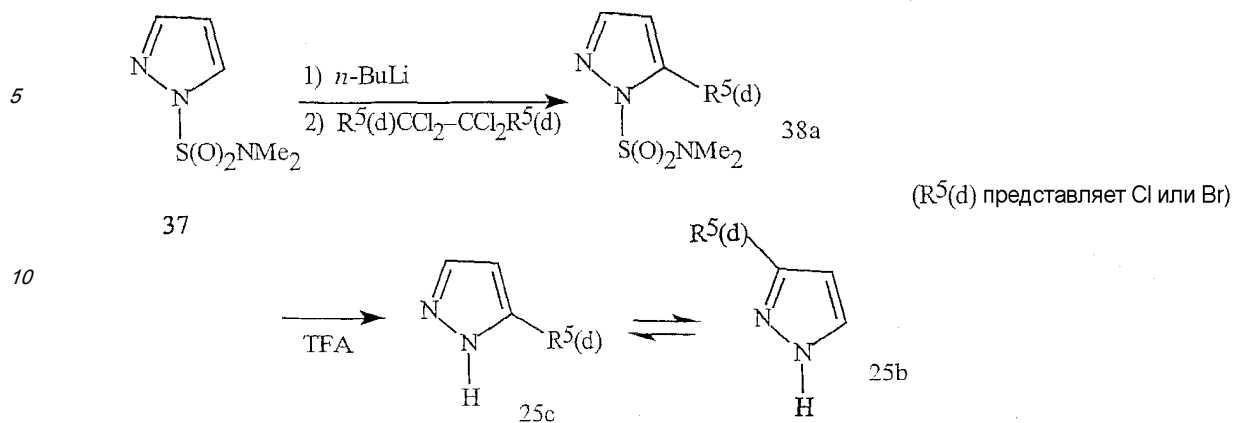


Исходные пиразолы Формулы 25 являются известными соединениями и могут быть получены известными методами. Пиразол Формулы 25a (соединение Формулы 25, где $R^5(d)$ представляет собой CF_3) может быть получен способами, описанными в литературе (J.Fluorine Chem. 1991, 53(1), 61-70). Пиразолы Формулы 25b (соединение

30 Формулы 25, где $R^5(d)$ представляет собой Cl или Br) могут быть получены способами, описанными в литературе (Chem.Ber. 1966, 99(10), 3350-7). Полезный альтернативный способ получения соединения 25b представлен на Схеме 18. Металлирование сульфамойлпиразола Формулы 37 н-бутиллитием с последующим непосредственным галогенированием аниона либо гексахлорэтаном (для $R^5(d)$, который представляет собой Cl), либо 1,2-дибромтетрахлорэтаном (для $R^5(d)$, который представляет собой Br) дает галогенированные производные Формулы 38a. Реакция удаления сульфамойльной группы трифторуксусной кислотой (TFA) протекает чисто и приводит к получению пиразолов Формулы 25c с хорошим выходом. Специалисту в данной области должно быть понятно,

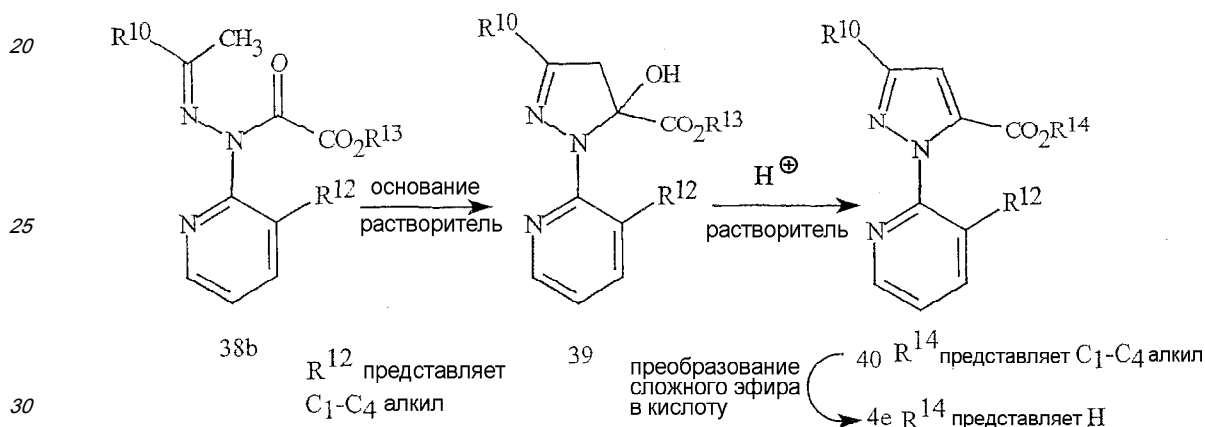
40 что Формула 25c представляет собой таутомер Формулы 25b.

Схема 18



Пиразолкарбоновые кислоты Формулы 4f, где R¹⁰ представляет собой CF₃, можно получить способом, представленным на Схеме 19.

Схема 19



Взаимодействие соединения Формулы 38b, где R¹² представляет собой C₁-C₄ алкил, с подходящим основанием в подходящем органическом растворителе дает циклизованный продукт Формулы 39 после нейтрализации кислотой, такой как уксусная кислота.

Подходящим основанием может быть, например (но без какого-либо ограничения), гидрид натрия, трет-бутоксид калия, димсил натрий (CH₃S(O)CH₂⁻Na⁺), карбонаты или гидроксиды щелочных металлов (таких как лития, натрия или калия), фториды или гидроксиды тетраалкил (например, метил, этил или бутил)аммония или 2-трет-бутилимино-2-диэтиламино-1,3-диметил-пергидро-1,3,2-диазафосфонин. Подходящим органическим растворителем может быть, например (но без какого-либо ограничения), ацетон, ацетонитрил, тетрагидрофуран, дихлорметан, диметилсульфоксид или N,N-диметилформамид. Реакцию циклизации обычно осуществляют при температуре в пределах от 0 до 120°C. Влияние растворителя, основания, температуры и времени добавления взаимосвязано, и выбор условий реакции является важным для получения минимального образования побочных продуктов. Предпочтительным основанием является фторид тетрабутиламмония.

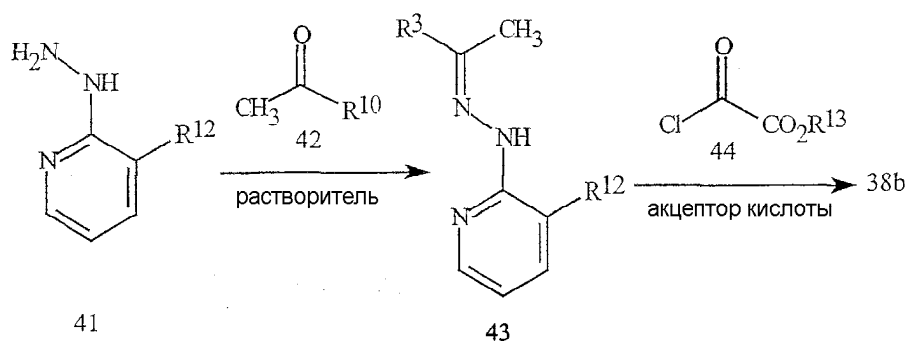
Дегидратация соединения Формулы 39 с получением соединения Формулы 40 с последующим преобразованием функциональной группы сложного эфира карбоновой кислоты в группу карбоновой кислоты дает соединение Формулы 4f. Дегидратацию осуществляют посредством обработки каталитическим количеством подходящей кислоты. Такая каталитическая кислота может, например, представлять собой (но без какого-либо ограничения) серную кислоту. Реакцию обычно осуществляют с использованием органического растворителя. Специалисту в данной области должно быть понятно, что

реакции дегидратации можно осуществлять в широком диапазоне растворителей при температуре в пределах от около 0 до 200°C, более предпочтительно, от около 0 до 100 °C. Для дегидратации способом, представленным на Схеме 19, предпочтительным является растворитель, включающий уксусную кислоту, и температура около 65°C.

Сложные эфиры карбоновых кислот могут быть преобразованы в соединения карбоновых кислот различными способами, включающими нуклеофильное отщепление в безводных условиях или гидролитические способы, включающие использование либо кислот, либо оснований (обзор таких способов см. T.W.Greene and P.G.M.Wuts, *Protective Groups in Organic Synthesis*, 2nd ed., John Wiley & Sons, Inc., New York, 1991, pp. 224-269). Для способа, представленного на Схеме 19, предпочтительными являются катализируемые основанием гидролитические способы. Подходящие основания включают гидроксиды щелочных металлов (таких как литий, натрий или калий). Например, сложный эфир можно растворить в смеси воды и спирта, такого как этанол. При обработке гидроксидом натрия или гидроксидом калия, сложный эфир омыляется с получением натриевой или калиевой соли карбоновой кислоты. Подкисление сильной кислотой, такой как хлористоводородная или серная кислота, дает карбоновую кислоту Формулы 4F. Карбоновую кислоту можно выделить методами, известными специалистам, включающими кристаллизацию, экстракцию и дистилляцию.

Соединения Формулы 38b можно получить способом, представленным на Схеме 20.

Схема 20

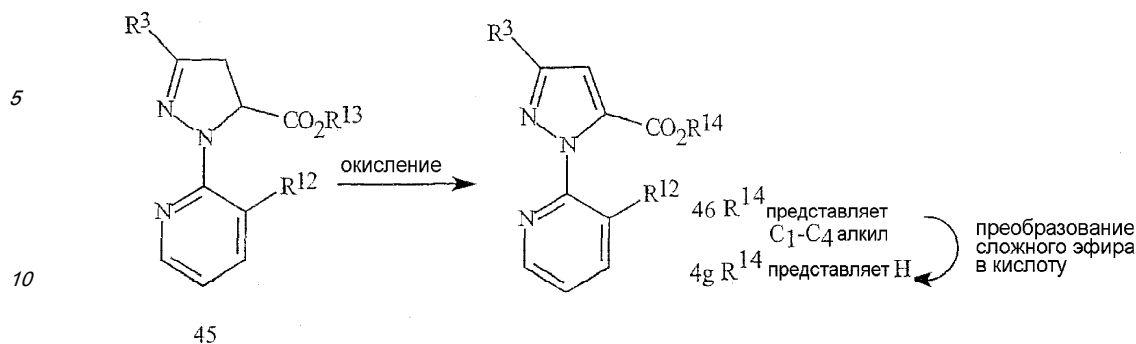


где R³ представляет собой CF₃ и R¹³ представляет собой C₁-C₄ алкил.

Обработка гидразина Формулы 41 кетоном Формулы 42 в растворителе, таком как вода, метанол или уксусная кислота, дает гидразон Формулы 43. Специалисту в данной области должно быть понятно, что может возникнуть необходимость катализировать эту реакцию необязательной кислотой, а также может возникнуть необходимость повышения температуры в зависимости от картины молекулярного замещения гидразона Формулы 43. Взаимодействие гидразона Формулы 43 с соединением Формулы 44 в подходящем органическом растворителе, таком как (но без какого-либо ограничения) дихлорметан или тетрагидрофуран, в присутствии акцептора кислоты, такого как триэтиламин, дает соединение Формулы 38. Реакцию обычно осуществляют при температуре в пределах от около 0 до 100°C. Гидразины Формулы 98 можно получить стандартными способами, такими как контактирование галогенированного соединения Формулы 23 (Схема 15) с гидразином.

Пирозолкарбоновые кислоты Формулы 4g, где R¹⁰ представляет собой Cl или Br, можно получить способом, представленным на Схеме 21.

Схема 21



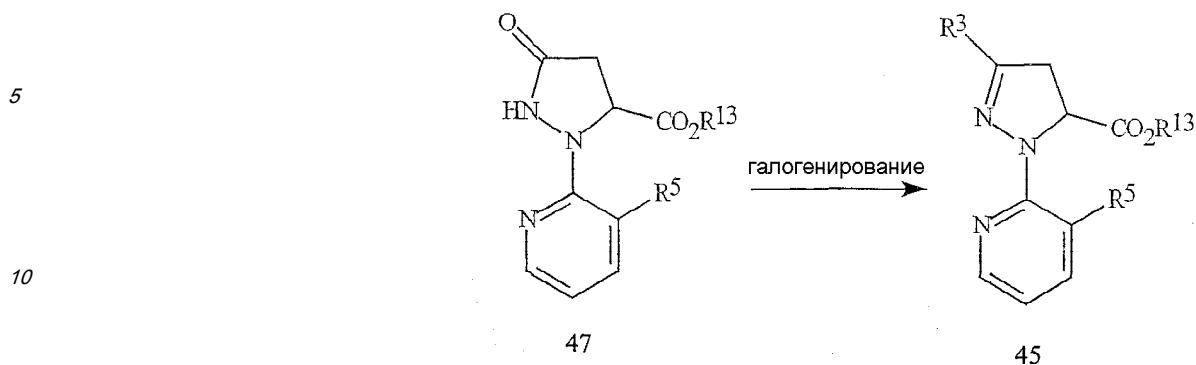
где R¹³ представляет C₁-C₄ алкил.

Окисление соединения Формулы 45, необязательно в присутствии кислоты, с получением соединения Формулы 46 с последующим преобразованием функциональной группы сложного эфира карбоновой кислоты в карбоновую кислоту дает соединение Формулы 4g. Окислителем может быть перекись водорода, органические пероксиды, персульфат калия, персульфат натрия, персульфат аммония, моноперсульфат калия (например, Oxone®) или перманганат калия. Для получения полной конверсии необходимо использовать, по меньшей мере, один эквивалент окислителя в расчете на соединение Формулы 45, предпочтительно от одного до двух эквивалентов. Такое окисление типично осуществляют в присутствии растворителя. Растворителем может быть простой эфир, такой как тетрагидрофуран, п-диоксан и т.д., сложный органический эфир, такой как этилацетат, диметилкарбонат и т.п., или полярный органический растворитель, такой как N,N-диметилформамид, ацетонитрил и т.д. Кислоты, подходящие для использования на стадии окисления, включают неорганические кислоты, такие как серная кислота, фосфорная кислота и т.д., и органические кислоты, такие как уксусная кислота, бензойная кислота и т.д. Когда используют кислоту, ее необходимо использовать в количестве, большем чем 0,1 эквивалент в расчете на соединение Формулы 45. Для получения полной конверсии можно использовать от одного до пяти эквивалентов кислоты. Предпочтительным окислителем является персульфат калия, и окисление осуществляют в присутствии серной кислоты. Реакцию можно осуществлять путем смешивания соединения Формулы 45 в желаемом растворителе и, если ее используют, кислоты. Затем можно добавлять обычное количество окислителя. Температура реакции обычно варьирует от около 0°C вплоть до температуры кипения растворителя, в целях достижения разумного времени реакции для доведения ее до завершения, предпочтительно она составляет менее 8 час. Желаемый продукт, соединение Формулы 46, можно выделить методами, известными специалистам, включающими кристаллизацию, экстракцию и дистилляцию. Способы, подходящие для преобразования сложного эфира Формулы 46 в карбоновую кислоту Формулы 4g, были описаны для Схемы 19.

Соединения Формулы 45 можно получить из соответствующих соединений Формулы 47,

как показано на Схеме 22.

Схема 22



где R^{13} представляет C_1 - C_4 алкил.

15 Обработка соединения Формулы 47 галогенирующим агентом, обычно в присутствии растворителя, дает соответствующее галоидное соединение Формулы 45. Галогенирующие агенты, которые можно использовать, включают оксигалогениды фосфора, тригалогениды фосфора, пентагалогениды фосфора, тионилхлорид, дигалогентриалкилфосфораны, дигалогендифенилфосфораны, оксалилхлорид и фосген. Предпочтительными являются оксигалогениды фосфора и пентагалогениды фосфора. Для получения полной конверсии необходимо использовать, по меньшей мере, 0,33 эквивалента оксигалогенида фосфора в расчете на соединение Формулы 47, предпочтительно, от около 0,33 до около 1,2 эквивалентов. Для получения полной конверсии необходимо использовать, по меньшей мере, 0,20 эквивалента пентагалогенида фосфора в расчете на соединение Формулы 47, предпочтительно, от около 0,20 до около 1,0 эквивалентов. Для этой реакции предпочтительными являются соединения Формулы 47,

20 где R^{13} представляет C_1 - C_4 алкил. Типичные растворители для такого галогенирования включают галогенированные алканы, такие как дихлорметан, хлороформ, дихлорбутан и т.п., ароматические растворители, такие как бензол, ксилол, дихлорбензол и т.п., простые эфиры, такие как тетрагидрофуран, п-диоксан, диэтиловый эфир и т.п., полярные апротонные растворители, такие как ацетонитрил, N,N-диметилформамид и т.п. Необязательно, может быть добавлено органическое основание, такое как триэтиламин, пиридин, N,N-диметиланилин и т.п. Добавление катализатора, такого как N,N-диметилформамид, также является необязательным. Предпочтительным является способ, в котором растворителем является ацетонитрил, а основание отсутствует. Типично, не требуется ни основания, ни катализатора, когда в качестве растворителя используют ацетонитрил. Предпочтительный способ осуществляют путем смешивания соединения Формулы 47 в ацетонитриле. Затем добавляют агент галогенирования в течение подходящего периода времени, и смесь затем выдерживают при желаемой температуре до 35 завершения реакции. Температура реакции типично находится в пределах от 20°C до температуры кипения ацетонитрила, и время реакции типично составляет менее 2 час. Затем реакционную массу нейтрализуют неорганическим основанием, таким как бикарбонат натрия, гидроксид натрия и т.п., или органическим основанием, таким как ацетат натрия. Желаемый продукт, соединение Формулы 45, можно выделить методами, известными специалистам, включающими кристаллизацию, экстракцию и дистилляцию.

40 Альтернативно, соединения Формулы 45, где R^{10} представляет собой Br или Cl, можно получить обработкой соответствующих соединений Формулы 45, где R^{10} представляет собой другой галоген (например, Cl для получения соединения Формулы 45, где R^{10} представляет собой бром) или сульфонатную группу, такую как п-толуолсульфонат, бромистым водородом или хлористым водородом, соответственно. При использовании этого способа галогеновый или сульфонатный заместитель R^{10} исходного соединения Формулы 45 замещают бромом или хлором из бромистого водорода или хлористого водорода, соответственно. Реакцию осуществляют в подходящем

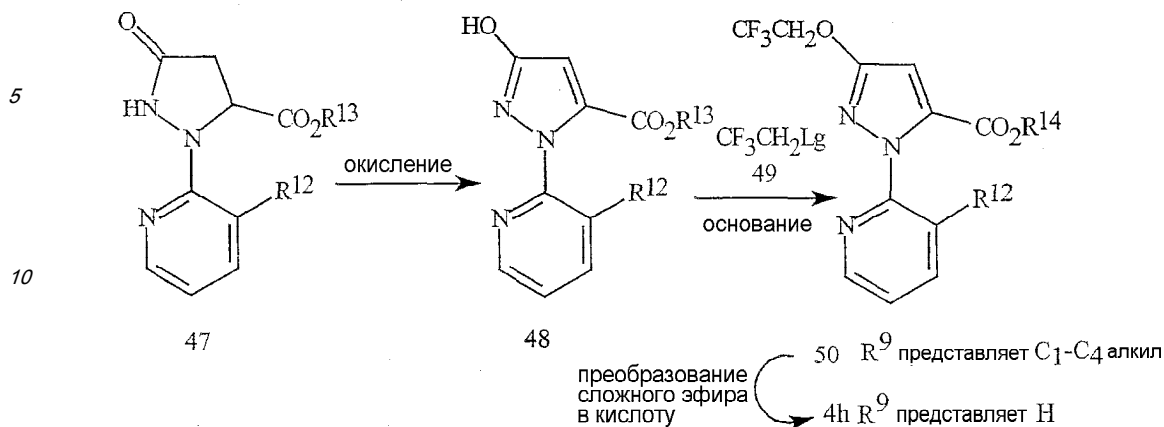
растворителе, таком как дибромметан, дихлорметан или ацетонитрил. Реакцию можно осуществлять при атмосферном давлении, или около этого, или при давлении выше атмосферного в аппарате высокого давления. Когда R^{10} в исходном соединении Формулы 45 представляет собой галоген, такой как Cl, реакцию предпочтительно осуществляют таким способом, чтобы галогенводородное соединение, образованное в результате реакции, можно было удалить барботированием или другим подходящим путем. Реакцию можно осуществлять при температуре в пределах от 0 до 100°C, наиболее удобной является температура около комнатной (например, от около 10 до около 40°C) и наиболее предпочтительно в пределах от 20 до 30°C. Добавление катализатора на основе кислоты Льюиса (такого как трибромид алюминия, для получения соединения Формулы 45, где R^{10} представляет собой Br) способствует протеканию реакции. Продукт Формулы 45 выделяют методами, известными специалистам, включающими экстракцию, дистилляцию и кристаллизацию.

Исходные соединения Формулы 45, где R^{10} представляет собой Br или Cl, можно получить из соответствующих соединений Формулы 47, как описано выше. Исходные соединения Формулы 45, где R^{10} представляет собой сульфонатную группу, также можно получить из соответствующих соединений Формулы 47 стандартными способами, такими как обработка сульфонилхлоридом (например, п-толуолсульфонилхлоридом) и основанием, таким как третичный амин (например, триэтиламин), в подходящем растворителе, таком как дихлорметан.

Пиразолкарбоновые кислоты Формулы 4h, где R^{10} представляет собой OCH_2CF_3 , можно получить способом, представленным на Схеме 23. В этом способе, вместо галогенирования, как это показано на Схеме 22, соединение Формулы 47 окисляют до соединения Формулы 48. Условия реакции для такого окисления описаны выше для преобразования соединения Формулы 45 в соединение Формулы 46, как показано на Схеме 21.

Затем соединение Формулы 48 алкилируют с образованием соединения Формулы 50 путем контактирования с агентом алкилирования CF_3CH_2Lg (49) в присутствии основания. В агенте алкилирования (49) Lg представляет собой удаляемую в процессе реакции нуклеофильного замещения группу, такую как галоген (например, Br, I), $OS(O)_2CH_3$ (метансульфонат), $OS(O)_2CF_3$, $OS(O)_2Ph$ -p- CH_3 (п-толуолсульфонат) и т.п.; выгодно использовать метансульфонат. Реакцию осуществляют в присутствии, по меньшей мере, одного эквивалента основания. Подходящие основания включают неорганические основания, такие как карбонаты или гидроксиды щелочных металлов (таких как лития, натрия или калия), и органические основания, такие как триэтиламин, диизопропилэтиламин и 1,8-диазабицикло[5.4.0]ундец-7-ен. Обычно реакцию осуществляют в растворителе, который может включать спирты, такие как метанол и этанол, галогенированные алканы, такие как дихлорметан, ароматические растворители, такие как бензол, толуол и хлорбензол, простые эфиры, такие как тетрагидрофуран, и полярные апротонные растворители, такие как ацетонитрил, N,N-диметилформамид и т.п. Спирты и полярные апротонные растворители являются предпочтительными для использования с неорганическими основаниями. Карбонат калия в качестве основания и ацетонитрил в качестве растворителя являются предпочтительными. Реакцию обычно осуществляют при температуре в пределах от 0 до 150°C, наиболее типично при температуре от около комнатной до около 100°C. Продукт Формулы 50 выделяют традиционными методами, такими как экстракция. Сложный эфир Формулы 50 затем преобразовывают в карбоновую кислоту Формулы 4h способами, описанными выше для преобразования соединения Формулы 40 в соединение Формулы 4f на Схеме 19.

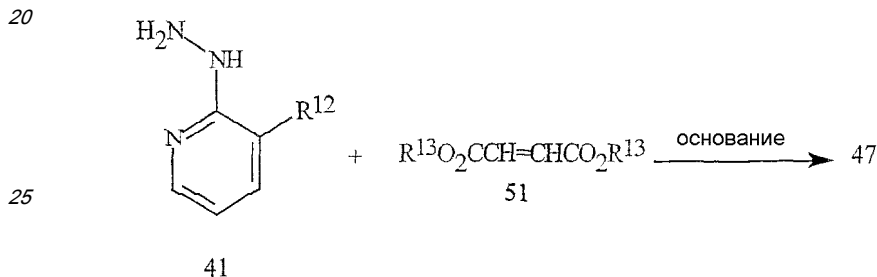
Схема 23



где R⁸ представляет C₁-C₄ алкил и Lg представляет собой удаляемую группу.

Соединения Формулы 47 можно получить из соединений Формулы 41 (Схема 20), как показано на Схеме 24.

Схема 24



где R¹³ представляет C₁-C₄ алкил.

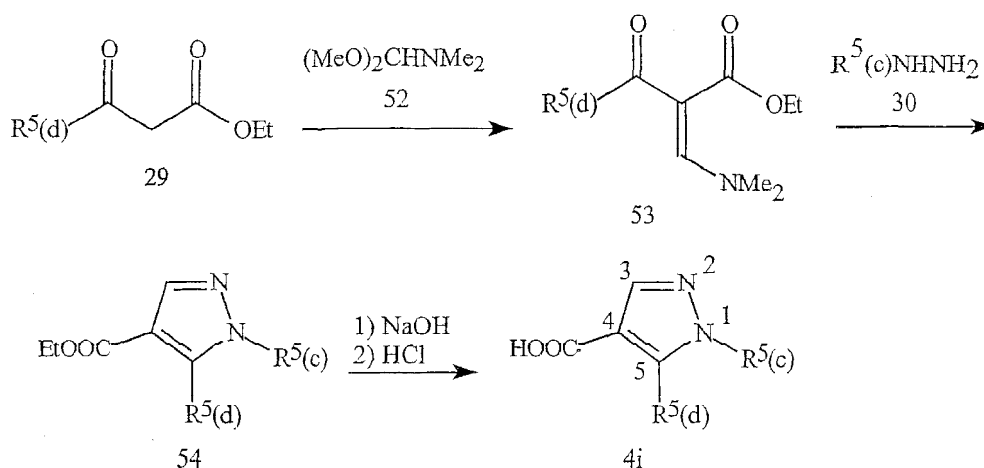
В этом способе обеспечивают контактирование гидразина Формулы 41 с соединением Формулы 51 (можно использовать сложный эфир фумаровой кислоты или сложный эфир малеиновой кислоты, или их смесь) в присутствии основания и растворителя. Основание типично представляет собой соль щелочного металла, такую как метоксид натрия, метоксид калия, этоксид натрия, этоксид калия, трет-бутоксид калия, трет-бутоксид лития и т.п. Необходимо использовать более чем 0,5 эквивалента основания в расчете на соединение Формулы 51, предпочтительно, от 0,9 до 1,3 эквивалентов. Необходимо использовать более чем 1,0 эквивалент соединения Формулы 108, предпочтительно, от 1,0 до 1,3 эквивалентов. Можно использовать полярные протонные и полярные апротонные органические растворители, такие спирты, ацетонитрил, тетрагидрофуран, N,N-диметилформамид, диметилсульфоксид и т.п. Предпочтительными растворителями являются спирты, такие как метанол и этанол. Особенно предпочтительно, чтобы спирт был таким же, из которого получают сложный эфир фумаровой или малеиновой кислоты и алкоксидное основание. Реакцию типично осуществляют смешиванием соединения Формулы 108 и основания в растворителе. Смесь можно нагревать или охлаждать до желаемой температуры, и соединение Формулы 98 добавляют в течение некоторого периода времени. Типично, температура реакции находится в пределах от 0°C до температуры кипения используемого растворителя. Реакцию можно осуществлять при давлении выше атмосферного, с тем, чтобы повысить температуру кипения растворителя. Обычно предпочтительной является температура в пределах от около 30 до около 90°C. Время добавления должно быть столь коротким, насколько это позволяет теплопередача. Типичное время добавления составляет от 1 мин до 2 час. Оптимальные температура реакции и время добавления варьируют в зависимости от природы соединений Формулы 98 и Формулы 51. По окончании добавления реакционную смесь можно выдерживать в течение некоторого времени при реакционной температуре. В зависимости от реакционной

температуры время выдерживания может составлять от 0 до 2 час. Типичное время выдерживания составляет от 10 до 60 мин. Затем реакционную массу подкисляют добавлением органической кислоты, такой как уксусная кислота и т.п., или неорганической кислоты, такой как хлористоводородная кислота, серная кислота и т.п. В

зависимости от условий реакции и способов выделения, функциональная группа $-\text{CO}_2\text{R}^{13}$ в соединении Формулы 47 может быть гидролизована до $-\text{CO}_2\text{H}$; например, присутствие воды в реакционной смеси может способствовать такому гидролизу. Если образуется карбоновая кислота ($-\text{CO}_2\text{H}$), она может быть преобразована обратно в $-\text{CO}_2\text{R}^{13}$, где R^{13} представляет собой C_1 - C_4 алкил, при помощи методов этерификации, хорошо известных из уровня техники. Желаемый продукт, соединение Формулы 47, можно выделить методами, известными специалистам, включающими кристаллизацию, экстракцию и дистилляцию.

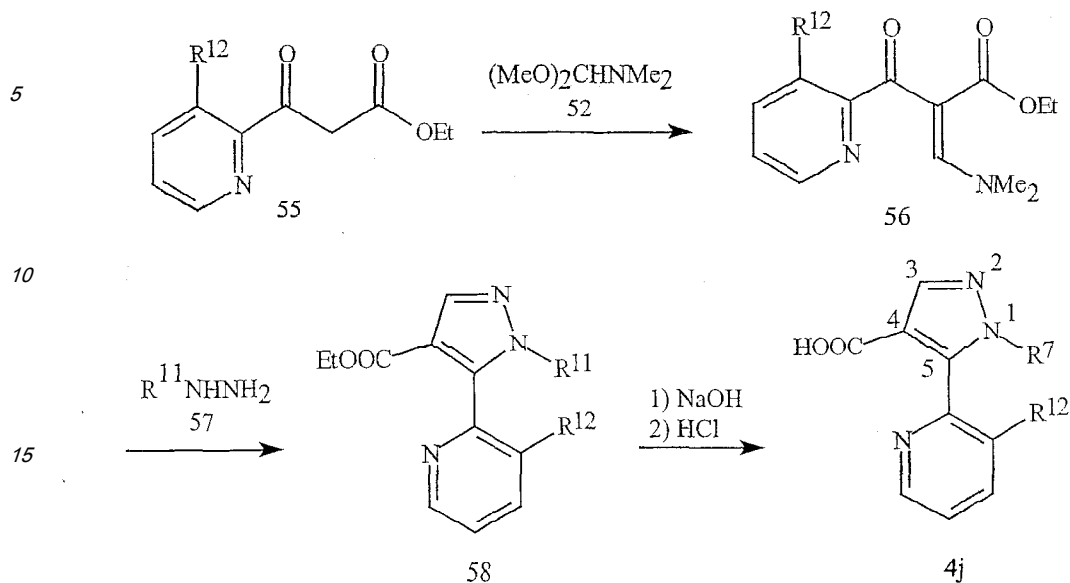
Синтез репрезентативных пиразоловых кислот Формулы 4i представлен на Схеме 25. Взаимодействие сложного кетозфира диметиламиноилидена Формулы 53 с замещенными гидразинами Формулы 30 дает пиразолы Формулы 54. Предпочтительные заместители $\text{R}^5(\text{c})$ включают алкил или галогеналкил, при этом особенно предпочтительным является 2,2,2-трифторэтил. Сложные эфиры Формулы 54 преобразовывают в кислоты Формулы 4i стандартным методом гидролиза.

Схема 25



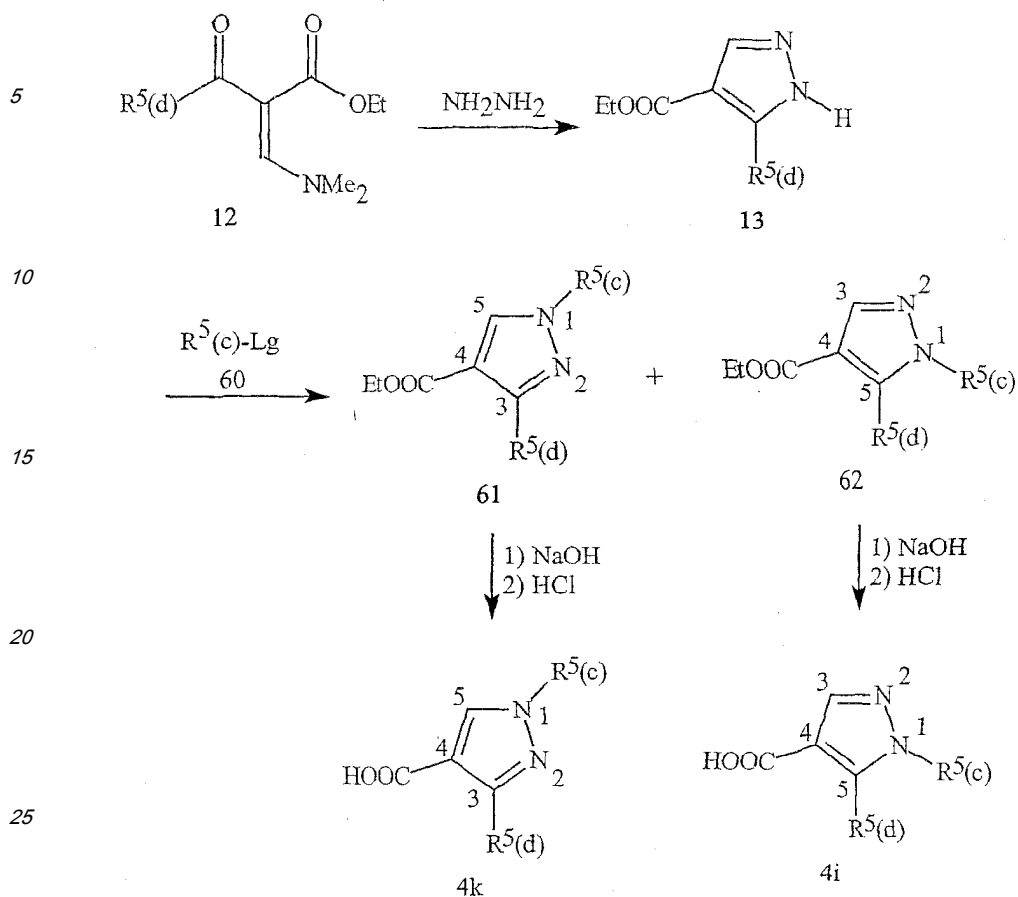
Синтез пиразоловых кислот Формулы 4j, относящихся к предпочтительной группе J-6, где R^5 представляет собой замещенную 2-пиридильную группу, присоединенную в положении 5 пиразольного кольца, представлен на Схеме 26. Этот синтез осуществляют в соответствии с общим способом синтеза, представленным на Схеме 27.

Схема 26



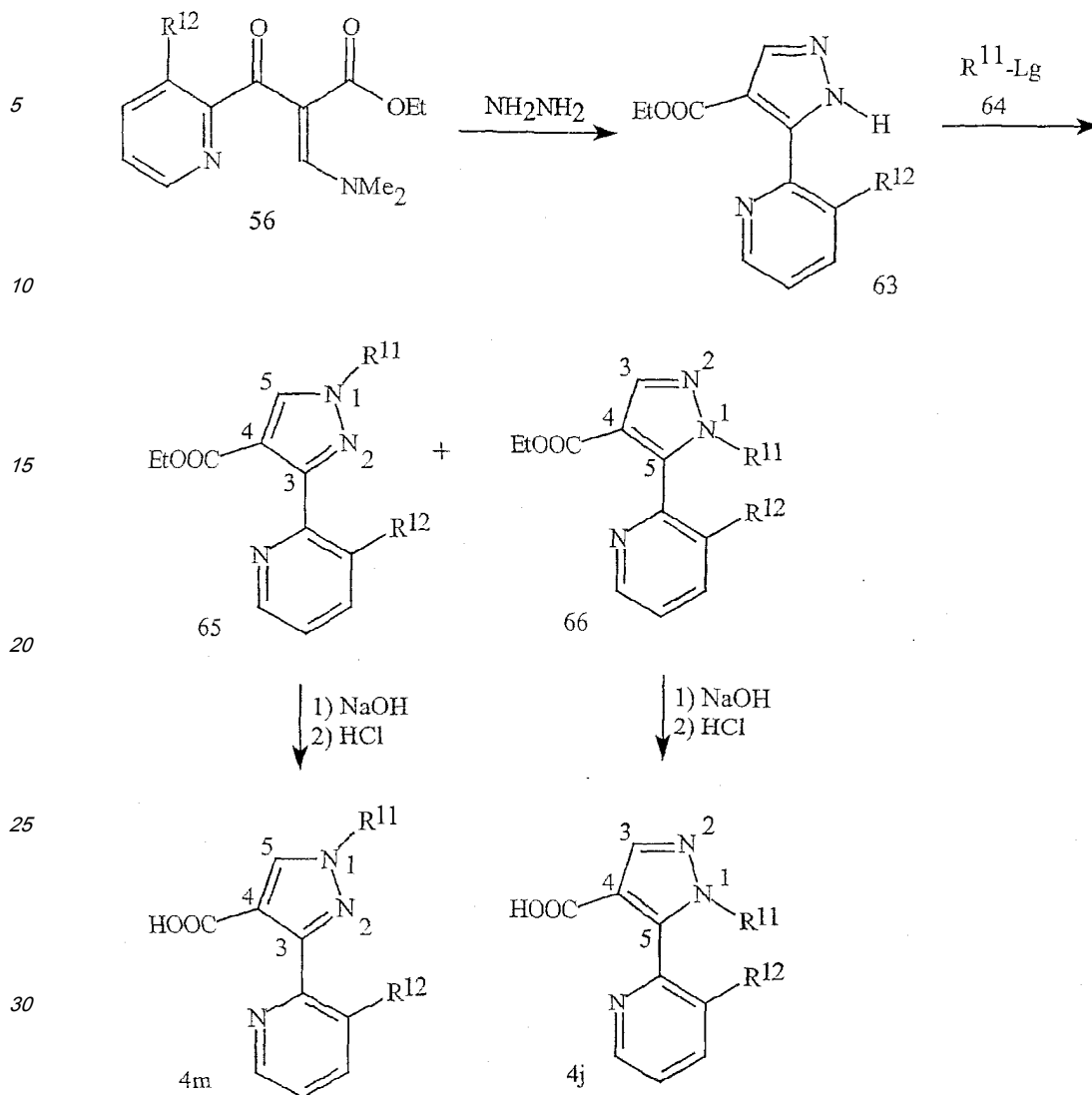
Синтез репрезентативных пиразоловых кислот Формулы 4к, а также альтернативный синтез соединения Формулы 4i представлен на Схеме 27. Взаимодействие сложного кетозфира диметиламиноилидена Формулы 53 с гидразином дает пиразол Формулы 59. Взаимодействие пиразола Формулы 59 с агентом алкилирования Формулы 60 ($R^5(c)$ -Lg, где Lg представляет собой удаляемую группу, такую как галоген (например, Br, I), $OS(O)_2CH_3$ (метансульфонат), $OS(O)_2CF_3$, $OS(O)_2Ph$ -p- CH_3 (п-толуолсульфонат) и т.п.), дает смесь пиразолов Формул 61 и 62. Смесь изомеров пиразола легко разделяют хроматографическими методами и преобразовывают в соответствующие кислоты. Предпочтительные заместители $R^5(c)$ включают алкильные и галогеналкильные группы.

Схема 27



Следует особо отметить синтез пиридинилпиразоловых кислот Формулы 4m, связанных с формулой J-7, в которой R^5 представляет собой замещенный 2-пиридинил и является связанным с положением 3 пиразольного кольца, а также альтернативный синтез соединения Формулы 4j представлены на Схеме 28. Этот способ осуществляют в соответствии с общим способом синтеза, представленным на Схеме 27.

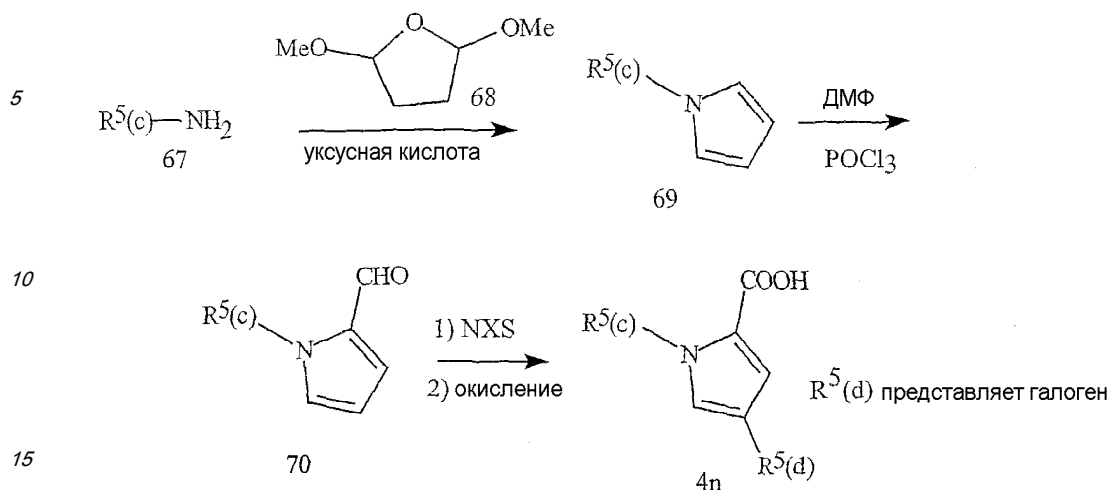
Схема 28



Общий способ синтеза пирроловых кислот Формулы 4n представлен на Схеме 29.

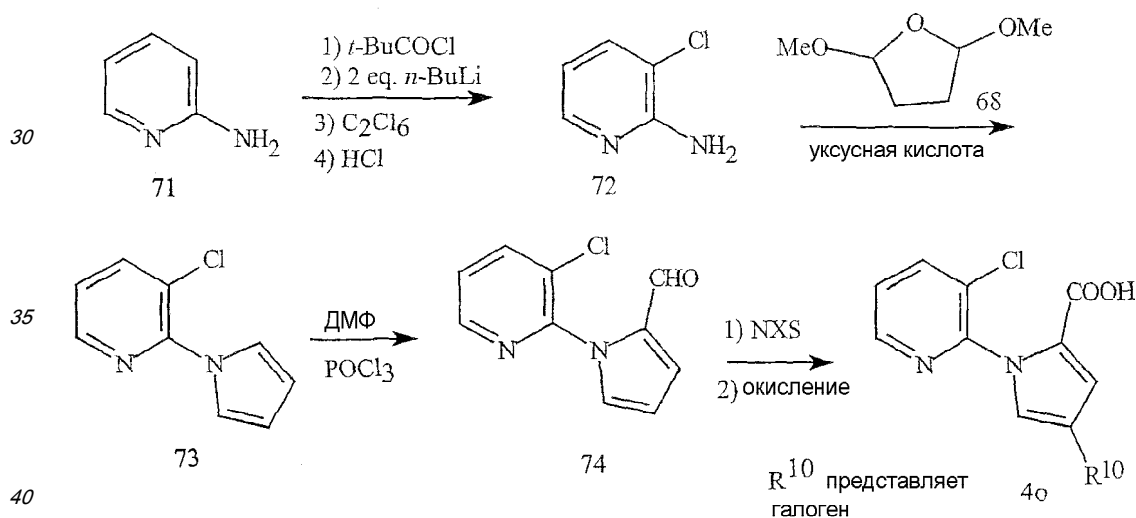
Обработка соединения Формулы 67 2,5-диметокситетрагидрофураном (68) дает пиррол Формулы 69. Формилирование пиррола Формулы 69 с образованием альдегида Формулы 70 можно осуществлять с использованием стандартных условий формилирования Vilsmeier-Haack, таких как N,N-диметилформамид (DMF) и оксихлорид фосфора. Галогенирование соединения Формулы 70 N-галогенсукцинимидами (NXS), такими как N-хлорсукцинимид или N-бромсукцинимид, преимущественно происходит в положении 4 пиррольного кольца. Окисление галогенированного альдегида дает пирроловую кислоту Формулы 4n. Окисление можно осуществлять с использованием различных стандартных условий окисления.

Схема 29



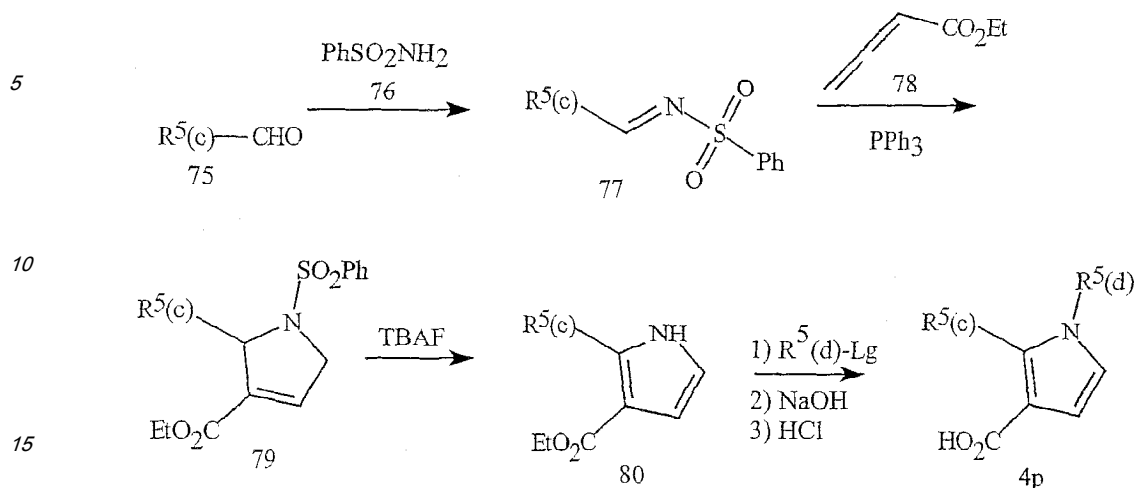
Синтез некоторых пиридинилпирроловых кислот Формулы 4о, связанных с формулой J-8, в которой R⁵ представляет собой 2-пиридинил, и является связанным с атомом азота пиррольного кольца, представлен на Схеме 30. Соединение Формулы 72, 3-хлор-2-аминопиридин, является известным соединением (см. J.Heterocycl.Chem. 1987, 24(5), 1313-16). Удобный способ получения соединения Формулы 72 из 2-аминопиридина Формулы 71 включает введение защитных групп, орто-металлирование, хлорирование и последующее удаление защиты. Остальной синтез осуществляют в соответствии с общим способом синтеза, представленным на Схеме 29.

Схема 30



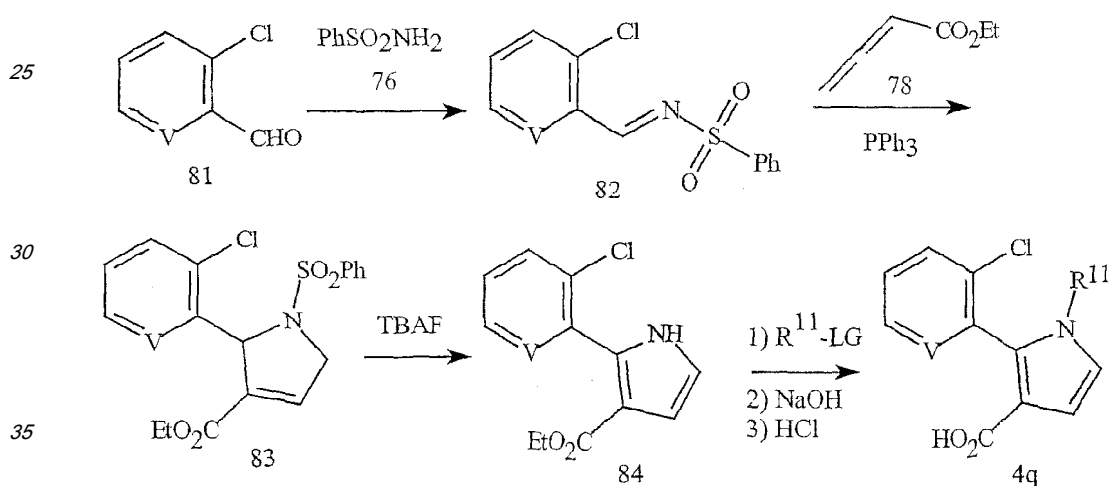
Синтез пирроловых кислот Формулы 4р представлен на Схеме 31. Циклоприсоединение аллена Формулы 78 и фенилсульфонилгидразина Формулы 77 (см. Pavri, N.P.; Trudell, M.L. J.Org.Chem. 1997, 62, 2649-2651) дает пирролин Формулы 79. Обработка пирролина Формулы 79 тетрабутиламмонийфторидом (TBAF) дает пиррол Формулы 80. Взаимодействие пиррола Формулы 80 с агентом алкилирования R⁵(d)-Lg (где Lg представляет собой удаляемую группу, определенную выше) с последующим гидролизом дает пирроловую кислоту Формулы 4р.

Схема 31



Синтез пирроловых кислот Формулы 4q, которые связаны с Формулой J-9, где R^5 представляет собой фенил или 2-пиридил и присоединен в положении 2 пиррольного кольца, представлен на Схеме 32. Синтез осуществляют в соответствии с общим способом, представленным на Схеме 31.

Схема 32

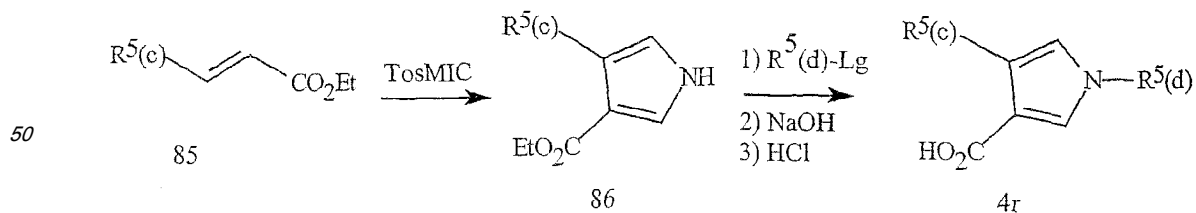


Синтез пирроловых кислот Формулы 4r представлен на Схеме 33.

Взаимодействие α,β -ненасыщенного сложного эфира Формулы 85 с п-толилсульфонилметилизоцианидом (TosMIC) дает пиррол Формулы 86. Руководящие указания для этого синтеза см. в Xu, Z. Et al., J.Org.Chem., 1988, 63, 5031-5041.

Взаимодействие пиррола Формулы 86 с агентом алкилирования $R^5(d)$ -Lg (где Lg представляет собой удаляемую группу, определенную выше) с последующим гидролизом дает пирроловую кислоту Формулы 4r.

Схема 33

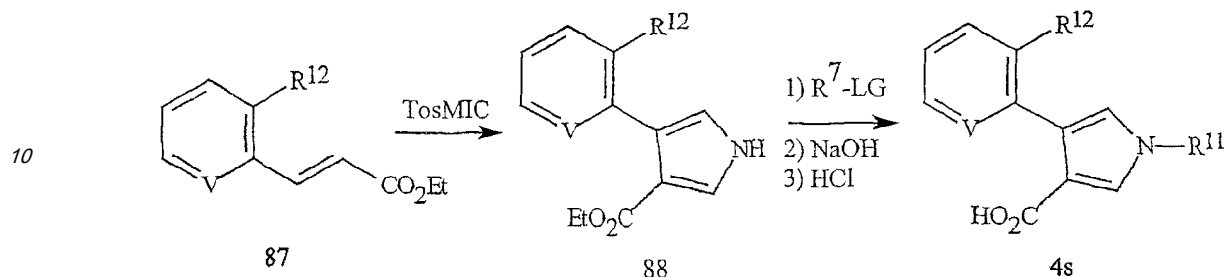


Синтез пирроловых кислот Формулы 4s, которые связаны с Формулой J-6,

где R⁵ представляет собой замещенное фенильное или замещенное 2-пиридиныльное кольцо, представлен на Схеме 34. Синтез осуществляют в соответствии с общим способом, представленным на Схеме 33.

5

Схема 34



Необходимо понимать, что некоторые реагенты и условия реакций, описанные выше для получения соединений Формулы I, могут быть несовместимыми с некоторыми функциональными группами, присутствующими в промежуточных соединениях. В этих случаях включение в процедуру синтеза стадий введения защитных групп/удаления защитных групп или взаимопревращения функциональных групп может быть полезным для получения желаемых продуктов. Использование и выбор защитных групп должен быть очевидным для специалиста в области химического синтеза (см., например, Greene, T.W.; Wuts, P.G.M. Protective Groups in Organic Synthesis, 2nd ed.; Wiley: New York, 1991). Специалисту в данной области должно быть понятно, что в некоторых случаях, после введения определенного реагента, как это указано на любой конкретной схеме, в целях доведения синтеза соединений Формулы I до завершения, может быть необходимым осуществление дополнительных рутинных стадий синтеза, подробно не описанных. Специалисту должно быть понятно, что для получения соединений Формулы I может быть необходимым осуществление комбинации стадий, проиллюстрированных на приведенных выше схемах, в другом порядке, отличном от представленной конкретной последовательности стадий.

Также специалисту в данной области должно быть понятно, что описанные здесь соединения Формулы I и промежуточные соединения можно подвергнуть различным реакциям, таким как реакции с электрофилами, нуклеофилами, радикалами, металлоорганическими соединениями, реакции окисления и восстановления, для добавления заместителей или модификации существующих заместителей.

Без дополнительного экспериментирования специалист в данной области сможет применить настоящее изобретение в его самом широком объеме, используя представленное выше описание. Поэтому представленные ниже примеры должны рассматриваться просто как иллюстративные и никоим образом не ограничивающие данное раскрытие. Проценты указаны в расчете на массу, за исключением смесей растворителей для хроматографии или если указано иное. Части и проценты, указанные для смесей растворителей для хроматографии, приводятся в расчете на объем, если не указано иное. Спектры ¹H-ЯМР приведены в м.д. ниже области спектра тетраметилсилана; с означает синглет, д означает дублет, т означает триплет, кв означает квартет, м означает мультиплет, дд означает дублет дублетов, дт означает дублет триплетов, шир.с означает широкий синглет и шир.д означает широкий дублет.

ПРИМЕР 1

Получение N-[2-метил-6-[(1-метилэтил)амино]сульфонил] фенил]-4-(трифторметокси)бензамида

Стадия А: Получение 3-метил-N-(1-метилэтил)-2-нитробензолсульфонамида
К раствору изопропиламина (13 мл, 155 ммоль) в 60 мл дихлорметана при 0°C добавляли по каплям раствор 5,3 г 3-метил-2-нитробензолсульфонилхлорида (полученный в соответствии со способом Courtin, A. Helv. Chim. Acta, 1976, 59, 379-387) в 60 мл

дихлорметана. Реакционную смесь перемешивали в течение 2 час при комнатной температуре. Добавляли воду и слои разделяли. Органический слой сушили (сульфат натрия) и летучие компоненты удаляли при помощи роторного испарителя. Остаток очищали жидкостной хроматографией среднего давления (MPLC), используя в качестве элюента 20-40% этилацетат в гексане, с получением 4,3 г указанного в заголовке соединения в виде желтого твердого вещества.

^1H ЯМР (CDCl_3) δ 1,12 (д, 6H), 2,39 (с, 1H), 3,56 (м, 1H), 4,65 (ушир.д, 1H), 7,54 (м, 2H), 7,91 (дд, 1H).

Стадия В: Получение 2-амино-3-метил-N-(1-метилэтил)бензолсульфонамида

К смеси 4,13 г вещества со Стадии А и 0,25 г 10% палладия на угле добавляли 150 мл этанола. Реакционную смесь перемешивали в атмосфере баллоного водорода в течение трех дней. Смесь фильтровали через целит и растворитель удаляли при помощи роторного испарителя с получением 3,65 г указанного в заголовке соединения в виде коричневого масла.

^1H ЯМР (CDCl_3) δ 1,03 (д, 6H), 2,21 (с, 1H), 3,60 (м, 1H), 4,57 (ушир.д, 1H), 4,86 (ушир.с, 2H), 6,73 (дд, 1H), 7,24 (д, 1H), 7,64 (д, 1H).

Стадия С: Получение N-[2-метил-6-[(1-метилэтил)амино]сульфонил]фенил]-4-(трифторметокси)бензамида

К 0,30 г (1,4 ммоль) вещества со Стадии В в 5 мл хлороформа добавляли 0,28 мл (3,5 ммоль) пиридина и 0,27 мл (1,7 ммоль) 4-(трифторметокси)бензоилхлорида. Реакционную смесь перемешивали в течение ночи при комнатной температуре и затем нагревали при кипячении с обратным холодильником в течение 5 час. После охлаждения до комнатной температуры реакционную смесь промывали 1N HCl, сушили (сульфат натрия) и фильтровали. Летучие компоненты удаляли при помощи роторного испарителя. Остаток очищали при помощи MPLC (5-25% этилацетат в гексане в качестве элюента) с получением 0,10 г указанного в заголовке соединения, соединения по изобретению, в виде белого твердого вещества, плавящегося при температуре 104-107°C.

^1H ЯМР (CDCl_3) δ 0,99 (д, 6H), 2,36 (с, 1H), 3,32 (м, 1H), 4,07 (ушир.д, 1H), 7,35 (м, 3H), 7,56 (д, 1H), 7,89 (д, 1H), 8,05 (д, 2H), 8,78 (ушир.с, 1H).

ПРИМЕР 2

Получение 2-[[[1-(3-Хлор-2-пиридинил)-3-(трифторметил)-1Н-пиразол-5-ил]сульфонил]-амино]-3-метил-N-(1-метилэтил)бензамида

Стадия А: Получение 3-хлор-2-[3-(трифторметил)-1Н-пиразол-1-ил]пиридина

К смеси 2,3-дихлорпиридина (99,0 г, 0,67 моль) и 3-трифторметилпиразола (83 г, 0,61 моль) в безводном N,N-диметилформамиде (300 мл) добавляли карбонат калия (166,0 г, 1,2 моль) и реакционную затем нагревали до 110-125°C в течение 48 час. Реакционную смесь охлаждали до 100°C и фильтровали через диатомовый вспомогательный фильтрующий материал Celite® для удаления твердых частиц. N,N-Диметилформамид и избыток дихлорпиридина удаляли путем дистилляции при атмосферном давлении. Дистилляция (перегонка) продукта при пониженном давлении (т. кип. 139-141°C, 7 мм) давала желаемое промежуточное соединение в виде прозрачного желтого масла (113,4 г).

^1H ЯМР (CDCl_3) δ 6,78 (с, 1H), 7,36 (т, 1H), 7,93 (д, 1H), 8,15 (с, 1H), 8,45 (д, 1H).

Стадия В: Получение 1-(3-хлор-2-пиридинил)-3-(трифторметил)-1Н-пиразол-5-сульфината лития

К раствору изопропиламина (2,5 мл, 30 ммоль) в 25 мл тетрагидрофурана при температуре -78°C добавляли по каплям 7,1 мл (18 ммоль) 2,5М раствора н-бутиллития в гексане. Полученный раствор добавляли через канюлю к раствору 4,0 г 3-хлор-2-[3-(трифторметил)-1Н-пиразол-1-ил]пиридина (т.е. указанного в заголовке соединения со Стадии А) в 50 мл тетрагидрофурана при температуре -78°C. Реакционная смесь становилась оранжевой. Через 15 мин добавляли еще 20 мл тетрагидрофурана. В течение 5 мин через раствор барботировали диоксид серы. Оранжевый цвет исчезал. Спустя 15 мин реакционную смесь фильтровали и растворитель удаляли из фильтрата при помощи

роторного испарителя. Остаток растирали с простым эфиром с получением 4,53 г указанного в заголовке соединения в виде не совсем белого твердого вещества.

^1H ЯМР (D_2O) δ 7,08 (с, 1H), 7,72 (дд, 1H), 8,24 (дд, 1H), 8,55 (дд, 1H).

Стадия С: Получение 1-(3-Хлор-2-пиридинил)-3-(трифторметил)-1H-пиразол-5-сульфоновой кислоты

К 100 мл pH 6 буфера (полученного растворением 1,2 г (10 ммоль) дигидрофосфата натрия в 100 мл воды и добавлением 11,2 мл 1N раствора гидроксида натрия) добавляли 3,52 г (11,1 ммоль) указанного в заголовке Стадии В вещества. Полученный раствор охлаждали на ледяной бане и добавляли 75 мл этилацетата и 1,48 г (11,1 ммоль) N-хлорсукцинимид. Через 30 мин слои разделяли. Органический слой сушили (сульфат натрия) и растворитель удаляли при помощи роторного испарителя. К остатку добавляли тетрахлорид углерода и твердые частицы удаляли фильтрованием. Растворитель из фильтрата удаляли при помощи роторного испарителя с получением 2,84 г указанного в заголовке соединения в виде масла янтарного цвета.

^1H ЯМР (CDCl_3) δ 7,45 (с, 1H), 7,58 (дд, 1H), 8,01 (дд, 1H), 8,58 (дд, 1H).

Стади D: Получение 3-метил-N-(1-метилэтил)-2-нитробензамида

Раствор 3-метил-2-нитробензойной кислоты (2,00 г, 11,0 ммоль) и триэтиламина (1,22 г, 12,1 ммоль) в 25 мл дихлорметана охлаждали до 10°C. Осторожно добавляли этилхлороформиат, что приводило к образованию твердого осадка. После перемешивания смеси в течение 30 мин, добавляли изопропиламин (0,94 г, 16,0 ммоль) и получали гомогенный раствор. Реакционную смесь перемешивали еще в течение часа, выливали в воду и экстрагировали этилацетатом. Органические экстракты промывали водой, сушили над сульфатом магния и выпаривали при пониженном давлении с получением 1,96 г желаемого промежуточного соединения в виде белого твердого вещества, плавящегося при температуре 126-128°C.

^1H ЯМР (CDCl_3) δ 1,24 (д, 6H), 2,38 (с, 3H), 4,22 (м, 1H), 5,80 (ушир.с, 1H), 7,4 (м, 3H).

Стадия E: Получение 2-амино-3-метил-N-(1-метилэтилбензамида)

2-Нитробензамид со Стадии D (1,70 г, 7,6 ммоль) гидрировали над 5% палладием на углероде в 40 мл этанола при давлении 345 кПа (50 ф/кв.дюйм). После прекращения поглощения водорода реакционную смесь фильтровали через фильтрующий материал Celite® и Celite® промывали эфиром. Фильтрат выпаривали при пониженном давлении с получением 1,41 г указанного в заголовке соединения в виде твердого вещества, плавящегося при температуре 149-151°C.

^1H ЯМР (CDCl_3) δ 1,24 (дд, 6H), 2,16 (с, 3H), 4,25 (м, 1H), 5,54 (ушир.с, 2H), 5,85 (ушир.с, 1H), 6,59 (т, 1H), 7,13 (д, 1H), 7,17 (д, 1H).

Стадия F: Получение 2-[[[1-(3-хлор-2-пиридинил)-3-(трифторметил)-1H-пиразол-5-ил]сульфонил]амино]-3-метил-N-(1-метилэтил)бензамида

К 2,84 г (10,2 ммоль) 1-(3-хлор-2-пиридинил)-3-(трифторметил)-1H-пиразол-5-сульфоновой кислоты (т.е. указанного в заголовке Стадии С соединения) в 70 мл дихлорметана добавляли 1,96 г (10,2 ммоль) 2-амино-3-метил-N-(1-метилэтил)бензамида (т.е. указанного в заголовке Стадии E соединения) в 1,78 мл (10,2 ммоль) диизопропилэтиламина и примерно 5 мг 4-(диметиламино)пиридина. Реакционную смесь перемешивали в течение 9 час, затем промывали водой и сушили (сульфат натрия).

Растворитель удаляли при помощи роторного испарителя. Остаток очищали при помощи MPLC (20-40% этилацетат в гексане в качестве элюента) с получением 0,50 г указанного в заголовке соединения в виде пенообразного белого твердого вещества, плавящегося при температуре 69-72°C.

^1H ЯМР (CDCl_3) δ 0,1,12 (д, 6H), 2,32 (с, 1H), 3,85 (м, 1H), 5,96 (ушир.д, 1H), 7,07 (с, 1H), 7,35 (м, 3H), 7,39 (дд, 1H), 7,89 (дд, 1H), 8,20 (дд, 1H), 9,26 (с, 1H).

ПРИМЕР 3

Получение 3-Бром-1-(3-хлор-2-пиридинил)-N-[2-метил-6-(3-метил-1-оксобутил)фенил]-1H-пиразол-5-карбоксамид

Стадия А: Получение 3-бром-N,N-диметил-1Н-пиразол-1-сульфонамида

К раствору N,N-диметилсульфамоилпиразола (44,0 г, 0,251 моль) в безводном тетрагидрофуране (500 мл) при температуре -78°C добавляли по каплям раствор н-бутиллития (2,5 М в гексане, 105,5 мл, 0,264 моль), поддерживая при этом температуру ниже -60°C. В процессе добавления образовывалось густое твердое вещество. По завершении добавления реакционную смесь выдерживали еще в течение 15 мин, затем добавляли по каплям раствор 1,2-дибромтетрахлорэтана (90 г, 0,276 моль) в тетрагидрофуране (150 мл), поддерживая при этом температуру ниже -70°C. Реакционная смесь становилась прозрачной, приобретая оранжевую окраску; перемешивание продолжали еще в течение 15 мин. Баню с температурой -78°C удаляли и реакцию гасили водой (600 мл). Реакционную смесь экстрагировали дихлорметаном (4х), и органические экстракты сушили над сульфатом магния и концентрировали. Неочищенный продукт затем очищали при помощи хроматографии на силикагеле, используя в качестве элюента дихлорметан-гексан (50:50), с получением указанного в заголовке соединения в виде прозрачного бесцветного масла (57,04 г).

¹Н ЯМР (CDCl₃) δ 3,07 (д, 6Н), 6,44 (м, 1Н), 7,62 (м, 1Н).

Стадия В: Получение 3-бромпиразола

К трифторуксусной кислоте (70 мл) медленно добавляли 3-бром-N,N-диметил-1Н-пиразол-1-сульфонамид (т.е. продукт бромпиразола Стадии А) (57,04 г). Реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 30 мин и затем концентрировали при пониженном давлении. Остаток поглощали гексаном, нерастворимые твердые вещества отфильтровывали и гексан выпаривали с получением неочищенного продукта в виде масла. Неочищенный продукт затем очищали при помощи хроматографии на силикагеле, используя в качестве элюента этилацетат/дихлорметан (10:90) с получением масла. Полученное масло поглощали дихлорметаном, нейтрализовали водным раствором бикарбоната натрия, экстрагировали дихлорметаном (3х), сушили над сульфатом магния и концентрировали с получением указанного в заголовке соединения в виде белого твердого вещества (25.9 г), т.пл. 61-64°C.

¹Н ЯМР (CDCl₃) δ 6,37 (д, 1Н), 7,59 (д, 1Н), 12,4 (ушир.с, 1Н).

Стадия С: Получение 2-(3-бром-1Н-пиразол-1-ил)-3-хлорпиридина

К смеси 2,3-дихлорпиридина (27,4 г, 185 ммоль) и 3-бромпиразола (т.е. продукта Стадии В) (25,4 г, 176 ммоль) в безводном N,N-диметилформамиде (88 мл) добавляли карбонат калия (48,6 г, 352 ммоль) и реакционную смесь нагревали до 125°C в течение 18 час. Реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры и выливали в ледяную воду (800 мл). Происходило образование осадка. Водную смесь осажденного твердого вещества перемешивали в течение 1,5 час, фильтровали и промывали водой (2х100 мл). Твердую фильтровальную лепешку поглощали дихлорметаном и промывали последовательно водой, 1н раствором хлористоводородной кислоты, насыщенным водным раствором бикарбоната натрия и насыщенным соевым раствором. Органические экстракты затем сушили над сульфатом магния и концентрировали с получением 39,9 г твердого вещества ярко-розового цвета. Неочищенное твердое вещество суспендировали в гексане и интенсивно перемешивали в течение 1 часа. Твердое вещество фильтровали, промывали гексаном и сушили с получением указанного в заголовке соединения в виде не совсем белого порошка (30,4 г), чистота которого, по определению методом ЯМР, составила >94. Это вещество использовали на Стадии D без дополнительной очистки.

¹Н ЯМР (CDCl₃) δ 6,52 (с, 1Н), 7,30 (дд, 1Н), 7,92 (д, 1Н), 8,05 (с, 1Н), 8,43 (д, 1Н).

Стадия D: Получение 3-Бром-1-(3-хлор-2-пиридинил)-1Н-пиразол-5-карбоновой кислоты

К раствору 2-(3-бром-1Н-пиразол-1-ил)-3-хлорпиридина (т.е. продукт пиразол Стадии С) (30,4 г, 118 ммоль) в безводном тетрагидрофуране (250 мл) при температуре -76°C добавляли по каплям раствор диизопропиламида лития (118 ммоль) в тетрагидрофуране с такой скоростью, чтобы поддерживать температуру ниже -71°C. Реакционную смесь перемешивали в течение 15 мин при температуре -76°C, и затем через нее барботировали

диоксид углерода в течение 10 мин, вызывая нагревание смеси до -57°C . Реакционную смесь нагревали до -20°C и гасили водой. Реакционную смесь концентрировали и затем поглощали водой (1 л) и простой эфир (500 мл), затем добавляли 1н водный раствор гидроксида натрия (20 мл). Водные экстракты промывали эфиром и подкисляли

5 хлористоводородной кислотой. Осажденное твердое вещество фильтровали, промывали водой и сушили с получением указанного в заголовке соединения в виде рыжевато-коричневого твердого вещества (27,7 г). (Продукт другого цикла, использующего такую же процедуру, плавился при температуре $200-201^{\circ}\text{C}$.)

^1H ЯМР ($\text{DMSO}-d_6$) δ 7,25 (с, 1H), 7,68 (дд, 1H), 8,24 (д, 1H), 8,56 (д, 1H).

10 Стадия E: Получение 3-Бром-1-(3-хлор-2-пиридинил)-N-[2-метил-6-(3-метил-1-оксобутил)фенил]-1H-пиразол-5-карбоксамида

К раствору 3-бром-1-(3-хлор-2-пиридинил)-1H-пиразол-5-карбоновой кислоты (т.е. продукта пиразола Стадии D) (500 мг, 1,65 ммоль) в дихлорметане (10 мл) добавляли 1 каплю N,N-диметилформамида. Добавляли оксалилхлорид (0,43 мл, 5 ммоль) и смесь

15 перемешивали при 23°C в течение 1 часа. Растворитель удаляли при пониженном давлении и остаток разбавляли ацетонитрилом (20 мл) и растворитель снова удаляли при пониженном давлении. Остаток растворяли в тетрагидрофуране (10 мл) и обрабатывали 1-(2-амино-3-метилфенил)-3-метил-1-бутанолем, полученным в соответствии с Chem. Pharm. Bull, 2000, 48, 1-15 (330 мг, 1,6 ммоль) и затем триэтиламино (0,45 мл, 3,2 ммоль).

20 Смесь нагревали при температуре 60°C в течение 1 часа. Охлажденную реакционную смесь разбавляли этилацетатом (50 мл) и водой (50 мл). Органический слой промывали водой (2×30 мл) и 1н раствором хлористоводородной кислоты (2×30 мл). Отделенный органический слой сушили над сульфатом магния и выпаривали досуха при пониженном давлении. Остаток очищали хроматографией на силикагеле, используя в качестве элюента этилацетат/гексан (3:7). Соответствующие фракции объединяли с получением, после

25 удаления растворителей, указанного в заголовке соединения, соединения по изобретению (210 мг), в виде желтого твердого вещества, плавящегося при температуре $119-120^{\circ}\text{C}$.

^1H ЯМР (CDCl_3) δ 0,97 (д, 6H), 2,21 (с, 3H), 2,84 (д, 2H), 7,06 (с, 1H), 7,21 (м, 1H), 7,4 (м, 2H), 7,62 (д, 1H), 7,81 (д, 1H), 8,42 (д, 1H), 10,6 (ушир., 1H).

ПРИМЕР 4

Получение метиламида 2-амино-3-метилбензойной кислоты

Смесь 8-метил-1H-бензо[d][1,3]оксазин-2,4-диона (18 г, 0,1 ммоль) и уксусной кислоты (1,2 г, 0,02 ммоль) в этилацетате (200 мл) нагревали до 35°C и добавляли по

35 каплям 40% водный раствор метиламина (9,0 г, 0,12 ммоль) в течении 15 минут при температуре $35-37^{\circ}\text{C}$. После того, как весь метиленамин был добавлен, смесь дополнительно перемешивали в течение 2,5 час при 36°C . Затем добавляли воду (20 мл), слои разделяли и органический слой промывали водой, сушили над сульфатом магния и выпаривали с получением 15,45 г (92%) указанного в заголовке соединения.

40 ^1H ЯМР (CDCl_3) δ 2.14 (с, 3H), 2.94 (д, 3H, $J=5$ Гц), 5.37 (ушир.с, 2H), 6.21 (ушир.с, 1H), 6.56 (т, $J=7.5$ Гц, 1H), 7.10 (дд, $J=7.5$ Гц, 7.5 Гц, 1H), 7.18 (дд, $J=7.5$ Гц, 7.5 Гц, 1H).

ПРИМЕР 5

Получение метиламида 2-амино-5-хлор-3-метилбензойной кислоты

45 Смесь метиламида 2-амино-3-метилбензойной кислоты (продукт примера 4) (16,6 г, 100 ммоль) и N,N-диметилформамида (15,0) охлаждали до 10°C и медленно добавляли концентрированный водный раствор соляной кислоты (70 г, 700 ммоль). Затем смесь нагревали до 30°C и добавляли по каплям 30% водный раствор перекиси водорода (18,5 г, 160 ммоль) в течение 15 минут при температуре $30-35^{\circ}\text{C}$. Затем смесь перемешивали при

50 приблизительно 35°C в течение 3 часов, охлаждали до 10°C и добавляли воду (200 мл). Добавляли сульфат натрия (7,56 г, 60 ммоль) и доводили pH до 2,2, медленно добавляя 50% водный раствор гидроксида натрия (38,1 г). После перемешивания при 10°C в течение

15 минут, смесь фильтровали, твердые частицы промывали водой (2×50 мл) и сушили в вакуумной печи с получением 14,61 г соединения (выход 72,7%) указанного в заголовке соединения в виде розового твердого вещества.

ПРИМЕР 6

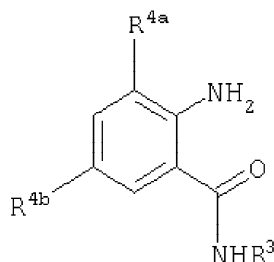
5 Получение метиламида 2-амино-5-бром-3-метилбензойной кислоты

Смесь метиламида 2-амино-3-метилбензойной кислоты (продукт примера 4) (14 г, 85 ммоль), уксусной кислоты (50 мл) и воды (50 мл) охлаждали до 12°C и добавляли концентрированный водный раствор бромистоводородной кислоты (28,5 г, 0,34 моль) в течение 10 минут при этой температуре. Затем добавляли 30% водный раствор пероксида водорода (9 г, 0,08 моль) в течение 15 минут при 10-11°C, оставляли смесь нагреваться медленно до комнатной температуры и перемешивали в течение 2,5 часов. Затем добавляли более концентрированный водный раствор бромистоводородной кислоты (2,9 г), смесь перемешивают в течение ночи при комнатной температуре. К смеси добавляли воду (50 мл) и бисульфат натрия (1,5 г) и затем доводили pH до 5-6 добавлением 50% водного раствора гидроксида натрия (около 15 мл). Смесь фильтровали, твердые частицы промывали водой и сушили в вакууме с получением 19,5 г (94%) указанного в заголовке соединения.

¹H ЯМР (CDCl₃) δ 2.14 (с, 3H), 2.95 (д, J=5 Гц, 3H), 5.55 (ушир.с, 2H), 6.01 (ушир.с, 1H), 7.21 (м, 1H), 7.30 (д, J=2 Гц, 1H).

Используя описанные выше методики вместе с известными из уровня техники методами, можно получить указанные далее соединения Таблиц 1-12. В Таблицах использованы следующие сокращения: i означает изо, Me означает метил, Pr означает пропил, i-Pr означает изопропил, Ph означает фенил, OMe означает метокси, SMe означает метилтио, CN означает циано и NO₂ означает нитро.

ТАБЛИЦА ИНДЕКСОВ G

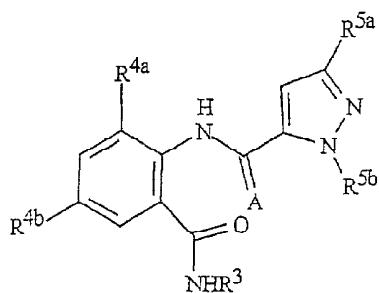


Соединение	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	Т.пл. °C
G1 (Пример 4)	CH ₃	CH ₃	H	120-122
G2 (Пример 5)	CH ₃	CH ₃	Cl	141-143
G3 (Пример 6)	CH ₃	CH ₃	Br	*

* См. таблицу индексов H для ¹H ЯМР

ТАБЛИЦА ИНДЕКСОВ H

Соединение №	¹ H ЯМР данные (CDCl ₃ , если не определено изначально)
G3	δ 2,14 (с, 3H), 2,95 (д, J=5 Гц, 3H), 5,55 (уш. с, 2H), 6,01 (уш. с, 1H), 7,21 (м, 1H), 7,30 (д, J=2 Гц, 1H)



5

10

A представляет NОМе

A представляет NNMe₂

	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}		R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил		Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил		Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил		Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
15	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил		Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил		Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил		Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил		Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил		Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил		Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
20	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил		Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил		Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил		Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил		Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил		Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил		Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
25	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил		Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил		Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил		Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил		Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил		Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил		Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
30	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил		Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил		Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил		Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил		Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил		Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил		Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил		Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
35	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил		Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил		Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил		Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил		Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил		Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил		Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
40	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил		Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил		Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил		Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил		Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил		Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил		Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил		Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
45	Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил		Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил		Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил		Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил

50

5	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	H	Me	Br	2-Cl-фенил
10	Cl	H	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	Br	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	Br	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	Br	2-Cl-фенил
15	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
20	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	H	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил
25	Me	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
30	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
35	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
40	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
45	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
50	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
55	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
60	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
65	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил

5	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	H	Me	OCF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	OCF ₂	2-Cl-фенил
10	Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	OCF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	OCF ₂	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	OCF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	OCF ₂	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	OCF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	OCF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	OCF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	OCF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	OCF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	OCF ₂	3-Cl-2-пиридил

А представляет S=O

	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
15	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
20	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
25	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
30	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
35	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
40	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
45	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
50	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
55	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил

А представляет N-CN

	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
15	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
20	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
25	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
30	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
35	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
40	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
45	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
50	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
55	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил

5	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
10	Me	H	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	H	Me	Br	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	Br	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	Br	2-Cl-фенил
15	Cl	Br	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	Br	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
20	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	H	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил
25	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
30	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
35	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
40	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
45	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
50	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
55	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
60	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил

5	C1	C1	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	C1	C1	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	C1	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	C1	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	C1	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	C1	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	C1	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	C1	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	C1	C1	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	C1	C1	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	C1	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	C1	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
10	C1	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	C1	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	C1	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	C1	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	C1	C1	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	C1	C1	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	C1	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	C1	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил

А представляет N-NO₂

15	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	C1	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	C1	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	C1	C1	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
20	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	C1	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	C1	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	C1	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
25	C1	C1	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	C1	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	C1	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
30	Me	C1	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	C1	C1	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	C1	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
35	C1	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	C1	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	C1	C1	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	C1	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
40	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	C1	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Me	C1	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	C1	C1	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
45	C1	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	C1	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	C1	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	C1	C1	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
50	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	C1	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	C1	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	C1	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
55	C1	C1	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	C1	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	C1	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил

А представляет NMe

15	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	C1	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	C1	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	C1	C1	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
20	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	C1	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	C1	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	C1	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
25	C1	C1	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	C1	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	C1	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
30	Me	C1	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	C1	C1	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	C1	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
35	C1	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	C1	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	C1	C1	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	C1	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
40	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	C1	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Me	C1	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	C1	C1	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
45	C1	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	C1	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	C1	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	C1	C1	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
50	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	C1	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	C1	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	C1	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
55	C1	C1	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	C1	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	C1	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил

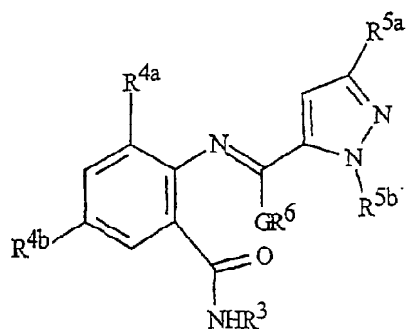
5	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
10	Me	H	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	H	Me	Br	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	Br	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	Br	2-Cl-фенил
15	Cl	Br	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	Br	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
20	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	H	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил
25	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
30	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
35	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
40	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
45	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
50	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил

5	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
10	Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
15	Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил

Таблица 2

15

20



25

GR⁶ представляет OMe

30

35

40

45

50

R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил

GR⁶ представляет SMe

R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил

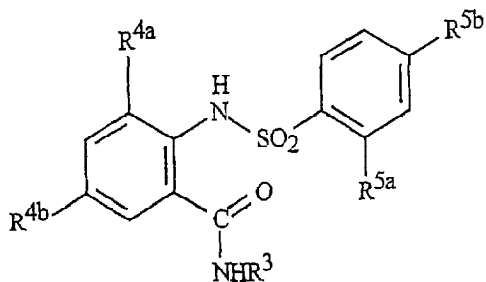
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
5	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
10	Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
15	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	H	Me	Br	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	Br	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил
20	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	Br	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	Br	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
25	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	H	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил
30	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
35	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
40	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
45	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
50	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил

5	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
10	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
15	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
20	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
25	Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
30	Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
GR ⁶ представляет SCH ₂ Ph						GR ⁶ представляет NMe ₂				
35	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
40	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
45	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
50	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
55	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
60	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил

	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
5	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
10	Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
15	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	H	Me	Br	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	Br	2-Cl-фенил
20	Me	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	Br	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	Br	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
25	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	H	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил
30	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
35	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
40	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
45	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
50	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил

Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил

Таблица 3



5

10

15

20

25

30

35

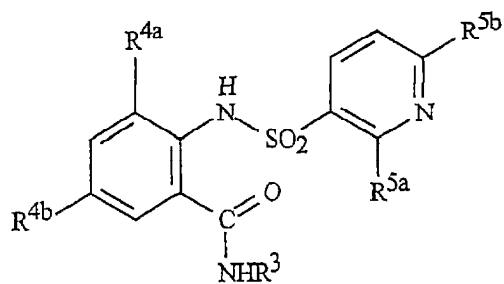
40

45

50

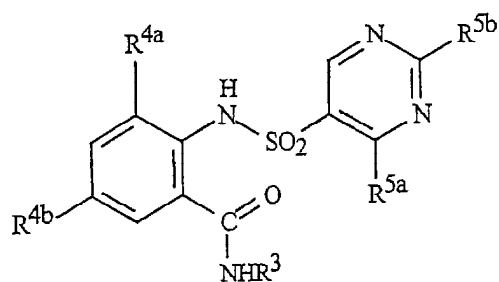
R^{4a}	R^{4b}	R^3	R^{5a}	R^{5b}	R^{4a}	R^{4b}	R^3	R^{5a}	R^{5b}
Me	H	<i>i</i> -Pr	Me	CF ₃	Me	H	<i>i</i> -Pr	Me	OCH ₂ CF ₃
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Me	CF ₃	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Me	OCH ₂ CF ₃
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	CF ₃	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	OCH ₂ CF ₃
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	CF ₃	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	OCH ₂ CF ₃
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Me	CF ₃	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Me	OCH ₂ CF ₃
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Me	CF ₃	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Me	OCH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Me	CF ₃	Me	H	Me	Me	OCH ₂ CF ₃
Cl	H	Me	Me	CF ₃	Cl	H	Me	Me	OCH ₂ CF ₃
Me	Cl	Me	Me	CF ₃	Me	Cl	Me	Me	OCH ₂ CF ₃
Cl	Cl	Me	Me	CF ₃	Cl	Cl	Me	Me	OCH ₂ CF ₃
Me	Br	Me	Me	CF ₃	Me	Br	Me	Me	OCH ₂ CF ₃
Cl	Br	Me	Me	CF ₃	Cl	Br	Me	Me	OCH ₂ CF ₃
Me	H	<i>i</i> -Pr	Me	OCF ₃	Me	H	<i>i</i> -Pr	Me	CF(CF ₃) ₂
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Me	OCF ₃	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	OCF ₃	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	CF(CF ₃) ₂
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	OCF ₃	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Me	OCF ₃	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Me	CF(CF ₃) ₂
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Me	OCF ₃	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	H	Me	Me	OCF ₃	Me	H	Me	Me	CF(CF ₃) ₂
Cl	H	Me	Me	OCF ₃	Cl	H	Me	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Me	Me	OCF ₃	Me	Cl	Me	Me	CF(CF ₃) ₂
Cl	Cl	Me	Me	OCF ₃	Cl	Cl	Me	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Br	Me	Me	OCF ₃	Me	Br	Me	Me	CF(CF ₃) ₂
Cl	Br	Me	Me	OCF ₃	Cl	Br	Me	Me	CF(CF ₃) ₂

Таблица 4

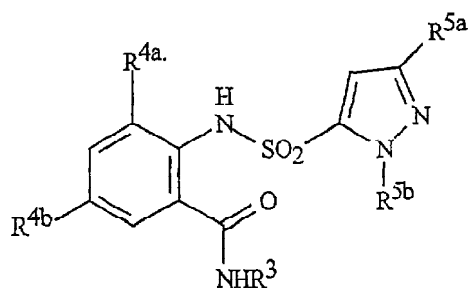


R^{4a}	R^{4b}	R^3	R^{5a}	R^{5b}	R^{4a}	R^{4b}	R^3	R^{5a}	R^{5b}
Me	H	<i>i</i> -Pr	Me	CF ₃	Me	H	<i>i</i> -Pr	Me	OCH ₂ CF ₃
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Me	CF ₃	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Me	OCH ₂ CF ₃
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	CF ₃	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	OCH ₂ CF ₃
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	CF ₃	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	OCH ₂ CF ₃
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Me	CF ₃	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Me	OCH ₂ CF ₃
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Me	CF ₃	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Me	OCH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Me	CF ₃	Me	H	Me	Me	OCH ₂ CF ₃
Cl	H	Me	Me	CF ₃	Cl	H	Me	Me	OCH ₂ CF ₃
Me	Cl	Me	Me	CF ₃	Me	Cl	Me	Me	OCH ₂ CF ₃
Cl	Cl	Me	Me	CF ₃	Cl	Cl	Me	Me	OCH ₂ CF ₃
Me	Br	Me	Me	CF ₃	Me	Br	Me	Me	OCH ₂ CF ₃
Cl	Br	Me	Me	CF ₃	Cl	Br	Me	Me	OCH ₂ CF ₃
Me	H	<i>i</i> -Pr	Me	OCF ₃	Me	H	<i>i</i> -Pr	Me	CF(CF ₃) ₂
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Me	OCF ₃	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	OCF ₃	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	CF(CF ₃) ₂
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	OCF ₃	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Me	OCF ₃	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Me	CF(CF ₃) ₂
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Me	OCF ₃	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	H	Me	Me	OCF ₃	Me	H	Me	Me	CF(CF ₃) ₂
Cl	H	Me	Me	OCF ₃	Cl	H	Me	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Me	Me	OCF ₃	Me	Cl	Me	Me	CF(CF ₃) ₂
Cl	Cl	Me	Me	OCF ₃	Cl	Cl	Me	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Br	Me	Me	OCF ₃	Me	Br	Me	Me	CF(CF ₃) ₂
Cl	Br	Me	Me	OCF ₃	Cl	Br	Me	Me	CF(CF ₃) ₂

Таблица 5



	R^{4a}	R^{4b}	R^3	R^{5a}	R^{5b}	R^{4a}	R^{4b}	R^3	R^{5a}	R^{5b}
10	Me	H	<i>i</i> -Pr	Me	CF ₃	Me	H	<i>i</i> -Pr	Me	OCH ₂ CF ₃
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Me	CF ₃	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Me	OCH ₂ CF ₃
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	CF ₃	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	OCH ₂ CF ₃
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	CF ₃	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	OCH ₂ CF ₃
15	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Me	CF ₃	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Me	OCH ₂ CF ₃
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Me	CF ₃	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Me	OCH ₂ CF ₃
	Me	H	Me	Me	CF ₃	Me	H	Me	Me	OCH ₂ CF ₃
	Cl	H	Me	Me	CF ₃	Cl	H	Me	Me	OCH ₂ CF ₃
	Me	Cl	Me	Me	CF ₃	Me	Cl	Me	Me	OCH ₂ CF ₃
	Cl	Cl	Me	Me	CF ₃	Cl	Cl	Me	Me	OCH ₂ CF ₃
20	Me	Br	Me	Me	CF ₃	Me	Br	Me	Me	OCH ₂ CF ₃
	Cl	Br	Me	Me	CF ₃	Cl	Br	Me	Me	OCH ₂ CF ₃
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Me	OCF ₃	Me	H	<i>i</i> -Pr	Me	CF(CF ₃) ₂
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Me	OCF ₃	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Me	CF(CF ₃) ₂
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	OCF ₃	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	CF(CF ₃) ₂
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	OCF ₃	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	CF(CF ₃) ₂
25	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Me	OCF ₃	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Me	CF(CF ₃) ₂
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Me	OCF ₃	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Me	CF(CF ₃) ₂
	Me	H	Me	Me	OCF ₃	Me	H	Me	Me	CF(CF ₃) ₂
	Cl	H	Me	Me	OCF ₃	Cl	H	Me	Me	CF(CF ₃) ₂
	Me	Cl	Me	Me	OCF ₃	Me	Cl	Me	Me	CF(CF ₃) ₂
	Cl	Cl	Me	Me	OCF ₃	Cl	Cl	Me	Me	CF(CF ₃) ₂
30	Me	Br	Me	Me	OCF ₃	Me	Br	Me	Me	CF(CF ₃) ₂
	Cl	Br	Me	Me	OCF ₃	Cl	Br	Me	Me	CF(CF ₃) ₂



10

15

20

25

30

35

40

45

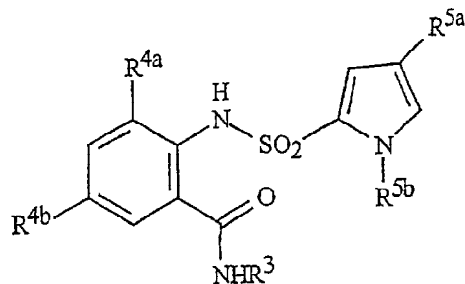
50

R^{4a}	R^{4b}	R^3	R^{5a}	R^{5b}	R^{4a}	R^{4b}	R^3	R^{5a}	R^{5b}
Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил

5	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
10	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
15	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
20	Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
25	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	H	Me	Br	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	Br	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил
30	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	Br	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	Br	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
35	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	H	Me	Cl	2-Cl-фенил
40	Cl	H	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил
45	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
50	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
55	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
60	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
65	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил

5	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
10	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
15	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
20	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
25	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
30	Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
35	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил

Таблица 7

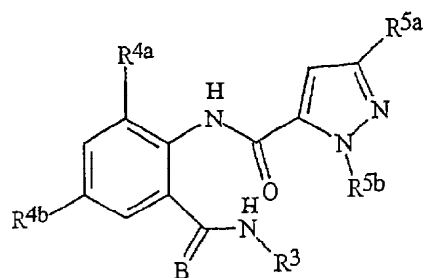


	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}		R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
40	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил		Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил		Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил		Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил		Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил		Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
45	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил		Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил		Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил		Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил		Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил		Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
50	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил		Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил		Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил		Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил		Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил		Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил

5	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
10	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
15	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
20	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
25	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
30	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
35	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	H	Me	Br	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	Br	2-Cl-фенил
40	Me	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	Br	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	Br	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
45	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
50	Me	H	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	H	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил

5	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
10	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
15	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
20	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
25	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
30	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
35	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
40	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
45	Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил

Таблица 8



В представляет NОМе					В представляет NNMe ₂				
<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил

5	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
10	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
15	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
20	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
25	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
30	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
35	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
40	Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
45	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
50	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	H	Me	Br	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	Br	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	Br	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	Br	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	H	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил

5	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
10	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
15	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
20	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
25	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
30	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
35	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
40	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
45	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
В представляет S=O						В представляет N-CN				
	$\underline{R^{4a}}$	$\underline{R^{4b}}$	$\underline{R^3}$	$\underline{R^{5a}}$	$\underline{R^{5b}}$		$\underline{R^{4a}}$	$\underline{R^{4b}}$	$\underline{R^3}$	$\underline{R^{5a}}$
	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил		Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃

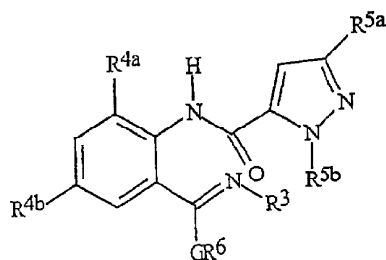
5	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
10	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
15	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
20	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
25	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
30	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
35	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
40	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
45	Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
50	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	H	Me	Br	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	Br	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	Br	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	Br	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	H	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	Cl	2-Cl-фенил

5	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
10	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
15	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
20	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
25	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
30	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
35	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
40	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
45	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил

5	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
10	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
15	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
20	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
25	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
30	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
35	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
40	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
45	Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
50	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	H	Me	Br	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	Br	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил
55	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	Br	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	Br	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
60	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	H	Me	Cl	2-Cl-фенил
65	Cl	H	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	Cl	2-Cl-фенил

5	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
10	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
15	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
20	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
25	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
30	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
35	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
40	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
45	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил

5



	GR ⁶ представляет OMe					GR ⁶ представляет SMe				
	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
10	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
15	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
20	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
25	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
30	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
35	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
40	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
45	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил

50

	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	H	Me	Br	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	Br	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил
5	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	Br	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	Br	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
10	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	H	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил
15	Me	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
20	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
25	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
30	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
35	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
40	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl-фенил
45	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
50	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил

5	Me	H	Me	OCF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	OCF ₂	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	OCF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	OCF ₂	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	OCF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	OCF ₂	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	OCF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	OCF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	OCF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	OCF ₂	3-Cl-2-пиридил
10	Me	Br	Me	OCF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	OCF ₂	3-Cl-2-пиридил

GR⁶ представляет SCH₂Ph

	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
15	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
20	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
30	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
40	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
45	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
50	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил

Me	H	Me	OCF ₂	2-Cl-фенил
Cl	H	Me	OCF ₂	2-Cl-фенил
Me	Cl	Me	OCF ₂	2-Cl-фенил
Cl	Cl	Me	OCF ₂	2-Cl-фенил
Me	Br	Me	OCF ₂	2-Cl-фенил
Cl	Br	Me	OCF ₂	2-Cl-фенил
Me	H	Me	OCF ₂	3-Cl-2-пиридил
Cl	H	Me	OCF ₂	3-Cl-2-пиридил
Me	Cl	Me	OCF ₂	3-Cl-2-пиридил
Cl	Cl	Me	OCF ₂	3-Cl-2-пиридил
Me	Br	Me	OCF ₂	3-Cl-2-пиридил
Cl	Br	Me	OCF ₂	3-Cl-2-пиридил

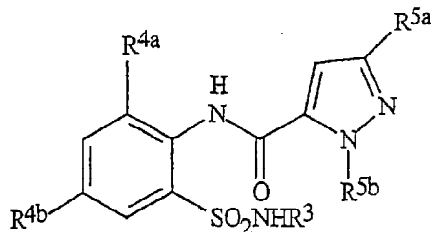
GR⁶ представляет NMe₂

	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃		2-Cl-фенил
Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃		2-Cl-фенил
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃		2-Cl-фенил
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃		2-Cl-фенил
Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃		2-Cl-фенил
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃		2-Cl-фенил
Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃		3-Cl-2-пиридил
Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃		3-Cl-2-пиридил
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃		3-Cl-2-пиридил
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃		3-Cl-2-пиридил
Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃		3-Cl-2-пиридил
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃		3-Cl-2-пиридил
Me	H	<i>i</i> -Pr	Br		2-Cl-фенил
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br		2-Cl-фенил
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br		2-Cl-фенил
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br		2-Cl-фенил
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br		2-Cl-фенил
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br		2-Cl-фенил
Me	H	<i>i</i> -Pr	Br		3-Cl-2-пиридил
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br		3-Cl-2-пиридил
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br		3-Cl-2-пиридил
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br		3-Cl-2-пиридил
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br		3-Cl-2-пиридил
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br		3-Cl-2-пиридил
Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl		2-Cl-фенил
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl		2-Cl-фенил
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl		2-Cl-фенил
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl		2-Cl-фенил
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl		2-Cl-фенил
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl		2-Cl-фенил
Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl		3-Cl-2-пиридил
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl		3-Cl-2-пиридил
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl		3-Cl-2-пиридил
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl		3-Cl-2-пиридил
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl		3-Cl-2-пиридил
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl		3-Cl-2-пиридил
Me	H	Me	CF ₃		2-Cl-фенил
Cl	H	Me	CF ₃		2-Cl-фенил
Me	Cl	Me	CF ₃		2-Cl-фенил
Cl	Cl	Me	CF ₃		2-Cl-фенил
Me	Br	Me	CF ₃		2-Cl-фенил
Cl	Br	Me	CF ₃		2-Cl-фенил
Me	H	Me	CF ₃		3-Cl-2-пиридил
Cl	H	Me	CF ₃		3-Cl-2-пиридил
Me	Cl	Me	CF ₃		3-Cl-2-пиридил
Cl	Cl	Me	CF ₃		3-Cl-2-пиридил

5	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	H	Me	Br	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	Br	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	Br	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	Br	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
10	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	H	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил
15	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
20	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
25	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
30	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
35	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
40	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
45	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил

5	Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
10	Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил

Таблица 10

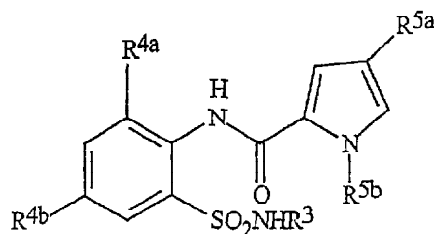


	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
20	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
25	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
30	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
35	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
40	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
45	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
50	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил

5	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
10	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	H	Me	Br	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	Br	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	Br	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	Br	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
15	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	H	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил
20	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
25	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
30	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
35	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
40	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
45	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил

5	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
10	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
15	Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
20	Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
25	Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил

Таблица 11

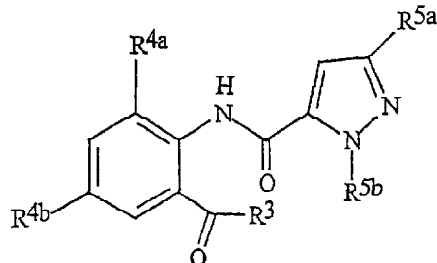


	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}		R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
30	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	35	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил		Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил		Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил		Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил		Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
40	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	45	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил		Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил		Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил		Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил		Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
45	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	50	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил		Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил		Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил		Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил		Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
50	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил		Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил		Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил		Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил		Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил		Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
55	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил		Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил		Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил		Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил		Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил		Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
60	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил		Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил		Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил

5	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
10	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
15	Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
20	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
25	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	H	Me	Br	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	Br	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил
30	Me	Br	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	Br	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	Br	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
35	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	H	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	Cl	2-Cl-фенил
40	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
45	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
50	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил

5	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCF ₂	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCF ₂	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCF ₂	3-Cl-2-пиридил
10	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
15	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
20	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
25	Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
30	Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
35	Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил

Таблица 12

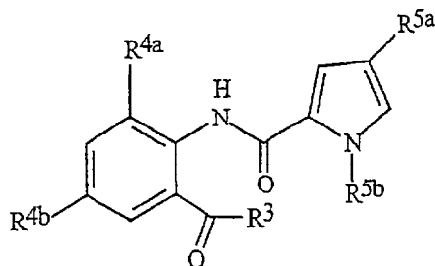


	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}		R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
40	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	45	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил		Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил		Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил		Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил		Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
50	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил		Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил		Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил		Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил		Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил		Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
55	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	60	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил		Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил		Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил		Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил		Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
60	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил		Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил

5	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
10	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
15	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
20	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
25	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
30	Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
35	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	H	Me	Br	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	Br	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил
40	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	Br	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	Br	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
45	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	H	Me	Cl	2-Cl-фенил
50	Cl	H	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил

5	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
10	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
15	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
20	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
25	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
30	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
35	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
40	Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
45	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
50	Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил

Таблица 13



R^{4a}	R^{4b}	R^3	R^{5a}	R^{5b}	R^{4a}	R^{4b}	R^3	R^{5a}	R^{5b}
Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил

5	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
10	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
15	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
20	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
25	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-фенил
30	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
35	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
40	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
45	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	H	Me	Br	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	Br	2-Cl-фенил
50	Me	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	Br	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	Br	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	Br	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	Br	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	Br	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
55	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	H	Me	Cl	2-Cl-фенил
60	Cl	H	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-фенил

	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
5	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
10	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
15	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
20	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
25	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
30	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
35	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-пиридил
	Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	H	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl-фенил
	Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl-фенил
	Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl-фенил
40	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил	Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-фенил
	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
45	Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил
	Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил	Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-пиридил

Состав/применимость

Соединения по настоящему изобретению, как правило, можно использовать в виде составов или композиций с сельскохозяйственно приемлемым носителем, включающим, по меньшей мере, один из жидкого разбавителя, твердого разбавителя или поверхностно-активного вещества. Ингредиенты состава или композиции выбирают так, чтобы они соответствовали физическим свойствам активного ингредиента, способу применения и особенностям окружающей среды, таким как тип почвы, влажность и температура.

Полезные составы включают жидкости, такие как растворы (включая эмульгируемые концентраты), суспензии, эмульсии (включая микроэмульсии и/или суспензии) и т.п. которые необязательно могут быть загущены до гелей. Полезные составы, кроме того, включают твердые составы, такие как дусты, порошки, гранулы, мелкие частицы,

5 таблетки, пленки и т.п., которые могут быть вододиспергируемыми ("смачиваемыми") или водорастворимыми. Активный ингредиент может быть (микро)инкапсулированным и затем может быть образована суспензия или твердый состав; альтернативно, вся композиция активного ингредиента может быть инкапсулирована (или "с нанесенным покрытием"). Инкапсулирование контролирует или замедляет высвобождение активного ингредиента.

10 Разбрызгиваемые составы можно разводить в подходящей среде и их можно использовать при объеме разбрызгивания от одного до нескольких литров на гектар.

Высококонцентрированные композиции в основном используют в качестве промежуточных составов для дальнейшего формулирования.

15 Составы типично содержат эффективные количества активного ингредиента, разбавителя и поверхностно-активного вещества, приблизительно в указанных ниже пределах, вместе составляющих 100 процентов по массе.

	Массовый процент		
	Активный ингредиент	разбавитель	Поверхностно-активное вещество
Вододиспергируемые и водорастворимые гранулы, таблетки и порошки	5-90	0-94	1-15
20 Суспензии, эмульсии, растворы (включая эмульгируемые концентраты)	5-50	40-95	0-15
Дусты	1-25	70-99	0-5
Гранулы и мелкие частицы	0,01-99	5-99,99	0-15
Высококонцентрированные композиции	90-99	0-10	0-2

Типичные твердые разбавители описаны Watkins, et al., Handbook of Insecticide Dust
 25 Diluents and Carriers, 2nd Ed., Dorland Books, Caldwell, New Jersey. Типичные жидкие разбавители описаны Marsden, Solvents Guide, 2nd Ed., Interscience, New York, 1950. McCutcheon's Detergents и Emulsifiers Annual, Allured Publ. Corp., Ridgewood, New Jersey, а также Sisely and Wood, Encyclopedia of Surface Active Agents, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964, перечень поверхностно-активных веществ и
 30 рекомендованные применения. Все составы могут содержать небольшие количества добавок для снижения вспенивания, слеживания, коррозии, роста микробов и т.п., или загустителей для повышения вязкости.

Поверхностно-активные вещества включают, например, полиэтоксилированные спирты, полиэтоксилированные алкилфенолы, сложные эфиры полиэтоксилированных жирных
 35 кислот сорбитана, диалкилсульфосукцинаты, алкилсульфаты, алкилбензолсульфонаты, кремнийорганические соединения, N,N-диалкилтаураты, лигнинсульфонаты, конденсаты нафталинсульфоната и формальдегида, поликарбоксилаты и блок-сополимеры полиоксиэтилена/полиоксипропилена. Твердые разбавители включают, например, глины, такие как бентонит, монтмориллонит, атапульгит и каолин, крахмал, сахар, диоксид
 40 кремния, тальк, диатомовую землю, мочевины, карбонат кальция, карбонат и бикарбонат натрия и сульфат натрия. Жидкие разбавители включают, например, воду, N,N-диметилформамид, диметилсульфоксид, N-алкилпирролидон, этиленгликоль, полипропиленгликоль, парафины, алкилбензолы, алкилнафталины, оливковое, касторовое, льняное, тунговое, кунжутное, кукурузное, арахисовое масло, масло хлопчатника,
 45 соевое, рапсовое и кокосовое масло, сложные эфиры жирных кислот, кетоны, такие как циклогексанон, 2-гептанон, изофорон и 4-гидрокси-4-метил-2-пентанон, и спирты, такие как метанол, циклогексанол, деканол и тетрагидрофурфуриловый спирт.

Растворы, включая эмульгируемые концентраты, можно получать просто путем смешивания ингредиентов. Дусты и порошки можно получать смешиванием и, обычно,
 50 измельчением, например, в молотковой дробилке или измельчением с использованием жидкости. Суспензии обычно получают путем мокрого размолла; см., например, U.S. 3,060,084. Гранулы и мелкие частицы можно получать путем распыления активного вещества на предварительно сформированные гранулированные носители или методом

агломерации. См. Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, December 4, 1967, pp 147-48, Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, pages 8-57 and following, и публикацию PCT WO 91/13546. Мелкие частицы можно получить, как описано в U.S. 4,172,714. Вододиспергируемые и водорастворимые гранулы можно получить, как указано в U.S. 4,144,050, U.S. 3,920,442 и DE 3,246,493. Таблетки можно получить, как указано в U.S. 5,180,587, U.S. 5,232,701 и U.S. 5,208,030. Пленки можно получить, как указано в GB 2,095,558 и U.S. 3,299,566.

Дополнительную информацию, касающуюся известных способов получения составов, см. в T. S. Woods, "The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture" in Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge, T. Brooks and T. R. Roberts, Eds., Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, pp. 120-133. См. также U.S. 3,235,361, кол. 6, строка 16 по кол. 7, строка 19 и Примеры 10-41; U.S. 3,309,192, кол. 5, строка 43 по кол. 7, строка 62 и Примеры 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138-140, 162-164, 166, 167 и 169-182; U.S. 2,891,855, кол. 3, строка 66 по кол. 5, строка 17 и Примеры 1-4; Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, pp 81-96; и Hance et al., Weed Control Handbook, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989.

В представленных далее Примерах все процентные значения указаны в расчете на массу, и все составы получены обычными способами. Номера соединений относятся к соединениям в Справочной Таблице А.

Пример А

Смачиваемый порошок

Соединение 1	65,0%
Полиэтиленгликолевый эфир додецилфенола	2,0%
Лигнинсульфонат натрия	4,0%
Силикоалюминат натрия	6,0%
Монтмориллонит (кальцинированный)	23,0%

Пример В

Гранулы

Соединение 1	10,0%
Атапульгитные гранулы (низколетучее вещество, 0,71/0,30 мм; сита U.S.S. № 25-50)	90,0%

Пример С

Экструдированные гранулы

Соединение 1	25,0%
Безводный сульфат натрия	10,0%
Неочищенный лигносульфонат кальция	5,0%
алкилнафталинсульфонат натрия	1,0%
Кальциевый/магниевый бентонит	59,0%

Пример D

Эмульгируемый концентрат

Соединение 1	20,0%
Смесь растворимых в масле сульфонатов и полиоксиэтиленовых простых эфиров	10,0%
изофорон	70,0%

Пример Е

Гранулы

Соединение 1	0,5%
Целлюлоза	2,5%
Лактоза	4,0%
Кукурузная мука	93,0%

Соединения по настоящему изобретению отличаются благоприятным характером метаболизма и/или остаточного содержания в почве и являются активными для борьбы с

целым рядом сельскохозяйственных и несельскохозяйственных беспозвоночных вредителей. (В контексте данного описания "борьба с беспозвоночными вредителями" означает ингибирование развития беспозвоночных вредителей (включая их гибель), что приводит к значительному уменьшению поедания или другого вреда или повреждений, наносимых вредителями; подобные выражения определяются аналогичным образом).

Используемый в данном описании термин "беспозвоночные вредители" включает членистоногих, брюхоногих моллюсков и нематод, которые с экономической точки зрения являются проблемными вредителями. Термин "членистоногие" включает насекомых, клопов, пауков, скорпионов, многоножек, двупарноногих, мокриц и симфил. Термин "брюхоногие моллюски" включает улиток, слизней и других *Stylommatophora*. Термин "нематода" включает все виды гельминтов, такие как: круглые черви, heartworms и травоядные нематоды (*Nematoda*), трематоды (*Tematoda*), *Acanthocephala* и ленточные черви (*Cestoda*). Специалисту в данной области должно быть понятно, что не все соединения являются равно эффективными против всех видов вредителей. Соединения по настоящему изобретению проявляют активность против имеющих значение с экономической точки зрения сельскохозяйственных и несельскохозяйственных вредителей. Термин "сельскохозяйственный" относится к производству полевых культур, таких как используемые для производства пищевых продуктов и волокон, и включает выращивание зерновых культур (например, пшеницы, овса, ячменя, ржи, риса, кукурузы), сои, овощных культур (например, салата, капусты, томатов, бобов), картофеля, сладкого картофеля, винограда, хлопчатника и плодовых деревьев (например, яблочных, косточковых и цитрусовых). Термин "несельскохозяйственный" является применимым в отношении других садовых культур (например, лесных растений, оранжерейных растений, растений, высаживаемых для защиты других культур, или декоративных растений, которые не растут в поле), области здравоохранения и ветеринарии, жилых и коммерческих помещений, домашнего хозяйства и хранения продуктов, или в отношении вредителей этих культур. В целях борьбы с широким рядом вредителей и по причинам экономической важности, защита (от повреждения или поражения, вызываемых беспозвоночными вредителями) таких сельскохозяйственных культур, как хлопчатник, кукуруза, соя, рис, овощные культуры, картофель, сладкий картофель, виноград и плодовые деревья, путем контроля беспозвоночных вредителей представляет собой предпочтительные воплощения настоящего изобретения. Сельскохозяйственные или несельскохозяйственные вредители включают таких вредителей как гусеницы отряда чешуекрылых (*Lepidoptera*), таких как "походные черви", подгрызающая совка, пяденицы и гусеницы семейства *Noctuidae* (например, осенние "походные черви" (*Spodoptera fugiperda* J. E. Smith), свекольные "походные черви" (*Spodoptera exigua* Hübner), совка ипсилон (*Agrotis ipsilon* Hufnagel), совка ни (*Trichoplusia ni* Hübner), совка табака (*Heliothis virescens* Fabricius)); точильщики, чехлоноски, гусеницы, строящие паутинные гнезда, *coneworms*, мермитиды и скелетирующие листья вредители семейства *Pyrulidae* (например, мотылек кукурузный (*Ostrinia nubilalis* Hübner), гусеница, вредящая цитрусовым (*Amyelois transitella* Walker), огневка (*Crambus caliginosellus* Clemens), луговой мотылек (*Herpetogramma licarsisalis* Walker)); листовертки, листовертки-почкоеды, вредители семян и фруктовые черви семейства *Tortricidae* (например, плодоярка яблонная (*Cydia pomonella* Linnaeus), листовертка виноградная (*Endopiza viteana* Clemens), листовертка восточная персиковая (*Grapholita molesta* Busck)); и многие другие имеющие значение с экономической точки зрения чешуекрылые (например, моль капустная (*Plutella xylostella* Linnaeus), розовый коробочный червь хлопчатника (*Pectinophora gossypiella* Saunders), шелкопряд непарный (*Lymantria dispar* Linnaeus)); нимфы и взрослые особи отряда *Blattodea*, в том числе тараканы семейств *Blattellidae* и *Blattidae* (например, таракан черный (*Blatta orientalis* Linnaeus), таракан азиатский (*Blattella asahinai* Mizukubo), таракан рыжий (*Blattella germanica* Linnaeus), таракан коричнево-полосатый (*Supella longipalpa* Fabricius), таракан американский (*Periplaneta americana* Linnaeus), таракан коричневый (*Periplaneta brunnea* Burmeister), таракан мадейрский (*Lencophaea maderae*

Fabricius)); поедающие листву личинки и взрослые особи отряда Coleoptera, в том числе долгоносики семейств Anthribidae, Bruchidae и Curculionidae (например, долгоносик хлопковый (*Anthonomus grandis* Boheman), долгоносик рисовый водяной (*Lissorhoptrus oryzophilus* Kuschel), долгоносик амбарный (*Sitophilus granarius* Linnaeus), долгоносик рисовый (*Sitophilus oryzae* Linnaeus)); земляные блошки, жук-блошка картофельная, листоеды, колорадские жуки и моли-минеры узкокрылые семейства Chrysomelidae (например, колорадский картофельный жук (*Leptinotarsa decemlineata* Say), блошка длинноусая (*Diabrotica virgifera virgifera* LeConte)); хрущи и другие жуки семейства Scarabaeidae (например, хрущик японский (*Popillia japonica* Newman) и хрущик европейский (*Rhizotrogus majalis* Razoumowsky)); жуки-кожееды семейства Dermestidae; проволочники семейства Elateridae; короеды семейства Scolytidae и хрущаки малые мучные семейства Tenebrionidae. Кроме того, сельскохозяйственные и несельскохозяйственные вредители включают: взрослые особи и личинки отряда Dermaptera, в том числе ухвертки семейства Forficulidae (например, ухвертка европейская (*Forficula auriculana* Linnaeus), ухвертка черная (*Chelisoches morio* Fabricius)); взрослые особи и нимфы отрядов Hemiptera и Homoptera, такие как, клопы-слепняки семейства Miridae, цикады семейства Cicadidae, цикадки (например, *Empoasca* spp.) семейства Cicadellidae, дельфициды семейств Fulgoroidae и Delphacidae, горбатки семейства Membracidae, листоблошки семейства Psyllidae, белокрылки семейства Aleocharidae, тли семейства Aphididae, филлоксеры семейства Phylloxeridae, мучнистые червецы семейства Pseudococcidae, щитовки семейств Coccidae, Diaspididae и Margarodidae, клопы-кружевницы семейства Tingidae, клопы-щитники семейства Pentatomidae, клопы белокрылые (например, *Blissus* spp.) и другие клопы семейства Lygaeidae, пенницы семейства Cercopidae, squash bugs семейства Coreidae, и красноклопы семейства Pyrrhocoridae. В этот перечень также входят взрослые особи и личинки отряда Acari (клещи), такие как клещики паутиные и клещики красные семейства Tetranychidae (например, паутинный клещик (*Panonychus ulmi* Koch), клещик паутиный двупятнистый (*Tetranychus urticae* Koch), клещик McDaniel (*Tetranychus mcdanieli* McGregor)), плоские клещи семейства Tenuipalpidae (например, клещик плоский цитрусовый (*Brevipalpus lewisi* McGregor)), клещик Шлехтендаля и клещик галловый семейства Eriophyidae и другие пожирающие листву клещи и клещи, наносящие вред здоровью людей и животных, т.е. пыльные клещи семейства Epidermoptidae, железницы семейства Demodicidae, зерновые клещи семейства Glycyphagidae, клещи отряда Ixodidae (например, иксодовый клещ (*Ixodes scapularis* Say), австралийский параличный клещ (*Ixodes holocyclus* Neumann), иксодовый клещ изменчивый (*Dermacentor variabilis* Say), клещ однозвездчатый (*Amblyomma americanum* Linnaeus) и клещ конский и чесоточный клещ семейств Psoroptidae, Pyemotidae, и Sarcoptidae; взрослые и незрелые особи отряда Orthoptera, в том числе прыгунчики и сверчки (например, кобылки (например, *Melanoplus sanguinipes* Fabricius, *M. differentialis* Thomas), саранча американская (например, *Schistocerca americana* Drury), пустынная саранча (*Schistocerca gregaria* Forskal), саранча прелетная (*Locusta migratoria* Linnaeus), сверчок домовый (*Acheta domesticus* Linnaeus), медведки (*Gryllotalpa* spp.)); взрослые и незрелые особи отряда Diptera, в том числе моли-минеры узкокрылые, мелкие двукрылые насекомые, плодовые мушки (Tephritidae), мушки шведские (например, *Oscinella frit* Linnaeus), почвенные личинки мух, мухи комнатные (например, *Musca domestica* Linnaeus), мелкие комнатные мухи (например, *Fannia canicularis* Linnaeus, *F. femoralis* Stein), жигалка осенняя (например, *Stomoxys calcitrans* Linnaeus), face flies, жигалка коровья малая, падальные мухи (например, *Chrysomya* spp., *Phormia* spp.), и другие мухообразные крылатые насекомые-вредители, слепни (например, *Tabanus* spp.), оводы (например, *Gastrophilus* spp., *Oestrus* spp.), личинки бычьего подкожного овода (например, *Hypoderma* spp.), оленьи оводы (например, *Chrysops* spp.), рунцы овечьи (например, *Melophagus ovinus* Linnaeus) и другие Brachycera, комары (например, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp.), мошки (например, *Prosimulium* spp., *Simulium* spp.),

мокрецы, мошки, сциариды и другие Nematocera; взрослые и незрелые особи отряда Thysanoptera, в том числе трипс табачный (*Thrips tabaci* Lindeman) и другие пожирающие листву трипсы; насекомые-вредители отряда Hymenoptera, в том числе муравьи (например, рыжий муравей-древоточец (*Camponotus ferrugineus* Fabricius), муравей-древоточец пенсильванский (*Camponotus pennsylvanicus* De Geer), фараонов муравей (*Monomorium pharaonis* Linnaeus), васмания (*Wasmannia auropunctata* Roger), муравей Рихтера (*Solenopsis geminata* Fabricius), муравей Рихтера (*Solenopsis invicta* Buren), муравей аргентинский (*Iridomyrmex humilis* Mayr), паратрехина (*Paratrechina longicornis* Latreille), муравей дерновый (*Tetramorium caespitum* Linnaeus), муравей полевой (*Lashis alienus* Forster), муравей *Tapinoma sessile* (*Tapinoma sessile* Say)), пчелы (в том числе пчелы-плотники), крупные осы, настоящие осы и роющие осы; насекомые-вредители отряда Isoptera, в том числе термит желтоногий (*Reticulitermes flavipes* Kollar), термит *Reticulitermes hesperus* (*Reticulitermes hesperus* Banks), термит *Coptotermes formosanus* (*Coptotermes formosanus* Shiraki), западно-индийский древесный термит (*Incisitermes immigrans* Snyder) и другие термиты, имеющие значение с экономической точки зрения; насекомые-вредители отряда Thysanura, такие как чешуйница (*Lepisma saccharina* Linnaeus) и чешуйница домашняя (*Thermobia domestica* Packard); насекомые-вредители отряда Mallophaga и в том числе вошь головная (*Pediculus humanus capitis* De Geer), вошь (*Pediculus humanus humanus* Linnaeus), пухоед (*Menacanthus stramineus* Nitsch), власоед собачий (*Trichodectes canis* De Geer), пухоед куриный пестробрюхий (*Goniocotes gallinae* De Geer), вошь овечья (*Bovicola ovis* Schrank), вошь крупного рогатого скота коротконосая кровососущая (*Haematopinus eurysternus* Nitsch), вошь крупного рогатого скота долгоносая кровососущая (*Linognathus vituli* Linnaeus) и другие сосущие и жующие вши-паразиты, которые нападают на человека и животных; насекомые-вредители отряда Siphonoptera, в том числе блоха восточная крысиная (*Xenopsylla cheopis* Rothschild), блоха кошачья (*Ctenocephalides felis* Bouche), блоха собачья (*Ctenocephalides canis* Curtis), блоха куриная (*Ceratophyllus gallinae* Schrank), блоха присасывающаяся (*Echidnophaga gallinacea* Westwood), блоха человеческая (*Pulex irritans* Linnaeus) и другие блохи, поражающие млекопитающих и птиц. Другие охватываемые членистоногие вредители включают: паукообразных отряда Araneae, таких как паук-отшельник коричневый (*Loxosceles reclusa* Gertsch & Mulaik) и паук-ткач черный (*Latrodectus mactans* Fabricius), и губоногие отряда Scutigeraomorpha, такие как мухоловка обыкновенная (*Scutigera coleoptrata* Linnaeus). Соединения по настоящему изобретению также проявляют активность в отношении членов классов Nematoda, Cestoda, Trematoda, и Acanthocephala, включая имеющих значение с экономической точки зрения членов отрядов Strongylida, Ascaridida, Oxyurida, Rhabditida, Spirurida, и Ecnoplida, таких как, но не ограничиваясь этим, имеющих значение с экономической точки зрения сельскохозяйственных вредителей (т.е. нематоды клубневых культур рода *Meloidogyne*, поражающие нематоды рода *Pratylenchus*, нематоды корней пня рода *Trichodorus*, и т.д.) и вредителей, наносящих ущерб здоровью людей и животных (т.е. все имеющие значение с экономической точки зрения трематоды, ленточные черви и круглые черви, такие как *Strongylus vulgaris* у лошадей, *Toxocara canis* у собак, *Haemonchus contortus* у овец, *Dirofilaria immitis* Leidy у собак, *Anoplocephala perfoliata* у лошадей, *Fasciola hepatica* Linnaeus у жвачных животных и т.д.). Соединения по настоящему изобретению проявляют особенно высокую активность против вредителей отряда Lepidoptera (например, *Alabama argillacea* Hübner (гусеница совки хлопковой американской), *Archips argyrospila* Walker (листовертка плодовых деревьев), *A. rosana* Linnaeus (листовертка европейская) и другие виды *Archips*, *Chilo suppressalis* Walker (огневка рисовая), *Snaphalocrosis medinalis* Guenee (листовертка рисовая), *Crambus caliginosellus* Clemens (огневка кукурузная корневая), *Crambus teterrellus* Zincken (огневка *Crambus teterrellus*), *Cydia pomonella* Linnaeus (плодожорка яблонная), *Earias insulana* Boisduval (совка хлопковая колючая), *Earias vittella* Fabricius (совка хлопковая пятнистая), *Helicoverpa armigera* Hübner (совка

хлопковая американская), *Helicoverpa zea* Boddie (коробочный червь), *Heliiothis virescens* Fabricius (совка табака), *Herpetogramma licarsisalis* Walker (луговой мотылек), *Lobesia botrana* Denis & Schiffermüller (листовертка виноградная), *Pectinophora gossypiella* Saunders (розовый коробочный червь хлопчатника), *Phyllocnistis citrella* Stainton (моль-минер узкокрылая цитрусовая), *Pieris brassicae* Linnaeus (бабочка-капустница), *Pieris rapae* Linnaeus (бабочка-репница), *Plutella xylostella* Linnaeus (моль капустная), *Spodoptera exigua* Hübner (свекольные "походные черви"), *Spodoptera litura* Fabricius (подгрызающая совка табачная, гусеница растущих гроздьями культур), *Spodoptera frugiperda* J. E. Smith (осенние "походные черви"), *Trichoplusia ni* Hübner (совка ни) и *Tuta absoluta* Meyrick (моль-минер узкокрылая томатная)). Соединения по настоящему изобретению также проявляют коммерчески значимую активность в отношении членов отряда Homoptera, включающих: *Acyrtisiphon pisum* Harris (тля гороховая), *Aphis craccivora* Koch (тля черная люцерновая), *Aphis fabae* Scopoli (тля черная бобовая), *Aphis gossypii* Glover (тля хлопковая), *Aphis pomi* De Geer (тля яблонная), *Aphis spiraeicola* Patch (тля таволговая), *Aulacorthum solani* Kaltenbach (тля вьюнковая), *Chaetosiphon fragaefolii* Cockerell (тля земляничная), *Diuraphis noxia* Kurdjumov/Mordvilko (тля пшеничная), *Dysaphis plantaginea* Paaserini (тля розовая), *Eriosoma lanigerum* Hausmann (тля кровяная яблонная), *Hyalopterus pruni* Geoffroy (тля мучнистая сливовая), *Lipaphis erysimi* Kaltenbach (тля ложнокапустная), *Metopolophium dirrhodum* Walker (тля зерновых культур), *Macrosipum euphorbiae* Thomas (тля картофельная листовая), *Myzus persicae* Sulzer (тля персиковая), *Nasonovia ribisnigri* Mosley (тля латуковая), *Pemphigus* spp. (корневая тля и галлообразующая тля), *Rhopalosiphum maidis* Fitch (тля кукурузная листовая), *Rhopalosiphum padi* Linnaeus (тля черешневая-овсовая), *Schizaphis graminum* Rondani (тля злаковая обыкновенная), *Sitobion avenae* Fabricius (тля злаковая), *Therioaphis maculata* Buckton (тля люцерновая пятнистая), *Toxoptera aurantii* Boyer de Fonscolombe (тля черная цитрусовая) и *Toxoptera citricida* Kirkaldy (тля коричневая цитрусовая); *Adelges* spp. (хермесы); *Phylloxera devastatrix* Pergande (филлоксеры гикори); *Bemisia tabaci* Gennadius (белокрылка табачная, белокрылка сладкого картофеля), *Bemisia argentifolii* Bellows & Perring (белокрылка), *Dialeurodes citri* Ashmead (белокрылка цитрусовая) и *Trialeurodes vaporariorum* Westwood (белокрылка тепличная); *Empoasca fabae* Harris (цикадка картофельная), *Laodelphax triatellus* Fallen (мелкие коричневые дельфациды), *Macrolestes quadrilineatus* Forbes (цикадка звездчатая), *Nephotettix cincticeps* Uhler (цикадка зеленая), *Nephotettix nigropictus* Stel (цикадка рисовая), *Nilaparvata lugens* Stel (цикада коричневая), *Peregrinus maidis* Ashmead (цикада кукурузная), *Sogatella furcifera* Horvath (цикада белоспинная), *Sogatodes orizicola* Muir (дельфациды рисовые), *Typhlocyba pomaria* McAtee (цикадка яблонная), *Erythroneoura* spp. (цикадка виноградная); *Magacidada septendecim* Linnaeus (цикада периодическая); *Icerya purchasi* Maskell (червец австралийский желобчатый), *Quadraspidotus perniciosus* Comstock (червецы Сан-Хосе); *Planococcus citri* Risso (червец виноградный мучнистый); *Pseudococcus* spp. (другая группа червецов); *Sacopsylla pyricola* Foerster (медяница грушевая), *Trioza diospyri* Ashmead (листоблошка хурмовая). Соединения по изобретению также проявляют активность в отношении членов отряда Hemiptera, включая: *Acrosternum hilare* Say (клоп-щитник зеленый), *Anasa tristis* De Geer (клоп-ромбовик), *Blissus lencopterus lencopterus* Say (клоп белокрылый), *Corythuca gossypii* Fabricius (клоп хлопковый), *Cyrtopeltis modesta* Distant (клоп помидорный), *Dysdercus suturellus* Herrich-Schäffer (красноклоп хлопковый), *Euchistus servus* Say (клоп-щитник коричневый), *Euchistus variolarius* Palisot de Beauvois (клоп-щитник однопятнистый), *Graptosthetus* spp. (некоторые виды клопов семян), *Leptoglossus corculus* Say (клоп-краевик сосновый), *Lygus lineolaris* Palisot de Beauvois (клопик луговой), *Nezara viridula* Linnaeus (клоп хлопково-огородный), *Oebalus pugnax* Fabricius (клоп рисовый), *Oncopeltus fasciatus* Dallas (клоп молочайный крупный), *Pseudatomoscelis seriatus* Reuter (блоха хлопковая). Другие отряды насекомых, котролируемых соединениями по

настоящему изобретению, включают Thysanoptera (например, *Frankliniella occidentalis* Pergande (трипс цветочный западный), *Scirtothrips citri* Moulton (трипс цитрусовый), *Sericothrips variabilis* Beach (трипс соевый) и *Thrips tabaci* Lindeman (трипс табачный); и отряд Coleoptera (например, *Leptinotarsa decemlineata* Say (колорадский картофельный жук), *Epilachna varivestis* Mulsant (мексиканский бобовый жук) и нематоды родов *Agriotes*, *Athous* или *Limonius*).

Соединения по настоящему изобретению также можно смешивать с одним или несколькими другими биологически активными соединениями или веществами, включающими инсектициды, фунгициды, нематоциды, бактерициды, акарициды, регуляторы роста, такие как стимуляторы роста корней, химические стерилизаторы, полухимикаты, репелленты, аттрактанты, феромоны, стимуляторы питания, другие биологически активные соединения или энтомопатогенные бактерии, вирусы или грибы, с получением многокомпонентного пестицида с еще более широким спектром применения в сельском хозяйстве. Таким образом, композиции по настоящему изобретению могут также включать биологически эффективное количество, по меньшей мере, одного дополнительного биологически активного соединения или вещества. Примеры таких биологически активных соединений или веществ, с которыми соединения по настоящему изобретению можно формулировать в одну композицию, включают: инсектициды, такие как абамектин, ацефат, ацетамиприд, авермектин, азадирактин, азинфос-метил, бифентрин, бенфеназат, бупрофезин, карбофуран, хлорфенапир, хлорфлуазурон, хлорпирифос, хлорпирифос-метил, хромафенозид, клотианидин, цифлутрин, бета-цифлутрин, цигалотрин, лямбда-цигалотрин, циперметрин, циромазин, дельтаметрин, диафентиурон, диазинон, дифлубензурон, диметоат, диофенолан, эмаектин, эндосульфат, эсфенвалерат, этипрол, фенотикарб, феноксикарб, фенпропатрин, фенпроксимат, фенвалерат, фипронил, флониамид, флуцитринат, тау-флувалинат, флуфеноксурон, фонофос, галофенозид, гексафлумурон, имидаклоприд, индоксакарб, изофенфос, луфенурон, малатион, метальдегид, метамидофос, метидатион, метомил, метопрен, метоксихлор, монокротофос, метоксифенозид, нитиазин, новалурон, оксамил, паратион, паратион-метил, перметрин, фонат, фосалон, фосмет, фосамидон, пиримикарб, профенофос, пиметрозин, пиридадил, пирипроксифен, ротенон, спиносид, сулпрофос, тебуфенозид, тефлубензурон, тефлутрин, тетрафлорвинфос, триаклоприд, тиаметоксам, тиодикарб, тиосултап-натрий, тралометрин, трихлорфон и трифлумурон; фунгициды, такие как ацибензолар, азокситробин, беномил, бластицидин-S, смесь Bordeaux (трехосновной сульфат меди), бромукназол, капропамид, каптафол, каптан, карбендазим, хлоронеб, хлороталонил, оксихлорид меди, соли меди, цифлуфенамид, цимоксанил, ципроконазол, ципродинил, (S)-3,5-дихлор-N-(3-хлор-1-этил-1-метил-2-оксопропил)-4-метилбензамид (RH 7281), диклоцимет (S-2900), дикломезин, диклоран, дифеноконазол, (S)-3,5-дигидро-5-метил-2-(метилтио)-5-фенил-3-(фениламино)-4H-имидазол-4-он (RP 407213), диметоморф, димоксистробин, диниконазол, диниконазол-M, додин, эдифенфос, эпоксиконазол, фамоксадон, фенамидон, фенаримол, фенбуконазол, фенкарамид (SZX0722), фенпиклонил, фенпропидин, фенпропиморф, фентин ацетат, фентин гидроксид, флуазилам, флудиоксонил, флуметовер (RPA 403397), флуквинконазол, флусилазол, флутоланил, флутриафол, фолпет, фосетил-алюминий, фуралаксил, фураметапир (S-82658), гексаконазол, ипконазол, ипробенфос, ипродион, изопропиолан, казугамицин, крезоксим-метил, манкозеп, манеб, мефеноксам, мепронил, металаксил, метконазол, метомино-стробин/феноминоостробин (SSF-126), миклобутанил, нео-азоцин (метанарсонат железа), оксидиксил, пенконазол, пенцикурон, пробеназол, прохлораз, пропамокарб, пропиконазол, пирифенокс, пираклостробин, приметанил, пироксилон, хиноксифен, спироксамил, сера, тебуконазол, тетраконазол, тиабендазол, трифлузамид, тиофанат-метил, тирам, тиадинил, триадимефон, триадименол, трициклазол, трифлуксистробин, тритиконазол, валидамицин и винклозолин; нематоциды, такие как алдикарб, оксамил и фенамифос; бактерициды, такие как стерптомицин; акарициды, такие как амитраз, хинометионат, хлорбензилат, цигексатин, дикофол, диенохлор, этоксазол, феназахин,

фенбутатин оксид, фенпропатрин, фенпироксимат, гекситиазокс, пропаргит, пиридабен и тебуфенпирад; и биологические вещества, такие как *Bacillus thuringiensis*, включая подвиды *aizawai* и *kurstaki*, дельта эндотоксин *Bacillus thuringiensis*, бакуловирус и энтомопатогенные бактерии, вирусы и грибы. Соединения по настоящему изобретению и

5 композиции этих соединений можно применять для генетически трансформированных растений для экспрессии белков, токсичных для беспозвоночных вредителей (таких как токсин *Bacillus thuringiensis*). Эффект экзогенно применяемых соединений для контроля беспозвоночных вредителей по настоящему изобретению может быть синергическим с экскрессируемыми токсинами белками.

10 Общие сведения о таких сельскохозяйственных протектантах можно найти в *The Pesticide Manual*, 12th Edition, C. D. S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2000.

Предпочтительными инсектицидами и акарицидами для смешивания с соединениями по настоящему изобретению являются пиретроиды, такие как циперметрин, цигалотрин, 15 цифлутрин, бета-цифлутрин, эсфенвалерат, фенвалерат и тралометрин; карбаматы, такие как фенотикарб, метомил, оксамил и тиодикарб; неоникотиноиды такие как клотианидин, имидаклоприд и тиаклоприд; блокаторы нейронных натриевых каналов, такие как индоксакарб; инсектицидные макроциклические лактоны, такие как спиносад, абамектин, авермектин и эмаектин; антагонисты гамма-аминомасляной кислоты (GABA), такие как 20 эндосульфат, этипрол и фипронил; инсектицидные соединения мочевины, такие как флуфеноксурон и трифлумурон; вещества, имитирующие ювенильный гормон, такие как диофенолан и пирипроксифен; пиметрозин; и амитраз. Предпочтительными биологическими веществами для смешивания с соединениями по настоящему изобретению являются *Bacillus thuringiensis* и дельта эндотоксин *Bacillus thuringiensis*, а также 25 природные и генетически модифицированные вирусные инсектициды, включающие членов семейства *Baculoviridae*, а также насекомоядные грибы.

Наиболее предпочтительные смеси включают смесь соединения по настоящему изобретению с цигалотрином; смесь соединения по настоящему изобретению с бета-цифлутрином; смесь соединения по настоящему изобретению с эсфенвалератом; смесь 30 соединения по настоящему изобретению с метомилом; смесь соединения по настоящему изобретению с имидаклопридом; смесь соединения по настоящему изобретению с тиаклопридом; смесь соединения по настоящему изобретению с индоксакарбом; смесь соединения по настоящему изобретению с абамектином; смесь соединения по настоящему изобретению с эндосульфатом; смесь соединения по настоящему изобретению с 35 этипролом; смесь соединения по настоящему изобретению с финпропилом; смесь соединения по настоящему изобретению с флуфеноксуроном; смесь соединения по настоящему изобретению с пирипроксифеном; смесь соединения по настоящему изобретению с пиметрозином; смесь соединения по настоящему изобретению с амитразом; смесь соединения по настоящему изобретению с *Bacillus thuringiensis* и смесь 40 соединения по настоящему изобретению с дельта эндотоксином *Bacillus thuringiensis*.

В некоторых случаях для организации борьбы с вредителями особенно предпочтительными могут быть комбинации с другими соединениями или веществами для контроля беспозвоночных вредителей, с таким же спектром контроля, но другим способом действия. Так, композиции по настоящему изобретению могут также включать биологически 45 эффективное количество, по меньшей мере, одного дополнительного соединения или вещества для контроля беспозвоночных вредителей, с таким же спектром контроля, но с другим способом действия. Контактное нанесение генетически модифицированного растения для экспрессии защищающего соединения (например, белка), или места, где находится растение, с биологически эффективным количеством соединения по 50 изобретению также может обеспечить более широкий спектр защиты растения и может быть выгодным для организации борьбы с вредителями.

Борьба с беспозвоночными вредителями имеет сельскохозяйственное и несельскохозяйственное назначение, и ее осуществляют путем применения одного или

нескольких соединений по настоящему изобретению, в эффективном количестве, к среде обитания вредителей, включая сельскохозяйственный и несельскохозяйственный участок заражения, к площади, подлежащей защите, или непосредственно к вредителям, с которыми борются. Таким образом, настоящее изобретение, кроме того, включает способ

5 борьбы с беспозвоночными вредителями для применения в сельскохозяйственной и/или несельскохозяйственной области, включающий контактирование беспозвоночного вредителя или окружающей его среды с биологически эффективным количеством одного или нескольких соединений по настоящему изобретению, или с композицией, включающей, по меньшей мере, одно такое соединение, или с композицией, включающей, меньшей мере,

10 одно такое соединение и эффективное количество, по меньшей мере, одного дополнительного биологически активного соединения или вещества. Примеры подходящих композиций, включающих соединение по настоящему изобретению и эффективное количество, по меньшей мере, одного дополнительного биологически активного соединения или вещества, включают композиции гранул, где дополнительное биологически

15 активное соединение или вещество присутствует на той же грануле, что и соединение по настоящему изобретению, или на других гранулах, отдельно от тех, которые содержат соединение по настоящему изобретению.

Предпочтительным способом контактирования является разбрызгивание. Альтернативно, композицию в виде гранул, включающую соединение по настоящему изобретению, можно наносить на листву растения или в почву. Соединения по настоящему изобретению также можно легко доставлять путем поглощения растением при

20 контактировании растения с композицией, включающей соединение по настоящему изобретению, которую применяют для пропитки почвы в виде жидкой композиции, гранулированной композиции, вносимой в почву, для подсаживания защитных насаждений или погружения трансплантатов. Соединения также являются эффективными для местного

25 нанесения композиции, включающей соединение по настоящему изобретению, на участок заражения. Другие способы контактирования включают нанесение соединения или композиции по настоящему изобретению путем прямого или остаточного обрызгивания, распыления, в форме геля, путем покрытия семян, микроинкапсулирования, системного

30 поглощения, приманок, меток, болюсов, задымлений, фумигантов, аэрозолей, дустов и многие другие способы. Соединениями по настоящему изобретению также можно пропитывать материалы для изготовления устройств контроля беспозвоночных вредителей (например, сеток от насекомых).

Соединения по настоящему изобретению можно включать в приманки, поедаемые

35 беспозвоночными вредителями, или в устройства, такие как ловушки и т.п. Гранулы или приманки, включающие 0,01-5% активного ингредиента, 0,05-10% вещества(веществ), удерживающего влагу, и 40-99% растительной муки, являются эффективными для борьбы с обитающими в почве насекомыми при очень низких нормах применения, в частности, при

40 дозе активного ингредиента, являющейся летальной при поглощении, а не при прямом контакте.

Соединения по настоящему изобретению можно применять в их чистом виде, но наиболее часто применяют композицию, включающую одно или несколько соединений с подходящими носителями, разбавителями или поверхностно-активными веществами и, возможно, в сочетании с пищей, в зависимости от конечного предназначения.

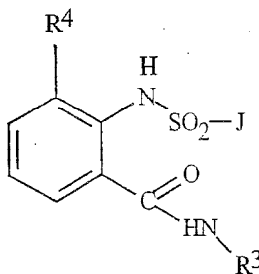
45 Предпочтительный способ применения включает разбрызгивание водной дисперсии или очищенного масляного раствора соединений. Комбинации с разбрызгиваемыми маслами, концентратами разбрызгиваемых масел, липкими веществами для распыления, адъювантами, другими растворителями и синергистами, такими как пиперонилбутоксид, часто повышает эффективность соединения.

50 Норма применения, необходимая для эффективного контроля (т.е. "биологически эффективное количество"), зависит от таких факторов, как вид подлежащего контролю беспозвоночного вредителя, цикл жизни вредителя, стадия развития, его размер, местонахождение, время года, культура или животное хозяин, способ питания, способ

спаривания, окружающая влага, температура и т.д. В нормальных условиях нормы применения примерно от 0,01 до 2 кг активного ингредиента на гектар являются достаточными для борьбы с вредителями в сельскохозяйственных экосистемах, но может быть достаточным такое малое количество как 0,0001 кг/га, или может потребоваться вплоть до 8 кг/га. Для несельскохозяйственных применений норма расхода находится в пределах от около 1,0 до около 50 мг/кв.м, но может быть достаточным такое малое количество как 0,1 мг/кв.м, или может потребоваться вплоть до 150 мг/кв.м. Специалист в данной области сможет легко определить биологически эффективное количество, необходимое для желаемого уровня контроля беспозвоночных вредителей.

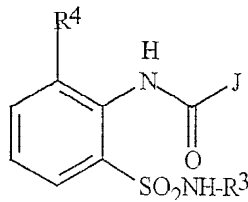
Следующие ИСПЫТАНИЯ демонстрируют эффективность контроля для соединений по настоящему изобретению в отношении конкретных вредителей. "Эффективность контроля" означает ингибирование развития беспозвоночных вредителей (включая их гибель), что приводит к значительно сниженному питанию. Однако контроль вредителей, обеспечиваемый соединениями по настоящему изобретению, не ограничивается этими видами. Описание соединений см. в Справочных таблицах А и В. В Справочных таблицах использованы следующие сокращения: "Me" означает метил, "i" означает изо, "Pr" означает пропил и "i-Pr" означает изопропил. Аббревиатура "Пр." означает "Пример" и указан номер примера, в котором было получено соединение.

Справочная Таблица А



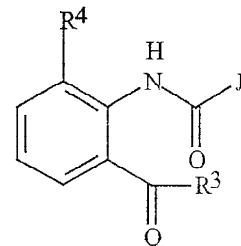
Соединение	R ⁴	R ³	J	Т.пл. °C
1	Me	i-Pr	4-Cl-фенил	208-210
2(Пр.2)	Me	i-Pr	1-(3-Cl-2-пиридинил)-3-CF ₃ -5-пиразол	69-72

Справочная Таблица В



Соединение	R ⁴	R ³	J	Т.пл. °C
B1	Me	i-Pr	4-CF ₃ -фенил	139-142
B2(Пр.1)	Me	i-Pr	4-OCF ₃ -фенил	104-107
B3	Me	i-Pr	1-(3-Cl-2-пиридинил)-3-CF ₃ -5-пиразолил	69-73

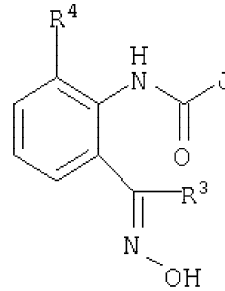
Справочная Таблица С



Соединение	R ⁴	R ³	J	Т.пл. °C
C1	Me	i-Bu	1-(3-Cl-2-пиридинил)-3-CF ₃ -5-пиразолил	138-140
C2(Пр.3)	Me	i-Bu	1-(3-Cl-2-пиридинил)-3-Br-5-пиразолил	119-120
C3	Me	Et	1-(3-Cl-2-пиридинил)-3-Br-5-пиразолил	185-186

10

Справочная Таблица D

15

СПРАВОЧНАЯ ТАБЛИЦА Е

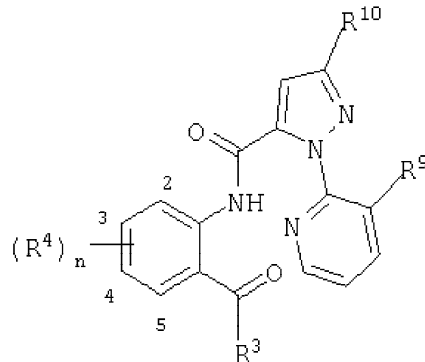
253035

ТАБЛИЦА ИНДЕКСОВ F

4045

^aДанные ТН-ЯМР приведены в м.д. в области более низкого поля от тетраметилсилана. Пики сигналов обозначены следующим образом: с означает синглет, д означает дублет, т означает триглет, кв означает кватерн, мс означает мультиплет, дд означает *doublet* *doublet*, дт означает *doublet* *triplet*.

50

Для оценки контроля моли капустной (*Plutella xylostella*) установка для испытания состояла из небольшого открытого контейнера, содержащего внутри 12-14-дневное

растение редьки. Его предварительно заражали 10-15 свежевылупившимися личинками на фрагменте корма для насекомых, при помощи пробоотборника для забора "пробки" из слоя плотного корма, содержащего множество растущих на нем личинок, и переноса пробки, содержащей личинки и рацион, в установку для испытания. Личинки перемещались по

5 испытываемому растению по мере высыхания пробки корма.

Композицию испытываемых соединений получали с использованием раствора, содержащего 10% ацетона, 90% воды и 300 ч/млн неионного поверхностно-активного вещества X-77® Spreader Lo-Foam Formula, содержащего алкиларилполиоксиэтилен, свободные жирные кислоты, гликоли и изопропанол (Loveland Industries, Inc.), если не

10 указано иное. Сформулированные в композицию соединения применяли в 1 мл жидкости через распылительное сопло SUJ2 корпусом 1/8 JJ (Sptaying Systems Co.), расположенным сверху, на высоте 1,27 см (0,5 дюйма) от каждой установки для испытания. Все испытываемые соединения в этом эксперименте разбрызгивали при концентрации 250 ч/млн (или ниже) при трех повторях. После разбрызгивания сформулированного в

15 композицию испытываемого соединения каждую установку для испытания оставляли для высыхания на 1 час, затем сверху помещали черную сетчатую крышку. Установки для испытания выдерживали в течение 6 дней в камере для выращивания при температуре 25 °C и относительной влажности 70%. Затем визуально оценивали повреждение растения, вызванное его поеданием.

20 Из испытываемых соединений соединения, указанные ниже, обеспечивали отличные уровни защиты растений (20% или менее повреждений, вызванных поеданием растения): I*, V3*, C2**, C5* и C6*, E1**, E3*, E5**, E7*, E9** и E10**.

ИСПЫТАНИЕ В

Для оценки контроля осенних "походных червей" (*Spodoptera frugiperda*) установка для

25 испытания состояла из небольшого открытого контейнера, содержащего внутри 4-5-дневное растение кукурузы. Его предварительно заражали 10-15 личинками однодневного возраста на фрагменте рациона насекомого при помощи пробоотборника, как описано в Испытании А.

Испытываемые соединения формулировали в композиции и разбрызгивали при

30 концентрации 250 ч/млн (или ниже), как описано для Испытания А. Нанесения композиций повторяли три раза. После разбрызгивания установки для испытания выдерживали в камере для выращивания и затем визуально оценивали повреждение растения, как описано для Испытания А.

Из испытываемых соединений соединения, указанные ниже, обеспечивали отличные

35 уровни защиты растений (20% или менее повреждений, вызванных выеданием растения): C2* и C5* и E5**.

ИСПЫТАНИЕ С

Для оценки контроля совки табачной (*Heliothis virescens*) установка для испытания состояла из небольшого открытого контейнера, содержащего внутри 6-7-дневное растение

40 хлопчатника. Его предварительно заражали 8 2-дневными личинками на фрагменте рациона насекомого при помощи пробоотборника, как описано в Испытании А.

Испытываемые соединения формулировали в композиции и разбрызгивали при

концентрации 250 ч/млн (или ниже), как описано для Испытания А. Нанесения композиций повторяли три раза. После разбрызгивания установки для испытания выдерживали в

45 камере для выращивания и затем визуально оценивали повреждение растения, как описано для Испытания А.

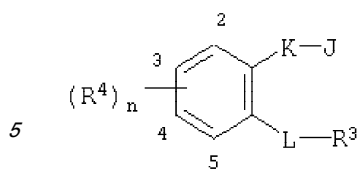
Из испытываемых соединений соединения, указанные ниже, обеспечивали отличные уровни защиты растений (20% или менее повреждений, вызванных поеданием растения): C2* и C6*.

50 *Испытывали при 50 ч/млн.

**Испытывали при 10 ч/млн.

Формула изобретения

1. Ортозамещенные ариламида формулы I



I

10 где J представляет собой фенильное кольцо или пиразольное кольцо, где каждое кольцо замещено одним-двумя заместителями, независимо выбранными из R⁵;

K представляет собой -NR¹C(=A)- или -NR¹SO₂-;

L представляет собой -C(=B)NR²-, -SO₂NR²- или -C(=B)-;

A и B представляют собой O;

15 R¹ представляет собой H;

R² представляет собой H;

R³ представляет собой C₁-C₆ алкил, необязательно замещенный одним или несколькими заместителями, независимо выбранными из группы, включающей CN, NO₂, C₁-C₄ алкилсульфонил и C₂-C₆ алкоксикарбонил;

20 каждый R⁴ независимо представляет собой C₁-C₆ алкил, галоген или CN;

каждый R⁵ независимо представляет собой C₁-C₆ галогеналкил, галоген или C₁-C₄ галогеналкокси; или

каждый R⁵ независимо представляет собой пиридинил, необязательно замещенный одним заместителем, независимо выбранными из R⁹;

25 R⁹ представляет собой галоген; и

n имеет значение от 1 до 2;

при условии, что когда K представляет собой -NR¹C(=A)-, тогда L является отличным от -C(=O)NR₂-, и его соли.

30 2. Соединение по п.1, в котором K представляет собой -NR¹C(=A)-.

3. Соединение по п.1, в котором L представляет собой -C(=B)NR²-.

4. Соединение по п.2 или 3, в котором R³ представляет собой C₁-C₆ алкил, необязательно замещенный одним или несколькими заместителями, независимо выбранными из группы, включающей CN и C₁-C₂ алкилсульфонил;

35 одна из групп R⁴ присоединена к остальной части формулы I либо по положению 2, либо по положению 4 фенильного кольца, и указанный R⁴ представляет собой C₁-C₄ алкил, галоген или CN;

каждый R⁵ независимо представляет собой C₁-C₄ галогеналкил, галоген или C₁-C₄ галогеналкокси; или

40 каждый R⁵ независимо представляет собой пиридинил необязательно замещенный одним заместителем, выбранными из R⁹; и

n имеет значение 1 или 2.

5. Соединение по п.4,

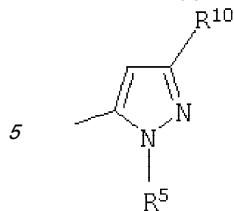
45 в котором R³ представляет собой C₁-C₄ алкил, необязательно замещенный CN или S(O)₂CH₃; и

один R⁵ связан с J в ортоположении относительно K.

6. Соединение по п.5, в котором

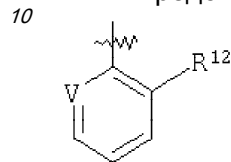
50 один R⁴ присоединен к остальной части формулы I в положении 2 фенильного кольца, орто относительно K-J фрагмента, и выбран из группы, включающей C₁-C₃ алкил, и, необязательно, второй R⁴ присоединен в положении 4 фенильного кольца, пара относительно K-J фрагмента, и выбран из группы, включающей галоген.

7. Соединение по п.6, в котором J представляет собой



J-5

R⁵ представляет собой



15 V представляет собой N;

каждый R¹⁰ представляет собой H, C₁-C₆ галогеналкил или галоген; и

R⁹ представляет собой галоген.

8. Соединение по п.7,

20 в котором R¹⁰ представляет собой CF₃ или галоген.

9. Соединение по п.8,

в котором J представляет собой J-5;

R⁹ представляет собой Cl; R¹⁰ представляет собой галоген или CF₃.

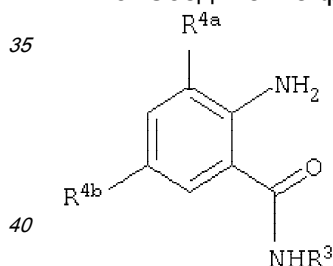
10. Соединение по п.1, которое представляет собой

25 1-(3-хлор-2-пиридинил)-N-[2-метил-6-[(1-метилэтил)амино]сульфонил]фенил]-3-(трифторметил)-1H-пиразол-5-карбоксамид.

11. Способ борьбы с насекомыми, включающий контактирование насекомых или окружающей их среды с биологически эффективным количеством соединения по п.1, или подходящей солью.

30 12. Композиция для борьбы с насекомыми, включающая биологически эффективное количество соединения по п.1 и, по меньшей мере, один дополнительный компонент, выбранный из группы, включающей поверхностно-активные вещества, твердые разбавители и жидкие разбавители.

13. Соединение формулы 2



где R³ представляет собой изопропил или метил;

R^{4a} представляет собой метил или Cl; и

45 R^{4b} представляет собой H, Cl или Br, при условии, что

(а) когда R^{4a} представляет собой метил и R^{4b} представляет собой водород, тогда R³ не является изопропилом;

(b) когда R^{4b} представляет собой H, тогда R^{4a} не является Cl; и

50 (с) когда R^{4a} и R^{4b} представляют собой Cl, тогда R³ не является изопропилом, или его соль.

14. Соединение по п.13, в котором R³ представляет собой метил, R^{4a} представляет собой метил и R^{4b} представляет собой водород.

15. Соединение по п.13, в котором R^3 представляет собой метил, R^{4a} представляет собой метил и R^{4b} представляет собой Cl.

5

10

15

20

25

30

35

40

45

50