



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ

(21)(22) Заявка: 2014128826, 13.12.2012

(24) Дата начала отсчета срока действия патента:
13.12.2012

Дата регистрации:
29.11.2017

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
15.12.2011 US 61/570,962

(43) Дата публикации заявки: 10.02.2016 Бюл. № 4

(45) Опубликовано: 29.11.2017 Бюл. № 34

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 15.07.2014

(86) Заявка РСТ:
US 2012/069468 (13.12.2012)

(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2013/090547 (20.06.2013)

Адрес для переписки:
129090, Москва, ул. Б. Спасская, 25, строение 3,
ООО "Юридическая фирма Городиский и
Партнеры"

(72) Автор(ы):

ЧЖАН Вэньмин (US),
АННИС Гари Дэвид (US)

(73) Патентообладатель(и):

Е.И.ДЮПОН ДЕ НЕМУР ЭНД
КОМПАНИ (US)

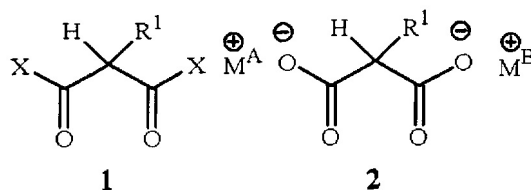
(56) Список документов, цитированных в отчете
о поиске: WO2011017351 A2, 10.02.2011. US
20040167329 A1, 26.08.2004. ARANYOS V. et
al. "Electrochemical and photoelectrochemical
investigation of new carboxylatobipyridine(bis-
bipyridine)ruthenium(II) complexes for dye-
sensitized TiO₂ electrodes" Solar Energy
Materials and Solar Cells Volume 64, Issue 2,
30 September 2000, Pages 97-114. WO 9736868
A1, (см. прод.)

(54) ДИСОЛИ МАЛОНОВОЙ КИСЛОТЫ И СПОСОБ ПОЛУЧЕНИЯ МАЛОНИЛДИГАЛОГЕНИДОВ

(57) Реферат:

Изобретение относится к способу получения соединения формулы 1, где R¹ представляет собой фенил, замещенный 1 или 2 заместителями, независимо выбранными из Cl или CF₃; и X представляет собой Cl или Br, включающему приведение в контакт соединения формулы 2, где R¹ представляет собой фенил, замещенный 1 или 2 заместителями, независимо выбранными из Cl или CF₃; и каждый M^A и M^B независимо представляет собой Na, K, NH₄, NH(CH₂CH₃)₃ или

NH(CH₂CH₂CH₂CH₃)₃, с галогенирующим средством. Предложенный способ является более коротким и более эффективным. 2 з.п. ф-лы, 3 пр., 321 табл.



(56) (продолжение):

09.10.1997. WO 2011017334 A2, 10.02.2011. RU 2373182 C2, 20.11.2009. US 4072710 A, 07.02.1978.



FEDERAL SERVICE
FOR INTELLECTUAL PROPERTY

(51) Int. Cl.

C07C 51/60 (2006.01)

C07C 57/36 (2006.01)

C07C 57/72 (2006.01)

C07C 57/34 (2006.01)

(12) ABSTRACT OF INVENTION

(21)(22) Application: 2014128826, 13.12.2012

(24) Effective date for property rights:
13.12.2012Registration date:
29.11.2017

Priority:

(30) Convention priority:
15.12.2011 US 61/570,962

(43) Application published: 10.02.2016 Bull. № 4

(45) Date of publication: 29.11.2017 Bull. № 34

(85) Commencement of national phase: 15.07.2014

(86) PCT application:
US 2012/069468 (13.12.2012)(87) PCT publication:
WO 2013/090547 (20.06.2013)

Mail address:

129090, Moskva, ul. B. Spasskaya, 25, stroenie 3,
OOO "Yuridicheskaya firma Gorodisskij i Partnery"

(72) Inventor(s):

CHZHAN Venmin (US),
ANNIS Gari Devid (US)

(73) Proprietor(s):

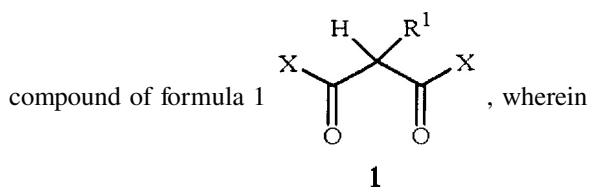
E.I.DYUPON DE NEMUR END KOMPANI
(US)

(54) DISOLS OF MALONIC ACID AND METHOD OF PRODUCTING MALONYLDIHALOGENIDES

(57) Abstract:

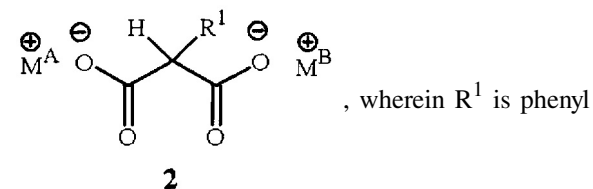
FIELD: chemistry.

SUBSTANCE: invention relates to of producing a



R¹ is phenyl substituted by 1 or 2 substituents independently selected from Cl or CF₃; and X is Cl or

Br, comprising contacting a compound of formula 2



substituted with 1 or 2 substituents independently selected from Cl or CF₃; and each M^A and M^B independently is Na, K, NH₄, NH(CH₂CH₃)₃ or NH(CH₂CH₂CH₂CH₃)₃, with a halogenating agent.

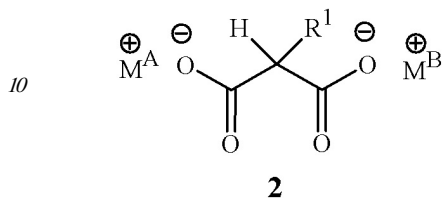
EFFECT: method is shorter and more efficient.
3 cl, 3 ex, 321 tbl

УРОВЕНЬ ТЕХНИКИ

Настоящее изобретение относится к новым дисолям малоновой кислоты. Эти дисоли применимы в способе получения определенных малонилдигалогенидов, которые, в свою очередь, применимы в получении определенных мезоионных инсектицидов (см. например, РСТ публикацию WO 2009/99929 A1).

СУЩНОСТЬ ИЗОБРЕТЕНИЯ

Настоящее изобретение относится к соединению формулы 2,



где

15 R^1 представляет собой фенил или пиридинил, каждый из которых необязательно замещен Q и имеет до 3 заместителей, независимо выбранных из R^2 ; при условии, что R^1 замещен по меньшей мере одним Q или одним R^2 ;

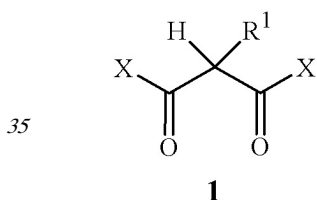
каждый R^2 независимо представляет собой галоген, циано, SF_5 , C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_4 галогеналкокси, C_1 - C_4 алкилтио или C_1 - C_4 галогеналкилтио;

Q представляет собой фенил или пиридинил, каждый из которых необязательно замещен максимум 5 заместителями, независимо выбранными из галогена, циано, C_1 - C_4 алкила, C_1 - C_4 галогеналкила, C_1 - C_4 алкокси и C_1 - C_4 галогеналкокси;

каждый M^A и M^B независимо представляет собой Li, Na, K, Ca, Ba или $N(R^A)(R^B)(R^C)(R^D)$; и

каждый R^A , R^B , R^C и R^D независимо представляет собой H, C_1 - C_4 алкил, циклогексил, фенил или бензил.

Настоящее изобретение относится к способу получения соединения формулы 1,



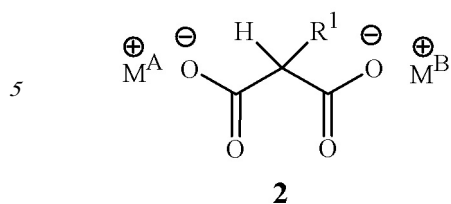
где

40 R^1 представляет собой фенил или пиридинил, каждый из которых необязательно замещен Q и имеет до 3 заместителей, независимо выбранных из R^2 ;

каждый R^2 независимо представляет собой галоген, циано, SF_5 , C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_4 галогеналкокси, C_1 - C_4 алкилтио или C_1 - C_4 галогеналкилтио;

Q представляет собой фенил или пиридинил, каждый из которых необязательно замещен максимум 5 заместителями, независимо выбранными из галогена, циано, C_1 - C_4 алкила, C_1 - C_4 галогеналкила, C_1 - C_4 алкокси и C_1 - C_4 галогеналкокси; и

X представляет собой Cl или Br,
предусматривающему контакт соединения формулы 2,



где

10 R^1 представляет собой фенил или пиридинил, каждый из которых необязательно замещен Q и имеет до 3 заместителей, независимо выбранных из R^2 ;

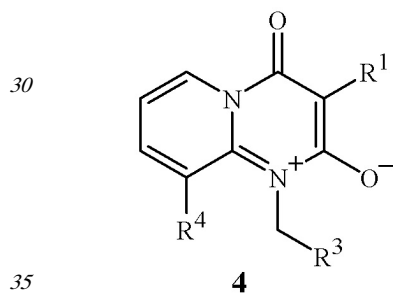
каждый R^2 независимо представляет собой галоген, циано, SF_5 , C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_4 галогеналкокси, C_1 - C_4 алкилтио или
15 C_1 - C_4 галогеналкилтио;

Q представляет собой фенил или пиридинил, каждый из которых необязательно замещен максимум 5 заместителями, независимо выбранными из галогена, циано, C_1 - C_4 алкила, C_1 - C_4 галогеналкила, C_1 - C_4 алкокси и C_1 - C_4 галогеналкокси;

20 каждый M^A и M^B независимо представляет собой Li, Na, K, Ca, Ba или $N(R^A)(R^B)(R^C)(R^D)$; и

каждый R^A , R^B , R^C и R^D независимо представляет собой H, C_1 - C_4 алкил, циклогексил, фенил или бензил,
25 с галогенирующим средством.

Настоящее изобретение также относится к способу получения соединения формулы
4,



где

R^1 представляет собой фенил или пиридинил, каждый из которых необязательно замещен Q и имеет до 3 заместителей, независимо выбранных из R^2 ;

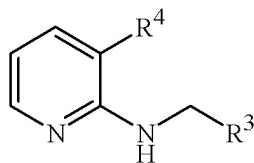
40 каждый R^2 независимо представляет собой галоген, циано, SF_5 , C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_4 галогеналкокси, C_1 - C_4 алкилтио или C_1 - C_4 галогеналкилтио;

Q представляет собой фенил или пиридинил, каждый из которых необязательно замещен максимум 5 заместителями, независимо выбранными из галогена, циано, C_1 - C_4 алкила, C_1 - C_4 галогеналкила, C_1 - C_4 алкокси и C_1 - C_4 галогеналкокси;

R^3 представляет собой тиазолил, пиридинил или пиримидинил, каждый из которых

необязательно замещен галогеном или C₁-C₄алкилом; и

R⁴ представляет собой H, C₁-C₄алкил или C₁-C₄галогеналкил, предусматривающему осуществление реакции соединения формулы 5,



5

где

R³ представляет собой тиазолил, пиридинил или пиримидинил, каждый из которых необязательно замещен галогеном или C₁-C₄алкилом; и

R⁴ представляет собой H, C₁-C₄алкил или C₁-C₄галогеналкил, с соединением формулы 1, при этом способ получения соединения формулы 4 предусматривает стадию получения соединения формулы 1 из соединения формулы 2 посредством раскрытого выше способа.

Также настоящее изобретение относится к соединению, которое представляет собой метил-3,5-дихлорбензолэтанимидат или этил-3,5-дихлорбензолэтанимидат или их соли.

ПОДРОБНОЕ ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ

Используемые в настоящем документе выражения “содержит”, “содержащий”, “включает”, “включающий”, “имеет”, “имеющий”, “вмещает”, “вмещающий”, “характеризующийся тем, что” или любые другие их вариации распространяются на неисключительное включение, если явно не указано какое-либо ограничение. Например, композиция, смесь, процесс или способ, которые включают перечень элементов, необязательно ограничены только этими элементами, но могут включать другие элементы, явно не перечисленные или присущие таким композиции, смеси, процессу или способу.

Переходная фраза “состоящий из” исключает любой не указанный элемент, стадию или ингредиент. Если подобное встречается в пункте формулы изобретения, то оно закрывает пункт формулы изобретения для включения материалов, отличных от перечисленных, за исключением посторонних примесей, обычно с ними связанными. Если фраза “состоящий из” появляется в отличительной части пункта формулы, а не сразу после ограничительной части, она ограничивает только элемент, изложенный в той отличительной части; при этом другие элементы в целом не исключаются из пункта формулы изобретения.

Переходная фраза “по сути состоящий из” используется для определения композиции или способа, которые включают материалы, стадии, признаки, компоненты или элементы, в дополнение к тем, которые точно раскрыты, причем данные добавочные материалы, стадии, признаки, компоненты или элементы существенно не влияют на основную и новую характеристику(и) заявленного изобретения. Выражение “по сути состоящий из” занимает среднюю позицию между “содержащий” и “состоящий из”.

Если заявители определили объем изобретения или его части неограничивающим выражением, таким как “содержащий”, явно следует понимать, что (если не указано иное) описание следует толковать как также описывающее такое изобретение с применением выражений “по сути состоящий из” или “состоящий из”.

Кроме того, если прямо не указано обратное, “или” относится к включающему “или”,

а не к исключаяющему “или”. Например, условие А или В удовлетворяется любым из следующего: А истинно (или выполняется) и В ошибочно (или не выполняется), А ошибочно (или не выполняется) и В истинно (или выполняется), и А и В истинно (или выполняются).

5 Также, упоминание элемента или компонента изобретения в единственном числе не подразумевает ограничения в отношении числа случаев (то есть, встречаемости) элемента или компонента. Поэтому единственное число следует понимать как включающее что-то одно или по меньшей мере одно, и форма единственного числа для обозначения элемента или компонента также включает множественное число, за исключения случаев,
10 когда ясно подразумевается единственное число.

В контексте настоящего раскрытия выражения “контакт”, “приводится в контакт” или “приведение в контакт” означает сведение вместе по меньшей мере двух химических реагентов. Выражение описывает такое взаимодействие, которое предназначено вызывать определенное химическое превращение. Например в кратком описании
15 изобретения, если соединение формулы 2 “приводится в контакт” с галогенирующим средством, два реагента “реагируют” с получением соединения формулы 1. Такое “приведение в контакт” также можно выполнять в присутствии дополнительных реагентов, растворителей, катализаторов и т.п., как описано в кратком описании изобретения или в каком-либо из вариантов осуществления в настоящем документе.

20 В вышеуказанных перечислениях выражение “алкил”, используемое либо самостоятельно, либо в сложных словах, таких как “алкилтио” или “галогеналкил”, включает алкил с прямой цепью или разветвленный алкил, такой как метил, этил, н-пропил, изо-пропил или различные изомеры бутила, пентила или гексила. “Алкилен” обозначает прямой или разветвленный алкандиол. Примеры “алкилена” включают
25 CH_2 , CH_2CH_2 , $\text{CH}(\text{CH}_3)$, $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, $\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)$ и различные изомеры бутилена. “Алкокси” включает, например, метокси, этокси, н-пропилокси, изопропилокси и различные изомеры бутокси, пентокси и гексилокси. Выражение “алкилтио” включает фрагменты алкилтио с разветвленной или прямой цепью, такие как метилтио, этилтио, и различные изомеры пропилтио, бутилтио, пентилтио и гексилтио.

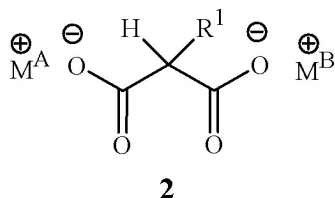
30 Выражение “галоген” либо самостоятельно, либо в сложном слове, таком как “галогеналкил”, или при использовании в выражениях, таких как “алкил, замещенный галогеном”, включает фтор, хлор, бром или йод. Кроме того, при использовании в сложных словах, таких как “галогеналкил”, или при использовании в выражениях, таких как “алкил, замещенный галогеном”, указанный алкил может быть частично или
35 полностью замещен атомами галогена, которые могут быть одинаковыми или разными. Примеры “галогеналкила” или “алкила, замещенного галогеном” включают $-\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{Cl}$, $-\text{CH}_2\text{CF}_3$ и $-\text{CCl}_2\text{CF}_3$. Выражения “галогеналкокси”, “галогеналкилтио” и т.п. определяются по аналогии с выражением “галогеналкил”. Примеры “галогеналкокси” включают $-\text{OCF}_3$, $-\text{OCH}_2\text{CCl}_3$, $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CF}_2\text{H}$ и $-\text{OCH}_2\text{CF}_3$. Примеры “галогеналкилтио”
40 включают $-\text{SCCl}_3$, $-\text{SCF}_3$, $-\text{SCH}_2\text{CCl}_3$ и $-\text{SCH}_2\text{CH}_2\text{CHCl}$.

Используемое в настоящем документе выражение “алкилирующее средство” относится к химическому соединению, в котором содержащий углерод радикал связывается через атом углерода с уходящей группой, такой как галогенид или
45 сульфат, которая является замещаемой путем связывания нуклеофила с указанным атомом углерода. Если не указано иное, выражение “алкилирование” не ограничивает содержащий углерод радикал до алкила; содержащие углерод радикалы в алкилирующих средствах включают ряд связанных с углеродом замещающих радикалов, определенных

для R^1 и R^2 . Используемый в настоящем документе термин “галогенирующее средство” относится к химическому реагенту, который обеспечивает, включает или помещает атом галогена в (или на) органическую молекулу в определенном положении посредством ряда механизмов.

Варианты осуществления данного изобретения включают:

Вариант осуществления 1. Соединение формулы 2,



где

R^1 представляет собой фенил или пиридинил, каждый из которых необязательно замещен Q и имеет до 3 заместителей, независимо выбранных из R^2 ; при условии, что R^1 замещен по меньшей мере одним Q или одним R^2 ;

каждый R^2 независимо представляет собой галоген, циано, SF_5 , C_1 - C_4 алкил,

C_1 - C_4 галогеналкил, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_4 галогеналкокси, C_1 - C_4 алкилтио или C_1 - C_4 галогеналкилтио;

Q представляет собой фенил или пиридинил, каждый из которых необязательно замещен максимум 5 заместителями, независимо выбранными из галогена, циано, C_1 - C_4 алкила, C_1 - C_4 галогеналкила, C_1 - C_4 алкокси и C_1 - C_4 галогеналкокси;

каждый M^A и M^B независимо представляет собой Li, Na, K, Ca, Ba или $N(R^A)(R^B)(R^C)(R^D)$; и

каждый R^A , R^B , R^C и R^D независимо представляет собой H, C_1 - C_4 алкил, циклогексил, фенил или бензил.

Вариант осуществления 2. Соединение варианта осуществления 1, где R^1 представляет собой фенил, необязательно замещенный Q и имеющий до 3 заместителей, независимо выбранных из R^2 .

Вариант осуществления 3. Соединение любого из вариантов осуществления 1 или 2, где R^1 представляет собой фенил, необязательно имеющий до 3 заместителей, независимо выбранных из R^2 .

Вариант осуществления 4. Соединение любого из вариантов осуществления 1-3, где R^1 представляет собой фенил, необязательно имеющий до 2 заместителей, независимо выбранных из R^2 .

Вариант осуществления 5. Соединение любого из вариантов осуществления 1-4, где R^1 представляет собой фенил, замещенный 1 заместителем, выбранным из R^2 .

Вариант осуществления 6. Соединение варианта осуществления 5, где R^1 представляет собой фенил, замещенный 1 заместителем, выбранным из R^2 , в 3-положении.

Вариант осуществления 7. Соединение варианта осуществления 6, где R^1 представляет собой 3-(трифторметил)фенил или 3-(трифторметокси)фенил.

Вариант осуществления 8. Соединение любого из варианта осуществления 1-4, где R^1 представляет собой фенил, замещенный 2 заместителями, выбранными из R^2 , в 3- и 5-положениях.

Вариант осуществления 9. Соединение варианта осуществления 8, где R^1 представляет собой 3,5-дихлорфенил или 3-хлор-5-(трифторметил)фенил.

Вариант осуществления 10. Соединение по любому из вариантов осуществления 1 или 2, где R^1 представляет собой фенил, замещенный 1 заместителем, выбранным из Q.

Вариант осуществления 11. Соединение варианта осуществления 10, где R^1 представляет собой фенил, замещенный одним заместителем, выбранным из Q в 3-положении.

Вариант осуществления 12. Соединение варианта осуществления 1, где R^1 представляет собой пиридинил, замещенный 1-2 заместителями, независимо выбранными из R^2 ; или пиридинил, замещенный 1 заместителем, выбранным из Q.

Вариант осуществления 13. Соединение варианта осуществления 12, где R^1 представляет собой пиридинил, замещенный 1-2 заместителями, независимо выбранными из R^2 .

Вариант осуществления 14. Соединение по любому из вариантов осуществления 1-13, где каждый R^2 независимо представляет собой галоген, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_1 - C_4 алкокси или C_1 - C_4 галогеналкокси.

Вариант осуществления 15. Соединение варианта осуществления 14, где каждый R^2 независимо представляет собой галоген, C_1 - C_2 алкил, C_1 - C_2 галогеналкил, C_1 - C_2 алкокси или C_1 - C_2 галогеналкокси.

Вариант осуществления 16. Соединение варианта осуществления 15, где каждый R^2 независимо представляет собой галоген, C_1 - C_2 галогеналкил или C_1 - C_2 галогеналкокси.

Вариант осуществления 17. Соединение варианта осуществления 16, где каждый R^2 независимо представляет собой C_1 - C_2 галогеналкил или C_1 - C_2 галогеналкокси.

Вариант осуществления 18. Соединение варианта осуществления 16, где каждый R^2 независимо представляет собой галоген или C_1 - C_2 галогеналкил.

Вариант осуществления 19. Соединение варианта осуществления 16, где каждый R^2 независимо представляет собой Cl, $-CF_3$ или $-OCF_3$.

Вариант осуществления 20. Соединение варианта осуществления 19, где каждый R^2 независимо представляет собой Cl.

Вариант осуществления 21. Соединение варианта осуществления 19, где каждый R^2 независимо представляет собой Cl или $-CF_3$.

Вариант осуществления 22. Соединение варианта осуществления 19, где каждый R^2 независимо представляет собой $-CF_3$ или $-OCF_3$.

Вариант осуществления 23. Соединение по любому из вариантов осуществления 1, 2, 10, 11 или 12, где Q представляет собой пиридинил, необязательно имеющий до 4 заместителей, независимо выбранных из галогена, циано, C_1 - C_4 алкила,

C₁-C₄галогеналкила, C₁-C₄алкокси и C₁-C₄галогеналкокси.

Вариант осуществления 24. Соединение варианта осуществления 23, где Q представляет собой пиридинил, необязательно имеющий до 2 заместителей, независимо выбранных из галогена и C₁-C₄галогеналкила.

Вариант осуществления 25. Соединение варианта осуществления 24, где Q представляет собой пиридинил, необязательно замещенный 2 заместителями, независимо выбранными из Cl и -CF₃.

Вариант осуществления 26. Соединение варианта осуществления 25, где Q представляет собой 2-пиридинил, замещенный Cl и -CF₃.

Вариант осуществления 27. Соединение варианта осуществления 26, где Q представляет собой 3-хлор-5-трифторметилпиридин-2-ил.

Вариант осуществления 28. Соединение по любому из вариантов осуществления 1-27, где каждый M^A и M^B независимо представляет собой Li, Na, K, NH₄, NH(CH₂CH₃)₃, NH(CH₂CH₂CH₂CH₃)₃, NH₂(Bn)₂, NH₂(циклогексил)₂ или NH₂(фенил)₂.

Вариант осуществления 29. Соединение варианта осуществления 28, где каждый M^A и M^B независимо представляет собой Na, K, NH₄, NH(CH₂CH₃)₃ или NH(CH₂CH₂CH₂CH₃)₃.

Вариант осуществления 30. Соединение варианта осуществления 28, где каждый M^A и M^B независимо представляет собой Na, K, NH₄ или NH(CH₂CH₃)₃.

Вариант осуществления 31. Соединение варианта осуществления 28, где каждый M^A и M^B независимо представляет собой Na, K или NH₄.

Вариант осуществления 32. Соединение варианта осуществления 31, где каждый M^A и M^B независимо представляет собой Na или K.

Вариант осуществления 33. Соединение варианта осуществления 31, где каждый M^A и M^B независимо представляет собой Na.

Вариант осуществления 34. Соединение варианта осуществления 31, где каждый M^A и M^B независимо представляет собой K.

Вариант осуществления 35. Соединение варианта осуществления 1, где R¹ является отличным от 3-(трифторметокси)фенила.

Вариант осуществления 36. Соединение варианта осуществления 1, где R¹ является отличным от 2-фторфенила.

Вариант осуществления 37. Соединение варианта осуществления 1, где R¹ является отличным от 2',3'-дихлор-[1,1'-бифенил]-3-ила.

Вариант осуществления 38. Соединение варианта осуществления 1, где R¹ является отличным от 3-(трифторметил)фенила.

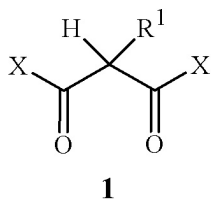
Вариант осуществления 39. Соединение варианта осуществления 1, где R¹ является отличным от 3-[3-хлор-5-(трифторметил)-2-пиридинил]фенила.

Вариант осуществления 40. Соединение по любому из вариантов осуществления 35-38, где каждый M^A и M^B независимо является отличным от Na.

Вариант осуществления 41. Соединение варианта осуществления 7, где R¹ представляет собой 3-(трифторметил)фенил.

Вариант осуществления 42. Соединение варианта осуществления 9, где R¹ представляет собой 3,5-дихлорфенил.

Вариант осуществления 1A. Способ получения соединения формулы 1,



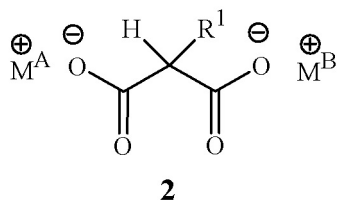
10 где

R¹ представляет собой фенил или пиридинил, каждый из которых необязательно замещен Q и имеет до 3 заместителей, независимо выбранных из R²;

каждый R² независимо представляет собой галоген, циано, SF₅, C₁-C₄алкил, C₁-C₄галогеналкил, C₁-C₄алкокси, C₁-C₄галогеналкокси, C₁-C₄алкилтио или C₁-C₄галогеналкилтио;

Q представляет собой фенил или пиридинил, каждый из которых необязательно замещен максимум 5 заместителями, независимо выбранными из галогена, циано, C₁-C₄алкила, C₁-C₄галогеналкила, C₁-C₄алкокси и C₁-C₄галогеналкокси; и

X представляет собой Cl или Br, предусматривающий контакт соединения формулы 2,



30 где

R¹ представляет собой фенил или пиридинил, каждый из которых необязательно замещен Q и имеет до 3 заместителей, независимо выбранных из R²;

каждый R² независимо представляет собой галоген, циано, SF₅, C₁-C₄алкил, C₁-C₄галогеналкил, C₁-C₄алкокси, C₁-C₄галогеналкокси, C₁-C₄алкилтио или C₁-C₄галогеналкилтио;

Q представляет собой фенил или пиридинил, каждый из которых необязательно замещен максимум 5 заместителями, независимо выбранными из галогена, циано, C₁-C₄алкила, C₁-C₄галогеналкила, C₁-C₄алкокси и C₁-C₄галогеналкокси;

каждый M^A и M^B независимо представляет собой Li, Na, K, Ca, Ba или N(R^A)(R^B)(R^C)(R^D); и

каждый R^A, R^B, R^C и R^D независимо представляет собой H, C₁-C₄алкил, циклогексил, фенил или бензил, с галогенирующим средством.

Вариант осуществления 2A. Способ варианта осуществления 1A, где R¹ представляет собой фенил, необязательно замещенный Q и имеющий до 3 заместителей, независимо

выбранных из R^2 .

Вариант осуществления 3А. Способ по любому из вариантов осуществления 1А или 2А, где R^1 представляет собой фенил, необязательно имеющий до 3 заместителей,
 5 независимо выбранных из R^2 .

Вариант осуществления 4А. Способ по любому из вариантов осуществления 1А-3А, где R^1 представляет собой фенил, необязательно имеющий до 2 заместителей, независимо
 10 выбранных из R^2 .

Вариант осуществления 5А. Способ по любому из вариантов осуществления 1А-4А, где R^1 представляет собой фенил, замещенный 1 заместителем, выбранным из R^2 .

Вариант осуществления 6А. Способ варианта осуществления 5А, где R^1 представляет собой фенил, замещенный 1 заместителем, выбранным из R^2 , в 3-положении.

Вариант осуществления 7А. Способ варианта осуществления 6А, где R^1 представляет собой 3-(трифторметил)фенил или 3-(трифторметокси)фенил.

Вариант осуществления 8А. Способ по любому из вариантов осуществления 1А-4А, где R^1 представляет собой фенил, замещенный 2 заместителями, выбранными из R^2 , в 3- и 5-положениях.

Вариант осуществления 9А. Способ варианта осуществления 8А, где R^1 представляет собой 3,5-дихлорфенил или 3-хлор-5-(трифторметил)фенил.

Вариант осуществления 10А. Способ по любому из вариантов осуществления 1А или 2А, где R^1 представляет собой фенил, замещенный 1 заместителем, выбранным из
 25 Q.

Вариант осуществления 11А. Соединение варианта осуществления 10А, где R^1 представляет собой фенил, замещенный одним заместителем, выбранным из Q, в 3-положении.

Вариант осуществления 12А. Способ варианта осуществления 1А, где R^1 представляет собой пиридинил, замещенный 1-2 заместителями, независимо выбранными из R^2 ; или пиридинил, замещенный 1 заместителем, выбранным из Q.

Вариант осуществления 13А. Способ варианта осуществления 12А, где R^1 представляет собой пиридинил, замещенный 1-2 заместителями, независимо выбранными
 35 из R^2 .

Вариант осуществления 14А. Способ по любому из вариантов осуществления 1А-13А, где каждый R^2 независимо представляет собой галоген, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_1 - C_4 алкокси или C_1 - C_4 галогеналкокси.

Вариант осуществления 15А. Способ варианта осуществления 14А, где каждый R^2 независимо представляет собой галоген, C_1 - C_2 алкил, C_1 - C_2 галогеналкил, C_1 - C_2 алкокси или C_1 - C_2 галогеналкокси.

Вариант осуществления 16А. Способ варианта осуществления 15А, где каждый R^2 независимо представляет собой галоген, C_1 - C_2 галогеналкил или C_1 - C_2 галогеналкокси.

Вариант осуществления 17А. Способ варианта осуществления 16А, где каждый R^2 независимо представляет собой C_1 - C_2 галогеналкил или C_1 - C_2 галогеналкокси.

Вариант осуществления 18А. Способ варианта осуществления 16А, где каждый R^2 независимо представляет собой галоген или C_1 - C_2 галогеналкил.

Вариант осуществления 19А. Способ варианта осуществления 16А, где каждый R^2
5 независимо представляет собой Cl, $-CF_3$ или $-OCF_3$.

Вариант осуществления 20А. Способ варианта осуществления 19А, где каждый R^2 независимо представляет собой Cl.

Вариант осуществления 21А. Способ варианта осуществления 19А, где каждый R^2
10 независимо представляет собой Cl или $-CF_3$.

Вариант осуществления 22А. Способ варианта осуществления 19А, где каждый R^2 независимо представляет собой $-CF_3$ или $-OCF_3$.

Вариант осуществления 23А. Способ по любому из вариантов осуществления 1А, 2А, 10А, 11А или 12А, где Q представляет собой пиридинил, необязательно имеющий
15 до 4 заместителей, независимо выбранных из галогена, циано, C_1 - C_4 алкила, C_1 - C_4 галогеналкила, C_1 - C_4 алкокси и C_1 - C_4 галогеналкокси.

Вариант осуществления 24А. Способ варианта осуществления 23А, где Q представляет собой пиридинил, необязательно имеющий до 2 заместителей, независимо выбранных
20 из галогена и C_1 - C_4 галогеналкила.

Вариант осуществления 25А. Способ варианта осуществления 24А, где Q представляет собой пиридинил, необязательно замещенный 2 заместителями, независимо выбранными из Cl и $-CF_3$.

Вариант осуществления 26А. Способ варианта осуществления 25А, где Q представляет собой 2-пиридинил, замещенный Cl и $-CF_3$.
25

Вариант осуществления 27А. Способ варианта осуществления 24А, где Q представляет собой 3-хлор-5-трифторметилпиридин-2-ил.

Вариант осуществления 28А. Способ по любому из вариантов осуществления 1А-27А, где каждый M^A и M^B независимо представляет собой Li, Na, K, NH_4 , $NH(CH_2CH_3)_3$,
30 $NH(CH_2CH_2CH_2CH_3)_3$, $NH_2(Bn)_2$, NH_2 (циклогексил) $_2$ или NH_2 (фенил) $_2$.

Вариант осуществления 29А. Соединение варианта осуществления 28А, где каждый M^A и M^B независимо представляет собой Na, K, NH_4 , $NH(CH_2CH_3)_3$ или NH
35 $(CH_2CH_2CH_2CH_3)_3$.

Вариант осуществления 30А. Соединение варианта осуществления 28А, где каждый M^A и M^B независимо представляет собой Na, K, NH_4 или $NH(CH_2CH_3)_3$.

Вариант осуществления 31А. Способ варианта осуществления 28А, где каждый M^A
40 и M^B независимо представляет собой Na, K или NH_4 .

Вариант осуществления 32А. Способ варианта осуществления 28А, где каждый M^A и M^B независимо представляет собой Na или K.

Вариант осуществления 33А. Способ варианта осуществления 28А, где каждый M^A
45 и M^B независимо представляет собой Na.

Вариант осуществления 34А. Способ варианта осуществления 28А, где каждый M^A и M^B независимо представляет собой K.

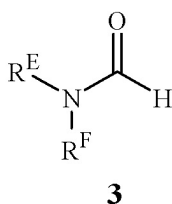
Вариант осуществления 35А. Способ по любому из вариантов осуществления 1А-34А, где галогенирующим средством является оксалилхлорид, тионилхлорид, фосген, трифосген, цианурхлорид, хлорокись фосфора, трихлорид фосфора, пентахлорид фосфора, дифосген, сульфурилхлорид, тионилбромид, трифенилфосфиндибромид или трибромид фосфора.

Вариант осуществления 36А. Способ варианта осуществления 35А, где галогенирующим средством является оксалилхлорид, тионилхлорид, фосген, трифосген или цианурхлорид.

Вариант осуществления 37А. Способ варианта осуществления 36А, где галогенирующим средством является оксалилхлорид или тионилхлорид.

Вариант осуществления 38А. Способ варианта осуществления 37А, где галогенирующим средством является оксалилхлорид.

Вариант осуществления 39А. Способ по любому из вариантов осуществления 1А-38А, где приведение в контакт выполняют в присутствии пиридина или соединения формулы 3,



где

R^{E} представляет собой C_1 - C_4 алкил;

R^{F} представляет собой C_1 - C_4 алкил; или

R^{E} и R^{F} взяты вместе как C_4 - C_6 алкилен.

Вариант осуществления 40А. Способ варианта осуществления 39А, где приведение в контакт выполняют в присутствии пиридина.

Вариант осуществления 41А. Способ варианта осуществления 40А, где R^{E} представляет собой $-\text{CH}_3$; и R^{F} представляет собой $-\text{CH}_3$.

Вариант осуществления 42А. Способ варианта осуществления 39А, где R^{E} и R^{F} взяты вместе как C_5 алкилен.

Вариант осуществления 43А. Способ по любому из вариантов осуществления 1А-42А, где молярное соотношение пиридина или соединения формулы 3 к соединению формулы 2 составляет от приблизительно 0,001 до приблизительно 0,5.

Вариант осуществления 44А. Способ варианта осуществления 43А, где молярное соотношение пиридина или соединения формулы 3 к соединению формулы 2 составляет от приблизительно 0,001 до приблизительно 0,4.

Вариант осуществления 45А. Способ варианта осуществления 44А, где молярное соотношение пиридина или соединения формулы 3 к соединению формулы 2 составляет от приблизительно 0,005 до приблизительно 0,3.

Вариант осуществления 46А. Способ варианта осуществления 45А, где молярное соотношение пиридина или соединения формулы 3 к соединению формулы 2 составляет от приблизительно 0,005 до приблизительно 0,2.

Вариант осуществления 47А. Способ варианта осуществления 46А, где молярное соотношение пиридина или соединения формулы 3 к соединению формулы 2 составляет

от приблизительно 0,005 до приблизительно 0,1.

Вариант осуществления 48А. Способ по любому из вариантов осуществления 1А-47А, где приведение в контакт выполняют в органическом растворителе.

Вариант осуществления 49А. Способ варианта осуществления 48А, где органическим растворителем является толуол, дихлорметан, циклогексан, бензол, 1,2-дихлорэтан, этилацетат или бутилацетат.

Вариант осуществления 50А. Способ варианта осуществления 49А, где органическим растворителем является толуол, дихлорметан или циклогексан.

Вариант осуществления 51А. Способ варианта осуществления 50А, где органическим растворителем является толуол.

Вариант осуществления 52А. Способ по любому из вариантов осуществления 1А-51А, где приведение в контакт выполняют при температуре до приблизительно 200°C.

Вариант осуществления 53А. Способ варианта осуществления 52А, где приведение в контакт выполняют при температуре от приблизительно 0 до приблизительно 200°C.

Вариант осуществления 54А. Способ варианта осуществления 53А, где приведение в контакт выполняют при температуре от приблизительно 0 до приблизительно 100°C.

Вариант осуществления 55А. Способ варианта осуществления 54А, где приведение в контакт выполняют при температуре от приблизительно 0 до приблизительно 70°C.

Вариант осуществления 56А. Способ варианта осуществления 55А, где приведение в контакт выполняют при температуре от приблизительно 18 до приблизительно 30°C.

Вариант осуществления 57А. Способ варианта осуществления 52А, где приведение в контакт выполняют при температуре от приблизительно 45 до приблизительно 55°C.

Вариант осуществления 58А. Способ по любому из вариантов осуществления 1А-57А, где приведение в контакт выполняют путем добавления соединения формулы 2 к галогенирующему средству.

Вариант осуществления 59А. Способ по любому из вариантов осуществления 1А-57А, где приведение в контакт выполняют путем добавления галогенирующего средства к соединению формулы 2.

Вариант осуществления 60А. Способ по любому из вариантов осуществления 1А-59А, где соединение формулы 1 необязательно выделяют.

Вариант осуществления 61А. Способ варианта осуществления 60А, где соединение формулы 1 выделяют.

Вариант осуществления 62А. Способ варианта осуществления 60А, где соединение формулы 1 не выделяют (т.е. используют in-situ в органическом растворителе).

Вариант осуществления 63А. Способ по любому из вариантов осуществления 1А-34А, где галогенирующим средством является хлорирующее средство или бромлирующее средство.

Вариант осуществления 64А. Способ варианта осуществления 63А, где хлорирующим средством является оксалилхлорид, тионилхлорид, фосген, трифосген, цианурхлорид, хлорокись фосфора, трихлорид фосфора, пентахлорид фосфора, дифосген или сульфурхлорид.

Вариант осуществления 65А. Способ варианта осуществления 63А, где бромлирующим средством является тионилбромид, трифенилфосфиндибромид или трибромид фосфора.

Вариант осуществления 66А. Способ по любому из вариантов осуществления 1А-34А, где X представляет собой Cl.

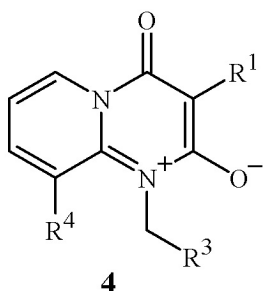
Вариант осуществления 67А. Способ по любому из вариантов осуществления 1А-34А, где X представляет собой Br.

Вариант осуществления 68А. Соединение варианта осуществления 7А, где R¹

представляет собой 3-(трифторметил)фенил.

Вариант осуществления 69А. Соединение варианта осуществления 9А, где R¹ представляет собой 3,5-дихлорфенил.

Вариант осуществления 1В. Способ получения соединения формулы 4,



где

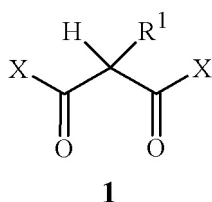
R¹ представляет собой фенил или пиридинил, каждый из которых необязательно замещен Q и имеет до 3 заместителей, независимо выбранных из R²;

каждый R² независимо представляет собой галоген, циано, SF₅, C₁-C₄алкил, C₁-C₄галогеналкил, C₁-C₄алкокси, C₁-C₄галогеналкокси, C₁-C₄алкилтио или C₁-C₄галогеналкилтио;

Q представляет собой фенил или пиридинил, каждый из которых необязательно замещен максимум 5 заместителями, независимо выбранными из галогена, циано, C₁-C₄алкила, C₁-C₄галогеналкила, C₁-C₄алкокси и C₁-C₄галогеналкокси;

R³ представляет собой тиазолил, пиридинил или пиримидинил, каждый из которых необязательно замещен галогеном или C₁-C₄алкилом; и

R⁴ представляет собой H, C₁-C₄алкил или C₁-C₄галогеналкил, предусматривающий получение соединения формулы 1,



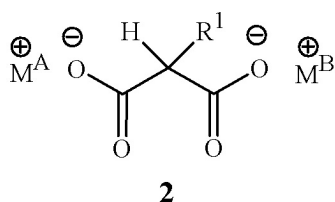
где

R¹ представляет собой фенил или пиридинил, каждый из которых необязательно замещен Q и имеет до 3 заместителей, независимо выбранных из R²;

каждый R² независимо представляет собой галоген, циано, SF₅, C₁-C₄алкил, C₁-C₄галогеналкил, C₁-C₄алкокси, C₁-C₄галогеналкокси, C₁-C₄алкилтио или C₁-C₄галогеналкилтио;

Q представляет собой фенил или пиридинил, каждый из которых необязательно замещен максимум 5 заместителями, независимо выбранными из галогена, циано, C₁-C₄алкила, C₁-C₄галогеналкила, C₁-C₄алкокси и C₁-C₄галогеналкокси; и

X представляет собой Cl или Br, путем приведения в контакт соединения формулы 2,



где

R^1 представляет собой фенил или пиридинил, каждый из которых необязательно замещен Q и имеет до 3 заместителей, независимо выбранных из R^2 ;

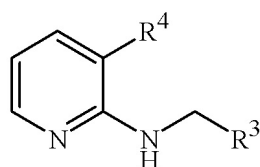
каждый R^2 независимо представляет собой галоген, циано, SF_5 , C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_4 галогеналкокси, C_1 - C_4 алкилтио или C_1 - C_4 галогеналкилтио;

Q представляет собой фенил или пиридинил, каждый из которых необязательно замещен максимум 5 заместителями, независимо выбранными из галогена, циано, C_1 - C_4 алкила, C_1 - C_4 галогеналкила, C_1 - C_4 алкокси и C_1 - C_4 галогеналкокси;

каждый M^A и M^B независимо представляет собой Li, Na, K, Ca, Ba или $N(R^A)(R^B)(R^C)(R^D)$; и

каждый R^A , R^B , R^C и R^D независимо представляет собой H, C_1 - C_4 алкил, циклогексил, фенил или бензил,

с галогенирующим средством с получением соединения формулы 1; и осуществление реакции соединения формулы 5,

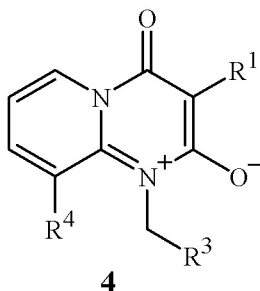


где

R^3 представляет собой тиазолил, пиридинил или пиримидинил, каждый из которых необязательно замещен галогеном или C_1 - C_4 алкилом; и

R^4 представляет собой H, C_1 - C_4 алкил или C_1 - C_4 галогеналкил, с соединением формулы 1 с получением соединения формулы 4.

Вариант осуществления 2В. Способ получения соединения формулы 4,



где

R^1 представляет собой фенил или пиридинил, каждый из которых необязательно

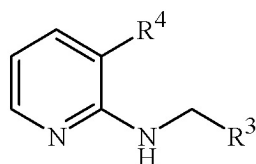
замещен Q и имеет до 3 заместителей, независимо выбранных из R^2 ;

каждый R^2 независимо представляет собой галоген, циано, SF_5 , C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_4 галогеналкокси, C_1 - C_4 алкилтио или C_1 - C_4 галогеналкилтио;

Q представляет собой фенил или пиридинил, каждый из которых необязательно замещен максимум 5 заместителями, независимо выбранными из галогена, циано, C_1 - C_4 алкила, C_1 - C_4 галогеналкила, C_1 - C_4 алкокси и C_1 - C_4 галогеналкокси;

R^3 представляет собой тиазолил, пиридинил или пиримидинил, каждый из которых необязательно замещен галогеном или C_1 - C_4 алкилом; и

R^4 представляет собой H, C_1 - C_4 алкил или C_1 - C_4 галогеналкил, предусматривающий осуществление реакции соединения формулы 5,

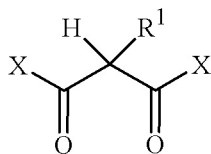


5

где

R^3 представляет собой тиазолил, пиридинил или пиримидинил, каждый из которых необязательно замещен галогеном или C_1 - C_4 алкилом; и

R^4 представляет собой H, C_1 - C_4 алкил или C_1 - C_4 галогеналкил, с соединением формулы 1,



1

где соединение формулы 1 получают с помощью способа варианта осуществления 1А.

Вариант осуществления 3В. Способ получения соединения формулы 4, предусматривающий осуществление реакции соединения формулы 5 с соединением формулы 1; при этом способ характеризуется получением соединения формулы 1 из соединения формулы 2 с помощью раскрытого выше способа, как описано в кратком описании изобретения.

Вариант осуществления 4В. Способ по любому из вариантов осуществления 1В-3В, где R^1 представляет собой фенил, необязательно замещенный Q и имеющий до 3 заместителей, независимо выбранных из R^2 .

Вариант осуществления 5В. Способ по любому из вариантов осуществления 1В-4В, где R^1 представляет собой фенил необязательно имеющий до 3 заместителей, независимо выбранных из R^2 .

Вариант осуществления 6В. Способ по любому из вариантов осуществления 1В-5В, где R^1 представляет собой фенил, необязательно имеющий до 2 заместителей, независимо

выбранных из R^2 .

Вариант осуществления 7В. Способ по любому из вариантов осуществления 1В-6В, где R^1 представляет собой фенил, замещенный 1 заместителем, выбранным из R^2 .

5 Вариант осуществления 8В. Способ варианта осуществления 7В, где R^1 представляет собой фенил, замещенный 1 заместителем, выбранным из R^2 , в 3-положении.

Вариант осуществления 9В. Способ варианта осуществления 8В, где R^1 представляет собой 3-(трифторметил)фенил или 3-(трифторметокси)фенил.

10 Вариант осуществления 10В. Способ по любому из вариантов осуществления 1В-6В, где R^1 представляет собой фенил, замещенный 2 заместителями, выбранными из R^2 , в 3- и 5-положениях.

Вариант осуществления 11В. Способ варианта осуществления 10В, где R^1 представляет собой 3,5-дихлорфенил или 3-хлор-5-(трифторметил)фенил.

15 Вариант осуществления 12В. Способ по любому из вариантов осуществления 1В-4В, где R^1 представляет собой фенил, замещенный 1 заместителем, выбранным из Q.

Вариант осуществления 13В. Способ варианта осуществления 12В, где R^1 представляет собой фенил, замещенный одним заместителем, выбранным из Q, в 3-положении.

20 Вариант осуществления 14В. Способ по любому из вариантов осуществления 1В-3В, где R^1 представляет собой пиридинил, замещенный 1-2 заместителями, независимо выбранными из R^2 ; или пиридинил, замещенный 1 заместителем, выбранным из Q.

25 Вариант осуществления 15В. Способ варианта осуществления 14В, где R^1 представляет собой пиридинил, замещенный 1-2 заместителями, независимо выбранными из R^2 .

Вариант осуществления 16В. Способ по любому из вариантов осуществления 1В-15В, где каждый R^2 независимо представляет собой галоген, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_1 - C_4 алкокси или C_1 - C_4 галогеналкокси.

30 Вариант осуществления 17В. Способ варианта осуществления 16В, где каждый R^2 независимо представляет собой галоген, C_1 - C_2 алкил, C_1 - C_2 галогеналкил, C_1 - C_2 алкокси или C_1 - C_2 галогеналкокси.

35 Вариант осуществления 18В. Способ варианта осуществления 17В, где каждый R^2 независимо представляет собой галоген, C_1 - C_2 галогеналкил или C_1 - C_2 галогеналкокси.

Вариант осуществления 19В. Способ варианта осуществления 18В, где каждый R^2 независимо представляет собой C_1 - C_2 галогеналкил или C_1 - C_2 галогеналкокси.

40 Вариант осуществления 20В. Способ варианта осуществления 18В, где каждый R^2 независимо представляет собой галоген или C_1 - C_2 галогеналкил.

Вариант осуществления 21В. Способ варианта осуществления 18В, где каждый R^2 независимо представляет собой Cl, $-CF_3$ или $-OCF_3$.

45 Вариант осуществления 22В. Способ варианта осуществления 21В, где каждый R^2 независимо представляет собой Cl.

Вариант осуществления 23В. Способ варианта осуществления 21В, где каждый R^2 независимо представляет собой Cl или $-CF_3$.

Вариант осуществления 24В. Способ варианта осуществления 21В, где каждый R^2 независимо представляет собой $-CF_3$ или $-OCF_3$.

Вариант осуществления 25В. Способ по любому из вариантов осуществления 1В, 2В, 3В, 4В, 12В, 13В или 14В, где Q представляет собой пиридинил, необязательно имеющий до 4 заместителей, независимо выбранных из галогена, циано, C_1 - C_4 алкила, C_1 - C_4 галогеналкила, C_1 - C_4 алкокси и C_1 - C_4 галогеналкокси.

Вариант осуществления 26В. Способ варианта осуществления 25В, где Q представляет собой пиридинил, необязательно имеющий до 2 заместителей, независимо выбранных из галогена и C_1 - C_4 галогеналкила.

Вариант осуществления 27В. Способ варианта осуществления 26В, где Q представляет собой пиридинил, необязательно замещенный 2 заместителями, независимо выбранными из Cl и $-CF_3$.

Вариант осуществления 28В. Способ варианта осуществления 27В, где Q представляет собой 2-пиридинил, замещенный Cl и $-CF_3$.

Вариант осуществления 29В. Способ варианта осуществления 28В, где Q представляет собой 3-хлор-5-трифторметилпиридин-2-ил.

Вариант осуществления 30В. Способ по любому из вариантов осуществления 1В-29В, где R^3 представляет собой тиазолил или пиримидинил, каждый из которых необязательно замещен галогеном или C_1 - C_2 алкилом.

Вариант осуществления 31В. Способ варианта осуществления 30В, где R^3 представляет собой тиазолил, необязательно замещенный галогеном или C_1 - C_2 алкилом.

Вариант осуществления 32В. Способ варианта осуществления 31В, где R^3 представляет собой тиазолил, необязательно замещенный галогеном.

Вариант осуществления 33В. Способ варианта осуществления 32В, где R^3 представляет собой 5-тиазолил, необязательно замещенный галогеном.

Вариант осуществления 34В. Способ варианта осуществления 33В, где R^3 представляет собой 2-хлор-5-тиазолил.

Вариант осуществления 35В. Способ варианта осуществления 30В, где R^3 представляет собой пиримидинил, необязательно замещенный галогеном или C_1 - C_4 алкилом.

Вариант осуществления 36В. Способ варианта осуществления 35В, где R^3 представляет собой пиримидинил (т.е. незамещен).

Вариант осуществления 37В. Способ варианта осуществления 36В, где R^3 представляет собой 5-пиримидинил (т.е. незамещен).

Вариант осуществления 38В. Способ по любому из вариантов осуществления 1В-37В, где R^4 представляет собой H или C_1 - C_4 алкил.

Вариант осуществления 39В. Способ варианта осуществления 38В, где R^4 представляет собой H или CH_3 .

Вариант осуществления 40В. Способ варианта осуществления 39В, где R^4 представляет собой H.

Вариант осуществления 41В. Способ варианта осуществления 39В, где R^4 представляет собой CH_3 .

Вариант осуществления 42В. Способ по любому из вариантов осуществления 1В-41В, где реакцию осуществляют в присутствии основания.

Вариант осуществления 43В. Способ варианта осуществления 42В, где основанием является органическое основание.

5 Вариант осуществления 44В. Способ варианта осуществления 43В, где органическим основанием является триметиламин, триэтиламин, трибутиламин-N,N-диизопропилэтиламин, пиридин, 2-пиколлин, 3-пиколлин, 4-пиколлин или 2,6-лутидин.

Вариант осуществления 45В. Способ варианта осуществления 44В, где органическим основанием является триэтиламин, трибутиламин, пиридин или 4-пиколлин.

10 Вариант осуществления 46В. Способ варианта осуществления 45В, где органическим основанием является триэтиламин или 4-пиколлин.

Вариант осуществления 47В. Способ варианта осуществления 46В, где органическим основанием является триэтиламин.

15 Вариант осуществления 48В. Способ варианта осуществления 46В, где органическим основанием является 4-пиколлин.

Вариант осуществления 49В. Способ по любому из вариантов осуществления 40В-48В, где молярное соотношение основания к соединению формулы 1 составляет от приблизительно 1 до приблизительно 10.

20 Вариант осуществления 50В. Способ варианта осуществления 49В, где молярное соотношение основания к соединению формулы 1 составляет от приблизительно 1 до приблизительно 5.

Вариант осуществления 51В. Способ варианта осуществления 50В, где молярное соотношение основания к соединению формулы 1 составляет от приблизительно 1,8 до приблизительно 2,5.

25 Вариант осуществления 52В. Способ варианта осуществления 50В, где молярное соотношение основания к соединению формулы 1 составляет от приблизительно 1,5 до приблизительно 3,5.

30 Вариант осуществления 53В. Способ варианта осуществления 52В, где молярное соотношение основания к соединению формулы 1 составляет от приблизительно 2 до приблизительно 3,5.

Вариант осуществления 54В. Способ варианта осуществления 53В, где молярное соотношение основания к соединению формулы 1 составляет от приблизительно 2 до приблизительно 3,25.

35 Вариант осуществления 55В. Способ по любому из вариантов осуществления 42В-54В, где молярное соотношение основания к соединению формулы 1 составляет по меньшей мере приблизительно 2.

Вариант осуществления 56В. Способ по любому из вариантов осуществления 1В-55В, где приведение в контакт выполняют в растворителе.

40 Вариант осуществления 57В. Способ варианта осуществления 56В, где растворителем является толуол, дихлорметан, циклогексан, бензол, 1,2-дихлорэтан, этилацетат или бутилацетат или их смесь.

Вариант осуществления 58В. Способ варианта осуществления 57В, где растворителем является толуол.

45 Вариант осуществления 59В. Способ согласно 57В, где растворителем является смесь толуола и этилацетата.

Вариант осуществления 60В. Способ согласно 57В, где растворителем является смесь толуола и бутилацетата.

Вариант осуществления 61В. Соединение варианта осуществления 9В, где R¹

представляет собой 3-(трифторметил)фенил.

Вариант осуществления 62В. Соединение варианта осуществления 11В, где R^1 представляет собой 3,5-дихлорфенил.

5 Вариант осуществления 1С. Соединение, которое представляет собой метил-3,5-дихлорбензолэтанимидат или этил-3,5-дихлорбензолэтанимидат или их соли.

Вариант осуществления 2С. Соединение варианта осуществления 1С, которое представляет собой метил-3,5-дихлорбензолэтанимидат или его соль.

Вариант осуществления 3С. Соединение варианта осуществления 2С, которое представляет собой метил-3,5-дихлорбензолэтанимидата гидрохлорид (1:1).

10 Комбинации вариантов осуществления 1-42 в соответствии с настоящим изобретением включают:

Вариант осуществления А. Соединение формулы 2 варианта осуществления 1, где R^1 представляет собой фенил, необязательно замещенный Q и имеющий до 3
15 заместителей, независимо выбранных из R^2 ;

каждый R^2 независимо представляет собой галоген, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_1 - C_4 алкокси или C_1 - C_4 галогеналкокси;

Q представляет собой пиридинил, необязательно имеющий до 2 заместителей,
20 независимо выбранных из галогена и C_1 - C_4 галогеналкила; и

каждый M^A и M^B независимо представляет собой Li, Na, K, NH_4 , $NH(CH_2CH_3)_3$, $NH(CH_2CH_2CH_2CH_3)_3$, $NH_2(Bn)_2$, NH_2 (циклогексил) $_2$ или NH_2 (фенил) $_2$.

Вариант осуществления В. Соединение варианта осуществления А, где
25 R^1 представляет собой фенил, необязательно имеющий до 2 заместителей, независимо выбранных из R^2 ;

каждый R^2 независимо представляет собой галоген, C_1 - C_2 алкил, C_1 - C_2 галогеналкил, C_1 - C_2 алкокси или C_1 - C_2 галогеналкокси; и

30 каждый M^A и M^B независимо представляет собой Na, K, NH_4 или $NH(CH_2CH_3)_3$.

Вариант осуществления С. Соединение варианта осуществления В, где

R^1 представляет собой фенил, замещенный 2 заместителями, выбранными из R^2 , в
3- и 5-положениях;

35 каждый R^2 независимо представляет собой Cl или $-CF_3$; и

каждый M^A и M^B независимо представляет собой Na, K или NH_4 .

Вариант осуществления D. Соединение варианта осуществления В, где

40 R^1 представляет собой фенил, замещенный 1 заместителем, выбранным из R^2 , в 3-положении;

каждый R^2 независимо представляет собой $-CF_3$ или $-OCF_3$; и

каждый M^A и M^B независимо представляет собой Na, K или NH_4 .

45 Комбинации вариантов осуществления 1А-69А в соответствии с настоящим изобретением включают:

Вариант осуществления АА. Способ получения соединения формулы 1, как описано в варианте осуществления 1А, где

R^1 представляет собой фенил, необязательно замещенный Q и имеющий до 3 заместителей, независимо выбранных из R^2 ;

каждый R^2 независимо представляет собой галоген, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_1 - C_4 алкокси или C_1 - C_4 галогеналкокси;

Q представляет собой пиридинил, необязательно имеющий до 2 заместителей, независимо выбранных из галогена и C_1 - C_4 галогеналкила; и

каждый M^A и M^B независимо представляет собой Li, Na, K, NH_4 , $NH(CH_2CH_3)_3$, $NH(CH_2CH_2CH_2CH_3)_3$, $NH_2(Bn)_2$, NH_2 (циклогексил) $_2$ или NH_2 (фенил) $_2$.

Вариант осуществления ВВ. Способ варианта осуществления АА, где

R^1 представляет собой фенил, необязательно имеющий до 2 заместителей, независимо выбранных из R^2 ;

каждый R^2 независимо представляет собой галоген, C_1 - C_2 алкил, C_1 - C_2 галогеналкил, C_1 - C_2 алкокси или C_1 - C_2 галогеналкокси; и

каждый M^A и M^B независимо представляет собой Na, K, NH_4 , $NH(CH_2CH_3)_3$ или $NH(CH_2CH_2CH_2CH_3)_3$.

Вариант осуществления СС. Способ варианта осуществления ВВ, где галогенирующим средством является оксалилхлорид, тионилхлорид, фосген, трифосген, цианурхлорид, хлорокись фосфора, трихлорид фосфора, пентахлорид фосфора, дифосген, сульфурилхлорид, тионилбромид, трифенилфосфиндибромид или трибромид фосфора;

приведение в контакт выполняют в органическом растворителе; и

X представляет собой Cl или Br.

Вариант осуществления DD. Способ варианта осуществления СС, где галогенирующим средством является оксалилхлорид, тионилхлорид, фосген, трифосген или цианурхлорид;

X представляет собой Cl; и

органическим растворителем является толуол, дихлорметан, циклогексан, бензол, 1,2-дихлорэтан, этилацетат или бутилацетат.

Комбинации вариантов осуществления 1В-62В в соответствии с настоящим изобретением включают:

Вариант осуществления ЕЕ. Способ получения соединения формулы 4, как описано в любом из вариантов осуществления 1В, 2В или 3В, где

R^1 представляет собой фенил, необязательно замещенный Q и имеющий до 3 заместителей, независимо выбранных из R^2 ;

каждый R^2 независимо представляет собой галоген, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_1 - C_4 алкокси или C_1 - C_4 галогеналкокси;

Q представляет собой пиридинил, необязательно имеющий до 2 заместителей, независимо выбранных из галогена и C_1 - C_4 галогеналкила;

R^3 представляет собой тиазолил или пиримидинил, каждый из которых необязательно замещен галогеном или C_1 - C_2 алкилом; и

R^4 представляет собой H или C_1 - C_4 алкил.

Вариант осуществления FF. Способ варианта осуществления EE, где

R^1 представляет собой фенил, необязательно имеющий до 2 заместителей, независимо выбранных из R^2 ;

каждый R^2 независимо представляет собой Cl или $-CF_3$;

R^3 представляет собой 2-хлор-5-тиазолил; и

R^4 представляет собой CH_3 .

Вариант осуществления GG. Способ варианта осуществления EE, где

R^1 представляет собой фенил, замещенный 1 заместителем, выбранным из R^2 ;

каждый R^2 независимо представляет собой $-CF_3$ или $-OCF_3$;

R^3 представляет собой 5-пиримидинил; и

R^4 представляет собой H.

Варианты осуществления в соответствии с настоящим изобретением, в том числе вышеприведенные варианты осуществления 1-42, 1A-69A, 1B-62B и A-GG, а также любые другие описанные в настоящем документе варианты осуществления, могут быть объединены любым способом. Более того, описания переменных в вариантах осуществления относятся не только к соединениям формул 1-5, а также к исходным соединениям и промежуточным соединениям, применимым для получения соединений формул 1-5 (т.е. 1b, 2a, 6, 6a, 7, 8, 9, 10, 11 и 11a, 1a и 5a). Кроме того, варианты осуществления настоящего изобретения, в том числе вышеприведенные варианты осуществления 1-54, а также любые другие варианты осуществления, описанные в данном документе, и их любая комбинация, относятся к любым из способов настоящего изобретения.

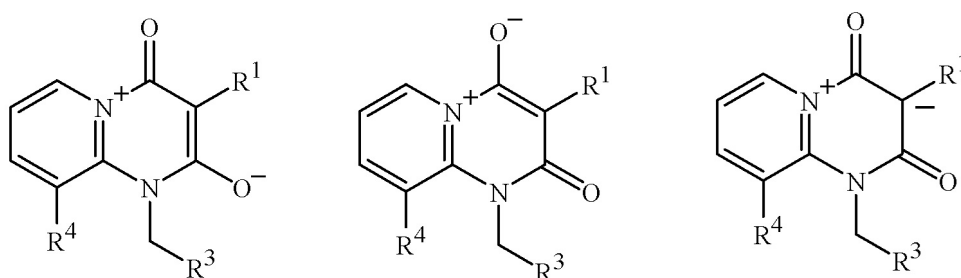
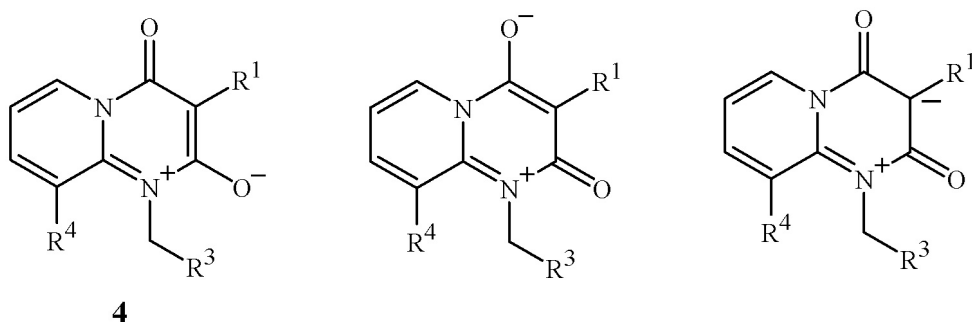
Малоновые кислоты, используемые в получении соединения формулы 2, могут быть нестабильными при стоянии или хранении (отдельно или в виде раствора в приемлемом растворителе) по причине тенденции по меньшей мере одного из двух фрагментов “ $-CO_2H$ ” декарбоксилироваться с образованием при этом CO_2 (газ). Образование CO_2 (газ) нежелательно, поскольку это может вызвать нежелательное повышение давления в каком-либо контейнере для хранения с созданием опасной ситуации. Кроме того, частичное декарбоксилирование малоновых кислот (т.е. декарбоксилирование по меньшей мере одного из двух фрагментов “ $-CO_2H$ ”) вводит в реагент примесь (т.е.

уксусную кислоту). Если примесь образуется во время получения соединения формулы 2, ее трудно удалять из желаемого компонента продукта. Поскольку соединение формулы 2 является более стабильным, чем соответствующая исходная малоновая кислота, при стоянии (или в виде раствора в соответствующем растворителе), дополнительный аспект настоящего изобретения относится к стабильной композиции, содержащей соединение формулы 2 в соответствующем растворителе. Соответствующие растворители для композиции включают перечисленные как соответствующие для применения в способе, применяемом для получения соединения формулы 1.

Специалисту в данной области будет понятно, что дисоли малоновой кислоты в соответствии с настоящим изобретением могут существовать в виде симметричной дисоли или асимметричной дисоли. Соединения в соответствии с настоящим изобретением, поэтому, не ограничиваются являющимися идентичными значениями для M^A или M^B . Поскольку соединения являются применимыми как промежуточные

соединения, значения для M^A или M^B , поэтому, могут быть одинаковыми или разными. В одном аспекте настоящего изобретения M^A и M^B являются эквивалентными (т.е. оба катиона являются идентичными), а в другом аспекте настоящего изобретения M^A и M^B являются разными (т.е. оба катиона не являются идентичными). Например, в соединении формулы 1 и M^A , и M^B могут представлять собой Na. В качестве альтернативы, M^A может представлять собой Na, а M^B может представлять собой Li, или какая-либо другая комбинация значений для M^A и M^B .

Соединения формулы 4 являются мезоионными внутренними солями. “Внутренние соли”, также известные в уровне техники как “цвиттер-ионы”, являются электрически нейтральными молекулами, но несут формальные положительные и отрицательные заряды на разных атомах в каждой структуре валентной связи согласно теории валентных связей. Кроме того молекулярная структура соединений формулы 4 может быть представлена шестью структурами валентных связей, показанными ниже, причем на каждой формальный положительный и отрицательный заряды размещены на разных атомах. Из-за данного резонанса соединения формулы 4 также описываются как “мезоионные”. Хотя в целях простоты в настоящем документе молекулярная структура формулы 4 изображается в виде отдельной структуры валентной связи, следует понимать, что данная конкретная структура валентной связи представляет все шесть структур валентных связей, имеющих отношение к связыванию в молекулы соединений формулы 4. Следовательно, ссылка на формулу 4 в данном документе относится ко всем шести соответствующим структурам валентной связи и к другим (например, по теории молекулярных орбиталей) структурам, если не указано иное.



Соединения настоящего изобретения могут существовать в виде одного или нескольких конформационных изомеров в связи с ограниченным вращением связи, обусловленным стерическим препятствием. Например, соединение формулы 4, где замещение на R^1 (т.е. R^2 или Q) представляет собой стерически затрудняющую алкильную группу (например, изопропил или фенил) в орто-положении фенильного кольца применительно к пиримидиниевому кольцу, может существовать в виде двух

ротамеров из-за ограниченного вращения около связи фенильное кольцо-пиримидиниевое кольцо. Настоящее изобретение относится к смесям конформационных изомеров. К тому же настоящее изобретение относится к соединениям, которые дополнены одним конформером по сравнению с другими.

5 Соединения, выбранные из формулы 4, обычно существуют в более чем одной форме, и формула 4, таким образом, включает все кристаллические и некристаллические формы соединений, которые представлены формулой 4. Некристаллические формы включают варианты осуществления, которые являются твердыми веществами, такими как воски и смолы, а также варианты осуществления, которые являются жидкостями, такими как
10 растворы и расплавы. Кристаллические формы включают варианты осуществления, которые представляют, по сути, отдельный кристаллический тип, и варианты осуществления, которые представляют смесь полиморфов (т.е. различных кристаллических типов). Выражение “полиморф” относится к определенной кристаллической форме химического соединения, которое может кристаллизоваться в
15 различные кристаллические формы, причем данные формы имеют разные расположения и/или конформации молекул в кристаллической решетке. Хотя полиморфы могут иметь одинаковый химический состав, они также могут отличаться по составу в связи с присутствием или отсутствием совместно кристаллизованной воды или других молекул, которые могут быть слабо или сильно связаны в решетке. Полиморфы могут отличаться
20 по таким химическим, физическим и биологическим свойствам, как форма кристалла, плотность, жесткость, цвет, химическая стабильность, точка плавления, гигроскопичность, суспендируемость, скорость растворения и биологическая доступность. Специалисту в данной области будет понятно, что полиморф соединения, представленного формулой 4, может проявлять положительные эффекты (например, возможность применения для получения полезных составов, улучшенная биологическая
25 эффективность) по сравнению с другим полиморфом или смесью полиморфов того же соединения, представленного формулой 4. Получение и выделение конкретного полиморфа соединения, представленного формулой 4, может быть достигнуто способами, известными специалистам в данной области техники, включая, например,
30 кристаллизацию с использованием выбранных растворителей и температур.

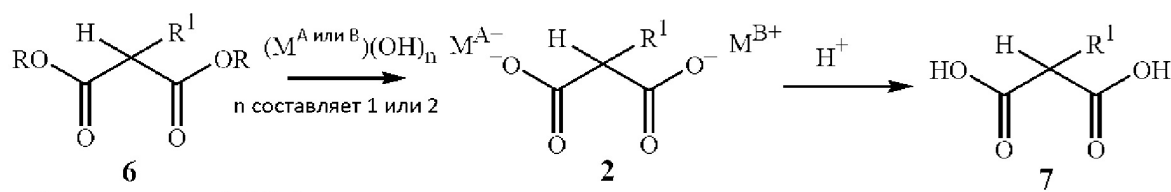
Специалисту в данной области известно, что, так как в окружающей среде и при физиологических условиях соли соединений формулы 4 равновесны их соответствующим
несолевым формам, то соли обладают такой же биологической применимостью
несолевых форм. Таким образом, широкое разнообразие солей соединений формулы
35 4 пригодно для контроля беспозвоночных вредителей и паразитов животных (т.е. приемлемо для применения в ветеринарии). Соли соединений формулы 4 включают соли присоединения кислоты с неорганическими или органическими кислотами, такими как бромистоводородная, соляная, азотная, фосфорная, серная, уксусная, масляная, фумаровая, молочная, малеиновая, малоновая, щавелевая, пропионовая, салициловая,
40 винная, 4-толуолсульфоновая или валериановая кислоты.

В следующих схемах 1-9 определения M^A , M^B , R^1 , R^3 и R^4 в соединениях формул 1, 1b, 2, 2a, 4, 5, 6, 6a, 7, 8, 9, 10, 11 и 11a являются такими, как определено выше в кратком описании изобретения и в описании вариантов осуществления, если не указано иное.
45 Формула 1b представляет собой подгруппу формулы 1, а формула 2a представляет собой подгруппу формулы 2, формула 6a представляет собой подгруппу формулы 6, и формула 11a представляет собой подгруппу формулы 11.

В способе, показанном в схеме 1, соединения формулы 2, если “ M^{A+} ” или “ M^{B+} ” представляют собой катион металла, как правило, существующие в виде

промежуточного соединения реакции в ходе основного гидролиза (т.е. сапонификации) соединений формулы 6 (арилмалонатов), всегда подкисляют *in situ*, превращают и используют как соответствующую малоновую кислоту в лаборатории (см, например: J. Org. Chem. 1997, 62, 5116-5127).

Схема 1



где R представляет собой $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкил

Реакция сапонификации может осуществляться различными основаниями, такими как LiOH, NaOH, KOH, $\text{Ba}(\text{OH})_2$, $\text{Ca}(\text{OH})_2$, NH_4OH . Предпочтительными для снижения стоимости являются NaOH, KOH и $\text{Ca}(\text{OH})_2$. Если катион имеет степень окисления +1, то по меньшей мере два эквивалента основания необходимо для превращения обеих сложноэфирных групп в карбоксилатные группы. Если катион имеет степень окисления +2, то по меньшей мере один эквивалент основания необходим для превращения обеих сложноэфирных групп в карбоксилатные группы. Избыток основания не является вредным для реакции, и он даже может быть желателен для протекания реакции с небольшим избыточным количеством основания, варьируемым от 0,02 до 0,2 эквивалента основания, до малоната для обеспечения завершения превращения более дорогого малоната формулы 6.

Сапонификацию можно выполнять при температуре, варьирующей от низкой приблизительно 0°C или комнатной температуры (приблизительно 25°C) до более высокой температуры приблизительно 100°C . Если сапонификацию выполняют при более высокой температуре, такой как приблизительно 40°C или выше, могут происходить побочные реакции, такие как декарбоксилирование. Наиболее предпочтительно проводить реакцию при более низкой температуре, такой как комнатная температура.

Поскольку реакция сапонификации является экзотермической, желательно контролировать скорость реакции, особенно, при выполнении ее в большом масштабе. Скорость реакции можно контролировать либо медленным добавлением соединения формулы 6 в основной раствор, либо медленным добавлением основания в смесь соединения формулы 6 в воде.

Получение соединения формулы 2 можно выполнять в соразтворителе, таком как спирт, ароматическое соединение или алкильный эфир, для облегчения реакции. При использовании соразтворителя, катализатор фазового переноса, такой как галогенид тетрабутиламмония, также можно использовать для облегчения гидролиза. Для устранения возможности образования частично декарбоксилированного побочного продукта (т.е. арилацетата) сапонификацию малоната лучше выполнять в воде без соразтворителя или катализатора фазового переноса. Арилацетатный побочный продукт не может быть легко удален при выделении соединения формулы 2. Более того, этот побочный продукт легко не удаляется при получении последующего малонилдигалогенида или при получении соединения формулы 4.

Выделение дисоли малоната обычно сопровождается удалением растворителя при завершении реакции. Удаление растворителя можно достичь непосредственной концентрацией реакционной смеси при сапонификации под вакуумом. Например, водный раствор дисоли малоната можно концентрировать непосредственно для удаления воды.

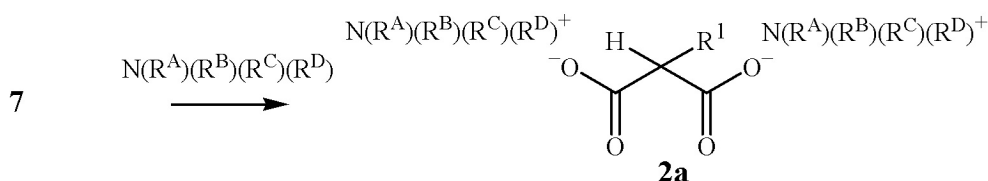
Полученный остаток далее можно растирать с органическим растворителем, таким как метанол, для выделения соединения дисоли (Chem. Commun. 2000, 1519-1520). При этом способе часто требуется нагревание реакционной смеси до температур, выше температуры окружающей среды, для обеспечения дистилляции воды. Поскольку водные растворы соединения формулы 2 проявляют более высокую скорость разложения, чем у твердых дисолей малонила, можно использовать альтернативную процедуру. Избыток воды можно удалять из реакционной смеси путем медленного добавления реакционной смеси в нагретый органический растворитель, из которого можно быстро азеотропно отгонять воду. При осуществлении дистилляции таким путем водный раствор будет минимальное время подвергаться высокой температуре. Другой способ удаления избыточной воды предусматривает осуществление дистилляции при низкой температуре и под вакуумом. Дистилляцию можно осуществлять путем медленного добавления реакционной смеси в желаемый органический растворитель или путем дистиллирования смеси водного раствора соединения формулы 2 и желаемого органического растворителя. Дистилляция под вакуумом делает процесс весьма эффективным, в то время как более низкая температура (такая как ниже 50°C или даже температура окружающей среды) будут предотвращать разложение соединения формулы 2.

Растворители, подходящие для облегчения удаления воды путем дистилляции для способа удаления в соответствии с настоящим изобретением, включают апротонные растворители, способные образовывать кипящий при низкой температуре азеотроп с водой. Апротонный растворитель, как правило, является отдельным растворителем; также он может быть смесью растворителей, таких как ксиленовые изомеры. Кипящие при низкой температуре азеотропы обычно имеют точку кипения меньше точки кипения воды и точки кипения растворителя. По определению кипящие при низкой температуре азеотропы, содержащие воду, имеют нормальные точки кипения менее 100°C (т.е. нормальные точки кипения воды). Таким образом, точка кипения кипящего при низкой температуре азеотропа по сути ниже точек кипения соединения формулы 2, так что при дистилляции оно будет оставаться в реакционной смеси. Как уже упоминалось, предпочтительно полярный апротонный растворитель и апротонный растворитель, способный образовывать кипящий при низкой температуре азеотроп, выбирают так, что полярный апротонный растворитель имеет более высокую точку кипения, чем азеотроп. Поэтому полярный растворитель не удаляется при дистилляции. Растворители, образующие азеотропы с водой, хорошо известны в уровне техники, и в опубликованном справочнике приводятся их точки кипения (см., например, Azeotropic Data, Number 6 in the Advances in Chemistry Series, American Chemical Society, Washington, D.C., 1952, особенно стр. 6-12). Примеры приемлемых апротонных растворителей, образующих кипящие при низкой температуре азеотропы с водой, включают сложные эфиры, такие как этилацетат, бутилацетат и метилбутират; ароматические углеводороды, такие как бензол, толуол и ксилены; эфиры, такие как трет-бутилметилловый эфир, тетрагидрофуран и 1,4-диоксан; спирты, такие как изопропанол и н-пропиловый спирт; и другие, такие как ацетонитрил и циклогексан, приемлемы для способа в соответствии с настоящим изобретением. Предпочтительно, азеотроп, образованный с помощью апротонного растворителя и воды, характеризуется более высоким процентным отношением воды, чем растворяется в апротонном растворителе при комнатной температуре (например, 15-35°C), что таким образом облегчает крупномасштабное отделение воды от конденсированного азеотропа в декантаторной ловушке и рециркуляцию обедненного водой апротонного растворителя в середину

дистилляционной колонки. Предпочтительными являются несмешиваемые с водой апротонные растворители, такие как этилацетат, бензол, толуол и трет-бутилметилвый эфир. Дистилляцию можно выполнять либо в окружающей атмосфере, либо при пониженном давлении, таком как 100 мм рт. ст., которого можно легко достичь в процессе изготовления. Дистилляция при пониженном давлении увеличивает скорость дистилляции и снижает температуру кипения и температуру реактора. Более низкая температура реактора является выгодной, поскольку менее вероятны соединения формулы 2 побочных реакций декарбоксилирования.

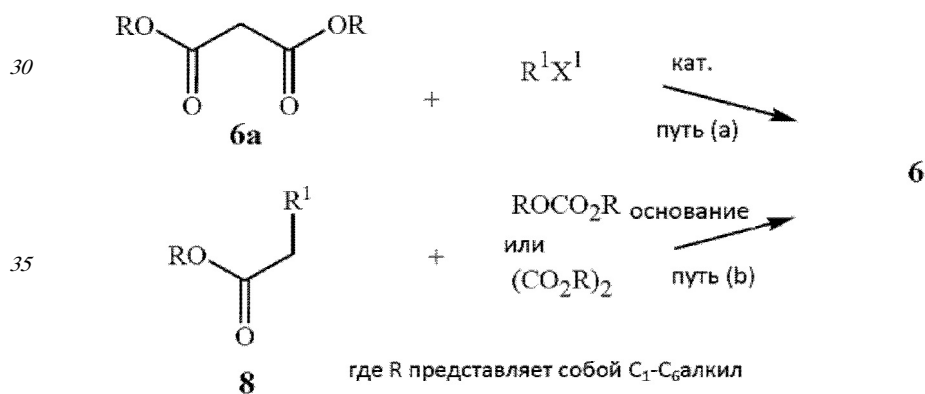
Соли аммония малоновых кислот можно получать путем смешивания соответствующей малоновой кислоты и аммиака при температуре окружающей среды (J. Am. Chem. Soc. 1914, 36, 742-747), как показано на схеме 2. Подобным образом, соли, полученные с другими солями аммония, можно также получать с использованием других органических аминов, таких как триэтиламин, трибутиламин, дифениламин или дициклогексиламин.

Схема 2



Соединения формулы 6 можно получать путем арилирования малонатных сложных эфиров (с использованием соединений формулы R^1X^1 , где X^1 представляет собой Cl, Br или I), катализированных палладием (J. Org. Chem. 2002, 67, 541-555; см. линию (a) на схеме 3) или медью (Org. Lett. 2002, 4, 269-272, и Org. Lett. 2005, 7, 4693-4695). В качестве альтернативы, соединения формулы 6 могут быть получены способом, показанным на схеме 3 (см. например J. Med. Chem. 1982, 25(6), 745-747; см. линию (b) на схеме 3).

Схема 3

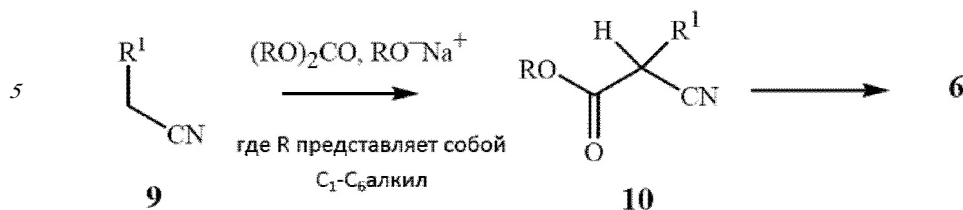


Соединения формулы 6 (где R^1 представляет собой C₁-C₆алкил) также можно получать из соответствующих кислот способами, хорошо известными в уровне техники. Многие из кислот коммерчески доступны или легко получают способами, известными в уровне техники.

Соединения формулы 6 также могут быть получены способом, показанным на схеме 4. Реакция нитрилов формулы 9 с диалкилкарбонатами дает сложные эфиры нитрила формулы 10, и последующий кислотный гидролиз в присутствии спирта обеспечивает соединения формулы 6 (см., например, Helvetica Chimica Acta 1991, 74 (2), 309-314). Многие из нитрилов формулы 9 коммерчески доступны или легко получают

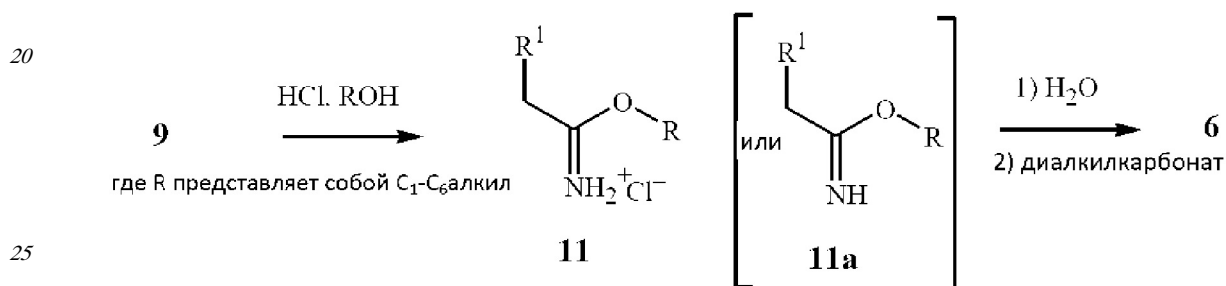
способами, известными в уровне техники.

Схема 4



10 В качестве альтернативы, соединение формулы 6 можно получать путем гидролиза соответствующей соли имидатного сложного эфира формулы 11 или имидатного сложного эфира формулы 11a, как показано на схеме 5. В этом способе соединение формулы 9 контактирует с сильной кислотой, такой как хлороводород, растворенный в спиртовом растворителе, таком как метанол или этанол (также известном как реакция Пиннера) с получением солей имидатного сложного эфира формулы 11 или имидатных сложных эфиров формулы 11a. Соединения формулы 11 или 11a можно гидролизовать в водных условиях, затем осуществлять реакцию с диалкилкарбонатом в основных условиях с получением соединения формулы 6.

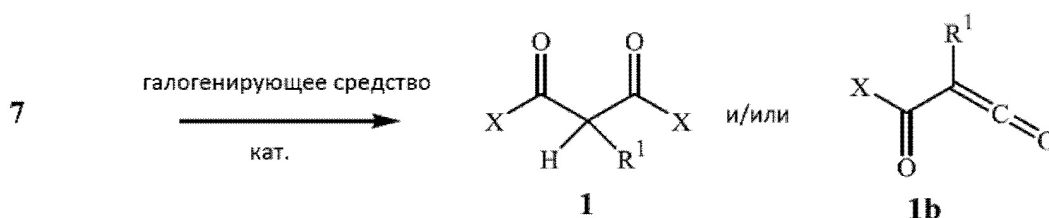
Схема 5



Соли имидатных сложных эфиров формулы 11 или имидатных сложных эфиров формулы 11a особенно применимы в получении соединения формулы 6. Поэтому, один аспект настоящего изобретения относится к соединению формулы 11 или 11a, где R¹ представляет собой 3,5-дихлорфенил, 3-трифторметилфенил, 3-трифторметоксифенил или 3-трифторметил-5-хлорфенил, а R представляет собой метил или этил, которые особенно применимы в получении соединения формулы 6. В частности, соединение формулы 11, где R¹ представляет собой 3,5-дихлорфенил, а R¹ представляет собой метил (11b) или этил (11c), особенно применимо в получении соединения формулы 6, которое применимо в получении соединения формулы 2 (соединения в соответствии с настоящим изобретением), которое, в свою очередь, применимо в способе получения соединения формулы 4 (способ в соответствии с настоящим изобретением).

40 Имеется множество сообщений о превращении малоновых кислот в соответствующие малонилдигалогениды с использованием различных галогенирующих реагентов, таких как SOCl₂, (COCl)₂, POCl₃, трифосген, PCl₅ и PPh₃Br₂ в присутствии или отсутствии катализатора, такого как N,N-диметилформамид (см. Tetrahedron, 2011, 2548-2554), и о превращении карбоновой кислоты в соответствующие галогенангидриды (Science of Synthesis, 20a-ProductClass 1: acid halides, 2006, 15-52), как показано на схеме 6. Соединение формулы 1b также образуются в реакции галогенирования как побочный продукт при образовании соединения формулы 1.

Схема 6

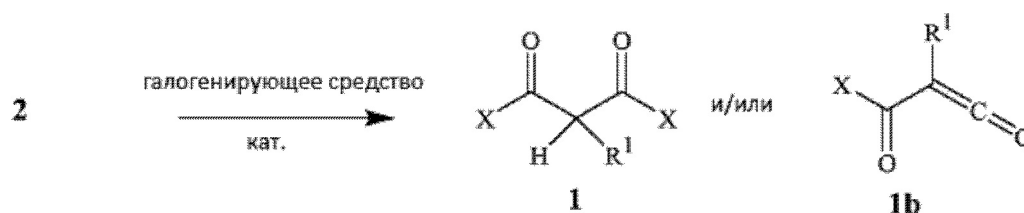


Неожиданно обнаружено, что дисоли малоновой кислоты формулы 2 можно непосредственно превратить в малонилдигалогениды формулы 1 в соответствии с настоящим изобретением, как показано ниже на схеме 7. Следует отметить, что соединение формулы 1b также могут быть образованы в реакции галогенирования в соответствии с настоящим изобретением. Реакцию выполняют тем же образом, как и превращение малоновых кислот в соответствующий дигалогенангидрид, но без необходимости выделения малоновой кислоты. Превращение можно проводить с различными галогенирующими реагентами, такими как SOCl_2 , $(\text{COCl})_2$, POCl_3 , трифосген, PCl_5 и PPh_3Br_2 . Можно использовать тионилхлорид (т.е. SOCl_2), однако, оксалилхлорид (т.е. $(\text{COCl})_2$) можно использовать при более низких температурах реакции (от приблизительно 0°C до приблизительно 30°C), чтобы влиять на превращение. Для превращения одного моля дисоли малоновой кислоты в соответствующий диальдегид минимальное необходимое количество галогенирующего реагента составляет два эквивалента так, чтобы преобразовать обе карбоксильные группы дисоли в галогенангидридные группы. Реакция, как правило, проходит с избытком галогенирующего реагента, составляющим от приблизительно 2,02 до приблизительно 3,0 эквивалента галогенирующего средства, относительно дисоли малоновой кислоты для обеспечения полного превращения соединения формулы 2.

Реакция может проходить в присутствии катализатора, такого как пиридин, N,N-диметилформамид или 1-формилпиперидин, с молярным соотношением катализатора к соединению формулы 2, варьируемому от приблизительно 0,001 до приблизительно 0,4 или от приблизительно 0,005 до приблизительно 0,05. Реакция может проходить в апротонных растворителях, таких как толуол, дихлорметан, циклогексан, бензол, 1,2-дихлорэтан, этилацетат или бутилацетат или комбинации этих растворителей. Реакция происходит при различных температурах в зависимости от хлорирующего средства. При использовании $(\text{COCl})_2$ температуру варьируют от приблизительно 0°C до комнатной температуры или от приблизительно 18°C до приблизительно 30°C . При использовании SOCl_2 в качестве галогенирующего средства можно использовать температуру от приблизительно 45°C до приблизительно 80°C .

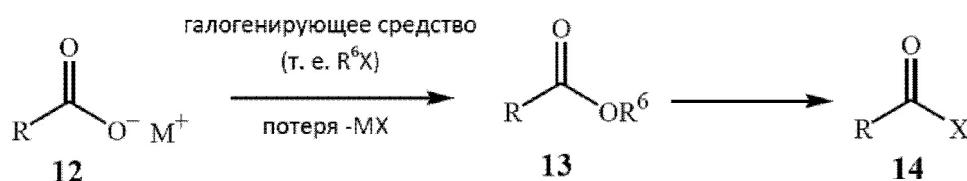
Объединение соединения формулы 2 с галогенирующим средством можно выполнять различными путями. Один способ предусматривает добавление соединения формулы 2 в виде твердого вещества (или в виде взвеси в соответствующем растворителе) в раствор галогенирующего реагента в апротонном растворителе, таком как толуол, дихлорметан, циклогексан, бензол, 1,2-дихлорэтан, этилацетат или бутилацетат или комбинация этих растворителей. Можно использовать одинаковые или разные растворители для получения раствора галогенирующего реагента и взвеси с соединением формулы 2. Этот способ обеспечивает непрерывное воздействие на соединение формулы 2 галогенирующего реагента в большом избытке и, таким образом, галогенирование, как только добавляют твердое вещество или взвесь.

Схема 7



Хотя при превращении дисолей малоновой кислоты в малонилдигалогениды используют подобные реакционные условия, как и при превращении малоновых кислот в малонилдигалогениды, малонатную дисоль превращают непосредственно в соответствующий малонилдигалогенид без образования малоновой кислоты. Карбоксилаты металла, как известно, превращаются непосредственно в соответствующий галогенангидрид (Science of Synthesis, 20a-Product Class 1: acid halides, 2006, 15-52, механизм обсуждается на стр. 29). Преимущество применения дисолей малоновой кислоты в соответствии с настоящим изобретением заключается в том, что в качестве побочных продуктов реакции образуются только соответствующие галогениды металла или аммония. Это исключает кислые реакционные условия, которые могут иметь место при традиционном превращении карбоновой кислоты в соответствующий галогенангидрид, поскольку галогенводороды образуются как побочные продукты реакции, как показано на схеме 8.

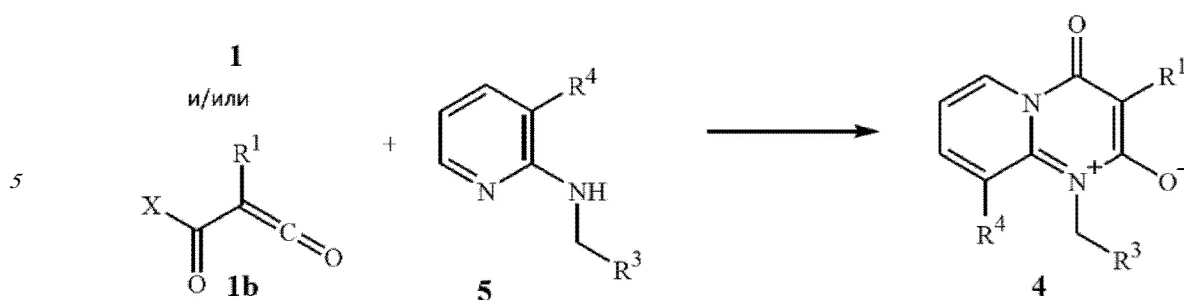
Схема 8



Высокая реакционная способность галогенангидридов или малонилдигалогенидов по отношению к относительно слабым нуклеофилам, таким как вода, требует, чтобы влага была строго исключена при получении, использовании или хранении галогенангидридов или малонилдигалогенидов. Реакцию следует проводить в сухом азоте в сухих растворителях для получения хороших выходов. По той же причине неочищенный раствор малонилгалогенида формулы 1 нужно использовать немедленно без очистки для минимизации возможности введения влаги при использовании или хранении.

Соединение формулы 4 можно получать путем осуществления реакции соединения формулы 1 с соединением формулы 5. Как правило, соединение формулы 4 можно получать конденсацией соединения формулы 1 с соединением формулы 5 или конденсацией соединения формулы 1 (или смеси соединений формул 1 и 1b) с соединением формулы 5, как показано на схеме 9. Соединение формулы 1 (или смесь соединений формул 1 и 1b) часто образуется *in situ* при получении соединений формулы 4. Соединение формулы 1 (или смесь соединений формул 1 и 1b) можно получать согласно вышеприведенной схеме 6 и может существовать *in situ* при различных концентрациях. Например, в вышеприведенных перечислениях, если упоминается смесь соединений формулы 1 и 1b, особенно применимой смесью для получения соединения формулы 4 является композиция, содержащая соединение формулы 1-1b в соотношении 0,01:99,09-99,09:0,01, 49:1-99:1, 80:1-99:1 или 89:1-1:99.

Схема 9



10 Стехиометрия этой реакции предусматривает эквимольные количества соединений формулы 1 (и/или смеси соединений формулы 1 и 1b) с соединением формулы 5. Однако небольшие молярные избытки одного из реактантов не оказывают отрицательного влияния на реакцию, и если один из реактантов намного дешевле или более доступен в получении, то может быть желательным использование его в небольшом избытке (например, 1,05 молярного эквивалента) для обеспечения полного превращения более

15 дорогого или менее доступного в получении реактанта.

Соединение формулы 1b часто образуется как побочный продукт при получении соединения формулы 1 и, таким образом, также применимо в получении соединения формулы 4. В одном случае соединение формулы 1b, где R¹ представляет собой 3-трифторметилфенил, а X представляет собой Cl, можно использовать для получения

20 соответствующего соединения формулы 4. В другом случае соединение формулы 1b, где R¹ представляет собой 3,5-дихлорфенил, а X представляет собой Cl, можно использовать для получения соответствующего соединения формулы 4. Соединение формулы 1b, где R¹ представляет собой 3-трифторметилфенил, а X представляет собой

25 Cl, необязательно можно выделять (¹H ЯМР (CDCl₃) δ м.д. 7,91 (с, 1H), 7,80 (м, 2H), 7,65 (дд, J=7,9 Гц, 7,9 Гц, 1H), ¹⁹F ЯМР (CDCl₃) δ м.д. - 62,81 (с)), а обычно незамедлительно осуществляют реакцию с соединением формулы 5 (т.е. in situ), как показано на схеме 9.

30 Эти реакции чаще выполняют в присутствии кислотного акцептора (см., например, Zeitschrift für Naturforschung, Teil B: Anorganische Chemie, Organische Chemie 1982, 37B(2), 222-233). Типичные кислотные акцепторы включают без ограничения органические амины, такие как триметиламин, триэтиламин, трибутиламин, N,N-диизопропилэтиламин, пиридин и замещенные пиридины, оксиды металлов, такие как

35 оксид кальция, гидроксиды металлов, такие как гидроксид натрия и гидроксид калия, карбонаты металлов, такие как карбонат калия и карбонат натрия, и бикарбонаты металлов, такие как бикарбонат натрия или бикарбонат калия.

Кислотный акцептор добавляют в реакционную смесь так, что молярное соотношение кислотного акцептора к соединению формулы 1, как правило, находится в диапазоне

40 от приблизительно 1 до приблизительно 5. Как правило, соотношение в диапазоне от приблизительно 2,0 до приблизительно 3,0 обеспечивает высокую скорость реакции и высокие выходы продукта.

Эти реакции, как правило, выполняют в апротонном растворителе, таком как толуол, дихлорметан, циклогексан, бензол, 1,2-дихлорэтан, этилацетат или бутилацетат или

45 комбинации этих растворителей. Растворителем, используемым для этой стадии циклизации, может быть тот же используемый для малонилхлорида растворитель или другой растворитель.

Соединения формулы 1 (или его раствор в апротонном растворителе) и 5, кислотный

акцептор и апротонный растворитель можно объединять в любом подходящем порядке для образования реакционной смеси. Установили, что особенно выгодными являются два способа смешивания; первый заключается в медленном добавлении кислотного акцептора в смесь соединений формул 1 и 5 для удаления галогенводородного побочного

продукта. Второй способ добавления заключается в получении сначала смеси соединения формулы 5 и кислотного акцептора, а затем медленном добавлении раствора соединения формулы 1 в полученную смесь. Эти два способа добавления обеспечивают улучшенный контроль заскоростью реакции и более высокий общий выход для циклизации.

Поскольку и реакция циклизации, и сопутствующая операция удаления кислоты являются экзотермическими, эту стадию выполняют при низкой температуре, варьируемой от приблизительно -10 до приблизительно 40°C. Необходимо охлаждение для удаления избытка образованного тепла, особенно в начале каждой операции смешивания, когда наибольшее количество тепла образуется за короткий период времени.

Без дополнительного уточнения предполагается, что специалист в данной области, применяя предшествующее описание, может использовать настоящее изобретение в полном его объеме. Следующие примеры, следовательно, расцениваются всего лишь как иллюстративные и неограничивающие никоим образом данное раскрытие. Исходный материал для следующих примеров необязательно должен быть получен конкретным процессом получения, процедура которого описывается в других примерах. Процентные соотношения являются весовыми, за исключением смесей хроматографических растворителей, или если указывается иное. Части и процентные соотношения для смесей хроматографических растворителей являются объемными, если не указано иное. Спектр ^1H ЯМР регистрируется в м.д. (ppm) слабого поля от тетраметилсилана при 300 МГц, если не указано иное; “с” означает синглет, “д” означает дублет, “т” означает триплет, “м” означает мультиплет, “дд” означает дублет дублетов, “ушир.с” означает уширенный синглет, а “раз.” означает разложение.

ПРИМЕР 1

Получение внутренней соли 1-[(2-хлор-5-тиазолил)метил]-3-(3,5-дихлорфенил)-2-гидрокси-9-метил-4-оксо-4Н-пиридо[1,2-а]пиридиния

Стадия А: Получение 1,3-диметил-2-(3,5-дихлорфенил)пропандиоата

В 3-горлый 1-л реактор, оснащенный датчиком температуры, верхнеприводной мешалкой, конденсатором флегмы и барботажным устройством для азота, добавляли йодид меди(I) (4,0 г, 0,021 моля), 2-пиколиновую кислоту (5,2 г, 0,042 моля), 3,5-дихлорйодбензол (99 г, 0,36 моля) и карбонат цезия (233 г, 0,72 моля) в азоте. Затем добавляли диоксан (600 мл) и диметилмалонат (91 г, 0,69 моля, 1,9 экв.) к твердой смеси с перемешиванием в азоте. Затем полученную смесь нагревали до 90°C в течение 7 часов с образованием бледно-желто-зеленой взвеси. Добавляли воду (300 мл) и гексаны (200 мл) к охлажденной реакционной смеси при комнатной температуре, перемешивали в течение 5 минут и переносили в разделительную воронку и дважды экстрагировали 75 мл смеси диоксан-гексаны (2:1). Объединенные органические фазы промывали насыщенным водным аммония хлоридом (200 мл) и концентрировали досуха для удаления всего диоксана. Остаток смешивали с MeOH (100 мл) и водой (200 мл). После перемешивания в течение 30 минут смесь охлаждали до 0°C с помощью внешней водяной бани со льдом и медленно перемешивали в течение 2 часов. Фильтрация давала 98,6 г неочищенного материала, который растворяли в MeOH (160 мл) при 50°C, с перемешиванием, охлаждали до 0°C за 6 часов, а затем выдерживали при 0°C в течение 2 часов. Фильтрация давала 85,6 г названного соединения в виде мелкого белого кристаллического твердого вещества. Фильтрат концентрировали для удаления всего

MeOH и остаток фильтровали с получением дополнительных 4,12 г названного соединения к объединенному выходу 89%.

Второе получение 1,3-диметил-2-(3,5-дихлорфенил)пропандиоата

Стадия A1a: Получение гидрохлорида метил-3,5-дихлорбензолэтанимидата (1:1)

5 Хлороводород пропускали через смесь толуола (485 мл), метанола (16,8 г, 0,112 моля) и 3,5-дихлорфенилацетонитрила (100 г, 0,107 моля) при 25°C. Когда прекращалось поглощение хлороводорода, смесь барботировали азотом в течение 30 минут. Смесь фильтровали и собранное твердое вещество промывали толуолом (150 мл) и сушили в течение ночи в вакуумной печи (50°C при 25 дюймах ртутного столба (635 миллиметрах

10 ртутного столба)) с выходом грязно-белого твердого вещества (98,4 г, 72%).

¹H ЯМР (DMSO-d₆) δ м.д. 4,06 (с, 3H), 4,10 (с, 2H), 7,44-7,53 (м, 2H), 7,61 (т, 1H).

Стадия A1b: Получение метил-3,5-дихлорбензолацетата

Метил-3,5-дихлорбензолэтанимидата гидрохлорид (1:1) (т.е. продукту стадии A1a) (50 г, 0,107 моля) добавляли к смеси толуола (167 мл) и воды (167 мл). Через 60 минут

15 органическую фазу удаляли, сушили (MgSO₄) и выпаривали с получением названного соединения в виде масла (39 г, 91%).

¹H ЯМР (DMSO-d₆) δ м.д. 3,63 (с, 3H), 3,77 (с, 2H), 7,38 (д, 2H), 7,52 (т, 1H).

Стадия A1c: Получение 1,3-диметил-2-(3,5-дихлорфенил)пропандиоата

20 Смесь метоксида натрия в метаноле (28,46 г, 25%, 0,132 моля) и толуоле (150 мл) кипятили с обеспечением колонки Олдершоу с пятью пластинами для удаления метанольного/толуольного азеотропа. Смесь охлаждали до 60°C и добавляли к ней толуол (объем, равный общему объему дистиллята). Добавляли диметилкарбонат (35,95 г, 0,399 моля) к реакционной смеси. Добавляли метил-3,5-дихлорбензолацетат (т.е.

25 продукт из стадии A1b) (22,2 г, 0,101 моля) в толуоле (17 мл) к смеси за 70 минут. При завершении добавления смесь перемешивали еще в течение 60 минут при 60°C. Смесь кипятили и удаляли диметилкарбонатный/метанольный азеотроп с использованием колонки Олдершоу. Смесь охлаждали до 25°C и по каплям добавляли уксусную кислоту (9,5 г, 0,158 моля). К смеси добавляли воду (100 мл) и органическую фазу отделяли и

30 удаляли при пониженном давлении. Кристаллизация полученного остатка из метанола (36 мл) давала продукт в виде белого твердого вещества (23,9 г, 85%), плавящегося при 72-73°C.

¹H ЯМР (CDCl₃) δ м.д. 3,78 (с, 6H), 4,57 (с, 1H), 7,30-7,37 (м, 3H).

35 Третье получение 1,3-диметил-2-(3,5-дихлорфенил)пропандиоата

Стадия A2a: Получение метил-3,5-дихлор-α-цианобензолуксусной кислоты

Смесь метоксида натрия (25% в метаноле, 225,9 г, 1,045 моля) и толуола (996 мл) кипятили для удаления метанольного/толуольного азеотропа. При необходимости порциями добавляли толуол в ходе дистилляции. Когда температура головки достигала

40 110°C дистилляцию продолжали в течение 20 минут. Смеси позволяли охладиться до комнатной температуры и добавляли толуол так, что объем оставался таким же, что и до дистилляции. К реакционной смеси добавляли метанол (74 мл) и диметилкарбонат (118,4 г, 1,31 моля). Смесь нагревали до 50°C и добавляли 3,5-дихлорфенилацетонитрил (148,2 г, 0,796 моля) в толуоле (140 мл) за 3,5 часа. Полученной смеси позволяли остыть

45 до комнатной температуры в течение ночи, затем нагревали до 50°C еще 2 часа. Смеси позволяли остыть до комнатной температуры и по каплям добавляли уксусную кислоту (80 г, 1,33 моля). К реакционной смеси добавляли воду (350 мл) и органическую фазу отделяли и удаляли растворитель при пониженном давлении. Кристаллизация

полученного остатка из метанола (171 мл) давала продукт в виде белого твердого вещества (148 г, 76%), плавящегося при 97-99°C.

^1H ЯМР (CDCl_3) δ м.д. 3,85 (с, 3H), 4,69 (с, 1H), 7,37-7,38 (м, 2H), 7,42-7,43 (м, 1H).

Стадия A2b: Получение 1,3-диметил-2-(3,5-дихлорфенил)пропандиоата

Добавляли метил-3,5-дихлор- α -цианобензолуксусную кислоту (т.е. продукт из стадии A2a) (50 г, 0,205 моля) в хлороводород (63,5 г, 1,73 моля) в метаноле (200 мл). Смесь нагревали до 45-50°C. Через 210 минут к реакционной смеси добавляли воду (2 г). Еще через 110 минут смеси позволяли остыть до комнатной температуры. После перемешивания в течение ночи растворитель удаляли при пониженном давлении и смесь разделяли между этилацетатом (200 мл) и водой (200 мл). Органический слой отделяли, высушивали и выпаривали. Кристаллизация полученного остатка из метанола (60 мл) давала продукт в виде белого твердого вещества (50,68 г, 79%), физические свойства которого были идентичными материалу, полученному на вышеприведенных стадиях А и А1с.

Стадия В: Получение калия 2-(3,5-дихлорфенил)пропандиоата (2:1)

Гидроксид калия (45% водный, 19 г, 152,7 ммоль) добавляли к перемешиваемой смеси 1,3-диметил-2-(3,5-дихлорфенил)пропандиоата (т.е. продукта стадии А, стадии А1с или стадии А2b) (20,0 г, 72,4 ммоль) в воде (40 мл) при 30°C с помощью шприцевого насоса за 2,5 часа. Шприц промывали водой (1 мл) и промывные воды сразу добавляли в реакционную смесь. Наблюдали умеренное повышение температуры (до 30-35°C). Полученную белую взвесь/суспензию, как правило, превращали в прозрачный раствор за 3 часа. Затем смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 16 часов.

Ловушку Дина-Старка с конденсатором устанавливали на 500-мл круглодонную колбу, содержащую толуол (300 мл). Толуол перемешивали с нагреванием для поддержания стремительного нагревания с обратным холодильником (внутренняя температура 125°C). Водный раствор калия 2-(3,5-дихлорфенил)пропандиоата (2:1) (всего 59 мл, полученного ранее) добавляли с помощью шприцевого насоса в нагреваемый с обратным холодильником толуол за 2 часа. Температуру понижали и удерживали при 115°C. Через 2,5 часа собирали и удаляли 43,9 г воды. После того, как вода явно больше не собиралась, смесь выдерживали при той же температуре еще 1 час, после чего нагревание убирали и перемешивание продолжали при комнатной температуре в течение 16 часов. Фильтрация охлажденной смеси давала влажный осадок, который сушили при 50°C в вакуумной печи в течение 20 часов с получением мелкого белого твердого вещества, соединения в соответствии с настоящим изобретением (23,55 г, 98,6% после вычитания 0,1 эквивалента гидроксида калия), плавящегося при 240-260°C (раз.).

^1H ЯМР (CD_3OD) δ 7,45-7,44 (м, 2H), 7,23-7,22 (м, 1H), 4,41 (с, 1H).

Стадия С: Получение N-[(2-хлор-5-тиазолил)метил]-3-метил-2-пиридинамина

В сухую 2-л трехгорлую колбу, оснащенную термогильзой и конденсатором, загружали N-(3-метил-2-пиридинил)формамид (100 г), карбонат калия (109,6 г), тетрабутиламмония бромид (4,73 г), изопропиловый спирт (7500 мл) и 2-хлор-5-(хлорметил)тиазол (дистиллированный, 123,9 г) в атмосфере азота. Затем реакционную смесь нагревали до 73-75°C и выдерживали при этой температуре в течение 5,5 часа. Затем смесь охлаждали до 50°C и добавляли 10% водный NaOH (880 г) через капельную воронку за 20 минут. Полученную плотную реакционную массу перемешивали при 57-60°C в течение приблизительно 3,5 часа. К реакционной смеси добавляли воду (приблизительно 800 мл) за 5 минут, затем реакционную смесь охлаждали до 10°C и

перемешивали при 10°C в течение 10 минут. Взвесь фильтровали и полученные твердые вещества промывали охлажденной водой (2 × 200 мл), сушили на воздухе, а затем сушили при пониженном давлении при 40°C в течение 16 часов с получением белого твердого вещества (134 г).

¹H ЯМР (dmso-d₆) δ 7,94 (м, 1H), 7,56 (с, 1H), 7,26 (м, 1H), 6,72 (т, 1H), 6,54 (дд, 1H), 4,61 (д, 2H), 2,04 (с, 3H).

Стадия D: Получение 2-(3,5-дихлорфенил)пропандиолдихлорида

К охлажденной водой со льдом смеси оксалилхлорида (13,76 г, 108,4 ммоль) в толуоле (100 мл) в азоте добавляли N,N-диметилформамид (6 капель). Добавляли калия 2-(3,5-дихлорфенил)пропандиоат (2:1) (т.е. продукт из стадии B) (11,60 г, 35,67 ммоль) 6 партиями по 1,9 г каждая с интервалами в 15 минут (предостережение: наблюдалось выделение газа). Наблюдала повышение температуры, но температуру поддерживали на уровне комнатной температуры (23-25°C) с использованием внешней водяной бани со льдом. Баню удаляли через 30 минут после завершения добавления дикалиевой соли и полученную смесь затем перемешивали при комнатной температуре еще 2 часа. Летучие вещества и какой-либо избыток оксалилхлорида удаляли при пониженном давлении (20 мм рт. ст.) в течение 15 минут. Полученный материал использовали непосредственно в следующей стадии.

Стадия E: Получение внутренней соли 1-[(2-хлор-5-тиазолил)метил]-3-(3,5-дихлорфенил)-2-гидрокси-9-метил-4-оксо-4H-пиридо[1,2-a]пиридиния

Смесь 2-(3,5-дихлорфенил)пропандиолдихлорид, полученную в вышеприведенной стадии D, охлаждали до 0°C в водяной бане со льдом, затем медленно добавляли взвесь N-[(2-хлор-5-тиазолил)метил]-3-метил-2-пиридинамина (т.е. продукт стадии C) (8,68 г, 36,2 ммоль) в толуоле (80 мл) за 20 минут. Полученную смесь перемешивали при 0°C в течение 30 минут, водяную баню со льдом удаляли и перемешивание продолжали при комнатной температуре еще 2 часа. Затем реакционную смесь охлаждали в водяной бане со льдом в течение 15 минут, потом по каплям добавляли смесь триэтиламина (7,32 г, 72,3 ммоль) в толуоле (20 мл) за 30 минут. Наблюдала повышение температуры, но температуру поддерживали при 23-30°C. После добавления водяную баню со льдом удаляли и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 2 часов. Смесь разбавляли водой (80 мл) и перемешивали в течение 30 минут, фильтровали и полученный желтый осадок промывали водой (30 мл) и этилацетатом (30 мл). Влажный осадок сушили в вакуумной печи при 50°C в течение 6 часов с получением названного соединения в виде твердого вещества (14,58 г, 91,8%).

¹H ЯМР (CD₃COCD₃) δ 9,41-9,39 (м, 1H), 8,40-8,38 (м, 1H), 8,14-8,13 (м, 2H), 7,77 (с, 1H), 7,67-7,41 (м, 1H), 7,24-7,23 (м, 1H), 5,66 (с, 2H), 2,92 (с, 3H).

Пример 1A

Второе получение внутренней соли 1-[(2-хлор-5-тиазолил)метил]-3-(3,5-дихлорфенил)-2-гидрокси-9-метил-4-оксо-4H-пиридо[1,2-a]пиридиния

Стадия A: Получение 2-(3,5-дихлорфенил)пропандиоата натрия (2:1)

Объединяли 1,3-диметил-2-(3,5-дихлорфенил)пропандиоат (50 г, 0,18 моль) и воду (75 мл) в 500-мл реакторе (с рубашкой), оснащенном термометром и верхнеприводной мешалкой. К смеси добавляли NaOH (37% водный, 39,4 г, 0,36 моль, 2,02 экв.) за 2,5 часа при 23-25°C с помощью шприцевого насоса. После добавления для промывания шприца использовали воду (1 мл) и промывную воду добавляли в реакционную смесь. Густая, белая реакционная смесь превращалась в прозрачный раствор через 6 часов. После завершения реакционную массу брали как таковую для азеодистилляции.

Толуол (250 мл) в 500-мл реакторе с рубашкой, оснащенном ловушкой Дина-Старка, нагревали до температуры реактора 108°C. В горячий толуол загружали вышеупомянутую реакционную массу с помощью шприцевого насоса с такой скоростью, которая не позволяла температуре падать ниже 104°C. После завершения дистилляции
 5 приблизительно 99 г воды собирали ловушкой Дина-Старка. После завершения сбора воды реакционную массу далее нагревали с обратным холодильником (108°C) в течение приблизительно 1 часа, затем охлаждали до комнатной температуры (23-25°C) и перемешивали в течение 1 часа. Продукт фильтровали и сушили воздухом с отсасыванием в течение приблизительно 15 минут в атмосфере N₂. Далее продукт
 10 сушили в вакуумной печи с продувкой азотом при 50°C в течение 25 часов. Высушенный продукт давал 51 г (96,5%, на основе анализа с поправкой на ввод и фактический выход) названного продукта в виде белого твердого вещества; с чистотой по ВЭЖХ: 94,60% площади (4,32% площади побочного продукта декарбоксилирования); с содержанием влаги (1,03%, по KF); т.п.=240-260°C (раз.).

15 ¹H ЯМР (CD₃OD) δ 7,45-7,44 (м, 2H), 7,23-7,22 (м, 1H), 4,41 (с, 1H).

Стадия В: Получение 2-(3,5-дихлорфенил)пропандиолдихлорида

Толуол (200 мл) добавляли в 1-л 4-горлую круглодонную колбу в атмосфере азота. Добавляли оксалилхлорид (25,81 г, 0,203 моля, 3 экв. в течение 5 минут. Смесь охлаждали
 20 до 2-5°C и добавляли 1-формилпиперидин(0,12 г, 1,02 ммоль, 0,02 экв.). Вышеупомянутую динатриевую соль, полученную в примере 1А, стадия А (т.е. натрия 2-(3,5-дихлорфенил)пропандиоат (2:1)) (20 г, 68 ммоль), добавляли 4 партиями (по 5 г в каждой) с временным интервалом 15 минут (наблюдали слабое выделение газа с умеренной экзотермичностью 2-3°C). Реакционную смесь нагревали до комнатной температуры (23-25°C) и
 25 выдерживали в течение 3 часов. Массу далее нагревали до 40°C в течение 1 часа. После завершения реакции реакционную массу дистиллировали при 40°C под вакуумом (приблизительно 90-120 мм рт. ст.) в течение приблизительно 30 минут для удаления летучих соединений и избытка оксалилхлорида (в ходе дистилляции температуру реакционной массы понижали от 40°C до 32°C, собирали приблизительно 53 мл
 30 дистиллята). После дистилляции полученный материал использовали непосредственно в следующей стадии.

¹H ЯМР (толуол-d₈, реакционная смесь за 4 часа) δ 7,10-6,70 (м, 3H), 4,49-4,45 (м, 1H).

Стадия С: Получение внутренней соли 1-[(2-хлор-5-тиазолил)метил]-3-(3,5-дихлорфенил)-2-гидрокси-9-метил-4-оксо-4Н-пиридо[1,2-а]пиридиния

35 Вышеупомянутую реакционную смесь охлаждали до 0°C ледяной баней, затем взвесъ N-[(2-хлор-5-тиазолил)метил]-3-метил-2-пиридинамина (16,36 г, 68,24 ммоль, 1 экв.) в толуоле (100 мл) добавляли к этой смеси 10-мл порциями в виде 10 партий с интервалом по 3 минуты каждый в атмосфере азота. Коническую колбу промывали толуолом (10 мл) и добавляли реакционную массу 2-(3,5-дихлорфенил)пропандиоида дихлорида при
 40 интенсивном перемешивании. Затем полученную смесь нагревали и перемешивали при 20-25°C в течение 2 часов. Затем реакционную смесь снова охлаждали до 0°C и по каплям добавляли триэтиламин (13,81 г, 136,7 ммоль, 2 экв.) в толуоле (20 мл) за 1 час при 0-5°C с помощью шприцевого насоса. После добавления ледяную баню удаляли и смесь перемешивали при комнатной температуре (23-25°C) в течение 6 часов. К
 45 реакционной массе добавляли воду (110 мл) за 10 минут; перемешивали в течение 30 минут и фильтровали. Отфильтрованное твердое вещество промывали три раза водой (3 × 50 мл), а затем промывали предварительно охлажденным (5°C) этилацетатом (2 × 55 мл). Влажный остаток сушили с отсасыванием в течение приблизительно 30 минут

и дополнительно сушили в вакуумной печи при 50°C в течение 22 часов с получением желтого твердого вещества (22,9 г, 74,13%).

¹H ЯМР (CD₃COCD₃) δ 9,41-9,39 (м, 1H), 8,40-8,38 (м, 1H), 8,14-8,13 (м, 2H), 7,77 (с, 1H), 7,67-7,41 (м, 1H), 7,24-7,23 (м, 1H), 5,66 (с, 2H), 2,92 (с, 3H).

ПРИМЕР 2

Получение 2-[3-(трифторметил)фенил]пропандиоата натрия (2:1)

Стадия А: Получение 2-[3-(трифторметил)фенил]пропандиоата натрия (2:1)

В 100-мл круглодонную колбу загружали 1,3-диметил-2-[3-(трифтор-метил)фенил]пропандиоат (5 г, 90,6% вес/вес, 16,4 ммоль) и H₂O (10 мл). Перемешиваемую смесь охлаждали до 2°C с использованием внешней водяной бани со льдом. К смеси добавляли раствор гидроксида натрия (50% водного, 3,0 г, 37,5 ммоль) через дополнительную воронку за 10 минут при 2-6°C. При завершении добавления раствора гидроксида натрия внешнюю водяную баню со льдом удаляли и обеспечивали нагревание реакционной смеси до комнатной температуры и перемешивали при комнатной температуре в течение 16 часов. Добавляли активированный уголь (0,5 г) и реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 15 минут, затем фильтровали.

Водный фильтрат загружали в 100-мл круглодонную колбу, оснащенную ловушкой Дина-Старка с конденсатором и датчиком температуры. Добавляли толуол (20 мл) к смеси, которую затем нагревали (температуру бани устанавливали на 115°C) и избыток воды удаляли азеотропно. После того, как дополнительная вода явно больше не собиралась, реакционную смесь держали при 110°C в течение 1 часа, затем ловушку Дина-Старка удаляли, а смесь охлаждали до комнатной температуры. Толуол (20 мл) добавляли в реакционную смесь и перемешивали при комнатной температуре в течение 30 минут, затем фильтровали. Влажное твердое вещество промывали ацетонитрилом (20 мл) и сушили в вакуумной печи при 50°C в течение 16 часов с получением белого твердого вещества, соединения в соответствии с настоящим изобретением (4 г, 79%), плавящегося при >300°C.

¹H ЯМР (D₂O) δ 7,51-7,68 (м, 4H), 4,54 (с, 1H).

ПРИМЕР 3

Получение внутренней соли 2-гидрокси-4-оксо-1-(5-пиримидинилметил)-3-[3-(трифторметил)фенил]-4Н-пиридо[1,2-а]пиримидиния

Стадия А: Получение N-(5-пиримидинилметил)-2-пиридинамина

Раствор 2-аминопиридина (11,314 г, 120,3 ммоль) и пиримидин-5-карбоксальдегида (14,0 г, 129,6 ммоль) в хлороформе (300 мл) перемешивали при комнатной температуре в течение 15 минут. Затем летучие вещества удаляли при пониженном давлении (1 час при 75°C) с получением желтого твердого вещества. Неочищенное твердое вещество растворяли в хлороформе (300 мл) и раствор перемешивали в течение 15 минут. Затем летучие вещества удаляли при пониженном давлении (1 час при 75°C) с получением желтого твердого вещества. Неочищенное твердое вещество снова растворяли в хлороформе (300 мл), раствор перемешивали в течение 15 минут, и летучие вещества удаляли под пониженным давлением (1 час при 85°C) с получением желтого твердого вещества. Данное твердое вещество высушивали в вакуумной печи в течение ночи при 80°C с получением 22,090 г (99,8%) титльного соединения.

¹H ЯМР (CDCl₃) δ 9,26-9,32 (м, 4H), 8,52 (д, 1H), 7,82 (т, 1H), 7,42 (д, 1H), 7,26 (т, 1H).

Стадия В: Получение N-[(5-пиримидинил)метил]-2-пиридинамина

Порошковый боргидрид натрия (98%, 2,868 г, 75,5 ммоль) добавляли в раствор

метанола (80 мл) и тетрагидрофурана (400 мл) и смесь энергично перемешивали в течение 5 минут. Продукт примера 3, стадии А (13,9 г, 75,5 ммоль) растворяли в тетрагидрофуране (400 мл) и полученный раствор по каплям добавляли к суспензии боргидрида натрия при постоянной скорости приблизительно 33 мл/минута. Внешний вид реакционной смеси изменялся от светло-желтой слегка мутноватой суспензии до прозрачного красного раствора. Протекание реакции контролировали посредством элюирования при тонкослойной хроматографии растворителем - 10% метанола:40% дихлорметана:50% толуола. При завершении реакции по каплям добавляли уксусную кислоту (3 мл) и реакционную смесь перемешивали в течение 5 минут. Добавляли уксусную кислоту (2 мл) и воду (30 мл), реакционную смесь недолго перемешивали, а затем добавляли этилацетат (500 мл). Реакционную смесь промывали 1 н водным раствором гидроксида натрия (300 мл), сушили над сульфатом магния, фильтровали и растворитель удаляли под пониженным давлением при 50°C. Полученное неочищенное масло растворяли в дихлорметане (50 мл) и раствор элюировали через пробку из силикагеля (100 г) этилацетатом (3 л). Элюент концентрировали до желто-оранжевого масла, которое медленно кристаллизовали с получением 8,909 г (63,4%) названного продукта в виде бледно-желтого твердого вещества.

^1H ЯМР (CDCl_3) δ 9,12 (с, 1H), 8,76 (с, 2H), 8,10 (д, 1H), 7,42 (т, 1H), 6,64 (т, 1H), 6,42 (д, 1H), 4,99 (ушир.с, NH), 4,61 (д, 2H).

Стадия С: Получение 1,3-диметил-2-[3-(трифторметил)фенил]пропандиоата

Диоксан (100 мл) продували газообразным азотом в течение 10 минут. Фенантролен (1,0 г) и меди (I) йодид (1,0 г) добавляли к диоксану, суспензии позволяли перемешиваться в атмосфере азота в течение 5 минут, и затем добавляли цезия карбонат (18,72 г, 57,45 ммоль), диметилмалонат (5,46 г, 50,6 ммоль) и 1-йод-3-(трифторметил)бензол (12,5 г, 46,0 ммоль). Реакционную смесь нагревали до температуры флегмы в течение 18 часов и затем охлаждали до комнатной температуры. Водную 1 н HCl добавляли к реакционной смеси, слои разделяли и водный слой экстрагировали этилацетатом (3 × 100 мл).

Объединенные органические слои высушивали над сульфатом магния и фильтровали.

Вспомогательное вещество для фильтрования на диатомовом фильтре Celite® (5 г) добавляли к фильтрату и полученную суспензию концентрировали под пониженным давлением при 50°C с получением твердого вещества, состоящего из неочищенного продукта, адсорбированного на Celite®. Данное твердое вещество очищали элюированием хроматографией с силикагелем с градиентом от 100% гексанов до 25% этилацетата в гексанах с получением 7,36 г (58,0%) названного продукта.

^1H ЯМР (CDCl_3) δ 7,59-7,65 (м, 3H), 7,49 (т, 1H), 4,70 (с, 1H), 3,76 (с, 6H).

Стадия D: Получение калия 2-[3-(трифторметил)фенил]пропандиоата (2:1)

Смесь 1,3-диметил-2-[3-(трифторметил)фенил]пропандиоата (т.е. продукта примера 3, стадии С) (50,0 г, 181 ммоль) и воды (100 мл) в 500-мл круглодонной колбе перемешивали при 0°C. Добавляли гидроксид калия (45% водный, 50 г, 401 ммоль) с помощью шприцевого насоса за 20 минут при поддержании температуры реакции от 0 до 5°C. При завершении добавления раствора гидроксида калия реакционную смесь нагревали до 23°C и перемешивали при комнатной температуре в течение ночи.

Ловушку Дина-Старка с конденсатором устанавливали на 500-мл круглодонную колбу, содержащую водный раствор 2-[3-(трифторметил)фенил]пропандиоата калия (2:1). Добавляли толуол (200 мл), затем раствор нагревали до температуры флегмы (~86°C) и воду азеотропно удаляли. Как только вода больше не удалялась, температуру флегмы повышали, и температура реактора достигала 110°C в конце дистилляции.

После того, как дополнительная вода явно больше не собиралась, реакционную смесь держали при температуре флегмы (110°C) еще 1 час, затем нагревание прекращали и полученную смесь перемешивали до охлаждения до комнатной температуры. Добавляли ацетонитрил (250 мл) и реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 1 часа. Реакционную смесь фильтровали и влажный осадок опять загружали в отдельную 500-мл круглодонную колбу, а затем ацетонитрил (250 мл). Полученную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 1 часа и фильтровали. Влажный осадок промывали ацетонитрилом (30 мл). Твердый продукт сушили в вакуумной печи (50°C при 20 дюймах ртутного столба) в течение 20 часов с получением бежевого твердого вещества, соединения в соответствии с настоящим изобретением (62 г, 97% на основе 95% площади ВЭЖХ и после вычитания избытка КОН). Т.п.=95,8°C.

¹H ЯМР (D₂O) δ 7,53-7,68 (м, 4H), 4,54 (с, 1H).

Стадия Е: Синтез внутренней соли 2-гидрокси-4-оксо-1-(5-пиримидинилметил)-3-[3-(трифторметил)фенил]-4Н-пиридо[1,2-а]пиримидиния

К перемешиваемой смеси 2-[3-(трифторметил)фенил]пропандиоата калия (2:1) (т.е. продукта примера 3, стадии D) (6,0 г, 18,5 ммоль) и толуола (60 мл) в 100-мл круглодонной колбе при 3°C порциями добавляли оксалилхлорид (5,4 г, 42,6 ммоль) через пипетку при поддержании внутренней температуры 3-5°C. После завершения добавления оксалилхлорида к реакционной смеси добавляли N,N-диметилформамид (4 капли) при 5°C. Полученную реакционную смесь перемешивали при 5°C с обеспечением внешнего охлаждения с помощью водяной бани со льдом в течение 30 минут. Баню удаляли, позволяли внутренней температуре подняться до 22°C. Реакционную смесь перемешивали при 22°C в течение приблизительно 5 часов. После завершения превращения в 2-[3-(трифторметил)фенил]пропандиоилдихлорид реакционную смесь охлаждали до 3°C. К реакционной смеси добавляли N-[(5-пиримидинил)метил]-2-пиридинамин (т.е. продукт примера 3, стадии В) (3,4 г, 18,3 ммоль) при 3°C. К реакционной смеси порциями добавляли триэтиламин (3,75 г, 36,7 ммоль) через дополнительную воронку за 15 минут при поддержании температуры реакционной смеси 3-6°C с использованием внешней водяной бани со льдом. После завершения добавления триэтиламина водяную баню со льдом удаляли и реакционной смеси позволяли нагреться до комнатной температуры. Добавляли гептан (50 мл) и полученную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 30 минут, а затем фильтровали. Влажное твердое вещество опять загружали в чистую круглодонную колбу, а затем воду (40 мл). Реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 1 часа, фильтровали и влажное твердое вещество промывали гептаном (15 мл). Твердый продукт сушили в вакуумной печи (при 50°C при 20 мм рт. ст.) в течение 20 часов с получением 7,75 г желтого твердого продукта. Твердый продукт далее очищали путем перемешивания в 77 мл смеси 7:1 трет-бутилметилового эфира/этилацетата, затем фильтровали с получением названного соединения (6,2 г, 50%; 94,6% чистоты на основе площади ВЭЖХ).

¹H ЯМР (CDCl₃) δ 5,64 (ушир.с, 2H), 7,43-7,48 (м, 2H), 7,50-7,52 (м, 2H), 8,03-8,11 (м, 1H), 8,13-8,16 (м, 2H) 8,83 (с, 2H), 9,19 (с, 1H), 9,55-9,58 (дд, 1H).

Пример 3А

Второе получение внутренней соли 2-гидрокси-4-оксо-1-(5-пиримидинилметил)-3-[3-(трифторметил)фенил]-4Н-пиридо[1,2-а]пиримидиния

Стадия А: Получение 2-[3-(трифторметил)фенил]пропандиоата натрия (2:1)

Смесь 1,3-диметил-2-[3-(трифторметил)фенил]пропандиоата (т.е. продукта примера

3, стадии С) (5,0 г, 90,6 вес. %, 16 ммоль) и воды (10 мл) в 100-мл круглодонной колбе перемешивали при 2°C. Добавляли гидроксид натрия (50% водный, 3,0 г, 38 ммоль) через дополнительную воронку за 10 минут при поддержании температуры реакции 2-6°C. После завершения добавления раствора гидроксида натрия реакционную смесь

нагревали до 23°C и перемешивали при комнатной температуре в течение ночи. К реакционной смеси добавляли активированный уголь (0,5 г) и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 15 минут, а затем фильтровали. Водный фильтрат загружали в 100-мл круглодонную колбу, оснащенную ловушкой Дина-Старка, конденсатором и датчиком температуры. Добавляли толуол (20 мл), затем раствор

нагревали до температуры флегмы и воду азеотропно удаляли. После того, как дополнительная вода явно больше не собиралась, реакционную смесь держали при температуре флегмы (110°C) еще 1 час, затем нагревание прекращали и полученную смесь перемешивали до охлаждения до комнатной температуры. Добавляли толуол (20 мл) и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 30 минут. Затем

взвесь фильтровали и твердые вещества промывали ацетонитрилом (20 мл). Затем твердые вещества сушили в вакуумной печи при 50°C в течение 16 часов с получением названного соединения в виде белого твердого вещества (4,0 г, 94,9% площади ВЭЖХ, 79% выход на основе %).

¹H ЯМР (D₂O) δ 7,51-7,68 (м, 4H), 4,54 (с, 1H).

Стадия В: Синтез внутренней соли 2-гидрокси-4-оксо-1-(5-пиримидинилметил)-3-[3-(трифторметил)фенил]-4Н-пиридо[1,2-а]пиримидиния

К перемешиваемой смеси 2-[3-(трифторметил)фенил]пропандиоата натрия (2:1) (т.е. продукта примера 3А, стадии А) (5,0 г, 95,0% площади, 16 ммоль) и дихлорметана (50 мл) в 250-мл круглодонной колбе при -1°C добавляли 1-формилпиперидин (0,09 г, 0,8 ммоль). Затем добавляли оксалилхлорид (5,6 г, 98%, 43 ммоль) через дополнительную воронку за 5 минут при поддержании внутренней температуры от -3 до +1°C.

Полученную реакционную смесь перемешивали при от -3 до +2°C в течение 10 минут, затем при 20-22°C в течение 2-3 часов. После завершения превращения в 2-[3-(трифторметил)фенил]пропандиол дихлорид реакционную смесь охлаждали до 0°C, затем добавляли смесь N-[(5-пиримидинил)метил]-2-пиридинамина (т.е. продукт примера 3, стадии В) (3,2 г, 95,3%, 16,4 ммоль) и 4-пиколина (3,1 г, 98%, 32,6 ммоль) в дихлорметане (20 мл) к смеси хлорангидрида через шприцевый насос за 10 минут при 0-3°C. После завершения добавления реакционную смесь нагревали до 10°C за 10 минут и перемешивали при 9-12°C в течение 30 минут, пока не наблюдалось полное превращение промежуточного хлорангидрида (с помощью гашения метанолом и определения путем ВЭЖХ отсутствия 1,3-диметил-2-[3-(трифторметил)фенил]пропандиоата). Реакционную смесь нагревали до 18°C, затем к реакционной смеси добавляли воду (15 мл) при 18-20°C и двухфазную смесь перемешивали при 18-20°C в течение 15 минут. Смесь отстаивали и слои разделяли. Водный слой экстрагировали дихлорметаном (2×25 мл). Органические слои объединяли, затем к объединенному органическому раствору добавляли изопропанол (30 мл), а потом воду (1,25 мл).

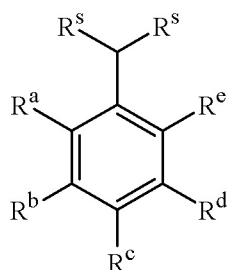
Полученную смесь дистиллировали с температурой реактора 82°C и с температурой головки 42-82°C при атмосферном давлении для удаления дихлорметана и воды. Когда температура головки достигала точки кипения чистого изопропанола, дистилляцию прекращали, добавляли дополнительный изопропанол (30 мл) в горячий концентрат и смеси позволяли нагреваться до комнатной температуры и перемешивали при комнатной температуре в течение ночи, в это время твердое вещество кристаллизовалось. Затем смесь фильтровали и влажные твердые вещества промывали

изопропанолом (3×5 мл). Твердый продукт сушили в вакуумной печи при 50-55°C и ~250 мм рт. ст. с получением названного соединения в виде желтого твердого вещества (5,0 г, 99,0% площади ВЭЖХ, 98,3 вес. %, 75,9% выход из динатриевой соли (т.е. натрия 2-[3-(трифторметил)фенил]пропандиоата (2:1)).

- 5 Следующие соединения таблиц I-1-I-35 могут быть получены процедурами, описанными в настоящем документе, вместе со способами, известными в уровне техники. С помощью процедур, описанных в настоящем документе, вместе со способами, известными в уровне техники, соединение формулы 1 может быть получено из соединения формулы 2, как показано в таблицах M-1-M-155. С помощью процедур,
- 10 описанных в настоящем документе, вместе со способами, известными в уровне техники, соединение формулы 4 может быть получено из соединений формул 1 и 5 с использованием способа получения соединения формулы 1 из соединения формулы 2. В таблицах индексов используют следующие сокращения: t означает третичный, s означает вторичный, n означает нормальный, i означает изо, c означает цикло, Me
- 15 означает метил, Et означает этил, Pr означает пропил, i-Pr означает изопропил, t-Bu означает третичный бутил, Hex означает гексил, Ph означает фенил, CN означает циано, а Bn означает бензил (-CH₂Ph). В таблицах I-1-I-35, M-1-M-174 и C-1-C-42 значения для Y1-Y41 указаны для каждого заместителя согласно следующей схеме:

20	Y1	2-фторфенил	Y3	3-(CF ₃)фенил
	Y2	3-хлорфенил	Y4	3-фторфенил
	Y5	3-цианофенил	Y24	2-фтор-4-цианофенил
	Y6	4-фторфенил	Y25	2-фтор-4-хлорфенил
	Y7	4-хлорфенил	Y26	2-метил-4-хлорфенил
	Y8	4-(CF ₃)фенил	Y27	2-фтор-4-(CF ₃)фенил
25	Y9	4-цианофенил	Y28	2,4-бис(CF ₃)фенил
	Y10	3-(OCF ₃)фенил	Y29	2-фтор-4-бромфенил
30	Y11	4-бромфенил	Y30	2-хлор-4-фторфенил
	Y12	6-хлор-3-пиридинил	Y31	2-(CF ₃)-4-фторфенил
	Y13	6-фтор-3-пиридинил	Y32	2-метил-4-(CF ₃)фенил
	Y14	6-(CF ₃)-3-пиридинил	Y33	2-хлор-4-(CF ₃)фенил
35	Y15	4,6-дихлор-3-пиридинил	Y34	2-(CF ₃)-4-хлорфенил
	Y16	2-фтор-6-хлор-3-пиридинил	Y35	2,5-дифторфенил
	Y17	2,6-дихлор-3-пиридинил	Y36	2-фтор-5-(CF ₃)фенил
	Y18	2-бром-5-хлор-4-пиридинил	Y37	2-фтор-5-хлорфенил
40	Y19	3-бром-5-фторфенил	Y38	2,5-дихлорфенил
	Y20	3-хлор-5-фторфенил	Y39	2-фтор-5-(OCF ₃)фенил
	Y21	3-фтор-4-хлорфенил	Y40	2-хлор-5-(CF ₃)фенил
	Y22	2,4-дихлорфенил	Y41	3-хлор-5-(CF ₃)-2-пиридинил
	Y23	2,4-дифторфенил		

45 ТАБЛИЦА I-1



Каждый R^s представляет собой CO_2Li^+ ; R^b , R^c , R^d и R^e представляют собой H

R^a	R^a	R^a	R^a	R^a	R^a	R^a
F	CH_2F	OCH_2CF_3	Y4	Y14	Y24	Y34
Cl	CHF_2	SCF_3	Y5	Y15	Y25	Y35
Br	OMe	SCF_3	Y6	Y16	Y26	Y36
I	OEt	SCHF_2	Y7	Y17	Y27	Y37
Me	O- <i>n</i> -Pr	CO_2Me	Y8	Y18	Y28	Y38
Et	Ph	CO_2Et	Y9	Y19	Y29	Y39
Pr	O- <i>i</i> -Pr	CN	Y10	Y20	Y30	Y40
<i>i</i> -Pr	SF_5	Y1	Y11	Y21	Y31	Y41
<i>t</i> -Bu	OCF_3	Y2	Y12	Y22	Y32	
CF_3	OCHF_2	Y3	Y13	Y23	Y33	

каждый R^s представляет собой CO_2Li^+ ; R^a , R^c , R^d и R^e представляют собой H

R^b	R^b	R^b	R^b	R^b	R^b	R^b
F	CH_2F	OCH_2CF_3	Y4	Y14	Y24	Y34
Cl	CHF_2	SCF_3	Y5	Y15	Y25	Y35
Br	OMe	SCF_3	Y6	Y16	Y26	Y36
I	OEt	SCHF_2	Y7	Y17	Y27	Y37
Me	O- <i>n</i> -Pr	CO_2Me	Y8	Y18	Y28	Y38
Et	Ph	CO_2Et	Y9	Y19	Y29	Y39
Pr	O- <i>i</i> -Pr	CN	Y10	Y20	Y30	Y40
<i>i</i> -Pr	SF_5	Y1	Y11	Y21	Y31	Y41
<i>t</i> -Bu	OCF_3	Y2	Y12	Y22	Y32	
CF_3	OCHF_2	Y3	Y13	Y23	Y33	

каждый R^s представляет собой CO_2Li^+ ; R^a , R^b , R^d и R^e представляют собой H

	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>
	F	CH ₂ F	OCH ₂ CF ₃	Y4	Y14	Y24
	Cl	CHF ₂	SCF ₃	Y5	Y15	Y25
5	Br	OMe	SCF ₃	Y6	Y16	Y26
	I	OEt	SCHF ₂	Y7	Y17	Y27
	Me	O- <i>n</i> -Pr	CO ₂ Me	Y8	Y18	Y28
	Et	Ph	CO ₂ Et	Y9	Y19	Y29
10	Pr	O- <i>i</i> -Pr	CN	Y10	Y20	Y30
	<i>i</i> -Pr	SF ₅	Y1	Y11	Y21	Y31
	<i>t</i> -Bu	OCF ₃	Y2	Y12	Y22	Y32
	CF ₃	OCHF ₂	Y3	Y13	Y23	Y33

каждый R^s представляет собой CO₂⁻Li⁺; R^a представляет собой F; R^c, R^d и R^e представляют собой H

	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>
	F	CH ₂ F	OCH ₂ CF ₃	Y4	Y14	Y24
	Cl	CHF ₂	SCF ₃	Y5	Y15	Y25
20	Br	OMe	SCF ₃	Y6	Y16	Y26
	I	OEt	SCHF ₂	Y7	Y17	Y27
	Me	O- <i>n</i> -Pr	CO ₂ Me	Y8	Y18	Y28
	Et	Ph	CO ₂ Et	Y9	Y19	Y29
25	Pr	O- <i>i</i> -Pr	CN	Y10	Y20	Y30
	<i>i</i> -Pr	SF ₅	Y1	Y11	Y21	Y31
	<i>t</i> -Bu	OCF ₃	Y2	Y12	Y22	Y32
	CF ₃	OCHF ₂	Y3	Y13	Y23	Y33

каждый R^s представляет собой CO₂⁻Li⁺; R^a представляет собой F; R^b, R^d и R^e представляют собой H

	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>
	F	CH ₂ F	OCH ₂ CF ₃	Y4	Y14	Y24
	Cl	CHF ₂	SCF ₃	Y5	Y15	Y25
35	Br	OMe	SCF ₃	Y6	Y16	Y26
	I	OEt	SCHF ₂	Y7	Y17	Y27
	Me	O- <i>n</i> -Pr	CO ₂ Me	Y8	Y18	Y28
	Et	Ph	CO ₂ Et	Y9	Y19	Y29
40	Pr	O- <i>i</i> -Pr	CN	Y10	Y20	Y30
	<i>i</i> -Pr	SF ₅	Y1	Y11	Y21	Y31
	<i>t</i> -Bu	OCF ₃	Y2	Y12	Y22	Y32
	CF ₃	OCHF ₂	Y3	Y13	Y23	Y33

каждый R^s представляет собой CO₂⁻Li⁺; R^a представляет собой F; R^b, R^c и R^e представляют собой H

	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
	F	CH ₂ F	OCH ₂ CF ₃	Y4	Y14	Y24
	Cl	CHF ₂	SCF ₃	Y5	Y15	Y25
5	Br	OMe	SCF ₃	Y6	Y16	Y26
	I	OEt	SCHF ₂	Y7	Y17	Y27
	Me	O- <i>n</i> -Pr	CO ₂ Me	Y8	Y18	Y28
	Et	Ph	CO ₂ Et	Y9	Y19	Y29
10	Pr	O- <i>i</i> -Pr	CN	Y10	Y20	Y30
	<i>i</i> -Pr	SF ₅	Y1	Y11	Y21	Y31
	<i>t</i> -Bu	OCF ₃	Y2	Y12	Y22	Y32
	CF ₃	OCHF ₂	Y3	Y13	Y23	Y33

каждый R^s представляет собой CO₂⁻Li⁺; R^a представляет собой F; R^b, R^c и R^d представляют собой H

	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>
	F	CH ₂ F	OCH ₂ CF ₃	Y4	Y14	Y24
	Cl	CHF ₂	SCF ₃	Y5	Y15	Y25
20	Br	OMe	SCF ₃	Y6	Y16	Y26
	I	OEt	SCHF ₂	Y7	Y17	Y27
	Me	O- <i>n</i> -Pr	CO ₂ Me	Y8	Y18	Y28
	Et	Ph	CO ₂ Et	Y9	Y19	Y29
25	Pr	O- <i>i</i> -Pr	CN	Y10	Y20	Y30
	<i>i</i> -Pr	SF ₅	Y1	Y11	Y21	Y31
	<i>t</i> -Bu	OCF ₃	Y2	Y12	Y22	Y32
	CF ₃	OCHF ₂	Y3	Y13	Y23	Y33

каждый R^s представляет собой CO₂⁻Li⁺; R^a представляет собой Cl; R^c, R^d и R^e представляют собой H

	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>
	F	CH ₂ F	OCH ₂ CF ₃	Y4	Y14	Y24
	Cl	CHF ₂	SCF ₃	Y5	Y15	Y25
35	Br	OMe	SCF ₃	Y6	Y16	Y26
	I	OEt	SCHF ₂	Y7	Y17	Y27
	Me	O- <i>n</i> -Pr	CO ₂ Me	Y8	Y18	Y28
	Et	Ph	CO ₂ Et	Y9	Y19	Y29
40	Pr	O- <i>i</i> -Pr	CN	Y10	Y20	Y30
	<i>i</i> -Pr	SF ₅	Y1	Y11	Y21	Y31
	<i>t</i> -Bu	OCF ₃	Y2	Y12	Y22	Y32
	CF ₃	OCHF ₂	Y3	Y13	Y23	Y33

каждый R^s представляет собой CO₂⁻Li⁺; R^a представляет собой Cl; R^b, R^d и R^e представляют собой H

	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>
	F	CH ₂ F	OCH ₂ CF ₃	Y4	Y14	Y24
	Cl	CHF ₂	SCF ₃	Y5	Y15	Y25
5	Br	OMe	SCF ₃	Y6	Y16	Y26
	I	OEt	SCHF ₂	Y7	Y17	Y27
	Me	O- <i>n</i> -Pr	CO ₂ Me	Y8	Y18	Y28
	Et	Ph	CO ₂ Et	Y9	Y19	Y29
10	Pr	O- <i>i</i> -Pr	CN	Y10	Y20	Y30
	<i>i</i> -Pr	SF ₅	Y1	Y11	Y21	Y31
	<i>t</i> -Bu	OCF ₃	Y2	Y12	Y22	Y32
	CF ₃	OCHF ₂	Y3	Y13	Y23	Y33

каждый R^s представляет собой CO₂⁻Li⁺; R^a представляет собой Cl; R^b, R^c и R^e представляют собой H

	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
	F	CH ₂ F	OCH ₂ CF ₃	Y4	Y14	Y24
	Cl	CHF ₂	SCF ₃	Y5	Y15	Y25
20	Br	OMe	SCF ₃	Y6	Y16	Y26
	I	OEt	SCHF ₂	Y7	Y17	Y27
	Me	O- <i>n</i> -Pr	CO ₂ Me	Y8	Y18	Y28
	Et	Ph	CO ₂ Et	Y9	Y19	Y29
25	Pr	O- <i>i</i> -Pr	CN	Y10	Y20	Y30
	<i>i</i> -Pr	SF ₅	Y1	Y11	Y21	Y31
	<i>t</i> -Bu	OCF ₃	Y2	Y12	Y22	Y32
	CF ₃	OCHF ₂	Y3	Y13	Y23	Y33

каждый R^s представляет собой CO₂⁻Li⁺; R^a представляет собой Cl; R^b, R^c и R^d представляют собой H

	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>
	F	CH ₂ F	OCH ₂ CF ₃	Y4	Y14	Y24
	Cl	CHF ₂	SCF ₃	Y5	Y15	Y25
35	Br	OMe	SCF ₃	Y6	Y16	Y26
	I	OEt	SCHF ₂	Y7	Y17	Y27
	Me	O- <i>n</i> -Pr	CO ₂ Me	Y8	Y18	Y28
	Et	Ph	CO ₂ Et	Y9	Y19	Y29
40	Pr	O- <i>i</i> -Pr	CN	Y10	Y20	Y30
	<i>i</i> -Pr	SF ₅	Y1	Y11	Y21	Y31
	<i>t</i> -Bu	OCF ₃	Y2	Y12	Y22	Y32
	CF ₃	OCHF ₂	Y3	Y13	Y23	Y33

каждый R^s представляет собой CO₂⁻Li⁺; R^a представляет собой OMe; R^c, R^d и R^e представляют собой H

	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>
	F	CH ₂ F	OCH ₂ CF ₃	Y4	Y14	Y24
	Cl	CHF ₂	SCF ₃	Y5	Y15	Y25
5	Br	OMe	SCF ₃	Y6	Y16	Y26
	I	OEt	SCHF ₂	Y7	Y17	Y27
	Me	O- <i>n</i> -Pr	CO ₂ Me	Y8	Y18	Y28
	Et	Ph	CO ₂ Et	Y9	Y19	Y29
10	Pr	O- <i>i</i> -Pr	CN	Y10	Y20	Y30
	<i>i</i> -Pr	SF ₅	Y1	Y11	Y21	Y31
	<i>t</i> -Bu	OCF ₃	Y2	Y12	Y22	Y32
	CF ₃	OCHF ₂	Y3	Y13	Y23	Y33

каждый R^s представляет собой CO₂⁻Li⁺; R^a представляет собой OMe; R^b, R^d и R^e представляют собой H

	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>
	F	CH ₂ F	OCH ₂ CF ₃	Y4	Y14	Y24
	Cl	CHF ₂	SCF ₃	Y5	Y15	Y25
20	Br	OMe	SCF ₃	Y6	Y16	Y26
	I	OEt	SCHF ₂	Y7	Y17	Y27
	Me	O- <i>n</i> -Pr	CO ₂ Me	Y8	Y18	Y28
	Et	Ph	CO ₂ Et	Y9	Y19	Y29
25	Pr	O- <i>i</i> -Pr	CN	Y10	Y20	Y30
	<i>i</i> -Pr	SF ₅	Y1	Y11	Y21	Y31
	<i>t</i> -Bu	OCF ₃	Y2	Y12	Y22	Y32
	CF ₃	OCHF ₂	Y3	Y13	Y23	Y33

каждый R^s представляет собой CO₂⁻Li⁺; R^a представляет собой OMe; R^b, R^c и R^e представляют собой H

	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
	F	CH ₂ F	OCH ₂ CF ₃	Y4	Y14	Y24
	Cl	CHF ₂	SCF ₃	Y5	Y15	Y25
35	Br	OMe	SCF ₃	Y6	Y16	Y26
	I	OEt	SCHF ₂	Y7	Y17	Y27
	Me	O- <i>n</i> -Pr	CO ₂ Me	Y8	Y18	Y28
	Et	Ph	CO ₂ Et	Y9	Y19	Y29
40	Pr	O- <i>i</i> -Pr	CN	Y10	Y20	Y30
	<i>i</i> -Pr	SF ₅	Y1	Y11	Y21	Y31
	<i>t</i> -Bu	OCF ₃	Y2	Y12	Y22	Y32
	CF ₃	OCHF ₂	Y3	Y13	Y23	Y33

каждый R^s представляет собой CO₂⁻Li⁺; R^a представляет собой OMe; R^b, R^c и R^d представляют собой H

	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>
	F	CH ₂ F	OCH ₂ CF ₃	Y4	Y14	Y24
	Cl	CHF ₂	SCF ₃	Y5	Y15	Y25
5	Br	OMe	SCF ₃	Y6	Y16	Y26
	I	OEt	SCHF ₂	Y7	Y17	Y27
	Me	O- <i>n</i> -Pr	CO ₂ Me	Y8	Y18	Y28
	Et	Ph	CO ₂ Et	Y9	Y19	Y29
10	Pr	O- <i>i</i> -Pr	CN	Y10	Y20	Y30
	<i>i</i> -Pr	SF ₅	Y1	Y11	Y21	Y31
	<i>t</i> -Bu	OCF ₃	Y2	Y12	Y22	Y32
	CF ₃	OCHF ₂	Y3	Y13	Y23	Y33

каждый R^s представляет собой CO₂⁻Li⁺; R^a представляет собой Me; R^c, R^d и R^e представляют собой H

	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>
	F	CH ₂ F	OCH ₂ CF ₃	Y4	Y14	Y24
	Cl	CHF ₂	SCF ₃	Y5	Y15	Y25
20	Br	OMe	SCF ₃	Y6	Y16	Y26
	I	OEt	SCHF ₂	Y7	Y17	Y27
	Me	O- <i>n</i> -Pr	CO ₂ Me	Y8	Y18	Y28
	Et	Ph	CO ₂ Et	Y9	Y19	Y29
25	Pr	O- <i>i</i> -Pr	CN	Y10	Y20	Y30
	<i>i</i> -Pr	SF ₅	Y1	Y11	Y21	Y31
	<i>t</i> -Bu	OCF ₃	Y2	Y12	Y22	Y32
	CF ₃	OCHF ₂	Y3	Y13	Y23	Y33

каждый R^s представляет собой CO₂⁻Li⁺; R^a представляет собой Me; R^b, R^d и R^e представляют собой H

	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>
	F	CH ₂ F	OCH ₂ CF ₃	Y4	Y14	Y24
	Cl	CHF ₂	SCF ₃	Y5	Y15	Y25
35	Br	OMe	SCF ₃	Y6	Y16	Y26
	I	OEt	SCHF ₂	Y7	Y17	Y27
	Me	O- <i>n</i> -Pr	CO ₂ Me	Y8	Y18	Y28
	Et	Ph	CO ₂ Et	Y9	Y19	Y29
40	Pr	O- <i>i</i> -Pr	CN	Y10	Y20	Y30
	<i>i</i> -Pr	SF ₅	Y1	Y11	Y21	Y31
	<i>t</i> -Bu	OCF ₃	Y2	Y12	Y22	Y32
	CF ₃	OCHF ₂	Y3	Y13	Y23	Y33

каждый R^s представляет собой CO₂⁻Li⁺; R^a представляет собой Me; R^b, R^c и R^e представляют собой H

	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	
	F	CH ₂ F	OCH ₂ CF ₃	Y4	Y14	Y24	Y34
	Cl	CHF ₂	SCF ₃	Y5	Y15	Y25	Y35
5	Br	OMe	SCF ₃	Y6	Y16	Y26	Y36
	I	OEt	SCHF ₂	Y7	Y17	Y27	Y37
	Me	O- <i>n</i> -Pr	CO ₂ Me	Y8	Y18	Y28	Y38
	Et	Ph	CO ₂ Et	Y9	Y19	Y29	Y39
	Pr	O- <i>i</i> -Pr	CN	Y10	Y20	Y30	Y40
10	<i>i</i> -Pr	SF ₅	Y1	Y11	Y21	Y31	Y41
	<i>t</i> -Bu	OCF ₃	Y2	Y12	Y22	Y32	
	CF ₃	OCHF ₂	Y3	Y13	Y23	Y33	

каждый R^s представляет собой CO₂⁻Li⁺; R^a представляет собой Me; R^b, R^c и R^d представляют собой H

	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>
	F	CH ₂ F	OCH ₂ CF ₃	Y4	Y14	Y24	Y34
	Cl	CHF ₂	SCF ₃	Y5	Y15	Y25	Y35
20	Br	OMe	SCF ₃	Y6	Y16	Y26	Y36
	I	OEt	SCHF ₂	Y7	Y17	Y27	Y37
	Me	O- <i>n</i> -Pr	CO ₂ Me	Y8	Y18	Y28	Y38
	Et	Ph	CO ₂ Et	Y9	Y19	Y29	Y39
25	Pr	O- <i>i</i> -Pr	CN	Y10	Y20	Y30	Y40
	<i>i</i> -Pr	SF ₅	Y1	Y11	Y21	Y31	Y41
	<i>t</i> -Bu	OCF ₃	Y2	Y12	Y22	Y32	
	CF ₃	OCHF ₂	Y3	Y13	Y23	Y33	

каждый R^s представляет собой CO₂⁻Li⁺; R^d представляет собой Cl; R^a, R^c и R^e представляют собой H

	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	
	F	CH ₂ F	OCH ₂ CF ₃	Y4	Y14	Y24	Y34
	Cl	CHF ₂	SCF ₃	Y5	Y15	Y25	Y35
35	Br	OMe	SCF ₃	Y6	Y16	Y26	Y36
	I	OEt	SCHF ₂	Y7	Y17	Y27	Y37
	Me	O- <i>n</i> -Pr	CO ₂ Me	Y8	Y18	Y28	Y38
	Et	Ph	CO ₂ Et	Y9	Y19	Y29	Y39
40	Pr	O- <i>i</i> -Pr	CN	Y10	Y20	Y30	Y40
	<i>i</i> -Pr	SF ₅	Y1	Y11	Y21	Y31	Y41
	<i>t</i> -Bu	OCF ₃	Y2	Y12	Y22	Y32	
	CF ₃	OCHF ₂	Y3	Y13	Y23	Y33	

каждый R^s представляет собой CO₂⁻Li⁺; R^d представляет собой CF₃; R^a, R^c и R^e представляют собой H

	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>
	F	CH ₂ F	OCH ₂ CF ₃	Y4	Y14	Y24
	Cl	CHF ₂	SCF ₃	Y5	Y15	Y25
5	Br	OMe	SCF ₃	Y6	Y16	Y26
	I	OEt	SCHF ₂	Y7	Y17	Y27
	Me	O- <i>n</i> -Pr	CO ₂ Me	Y8	Y18	Y28
	Et	Ph	CO ₂ Et	Y9	Y19	Y29
10	Pr	O- <i>i</i> -Pr	CN	Y10	Y20	Y30
	<i>i</i> -Pr	SF ₅	Y1	Y11	Y21	Y31
	<i>t</i> -Bu	OCF ₃	Y2	Y12	Y22	Y32
	CF ₃	OCHF ₂	Y3	Y13	Y23	Y33

каждый R^s представляет собой CO₂⁻Li⁺; R^b представляет собой Br; R^a, R^c и R^e представляют собой H

	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
	F	CH ₂ F	OCH ₂ CF ₃	Y4	Y14	Y24
	Cl	CHF ₂	SCF ₃	Y5	Y15	Y25
20	Br	OMe	SCF ₃	Y6	Y16	Y26
	I	OEt	SCHF ₂	Y7	Y17	Y27
	Me	O- <i>n</i> -Pr	CO ₂ Me	Y8	Y18	Y28
	Et	Ph	CO ₂ Et	Y9	Y19	Y29
25	Pr	O- <i>i</i> -Pr	CN	Y10	Y20	Y30
	<i>i</i> -Pr	SF ₅	Y1	Y11	Y21	Y31
	<i>t</i> -Bu	OCF ₃	Y2	Y12	Y22	Y32
	CF ₃	OCHF ₂	Y3	Y13	Y23	Y33

каждый R^s представляет собой CO₂⁻Li⁺; R^b представляет собой OCF₃; R^a, R^c и R^e представляют собой H

	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
	F	CH ₂ F	OCH ₂ CF ₃	Y4	Y14	Y24
	Cl	CHF ₂	SCF ₃	Y5	Y15	Y25
35	Br	OMe	SCF ₃	Y6	Y16	Y26
	I	OEt	SCHF ₂	Y7	Y17	Y27
	Me	O- <i>n</i> -Pr	CO ₂ Me	Y8	Y18	Y28
	Et	Ph	CO ₂ Et	Y9	Y19	Y29
40	Pr	O- <i>i</i> -Pr	CN	Y10	Y20	Y30
	<i>i</i> -Pr	SF ₅	Y1	Y11	Y21	Y31
	<i>t</i> -Bu	OCF ₃	Y2	Y12	Y22	Y32
	CF ₃	OCHF ₂	Y3	Y13	Y23	Y33

каждый R^s представляет собой CO₂⁻Li⁺; R^b представляет собой OMe; R^a, R^c и R^e представляют собой H

	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
	F	CH ₂ F	OCH ₂ CF ₃	Y4	Y14	Y24	Y34
	Cl	CHF ₂	SCF ₃	Y5	Y15	Y25	Y35
5	Br	OMe	SCF ₃	Y6	Y16	Y26	Y36
	I	OEt	SCHF ₂	Y7	Y17	Y27	Y37
	Me	O- <i>n</i> -Pr	CO ₂ Me	Y8	Y18	Y28	Y38
	Et	Ph	CO ₂ Et	Y9	Y19	Y29	Y39
10	Pr	O- <i>i</i> -Pr	CN	Y10	Y20	Y30	Y40
	<i>i</i> -Pr	SF ₅	Y1	Y11	Y21	Y31	Y41
	<i>t</i> -Bu	OCF ₃	Y2	Y12	Y22	Y32	
	CF ₃	OCHF ₂	Y3	Y13	Y23	Y33	

каждый R^s представляет собой CO₂⁻Li⁺; R^b представляет собой F; R^a, R^c и R^e
 15 представляют собой H

	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
	F	CH ₂ F	OCH ₂ CF ₃	Y4	Y14	Y24	Y34
	Cl	CHF ₂	SCF ₃	Y5	Y15	Y25	Y35
20	Br	OMe	SCF ₃	Y6	Y16	Y26	Y36
	I	OEt	SCHF ₂	Y7	Y17	Y27	Y37
	Me	O- <i>n</i> -Pr	CO ₂ Me	Y8	Y18	Y28	Y38
	Et	Ph	CO ₂ Et	Y9	Y19	Y29	Y39
25	Pr	O- <i>i</i> -Pr	CN	Y10	Y20	Y30	Y40
	<i>i</i> -Pr	SF ₅	Y1	Y11	Y21	Y31	Y41
	<i>t</i> -Bu	OCF ₃	Y2	Y12	Y22	Y32	
	CF ₃	OCHF ₂	Y3	Y13	Y23	Y33	

каждый R^s представляет собой CO₂⁻Li⁺; R^b представляет собой CN; R^a, R^c и R^e
 30 представляют собой H

	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
	F	CH ₂ F	OCH ₂ CF ₃	Y4	Y14	Y24	Y34
	Cl	CHF ₂	SCF ₃	Y5	Y15	Y25	Y35
35	Br	OMe	SCF ₃	Y6	Y16	Y26	Y36
	I	OEt	SCHF ₂	Y7	Y17	Y27	Y37
	Me	O- <i>n</i> -Pr	CO ₂ Me	Y8	Y18	Y28	Y38
	Et	Ph	CO ₂ Et	Y9	Y19	Y29	Y39
40	Pr	O- <i>i</i> -Pr	CN	Y10	Y20	Y30	Y40
	<i>i</i> -Pr	SF ₅	Y1	Y11	Y21	Y31	Y41
	<i>t</i> -Bu	OCF ₃	Y2	Y12	Y22	Y32	
	CF ₃	OCHF ₂	Y3	Y13	Y23	Y33	

каждый R^s представляет собой CO₂⁻Li⁺; R^b представляет собой Me; R^a, R^c и R^e
 45 представляют собой H

	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
	F	CH ₂ F	OCH ₂ CF ₃	Y4	Y14	Y24
	Cl	CHF ₂	SCF ₃	Y5	Y15	Y25
5	Br	OMe	SCF ₃	Y6	Y16	Y26
	I	OEt	SCHF ₂	Y7	Y17	Y27
	Me	O- <i>n</i> -Pr	CO ₂ Me	Y8	Y18	Y28
	Et	Ph	CO ₂ Et	Y9	Y19	Y29
10	Pr	O- <i>i</i> -Pr	CN	Y10	Y20	Y30
	<i>i</i> -Pr	SF ₅	Y1	Y11	Y21	Y31
	<i>t</i> -Bu	OCF ₃	Y2	Y12	Y22	Y32
	CF ₃	OCHF ₂	Y3	Y13	Y23	Y33

каждый R^s представляет собой CO₂⁻Li⁺; R^b представляет собой I; R^a, R^c и R^e представляют собой H

	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
	F	CH ₂ F	OCH ₂ CF ₃	Y4	Y14	Y24
	Cl	CHF ₂	SCF ₃	Y5	Y15	Y25
20	Br	OMe	SCF ₃	Y6	Y16	Y26
	I	OEt	SCHF ₂	Y7	Y17	Y27
	Me	O- <i>n</i> -Pr	CO ₂ Me	Y8	Y18	Y28
	Et	Ph	CO ₂ Et	Y9	Y19	Y29
25	Pr	O- <i>i</i> -Pr	CN	Y10	Y20	Y30
	<i>i</i> -Pr	SF ₅	Y1	Y11	Y21	Y31
	<i>t</i> -Bu	OCF ₃	Y2	Y12	Y22	Y32
	CF ₃	OCHF ₂	Y3	Y13	Y23	Y33

каждый R^s представляет собой CO₂⁻Li⁺; R^a и R^b представляют собой F; R^c и R^e представляют собой H

	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
	F	CH ₂ F	OCH ₂ CF ₃	Y4	Y14	Y24
	Cl	CHF ₂	SCF ₃	Y5	Y15	Y25
35	Br	OMe	SCF ₃	Y6	Y16	Y26
	I	OEt	SCHF ₂	Y7	Y17	Y27
	Me	O- <i>n</i> -Pr	CO ₂ Me	Y8	Y18	Y28
	Et	Ph	CO ₂ Et	Y9	Y19	Y29
40	Pr	O- <i>i</i> -Pr	CN	Y10	Y20	Y30
	<i>i</i> -Pr	SF ₅	Y1	Y11	Y21	Y31
	<i>t</i> -Bu	OCF ₃	Y2	Y12	Y22	Y32
	CF ₃	OCHF ₂	Y3	Y13	Y23	Y33

каждый R^s представляет собой CO₂⁻Li⁺; R^a представляет собой F; R^b представляет собой Cl; R^c и R^e представляют собой H

	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
	F	CH ₂ F	OCH ₂ CF ₃	Y4	Y14	Y24
	Cl	CHF ₂	SCF ₃	Y5	Y15	Y25
5	Br	OMe	SCF ₃	Y6	Y16	Y26
	I	OEt	SCHF ₂	Y7	Y17	Y27
	Me	O- <i>n</i> -Pr	CO ₂ Me	Y8	Y18	Y28
	Et	Ph	CO ₂ Et	Y9	Y19	Y29
10	Pr	O- <i>i</i> -Pr	CN	Y10	Y20	Y30
	<i>i</i> -Pr	SF ₅	Y1	Y11	Y21	Y31
	<i>t</i> -Bu	OCF ₃	Y2	Y12	Y22	Y32
	CF ₃	OCHF ₂	Y3	Y13	Y23	Y33

15 R^s представляет собой CO₂⁻Li⁺; R^c представляет собой OMe; R^a, R^b и R^e представляют собой H

	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
	F	CH ₂ F	OCH ₂ CF ₃	Y4	Y14	Y24
	Cl	CHF ₂	SCF ₃	Y5	Y15	Y25
20	Br	OMe	SCF ₃	Y6	Y16	Y26
	I	OEt	SCHF ₂	Y7	Y17	Y27
	Me	O- <i>n</i> -Pr	CO ₂ Me	Y8	Y18	Y28
	Et	Ph	CO ₂ Et	Y9	Y19	Y29
25	Pr	O- <i>i</i> -Pr	CN	Y10	Y20	Y30
	<i>i</i> -Pr	SF ₅	Y1	Y11	Y21	Y31
	<i>t</i> -Bu	OCF ₃	Y2	Y12	Y22	Y32
	CF ₃	OCHF ₂	Y3	Y13	Y23	Y33

30 каждый R^s представляет собой CO₂⁻Li⁺; R^c представляет собой Me; R^a, R^b и R^e представляют собой H

	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
	F	CH ₂ F	OCH ₂ CF ₃	Y4	Y14	Y24
	Cl	CHF ₂	SCF ₃	Y5	Y15	Y25
35	Br	OMe	SCF ₃	Y6	Y16	Y26
	I	OEt	SCHF ₂	Y7	Y17	Y27
	Me	O- <i>n</i> -Pr	CO ₂ Me	Y8	Y18	Y28
	Et	Ph	CO ₂ Et	Y9	Y19	Y29
40	Pr	O- <i>i</i> -Pr	CN	Y10	Y20	Y30
	<i>i</i> -Pr	SF ₅	Y1	Y11	Y21	Y31
	<i>t</i> -Bu	OCF ₃	Y2	Y12	Y22	Y32
	CF ₃	OCHF ₂	Y3	Y13	Y23	Y33

45 каждый R^s представляет собой CO₂⁻Li⁺; R^c представляет собой F; R^a, R^b и R^e представляют собой H

	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	
5	F	CH ₂ F	OCH ₂ CF ₃	Y4	Y14	Y24	Y34
	Cl	CHF ₂	SCF ₃	Y5	Y15	Y25	Y35
	Br	OMe	SCF ₃	Y6	Y16	Y26	Y36
	I	OE _t	SCHF ₂	Y7	Y17	Y27	Y37
	Me	O- <i>n</i> -Pr	CO ₂ Me	Y8	Y18	Y28	Y38
10	Et	Ph	CO ₂ Et	Y9	Y19	Y29	Y39
	Pr	O- <i>i</i> -Pr	CN	Y10	Y20	Y30	Y40
	<i>i</i> -Pr	SF ₅	Y1	Y11	Y21	Y31	Y41
	<i>t</i> -Bu	OCF ₃	Y2	Y12	Y22	Y32	
	CF ₃	OCHF ₂	Y3	Y13	Y23	Y33	

каждый R^s представляет собой CO₂⁻Li⁺; R^c представляет собой Cl; R^a, R^b и R^e представляют собой H

	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
	F	CH ₂ F	OCH ₂ CF ₃	Y4	Y14	Y24	Y34
	Cl	CHF ₂	SCF ₃	Y5	Y15	Y25	Y35
20	Br	OMe	SCF ₃	Y6	Y16	Y26	Y36
	I	OE _t	SCHF ₂	Y7	Y17	Y27	Y37
	Me	O- <i>n</i> -Pr	CO ₂ Me	Y8	Y18	Y28	Y38
	Et	Ph	CO ₂ Et	Y9	Y19	Y29	Y39
25	Pr	O- <i>i</i> -Pr	CN	Y10	Y20	Y30	Y40
	<i>i</i> -Pr	SF ₅	Y1	Y11	Y21	Y31	Y41
	<i>t</i> -Bu	OCF ₃	Y2	Y12	Y22	Y32	
	CF ₃	OCHF ₂	Y3	Y13	Y23	Y33	

каждый R^s представляет собой CO₂⁻Li⁺; R^a и R^e представляют собой F; R^c и R^d представляют собой H

	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>
	F	CH ₂ F	OCH ₂ CF ₃	Y4	Y14	Y24	Y34
	Cl	CHF ₂	SCF ₃	Y5	Y15	Y25	Y35
35	Br	OMe	SCF ₃	Y6	Y16	Y26	Y36
	I	OE _t	SCHF ₂	Y7	Y17	Y27	Y37
	Me	O- <i>n</i> -Pr	CO ₂ Me	Y8	Y18	Y28	Y38
	Et	Ph	CO ₂ Et	Y9	Y19	Y29	Y39
40	Pr	O- <i>i</i> -Pr	CN	Y10	Y20	Y30	Y40
	<i>i</i> -Pr	SF ₅	Y1	Y11	Y21	Y31	Y41
	<i>t</i> -Bu	OCF ₃	Y2	Y12	Y22	Y32	
	CF ₃	OCHF ₂	Y3	Y13	Y23	Y33	

ТАБЛИЦА I-2

Таблица I-2 идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^s представляет собой CO₂⁻Li⁺” в каждой строке заголовка заменяется фразой “R^s”

представляет собой CO_2^-Na^+ . Значения для R^a , R^b , R^c , R^d и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-3

Таблица I-3 идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^s представляет собой CO_2^-Li^+ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “каждый R^s представляет собой CO_2^-K^+ ”. Значения для R^a , R^b , R^c , R^d и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-4

Таблица I-4 идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^s представляет собой CO_2^-Li^+ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “каждый R^s представляет собой $\text{CO}_2^-\text{NH}_4^+$ ”. Значения для R^a , R^b , R^c , R^d и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-5

Таблица I-5 идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^s представляет собой CO_2^-Li^+ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “каждый R^s представляет собой $\text{CO}_2^-[\text{1/2 Ca}]^+$ ”. Значения для R^a , R^b , R^c , R^d и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-6

Таблица I-6 идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^s представляет собой CO_2^-Li^+ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “каждый R^s представляет собой $\text{CO}_2^-[\text{1/2 Ba}]^+$ ”. Значения для R^a , R^b , R^c , R^d и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-7

Таблица I-7 идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^s представляет собой CO_2^-Li^+ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “каждый R^s представляет собой $\text{CO}_2^-[\text{NH}(\text{Me})_3]^+$ ”. Значения для R^a , R^b , R^c , R^d и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-8

Таблица I-8 идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^s представляет собой CO_2^-Li^+ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “каждый R^s представляет собой $\text{CO}_2^-[\text{NH}(\text{Et})_3]^+$ ”. Значения для R^a , R^b , R^c , R^d и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-9

Таблица I-9 идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^s представляет собой CO_2^-Li^+ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “каждый R^s представляет собой $\text{CO}_2^-[\text{NH}(\text{n-Bu})_3]^+$ ”. Значения для R^a , R^b , R^c , R^d и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-10

Таблица I-10 идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^S представляет собой CO_2Li^+ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “каждый R^S представляет собой $CO_2[NH_2(Ph)_2]^+$ ”. Значения для R^a, R^b, R^c, R^d и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-11

Таблица I-11 идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^S представляет собой CO_2Li^+ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “каждый R^S представляет собой $CO_2[NH_2(Bn)_2]^+$ ”. Значения для R^a, R^b, R^c, R^d и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-12

Таблица I-12 идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^S представляет собой CO_2Li^+ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “каждый R^S представляет собой $CO_2[NH_2(c-Hex)_2]^+$ ”. Значения для R^a, R^b, R^c, R^d и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-13

Таблица I-13 идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^S представляет собой CO_2Li^+ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “каждый R^S представляет собой $CO_2[NH_2(Me)_2]^+$ ”. Значения для R^a, R^b, R^c, R^d и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-14

Таблица I-14 идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^S представляет собой CO_2Li^+ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “каждый R^S представляет собой $CO_2[NH_2(Et)_2]^+$ ”. Значения для R^a, R^b, R^c, R^d и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-15

Таблица I-15 идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^S представляет собой CO_2Li^+ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “каждый R^S представляет собой $CO_2[NHEt(i-Pr)_2]^+$ ”. Значения для R^a, R^b, R^c, R^d и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-1A

Таблица I-1A идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^S представляет собой CO_2Li^+ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^S представляет собой CO_2Li^+ , а другой R^S представляет собой CO_2Na^+ ”. Значения для R^a, R^b, R^c, R^d и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-2A

Таблица I-2A идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^S

представляет собой CO_2Li^{+} в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^{S} представляет собой CO_2K^{+} , а другой R^{S} представляет собой CO_2Na^{+} ”. Значения для $\text{R}^{\text{a}}, \text{R}^{\text{b}}, \text{R}^{\text{c}}, \text{R}^{\text{d}}$ и R^{e} , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-3A

Таблица I-3A идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^{S} представляет собой CO_2Li^{+} в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^{S} представляет собой $\text{CO}_2\text{NH}_4^{+}$, а другой R^{S} представляет собой CO_2Na^{+} ”. Значения для $\text{R}^{\text{a}}, \text{R}^{\text{b}}, \text{R}^{\text{c}}, \text{R}^{\text{d}}$ и R^{e} , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-4A

Таблица I-4A идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^{S} представляет собой CO_2Li^{+} в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^{S} представляет собой $\text{CO}_2[1/2 \text{Ca}]^{+}$, а другой R^{S} представляет собой CO_2Na^{+} ”. Значения для $\text{R}^{\text{a}}, \text{R}^{\text{b}}, \text{R}^{\text{c}}, \text{R}^{\text{d}}$ и R^{e} , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-5A

Таблица I-5A идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^{S} представляет собой CO_2Li^{+} в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^{S} представляет собой $\text{CO}_2[1/2 \text{Ba}]^{+}$, а другой R^{S} представляет собой CO_2Na^{+} ”. Значения для $\text{R}^{\text{a}}, \text{R}^{\text{b}}, \text{R}^{\text{c}}, \text{R}^{\text{d}}$ и R^{e} , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-6A

Таблица I-6A идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^{S} представляет собой CO_2Li^{+} в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^{S} представляет собой $\text{CO}_2[\text{NH}(\text{Me})_3]^{+}$, а другой R^{S} представляет собой CO_2Na^{+} ”. Значения для $\text{R}^{\text{a}}, \text{R}^{\text{b}}, \text{R}^{\text{c}}, \text{R}^{\text{d}}$ и R^{e} , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-7A

Таблица I-7A идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^{S} представляет собой CO_2Li^{+} в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^{S} представляет собой $\text{CO}_2[\text{NH}(\text{Et})_3]^{+}$, а другой R^{S} представляет собой CO_2Na^{+} ”. Значения для $\text{R}^{\text{a}}, \text{R}^{\text{b}}, \text{R}^{\text{c}}, \text{R}^{\text{d}}$ и R^{e} , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-8A

Таблица I-8A идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^{S} представляет собой CO_2Li^{+} в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^{S}

представляет собой $\text{CO}_2^-[\text{NH}(\text{n-Bu})_3]^+$, а другой R^s представляет собой $\text{CO}_2^- \text{Na}^+$. Значения для $\text{R}^a, \text{R}^b, \text{R}^c, \text{R}^d$ и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-9A

Таблица I-9A идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^s представляет собой $\text{CO}_2^- \text{Li}^+$ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^s представляет собой $\text{CO}_2^-[\text{NH}_2(\text{Ph})_2]^+$, а другой R^s представляет собой $\text{CO}_2^- \text{Na}^+$ ”. Значения для $\text{R}^a, \text{R}^b, \text{R}^c, \text{R}^d$ и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-10A

Таблица I-10A идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^s представляет собой $\text{CO}_2^- \text{Li}^+$ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^s представляет собой $\text{CO}_2^-[\text{NH}_2(\text{Bn})_2]^+$, а другой R^s представляет собой $\text{CO}_2^- \text{Na}^+$ ”. Значения для $\text{R}^a, \text{R}^b, \text{R}^c, \text{R}^d$ и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-11A

Таблица I-11A идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^s представляет собой $\text{CO}_2^- \text{Li}^+$ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^s представляет собой $\text{CO}_2^-[\text{NH}_2(\text{c-Hex})_2]^+$, а другой R^s представляет собой $\text{CO}_2^- \text{Na}^+$ ”. Значения для $\text{R}^a, \text{R}^b, \text{R}^c, \text{R}^d$ и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-12A

Таблица I-12A идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^s представляет собой $\text{CO}_2^- \text{Li}^+$ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^s представляет собой $\text{CO}_2^-[\text{NH}_2(\text{Me})_2]^+$, а другой R^s представляет собой $\text{CO}_2^- \text{Na}^+$ ”. Значения для $\text{R}^a, \text{R}^b, \text{R}^c, \text{R}^d$ и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-13A

Таблица I-13A идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^s представляет собой $\text{CO}_2^- \text{Li}^+$ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^s представляет собой $\text{CO}_2^-[\text{NH}_2(\text{Et})_2]^+$, а другой R^s представляет собой $\text{CO}_2^- \text{Na}^+$ ”. Значения для $\text{R}^a, \text{R}^b, \text{R}^c, \text{R}^d$ и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-14A

Таблица I-14A идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^s представляет собой $\text{CO}_2^- \text{Li}^+$ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^s представляет собой $\text{CO}_2^-[\text{NH}(\text{i-Pr})_2]^+$, а другой R^s представляет собой $\text{CO}_2^- \text{Na}^+$ ”.

Значения для R^a , R^b , R^c , R^d и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-1В

Таблица I-1В идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^s представляет собой CO_2Li^+ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^s представляет собой CO_2Li^+ , а другой R^s представляет собой CO_2K^+ ”. Значения для R^a , R^b , R^c , R^d и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-2В

Таблица I-2В идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^s представляет собой CO_2Li^+ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^s представляет собой CO_2Na^+ , а другой R^s представляет собой CO_2K^+ ”. Значения для R^a , R^b , R^c , R^d и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-3В

Таблица I-3В идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^s представляет собой CO_2Li^+ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^s представляет собой CO_2NH_4^+ , а другой R^s представляет собой CO_2K^+ ”. Значения для R^a , R^b , R^c , R^d и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-4В

Таблица I-4В идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^s представляет собой CO_2Li^+ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^s представляет собой $\text{CO}_2[1/2 \text{Ca}]^+$, а другой R^s представляет собой CO_2K^+ ”. Значения для R^a , R^b , R^c , R^d и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-5В

Таблица I-5В идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^s представляет собой CO_2Li^+ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^s представляет собой $\text{CO}_2[1/2 \text{Ba}]^+$, а другой R^s представляет собой CO_2K^+ ”. Значения R^a , R^b , R^c и R^d , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-6В

Таблица I-6В идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^s представляет собой CO_2Li^+ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^s представляет собой $\text{CO}_2[\text{NH}(\text{Me})_3]^+$, а другой R^s представляет собой CO_2K^+ ”. Значения для R^a , R^b , R^c , R^d и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-7B

Таблица I-7B идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^s представляет собой $CO_2^-Li^+$ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^s представляет собой $CO_2^-[NH(Et)_3]^+$, а другой R^s представляет собой $CO_2^-K^+$ ”. Значения для R^a, R^b, R^c, R^d и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-8B

Таблица I-8B идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^s представляет собой $CO_2^-Li^+$ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^s представляет собой $CO_2^-[NH(n-Bu)_3]^+$, а другой R^s представляет собой $CO_2^-K^+$ ”. Значения для R^a, R^b, R^c, R^d и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-9B

Таблица I-9B идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^s представляет собой $CO_2^-Li^+$ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^s представляет собой $CO_2^-[NH_2(Ph)_2]^+$, а другой R^s представляет собой $CO_2^-K^+$ ”. Значения для R^a, R^b, R^c, R^d и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-10B

Таблица I-10B идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^s представляет собой $CO_2^-Li^+$ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^s представляет собой $CO_2^-[NH_2(Bn)_2]^+$, а другой R^s представляет собой $CO_2^-K^+$ ”. Значения для R^a, R^b, R^c, R^d и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-11B

Таблица I-11B идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^s представляет собой $CO_2^-Li^+$ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^s представляет собой $CO_2^-[NH_2(c-Hex)_2]^+$, а другой R^s представляет собой $CO_2^-K^+$ ”. Значения для R^a, R^b, R^c, R^d и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-12B

Таблица I-12B идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^s представляет собой $CO_2^-Li^+$ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^s представляет собой $CO_2^-[NH_2(Me)_2]^+$, а другой R^s представляет собой $CO_2^-K^+$ ”. Значения для R^a, R^b, R^c, R^d и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-13B

Таблица I-13В идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^S представляет собой $CO_2^-Li^+$ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^S представляет собой $CO_2^-[NH_2(Et)_2]^+$, а другой R^S представляет собой $CO_2^-K^+$ ”. Значения для R^a, R^b, R^c, R^d и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-14В

Таблица I-14В идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^S представляет собой $CO_2^-Li^+$ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^S представляет собой $CO_2^-[NH_2(i-Pr)_2]^+$, а другой R^S представляет собой $CO_2^-K^+$ ”. Значения для R^a, R^b, R^c, R^d и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-1С

Таблица I-1С идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^S представляет собой $CO_2^-Li^+$ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^S представляет собой $CO_2^-Li^+$, а другой R^S представляет собой $CO_2^-[1/2 Ca]^+$ ”. Значения для R^a, R^b, R^c, R^d и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-2С

Таблица I-2С идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^S представляет собой $CO_2^-Li^+$ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^S представляет собой $CO_2^-K^+$, а другой R^S представляет собой $CO_2^-[1/2 Ca]^+$ ”. Значения для R^a, R^b, R^c, R^d и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-3С

Таблица I-3С идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^S представляет собой $CO_2^-Li^+$ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^S представляет собой $CO_2^-NH_4^+$, а другой R^S представляет собой $CO_2^-[1/2 Ca]^+$ ”. Значения для R^a, R^b, R^c, R^d и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-4С

Таблица I-4С идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^S представляет собой $CO_2^-Li^+$ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^S представляет собой $CO_2^-Na^+$, а другой R^S представляет собой $CO_2^-[1/2 Ca]^+$ ”. Значения для R^a, R^b, R^c, R^d и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-5С

Таблица I-5С идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^S

представляет собой CO_2Li^{+} в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^{S} представляет собой $\text{CO}_2\text{[1/2 Ba]}^{+}$, а другой R^{S} представляет собой $\text{CO}_2\text{[1/2 Ca]}^{+}$ ”.

Значения для R^{a} , R^{b} , R^{c} , R^{d} и R^{e} , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-6C

Таблица I-6C идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^{S} представляет собой CO_2Li^{+} ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^{S} представляет собой $\text{CO}_2\text{[NH(Me)}_3\text{]}^{+}$, а другой R^{S} представляет собой $\text{CO}_2\text{[1/2 Ca]}^{+}$ ”.

Значения для R^{a} , R^{b} , R^{c} , R^{d} и R^{e} , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-7C

Таблица I-7C идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^{S} представляет собой CO_2Li^{+} ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^{S} представляет собой $\text{CO}_2\text{[NH(Et)}_3\text{]}^{+}$, а другой R^{S} представляет собой $\text{CO}_2\text{[1/2 Ca]}^{+}$ ”.

Значения для R^{a} , R^{b} , R^{c} , R^{d} и R^{e} , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-8C

Таблица I-8C идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^{S} представляет собой CO_2Li^{+} ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^{S} представляет собой $\text{CO}_2\text{[NH(n-Bu)}_3\text{]}^{+}$, а другой R^{S} представляет собой $\text{CO}_2\text{[1/2 Ca]}^{+}$ ”.

Значения для R^{a} , R^{b} , R^{c} , R^{d} и R^{e} , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-9C

Таблица I-9C идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^{S} представляет собой CO_2Li^{+} ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^{S} представляет собой $\text{CO}_2\text{[NH}_2\text{(Ph)}_2\text{]}^{+}$, а другой R^{S} представляет собой $\text{CO}_2\text{[1/2 Ca]}^{+}$ ”.

Значения для R^{a} , R^{b} , R^{c} , R^{d} и R^{e} , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-10C

Таблица I-10C идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^{S} представляет собой CO_2Li^{+} ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^{S} представляет собой $\text{CO}_2\text{[NH}_2\text{(Bn)}_2\text{]}^{+}$, а другой R^{S} представляет собой $\text{CO}_2\text{[1/2 Ca]}^{+}$ ”.

Значения для R^{a} , R^{b} , R^{c} , R^{d} и R^{e} , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-11C

Таблица I-11C идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^{S} представляет собой CO_2Li^{+} ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^{S}

представляет собой $\text{CO}_2^-[\text{NH}_2(\text{с-Нex})_2]^+$, а другой R^s представляет собой $\text{CO}_2^-[1/2 \text{ Ca}]^{++}$.

Значения для $\text{R}^a, \text{R}^b, \text{R}^c, \text{R}^d$ и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-12C

Таблица I-12C идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^s представляет собой $\text{CO}_2^- \text{Li}^+$ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^s представляет собой $\text{CO}_2^-[\text{NH}_2(\text{Me})_2]^+$, а другой R^s представляет собой $\text{CO}_2^-[1/2 \text{ Ca}]^{++}$ ”.

Значения для $\text{R}^a, \text{R}^b, \text{R}^c, \text{R}^d$ и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-13C

Таблица I-13C идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^s представляет собой $\text{CO}_2^- \text{Li}^+$ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^s представляет собой $\text{CO}_2^-[\text{NH}_2(\text{Et})_2]^+$, а другой R^s представляет собой $\text{CO}_2^-[1/2 \text{ Ca}]^{++}$ ”.

Значения для $\text{R}^a, \text{R}^b, \text{R}^c, \text{R}^d$ и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-14C

Таблица I-14C идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^s представляет собой $\text{CO}_2^- \text{Li}^+$ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^s представляет собой $\text{CO}_2^-[\text{NH}(\text{Et})(\text{i-Pr})_2]^+$, а другой R^s представляет собой $\text{CO}_2^-[1/2 \text{ Ca}]^{++}$ ”.

Значения для $\text{R}^a, \text{R}^b, \text{R}^c, \text{R}^d$ и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-1D

Таблица I-1D идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^s представляет собой $\text{CO}_2^- \text{Li}^+$ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^s представляет собой $\text{CO}_2^- \text{Li}^+$, а другой R^s представляет собой $\text{CO}_2^-[\text{NH}(\text{Et})_3]^+$ ”. Значения для $\text{R}^a, \text{R}^b, \text{R}^c, \text{R}^d$ и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-2D

Таблица I-2D идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^s представляет собой $\text{CO}_2^- \text{Li}^+$ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^s представляет собой $\text{CO}_2^- \text{K}^+$, а другой R^s представляет собой $\text{CO}_2^-[\text{NH}(\text{Et})_3]^+$ ”. Значения для $\text{R}^a, \text{R}^b, \text{R}^c, \text{R}^d$ и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-3D

Таблица I-3D идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^s представляет собой $\text{CO}_2^- \text{Li}^+$ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^s представляет собой $\text{CO}_2^- \text{NH}_4^+$, а другой R^s представляет собой $\text{CO}_2^-[\text{NH}(\text{Et})_3]^+$ ”. Значения

для R^a, R^b, R^c, R^d и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-4D

Таблица I-4D идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^s представляет собой $CO_2^-Li^+$ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^s представляет собой $CO_2^-[1/2 Ca]^+$, а другой R^s представляет собой $CO_2^-[NH(Et)_3]^+$ ”.

Значения для R^a, R^b, R^c, R^d и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-5D

Таблица I-5D идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^s представляет собой $CO_2^-Li^+$ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^s представляет собой $CO_2^-[1/2 Ba]^+$, а другой R^s представляет собой $CO_2^-[NH(Et)_3]^+$ ”.

Значения для R^a, R^b, R^c, R^d и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-6D

Таблица I-6D идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^s представляет собой $CO_2^-Li^+$ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^s представляет собой $CO_2^-[NH(Me)_3]^+$, а другой R^s представляет собой $CO_2^-[NH(Et)_3]^+$ ”.

Значения для R^a, R^b, R^c, R^d и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-7D

Таблица I-7D идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^s представляет собой $CO_2^-Li^+$ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^s представляет собой $CO_2^-Na^+$, а другой R^s представляет собой $CO_2^-[NH(Et)_3]^+$ ”. Значения для R^a, R^b, R^c, R^d и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-8D

Таблица I-8D идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^s представляет собой $CO_2^-Li^+$ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^s представляет собой $CO_2^-[NH(n-Bu)_3]^+$, а другой R^s представляет собой $CO_2^-[NH(Et)_3]^+$ ”.

Значения для R^a, R^b, R^c, R^d и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-9D

Таблица I-9D идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^s представляет собой $CO_2^-Li^+$ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^s представляет собой $CO_2^-[NH_2(Ph)_2]^+$, а другой R^s представляет собой $CO_2^-[NH(Et)_3]^+$ ”.

Значения для R^a, R^b, R^c, R^d и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице,

остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-10D

Таблица I-10D идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^S представляет собой $CO_2^-Li^+$ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^S представляет собой $CO_2^-[NH_2(Bn)_2]^+$, а другой R^S представляет собой $CO_2^-[NH(Et)_3]^+$ ”.

Значения для R^a , R^b , R^c , R^d и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-11D

Таблица I-11D идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^S представляет собой $CO_2^-Li^+$ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^S представляет собой $CO_2^-[NH_2(c-Hex)_2]^+$, а другой R^S представляет собой $CO_2^-[NH(Et)_3]^+$ ”.

Значения для R^a , R^b , R^c , R^d и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-12D

Таблица I-12D идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^S представляет собой $CO_2^-Li^+$ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^S представляет собой $CO_2^-[NH_2(Me)_2]^+$, а другой R^S представляет собой $CO_2^-[NH(Et)_3]^+$ ”.

Значения для R^a , R^b , R^c , R^d и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-13D

Таблица I-13D идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^S представляет собой $CO_2^-Li^+$ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^S представляет собой $CO_2^-[NH_2(Et)_2]^+$, а другой R^S представляет собой $CO_2^-[NH(Et)_3]^+$ ”.

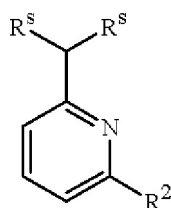
Значения для R^a , R^b , R^c , R^d и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-14D

Таблица I-14D идентична таблице I-1, за исключением того, что фраза “каждый R^S представляет собой $CO_2^-Li^+$ ” в каждой строке заголовка заменяется фразой “один R^S представляет собой $CO_2^-[NHEt(i-Pr)_2]^+$, а другой R^S представляет собой $CO_2^-[NH(Et)_3]^+$ ”.

Значения для R^a , R^b , R^c , R^d и R^e , фигурирующие в каждой строке заголовка или в таблице, остаются такими же.

ТАБЛИЦА I-15

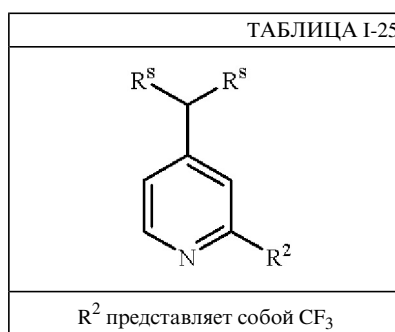


R² представляет собой CF₃

<u>R^s</u>	<u>R^s</u>	<u>R^s</u>
CO ₂ ⁻ Li ⁺	CO ₂ ⁻ [1/2 Ba] ⁺	CO ₂ ⁻ [NH ₂ (Bn) ₂] ⁺
CO ₂ ⁻ Na ⁺	CO ₂ ⁻ [NH(Me) ₃] ⁺	CO ₂ ⁻ [NH ₂ (<i>c</i> -Hex) ₂] ⁺
CO ₂ ⁻ K ⁺	CO ₂ ⁻ [NH(Et) ₃] ⁺	CO ₂ ⁻ [NH ₂ (Me) ₂] ⁺
CO ₂ ⁻ [NH ₄] ⁺	CO ₂ ⁻ [NH(<i>n</i> -Bu) ₃] ⁺	CO ₂ ⁻ [NH ₂ (Et) ₂] ⁺
CO ₂ ⁻ [1/2 Ca] ⁺	CO ₂ ⁻ [NH ₂ (Ph) ₂] ⁺	CO ₂ ⁻ [NH ₂ (<i>i</i> -Pr) ₂] ⁺

Таблица I-16 построена таким же образом, что и таблица I-15 за исключением того, что фраза “R² представляет собой CF₃” в строке заголовка заменяется фразой “R² представляет собой H”, как показано ниже для таблицы I-16. Таблицы I-17-I-24 построены подобным образом.

Таблица	R ² представляет собой
I-16	H
I-17	Cl
I-18	Br
I-19	I
I-20	2-хлор-4-(трифторметил)фенил
I-21	2-фтор-5-(трифторметил)фенил
I-22	2-хлор-4-цианофенил
I-23	2-фтор-4-цианофенил
I-24	3-хлор-5-трифторметил-2-пиридил



<u>R^s</u>	<u>R^s</u>	<u>R^s</u>
CO ₂ ⁻ Li ⁺	CO ₂ ⁻ [1/2 Ba] ⁺	CO ₂ ⁻ [NH ₂ (Bn) ₂] ⁺
CO ₂ ⁻ Na ⁺	CO ₂ ⁻ [NH(Me) ₃] ⁺	CO ₂ ⁻ [NH ₂ (<i>c</i> -Hex) ₂] ⁺
CO ₂ ⁻ K ⁺	CO ₂ ⁻ [NH(Et) ₃] ⁺	CO ₂ ⁻ [NH ₂ (Me) ₂] ⁺
CO ₂ ⁻ [NH ₄] ⁺	CO ₂ ⁻ [NH(<i>n</i> -Bu) ₃] ⁺	CO ₂ ⁻ [NH ₂ (Et) ₂] ⁺
CO ₂ ⁻ [1/2 Ca] ⁺	CO ₂ ⁻ [NH ₂ (Ph) ₂] ⁺	CO ₂ ⁻ [NH ₂ (<i>i</i> -Pr) ₂] ⁺

Таблица I-26 построена таким же образом, что и таблица I-25 за исключением того, что фраза “R² представляет собой CF₃” в строке заголовка заменяется фразой “R² представляет собой H”, как показано ниже для таблицы I-26. Таблицы I-27-I-34 построены подобным образом.

Таблица	R ² представляет собой
I-26	H

I-27	Cl
I-28	Br
I-29	I
I-30	2-хлор-4-(трифторметил)фенил
I-31	2-фтор-5-(трифторметил)фенил
I-32	2-хлор-4-цианофенил
I-33	2-фтор-4-цианофенил
I-34	3-хлор-5-трифторметил-2-пиридил

ТАБЛИЦА М-1



Каждый R^s представляет собой CO^+Li^- ; X представляет собой Cl ; и галогенирующим реагентом является $(COCl)_2$

	$(R^2)_m$	$(R^2)_m$	$(R^2)_m$	$(R^2)_m$
	2-F	3-OCF ₃	3-Y21	4- <i>i</i> -Pr
	2-Cl	3-OCHF ₂	3-Y22	4-OMe
5	2-Br	3-OCH ₂ F	3-Y23	4-OEt
	2-I	3-OCH ₂ CF ₃	3-Y24	4- <i>t</i> -Bu
	2-Me	3-SCF ₃	3-Y25	4-CF ₃
	2-Et	3-SCHF ₂	3-Y26	4-CH ₂ F
10	2- <i>n</i> -Pr	3-SCH ₂ F	3-Y27	4-CHF ₂
	2-CN	3-CN	3-Y28	4-O- <i>n</i> -Pr
	2-OMe	3-Y1	3-Y29	4-Ph
	2-OEt	3-Y2	3-Y30	4-O- <i>i</i> -Pr
15	3-F	3-Y3	3-Y31	4-SF ₅
	3-Cl	3-Y4	3-Y32	4-OCF ₃
	3-Br	3-Y5	3-Y33	4-OCHF ₂
	3-I	3-Y6	3-Y34	4-OCH ₂ F
	3-Me	3-Y7	3-Y35	4-OCH ₂ CF ₃
20	3-Et	3-Y8	3-Y36	4-SCF ₃
	3- <i>n</i> -Pr	3-Y9	3-Y37	4-SCHF ₂
	3- <i>i</i> -Pr	3-Y10	3-Y38	4-SCH ₂ F
	3-OMe	3-Y11	3-Y39	4-CN
25	3-OEt	3-Y12	3-Y40	2,3-di-F
	3- <i>t</i> -Bu	3-Y13	3-Y41	2-F-3-Cl
	3-CF ₃	3-Y14	4-F	2-F-3-Br
	3-CH ₂ F	3-Y15	4-Cl	2-F-3-I
	3-CHF ₂	3-Y16	4-Br	2-F-3-Me
30	3-O- <i>n</i> -Pr	3-Y17	4-I	2-F-3-Et
	3-Ph	3-Y18	4-Me	2-F-3- <i>n</i> -Pr
	3-O- <i>i</i> -Pr	3-Y19	4-Et	2-F-3- <i>i</i> -Pr
	3-SF ₅	3-Y20	4- <i>n</i> -Pr	2-F-3-OMe

	$(R^2)_m$	$(R^2)_m$	$(R^2)_m$	$(R^2)_m$
5	2-F-3-OEt	2-F-3-Y21	2-F-4-O- <i>i</i> -Pr	2-F-5-Y2
	2-F-3- <i>t</i> -Bu	2-F-3-Y22	2-F-4-SF ₅	2-F-5-Y3
	2-F-3-CF ₃	2-F-3-Y23	2-F-4-OCF ₃	2-F-5-Y4
	2-F-3-CH ₂ F	2-F-3-Y24	2-F-4-OCHF ₂	2-F-5-Y5
	2-F-3-CHF ₂	2-F-3-Y25	2-F-4-OCH ₂ F	2-F-5-Y6
10	2-F-3-O- <i>n</i> -Pr	2-F-3-Y26	2-F-4-OCH ₂ CF ₃	2-F-5-Y7
	2-F-3-Ph	2-F-3-Y27	2-F-4-SCF ₃	2-F-5-Y8
	2-F-3-O- <i>i</i> -Pr	2-F-3-Y28	2-F-4-SCHF ₂	2-F-5-Y9
	2-F-3-SF ₅	2-F-3-Y29	2-F-4-SCH ₂ F	2-F-5-Y10
	2-F-3-OCF ₃	2-F-3-Y30	2-F-4-CN	2-F-5-Y11
15	2-F-3-OCHF ₂	2-F-3-Y31	2,5- di -F	2-F-5-Y12
	2-F-3-OCH ₂ F	2-F-3-Y32	2-F-5-Cl	2-F-5-Y13
	2-F-3-OCH ₂ CF ₃	2-F-3-Y33	2-F-5-Br	2-F-5-Y14
	2-F-3-SCF ₃	2-F-3-Y34	2-F-5-I	2-F-5-Y15
	2-F-3-SCHF ₂	2-F-3-Y35	2-F-5-Me	2-F-5-Y16
20	2-F-3-SCH ₂ F	2-F-3-Y36	2-F-5-Et	2-F-5-Y17
	2-F-3-CN	2-F-3-Y37	2-F-5- <i>n</i> -Pr	2-F-5-Y18
	2-F-3-Y1	2-F-3-Y38	2-F-5- <i>i</i> -Pr	2-F-5-Y19
	2-F-3-Y2	2-F-3-Y39	2-F-5-OMe	2-F-5-Y20
	2-F-3-Y3	2-F-3-Y40	2-F-5-OEt	2-F-5-Y21
25	2-F-3-Y4	2-F-3-Y41	2-F-5- <i>t</i> -Bu	2-F-5-Y22
	2-F-3-Y5	2,4- di -F	2-F-5-CF ₃	2-F-5-Y23
	2-F-3-Y6	2-F-4-Cl	2-F-5-CH ₂ F	2-F-5-Y24
	2-F-3-Y7	2-F-4-Br	2-F-5-CHF ₂	2-F-5-Y25
	2-F-3-Y8	2-F-4-I	2-F-5-O- <i>n</i> -Pr	2-F-5-Y26
30	2-F-3-Y9	2-F-4-Me	2-F-5-Ph	2-F-5-Y27
	2-F-3-Y10	2-F-4-Et	2-F-5-O- <i>i</i> -Pr	2-F-5-Y28
	2-F-3-Y11	2-F-4- <i>n</i> -Pr	2-F-5-SF ₅	2-F-5-Y29
	2-F-3-Y12	2-F-4- <i>i</i> -Pr	2-F-5-OCF ₃	2-F-5-Y30
	2-F-3-Y13	2-F-4-OMe	2-F-5-OCHF ₂	2-F-5-Y31
35	2-F-3-Y14	2-F-4-OEt	2-F-5-OCH ₂ F	2-F-5-Y32
	2-F-3-Y15	2-F-4- <i>t</i> -Bu	2-F-5-OCH ₂ CF ₃	2-F-5-Y33
	2-F-3-Y16	2-F-4-CF ₃	2-F-5-SCF ₃	2-F-5-Y34
	2-F-3-Y17	2-F-4-CH ₂ F	2-F-5-SCHF ₂	2-F-5-Y35
	2-F-3-Y18	2-F-4-CHF ₂	2-F-5-SCH ₂ F	2-F-5-Y36
40	2-F-3-Y19	2-F-4-O- <i>n</i> -Pr	2-F-5-CN	2-F-5-Y37
	2-F-3-Y20	2-F-4-Ph	2-F-5-Y1	2-F-5-Y38
45				

	$(R^2)_m$	$(R^2)_m$	$(R^2)_m$	$(R^2)_m$
5	2-F-5-Y39	2-MeO-3-SCH ₂ F	2-MeO-3-Y36	2-MeO-5-Et
	2-F-5-Y40	2-MeO-3-CN	2-MeO-3-Y37	2-MeO-5- <i>n</i> -Pr
	2-F-5-Y41	2-MeO-3-Y1	2-MeO-3-Y38	2-MeO-5- <i>i</i> -Pr
	2,6- <i>ди</i> -F	2-MeO-3-Y2	2-MeO-3-Y39	2,5- <i>ди</i> -OMe
	2-F-6-Cl	2-MeO-3-Y3	2-MeO-3-Y40	2-MeO-5-OEt
10	2-F-6-Br	2-MeO-3-Y4	2-MeO-3-Y41	2-MeO-5- <i>t</i> -Bu
	2-F-6-I	2-MeO-3-Y5	2-MeO-4-F	2-MeO-5-CF ₃
	2-F-6-Me	2-MeO-3-Y6	2-MeO-4-Cl	2-MeO-5-CH ₂ F
	2-F-6-Et	2-MeO-3-Y7	2-MeO-4-Br	2-MeO-5-CHF ₂
	2-F-6- <i>n</i> -Pr	2-MeO-3-Y8	2-MeO-4-I	2-MeO-5-O- <i>n</i> -Pr
15	2-F-6-CN	2-MeO-3-Y9	2-MeO-4-Me	2-MeO-5-Ph
	2-F-6-OMe	2-MeO-3-Y10	2-MeO-4-Et	2-MeO-5-O- <i>i</i> -Pr
	2-F-6-OEt	2-MeO-3-Y11	2-MeO-4- <i>n</i> -Pr	2-MeO-5-SF ₅
	2-MeO-3-F	2-MeO-3-Y12	2-MeO-4- <i>i</i> -Pr	2-MeO-5-OCF ₃
	2-MeO-3-Cl	2-MeO-3-Y13	2,4- <i>ди</i> -OMe	2-MeO-5-OCHF ₂
20	2-MeO-3-Br	2-MeO-3-Y14	2-MeO-4-OEt	2-MeO-5-OCH ₂ F
	2-MeO-3-I	2-MeO-3-Y15	2-MeO-4- <i>t</i> -Bu	2-MeO-5-OCH ₂ CF ₃
	2-MeO-3-Me	2-MeO-3-Y16	2-MeO-4-CF ₃	2-MeO-5-SCF ₃
	2-MeO-3-Et	2-MeO-3-Y17	2-MeO-4-CH ₂ F	2-MeO-5-SCHF ₂
	2-MeO-3- <i>n</i> -Pr	2-MeO-3-Y18	2-MeO-4-CHF ₂	2-MeO-5-SCH ₂ F
25	2-MeO-3- <i>i</i> -Pr	2-MeO-3-Y19	2-MeO-4-O- <i>n</i> -Pr	2-MeO-5-CN
	2,3- <i>ди</i> -OMe	2-MeO-3-Y20	2-MeO-4-Ph	2-MeO-5-Y1
	2-MeO-3-OEt	2-MeO-3-Y21	2-MeO-4-O- <i>i</i> -Pr	2-MeO-5-Y2
	2-MeO-3- <i>t</i> -Bu	2-MeO-3-Y22	2-MeO-4-SF ₅	2-MeO-5-Y3
	2-MeO-3-CF ₃	2-MeO-3-Y23	2-MeO-4-OCF ₃	2-MeO-5-Y4
30	2-MeO-3-CH ₂ F	2-MeO-3-Y24	2-MeO-4-OCHF ₂	2-MeO-5-Y5
	2-MeO-3-CHF ₂	2-MeO-3-Y25	2-MeO-4-OCH ₂ F	2-MeO-5-Y6
	2-MeO-3-O- <i>n</i> -Pr	2-MeO-3-Y26	2-MeO-4-OCH ₂ CF ₃	2-MeO-5-Y7
	2-MeO-3-Ph	2-MeO-3-Y27	2-MeO-4-SCF ₃	2-MeO-5-Y8
	2-MeO-3-O- <i>i</i> -Pr	2-MeO-3-Y28	2-MeO-4-SCHF ₂	2-MeO-5-Y9
35	2-MeO-3-SF ₅	2-MeO-3-Y29	2-MeO-4-SCH ₂ F	2-MeO-5-Y10
	2-MeO-3-OCF ₃	2-MeO-3-Y30	2-MeO-4-CN	2-MeO-5-Y11
	2-MeO-3-OCHF ₂	2-MeO-3-Y31	2-MeO-5-F	2-MeO-5-Y12
	2-MeO-3-OCH ₂ F	2-MeO-3-Y32	2-MeO-5-Cl	2-MeO-5-Y13
	2-MeO-3-OCH ₂ CF ₃	2-MeO-3-Y33	2-MeO-5-Br	2-MeO-5-Y14
40	2-MeO-3-SCF ₃	2-MeO-3-Y34	2-MeO-5-I	2-MeO-5-Y15
	2-MeO-3-SCHF ₂	2-MeO-3-Y35	2-MeO-5-Me	2-MeO-5-Y16
45				

	$(R^2)_m$	$(R^2)_m$	$(R^2)_m$	$(R^2)_m$
5	2-MeO-5-Y17	3-Br-5-Cl	3-Y14-5-Cl	3-OEt-5-CF ₃
	2-MeO-5-Y18	3- <i>i</i> -5-Cl	3-Y15-5-Cl	3- <i>t</i> -Bu-5-CF ₃
	2-MeO-5-Y19	3-Me-5-Cl	3-Y16-5-Cl	3,5- <i>ди</i> -CF ₃
	2-MeO-5-Y20	3-Et-5-Cl	3-Y17-5-Cl	3-CH ₂ F-5-CF ₃
	2-MeO-5-Y21	3- <i>n</i> -Pr-5-Cl	3-Y18-5-Cl	3-CHF ₂ -5-CF ₃
10	2-MeO-5-Y22	3- <i>i</i> -Pr-5-Cl	3-Y19-5-Cl	3-O- <i>n</i> -Pr-5-CF ₃
	2-MeO-5-Y23	3-OMe-5-Cl	3-Y20-5-Cl	3-Ph-5-CF ₃
	2-MeO-5-Y24	3-OEt-5-Cl	3-Y21-5-Cl	3-O- <i>i</i> -Pr-5-CF ₃
	2-MeO-5-Y25	3- <i>t</i> -Bu-5-Cl	3-Y22-5-Cl	3-SF ₅ -5-CF ₃
	2-MeO-5-Y26	3-CF ₃ -5-Cl	3-Y23-5-Cl	3-OCF ₃ -5-CF ₃
15	2-MeO-5-Y27	3-CH ₂ F-5-Cl	3-Y24-5-Cl	3-OCHF ₂ -5-CF ₃
	2-MeO-5-Y28	3-CHF ₂ -5-Cl	3-Y25-5-Cl	3-OCH ₂ F-5-CF ₃
	2-MeO-5-Y29	3-O- <i>n</i> -Pr-5-Cl	3-Y26-5-Cl	3-OCH ₂ CF ₃ -5-CF ₃
	2-MeO-5-Y30	3-Ph-5-Cl	3-Y27-5-Cl	3-SCF ₃ -5-CF ₃
	2-MeO-5-Y31	3-O- <i>i</i> -Pr-5-Cl	3-Y28-5-Cl	3-SCHF ₂ -5-CF ₃
20	2-MeO-5-Y32	3-SF ₅ -5-Cl	3-Y29-5-Cl	3-SCH ₂ F-5-CF ₃
	2-MeO-5-Y33	3-OCF ₃ -5-Cl	3-Y30-5-Cl	3-CN-5-CF ₃
	2-MeO-5-Y34	3-OCHF ₂ -5-Cl	3-Y31-5-Cl	3-F-5-OCF ₃
	2-MeO-5-Y35	3-OCH ₂ F-5-Cl	3-Y32-5-Cl	3-Cl-5-OCF ₃
	2-MeO-5-Y36	3-OCH ₂ CF ₃ -5-Cl	3-Y33-5-Cl	3-Br-5-OCF ₃
25	2-MeO-5-Y37	3-SCF ₃ -5-Cl	3-Y34-5-Cl	3- <i>i</i> -5-OCF ₃
	2-MeO-5-Y38	3-SCHF ₂ -5-Cl	3-Y35-5-Cl	3-Me-5-OCF ₃
	2-MeO-5-Y39	3-SCH ₂ F-5-Cl	3-Y36-5-Cl	3-Et-5-OCF ₃
	2-MeO-5-Y40	3-CN-5-Cl	3-Y37-5-Cl	3- <i>n</i> -Pr-5-OCF ₃
	2-MeO-5-Y41	3-Y1-5-Cl	3-Y38-5-Cl	3- <i>i</i> -Pr-5-OCF ₃
30	2-MeO-6-F	3-Y2-5-Cl	3-Y39-5-Cl	3-OMe-5-OCF ₃
	2-MeO-6-Cl	3-Y3-5-Cl	3-Y40-5-Cl	3-OEt-5-OCF ₃
	2-MeO-6-Br	3-Y4-5-Cl	3-Y41-5-Cl	3- <i>t</i> -Bu-5-OCF ₃
	2-MeO-6-I	3-Y5-5-Cl	3-F-5-CF ₃	3-CF ₃ -5-OCF ₃
	2-MeO-6-Me	3-Y6-5-Cl	3-Cl-5-CF ₃	3-CH ₂ F-5-OCF ₃
35	2-MeO-6-Et	3-Y7-5-Cl	3-Br-5-CF ₃	3-CHF ₂ -5-OCF ₃
	2-MeO-6- <i>n</i> -Pr	3-Y8-5-Cl	3- <i>i</i> -5-CF ₃	3-O- <i>n</i> -Pr-5-OCF ₃
	2-MeO-6-CN	3-Y9-5-Cl	3-Me-5-CF ₃	3-Ph-5-OCF ₃
	2,6- <i>ди</i> -OMe	3-Y10-5-Cl	3-Et-5-CF ₃	3-O- <i>i</i> -Pr-5-OCF ₃
	2-MeO-6-OEt	3-Y11-5-Cl	3- <i>n</i> -Pr-5-CF ₃	3-SF ₅ -5-OCF ₃
40	3-F-5-Cl	3-Y12-5-Cl	3- <i>i</i> -Pr-5-CF ₃	3,5- <i>ди</i> -OCF ₃
	3,5- <i>ди</i> -Cl	3-Y13-5-Cl	3-OMe-5-CF ₃	3-OCHF ₂ -5-OCF ₃
45				

	$(R^2)_m$	$(R^2)_m$	$(R^2)_m$	$(R^2)_m$
5	3-OCH ₂ F-5-OCF ₃	3-SCF ₃ -5-F	3-CN-5-OMe	2,3-ди-Ф-5-Cl
	3-OCH ₂ CF ₃ -5-OCF ₃	3-SCHF ₂ -5-F	2,3,6-три-Ф	2,3-ди-Ф-5-Br
	3-SCF ₃ -5-OCF ₃	3-SCH ₂ F-5-F	2,6-ди-Ф-3-Cl	2,3-ди-Ф-5-I
	3-SCHF ₂ -5-OCF ₃	3-CN-5-F	2,6-ди-Ф-3-Br	2,3-ди-Ф-5-Me
	3-SCH ₂ F-5-OCF ₃	3-F-5-OMe	2,6-ди-Ф-3-I	2,3-ди-Ф-5-Et
10	3-CN-5-OCF ₃	3-Cl-5-OMe	2,6-ди-Ф-3-Me	2,3-ди-Ф-5- <i>n</i> -Pr
	3,5-ди-Ф	3-Br-5-OMe	2,6-ди-Ф-3-Et	2,3-ди-Ф-5- <i>i</i> -Pr
	3-Cl-5-F	3- <i>i</i> -5-OMe	2,6-ди-Ф-3- <i>n</i> -Pr	2,3-ди-Ф-5-OMe
	3-Br-5-F	3-Me-5-OMe	2,6-ди-Ф-3- <i>i</i> -Pr	2,3-ди-Ф-5-OEt
	3- <i>i</i> -5-F	3-Et-5-OMe	2,6-ди-Ф-3-OMe	2,3-ди-Ф-5- <i>t</i> -Bu
15	3-Me-5-F	3- <i>n</i> -Pr-5-OMe	2,6-ди-Ф-3-OEt	2,3-ди-Ф-5-CF ₃
	3-Et-5-F	3- <i>i</i> -Pr-5-OMe	2,6-ди-Ф-3- <i>t</i> -Bu	2,3-ди-Ф-5-CH ₂ F
	3- <i>n</i> -Pr-5-F	3,5-ди-OMe	2,6-ди-Ф-3-CF ₃	2,3-ди-Ф-5-CHF ₂
	3- <i>i</i> -Pr-5-F	3-OEt-5-OMe	2,6-ди-Ф-3-CH ₂ F	2,3-ди-Ф-5-O- <i>n</i> -Pr
	3-OMe-5-F	3- <i>t</i> -Bu-5-OMe	2,6-ди-Ф-3-CHF ₂	2,3-ди-Ф-5-Ph
20	3-OEt-5-F	3-CF ₃ -5-OMe	2,6-ди-Ф-3-O- <i>n</i> -Pr	2,3-ди-Ф-5-O- <i>i</i> -Pr
	3- <i>t</i> -Bu-5-F	3-CH ₂ F-5-OMe	2,6-ди-Ф-3-Ph	2,3-ди-Ф-5-SF ₅
	3-CF ₃ -5-F	3-CHF ₂ -5-OMe	2,6-ди-Ф-3-O- <i>i</i> -Pr	2,3-ди-Ф-5-OCF ₃
	3-CH ₂ F-5-F	3-O- <i>n</i> -Pr-5-OMe	2,6-ди-Ф-3-SF ₅	2,3-ди-Ф-5-OCHF ₂
	3-CHF ₂ -5-F	3-Ph-5-OMe	2,6-ди-Ф-3-OCF ₃	2,3-ди-Ф-5-OCH ₂ F
25	3-O- <i>n</i> -Pr-5-F	3-O- <i>i</i> -Pr-5-OMe	2,6-ди-Ф-3-OCHF ₂	2,3-ди-Ф-5-OCH ₂ CF ₃
	3-Ph-5-F	3-SF ₅ -5-OMe	2,6-ди-Ф-3-OCH ₂ F	2,3-ди-Ф-5-SCF ₃
	3-O- <i>i</i> -Pr-5-F	3-OCF ₃ -5-OMe	2,6-ди-Ф-3-OCH ₂ CF ₃	2,3-ди-Ф-5-SCHF ₂
	3-SF ₅ -5-F	3-OCH ₂ F-5-OMe	2,6-ди-Ф-3-SCF ₃	2,3-ди-Ф-5-SCH ₂ F
	3-OCF ₃ -5-F	3-OCH ₂ CF ₃ -5-OMe	2,6-ди-Ф-3-SCHF ₂	2,3-ди-Ф-5-CN
30	3-OCHF ₂ -5-F	3-SCF ₃ -5-OMe	2,6-ди-Ф-3-SCH ₂ F	
	3-OCH ₂ F-5-F	3-SCHF ₂ -5-OMe	2,6-ди-Ф-3-CN	
	3-OCH ₂ CF ₃ -5-F	3-SCH ₂ F-5-OMe	2,3,5-три-Ф	

Таблица М-2 построена таким же образом, что и таблица М-1, за исключением того, что фраза “каждый R^S, X и галогенирующий реагент” в строке заголовка таблицы М-1 заменяется соответственными “каждому R^S, X и галогенирующему реагенту” значениями, которые приведены ниже. Например, строкой заголовка в таблице М-2 является “каждый R^S представляет собой CO₂⁻Na⁺; X представляет собой Cl; и галогенирующим реагентом является SOCl₂”. Таблицы М-3-М-75 построены подобным образом.

Таблица	каждый R ^S представляет собой	каждый X представляет собой	галогенирующим реагентом является
М-2	CO ₂ ⁻ Na ⁺	Cl	SOCl ₂
М-3	CO ₂ ⁻ K ⁺	Cl	SOCl ₂

5	M-4	$\text{CO}_2^-[\text{NH}_4]^+$	Cl	COCl_2
	M-5	$\text{CO}_2^- [1/2 \text{ Ca}]^+$	Cl	COCl_2
	M-6	$\text{CO}_2^- [1/2 \text{ Ba}]^+$	Cl	COCl_2
	M-7	$\text{CO}_2^- [\text{NH}(\text{Me})_3]^+$	Cl	COCl_2
	M-8	$\text{CO}_2^- [\text{NH}(\text{Et})_3]^+$	Cl	COCl_2
10	M-9	$\text{CO}_2^- [\text{NH}(\text{n-Bu})_3]^+$	Cl	COCl_2
	M-10	$\text{CO}_2^- [\text{NH}_2(\text{Ph})_2]^+$	Cl	COCl_2
	M-11	$\text{CO}_2^- [\text{NH}_2(\text{Bn})_2]^+$	Cl	COCl_2
	M-12	$\text{CO}_2^- [\text{NH}_2(\text{c-Hex})_2]^+$	Cl	COCl_2
	M-13	$\text{CO}_2^- [\text{NH}_2(\text{Me})_2]^+$	Cl	COCl_2
15	M-14	$\text{CO}_2^- [\text{NH}_2(\text{Et})_2]^+$	Cl	COCl_2
	M-15	$\text{CO}_2^- [\text{NHEt}(\text{i-Pr})_2]^+$	Cl	COCl_2
	M-16	$\text{CO}_2^- \text{Li}^+$	Cl	SOCl_2
	M-17	$\text{CO}_2^- \text{Na}^+$	Cl	SOCl_2
	M-18	$\text{CO}_2^- \text{K}^+$	Cl	SOCl_2
20	M-19	$\text{CO}_2^- [\text{NH}_4]^+$	Cl	SOCl_2
	M-20	$\text{CO}_2^- [1/2 \text{ Ca}]^+$	Cl	SOCl_2
	M-21	$\text{CO}_2^- [1/2 \text{ Ba}]^+$	Cl	SOCl_2
	M-22	$\text{CO}_2^- [\text{NH}(\text{Me})_3]^+$	Cl	SOCl_2
	M-23	$\text{CO}_2^- [\text{NH}(\text{Et})_3]^+$	Cl	SOCl_2
25	M-24	$\text{CO}_2^- [\text{NH}(\text{n-Bu})_3]^+$	Cl	SOCl_2
	M-25	$\text{CO}_2^- [\text{NH}_2(\text{Ph})_2]^+$	Cl	SOCl_2
	M-26	$\text{CO}_2^- [\text{NH}_2(\text{Bn})_2]^+$	Cl	SOCl_2
	M-27	$\text{CO}_2^- [\text{NH}_2(\text{c-Hex})_2]^+$	Cl	SOCl_2
	M-28	$\text{CO}_2^- [\text{NH}_2(\text{Me})_2]^+$	Cl	SOCl_2
30	M-29	$\text{CO}_2^- [\text{NH}_2(\text{Et})_2]^+$	Cl	SOCl_2
	M-30	$\text{CO}_2^- [\text{NHEt}(\text{i-Pr})_2]^+$	Cl	SOCl_2
	M-31	$\text{CO}_2^- \text{Li}^+$	Cl	трифосген
	M-32	$\text{CO}_2^- \text{Na}^+$	Cl	трифосген
	M-33	$\text{CO}_2^- \text{K}^+$	Cl	трифосген
35	M-34	$\text{CO}_2^- [\text{NH}_4]^+$	Cl	трифосген
	M-35	$\text{CO}_2^- [1/2 \text{ Ca}]^+$	Cl	трифосген
	M-36	$\text{CO}_2^- [1/2 \text{ Ba}]^+$	Cl	трифосген
	M-37	$\text{CO}_2^- [\text{NH}(\text{Me})_3]^+$	Cl	трифосген
	M-38	$\text{CO}_2^- [\text{NH}(\text{Et})_3]^+$	Cl	трифосген
40	M-39	$\text{CO}_2^- [\text{NH}(\text{n-Bu})_3]^+$	Cl	трифосген
	M-40	$\text{CO}_2^- [\text{NH}_2(\text{Ph})_2]^+$	Cl	трифосген
	M-41	$\text{CO}_2^- [\text{NH}_2(\text{Bn})_2]^+$	Cl	трифосген
	M-42	$\text{CO}_2^- [\text{NH}_2(\text{c-Hex})_2]^+$	Cl	трифосген

5	M-43	$\text{CO}_2^-\text{[NH}_2(\text{Me})_2]^+$	Cl	трифосген
	M-44	$\text{CO}_2^-\text{[NH}_2(\text{Et})_2]^+$	Cl	трифосген
	M-45	$\text{CO}_2^-\text{[NHEt(i-Pr)}_2]^+$	Cl	трифосген
	M-46	CO_2^-Li^+	Br	SOBr_2
	M-47	CO_2^-Na^+	Br	SOBr_2
	M-48	CO_2^-K^+	Br	SOBr_2
	M-49	$\text{CO}_2^-\text{[NH}_4]^+$	Br	SOBr_2
10	M-50	$\text{CO}_2^-\text{[1/2 Ca]}^+$	Br	SOBr_2
	M-51	$\text{CO}_2^-\text{[1/2 Ba]}^+$	Br	SOBr_2
	M-52	$\text{CO}_2^-\text{[NH(Me)}_3]^+$	Br	SOBr_2
	M-53	$\text{CO}_2^-\text{[NH(Et)}_3]^+$	Br	SOBr_2
15	M-54	$\text{CO}_2^-\text{[NH(n-Bu)}_3]^+$	Br	SOBr_2
	M-55	$\text{CO}_2^-\text{[NH}_2(\text{Ph})_2]^+$	Br	SOBr_2
	M-56	$\text{CO}_2^-\text{[NH}_2(\text{Bn})_2]^+$	Br	SOBr_2
	M-57	$\text{CO}_2^-\text{[NH}_2(\text{c-Hex})_2]^+$	Br	SOBr_2
20	M-58	$\text{CO}_2^-\text{[NH}_2(\text{Me})_2]^+$	Br	SOBr_2
	M-59	$\text{CO}_2^-\text{[NH}_2(\text{Et})_2]^+$	Br	SOBr_2
	M-60	$\text{CO}_2^-\text{[NHEt(i-Pr)}_2]^+$	Br	SOBr_2
	M-61	CO_2^-Li^+	Cl	фосген
25	M-62	CO_2^-Na^+	Cl	фосген
	M-63	CO_2^-K^+	Cl	фосген
	M-64	$\text{CO}_2^-\text{[NH}_4]^+$	Cl	фосген
	M-65	$\text{CO}_2^-\text{[1/2 Ca]}^+$	Cl	фосген
30	M-66	$\text{CO}_2^-\text{[1/2 Ba]}^+$	Cl	фосген
	M-67	$\text{CO}_2^-\text{[NH(Me)}_3]^+$	Cl	фосген
	M-68	$\text{CO}_2^-\text{[NH(Et)}_3]^+$	Cl	фосген
	M-69	$\text{CO}_2^-\text{[NH(n-Bu)}_3]^+$	Cl	фосген
35	M-70	$\text{CO}_2^-\text{[NH}_2(\text{Ph})_2]^+$	Cl	фосген
	M-71	$\text{CO}_2^-\text{[NH}_2(\text{Bn})_2]^+$	Cl	фосген
	M-72	$\text{CO}_2^-\text{[NH}_2(\text{c-Hex})_2]^+$	Cl	фосген
	M-73	$\text{CO}_2^-\text{[NH}_2(\text{Me})_2]^+$	Cl	фосген
40	M-74	$\text{CO}_2^-\text{[NH}_2(\text{Et})_2]^+$	Cl	фосген
	M-75	$\text{CO}_2^-\text{[NHEt(i-Pr)}_2]^+$	Cl	фосген

ТАБЛИЦА М-76

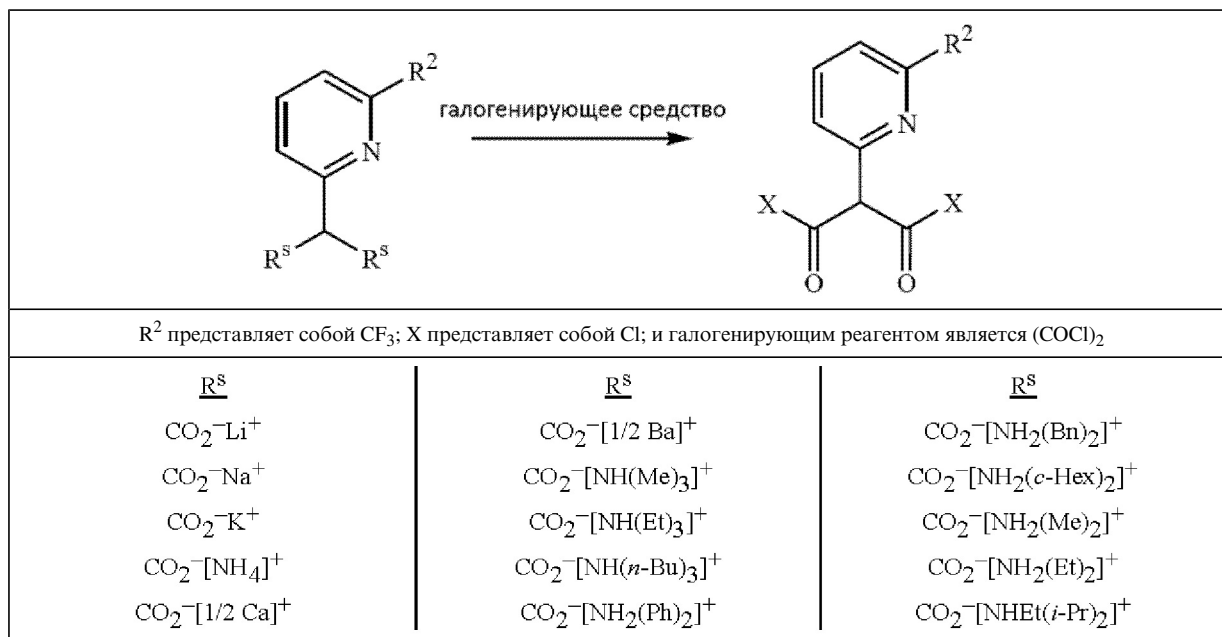


Таблица М-77 построена таким же образом, что и таблица М-76 за исключением того, что фраза в строке заголовка (т.е. “ R^2 представляет собой CF_3 ; X представляет собой Cl; и галогенирующим реагентом является $(COCl)_2$ ”) заменена строкой заголовка

20

таблицы М-77, показанной ниже. Например, строкой заголовка в таблице М-77 является “ R^2 представляет собой H; X представляет собой Cl; и галогенирующим реагентом является $(COCl)_2$ ”. Таблицы М-78-М-125 построены подобным образом.

25

Таблица	R^2 представляет собой	X представляет собой	галогенирующим реагентом является
М-77	H	Cl	$(COCl)_2$
М-78	Cl	Cl	$(COCl)_2$
М-79	Br	Cl	$(COCl)_2$

30

М-80	I	Cl	$(COCl)_2$
М-81	2-хлор-4-(трифторметил)фенил	Cl	$(COCl)_2$
М-82	2-фтор-5-(трифторметил)фенил	Cl	$(COCl)_2$
М-83	2-хлор-4-цианофенил	Cl	$(COCl)_2$
М-84	2-фтор-4-цианофенил	Cl	$(COCl)_2$
М-85	3-хлор-5-трифторметил-2-пиридил	Cl	$(COCl)_2$
М-86	CF_3	Cl	$SOCl_2$
М-87	H	Cl	$SOCl_2$
М-88	Cl	Cl	$SOCl_2$
М-89	Br	Cl	$SOCl_2$
М-90	I	Cl	$SOCl_2$
М-91	2-хлор-4-(трифторметил)фенил	Cl	$SOCl_2$
М-92	2-фтор-5-(трифторметил)фенил	Cl	$SOCl_2$
М-93	2-хлор-4-цианофенил	Cl	$SOCl_2$
М-94	2-фтор-4-цианофенил	Cl	$SOCl_2$
М-95	3-хлор-5-трифторметил-2-пиридил	Cl	$SOCl_2$
М-96	CF_3	Br	$SOBr_2$
М-97	H	Br	$SOBr_2$

35

40

45

	M-98	Cl	Br	SOBr ₂
	M-99	Br	Br	SOBr ₂
	M-100	I	Br	SOBr ₂
5	M-101	2-хлор-4-(трифторметил)фенил	Br	SOBr ₂
	M-102	2-фтор-5-(трифторметил)фенил	Br	SOBr ₂
	M-103	2-хлор-4-цианофенил	Br	SOBr ₂
	M-104	2-фтор-4-цианофенил	Br	SOBr ₂
10	M-105	3-хлор-5-трифторметил-2-пиридил	Br	SOBr ₂
	M-106	CF ₃	Cl	фосген
	M-107	H	Cl	фосген
	M-108	Cl	Cl	фосген
	M-109	Br	Cl	фосген
	M-110	I	Cl	фосген
15	M-111	2-хлор-4-(трифторметил)фенил	Cl	фосген
	M-112	2-фтор-5-(трифторметил)фенил	Cl	фосген
	M-113	2-хлор-4-цианофенил	Cl	фосген
	M-114	2-фтор-4-цианофенил	Cl	фосген
	M-115	3-хлор-5-трифторметил-2-пиридил	Cl	фосген
	M-116	CF ₃	Cl	трифосген
20	M-117	H	Cl	трифосген
	M-118	Cl	Cl	трифосген
	M-119	Br	Cl	трифосген
	M-120	I	Cl	трифосген
	M-121	2-хлор-4-(трифторметил)фенил	Cl	трифосген
25	M-122	2-фтор-5-(трифторметил)фенил	Cl	трифосген
	M-123	2-хлор-4-цианофенил	Cl	трифосген
	M-124	2-фтор-4-цианофенил	Cl	трифосген
	M-125	3-хлор-5-трифторметил-2-пиридил	Cl	трифосген

ТАБЛИЦА М-125

30			
35	$\text{R}^2 \text{ представляет собой CF}_3; \text{X представляет собой Cl; и галогенирующим реагентом является (COCl)}_2$		
40	$\begin{array}{c} \text{R}^S \\ \text{CO}_2^-\text{Li}^+ \\ \text{CO}_2^-\text{Na}^+ \\ \text{CO}_2^-\text{K}^+ \\ \text{CO}_2^-\text{[NH}_4\text{]}^+ \\ \text{CO}_2^-\text{[1/2 Ca]}^+ \end{array}$	$\begin{array}{c} \text{R}^S \\ \text{CO}_2^-\text{[1/2 Ba]}^+ \\ \text{CO}_2^-\text{[NH(Me)}_3\text{]}^+ \\ \text{CO}_2^-\text{[NH(Et)}_3\text{]}^+ \\ \text{CO}_2^-\text{[NH}(n\text{-Bu)}_3\text{]}^+ \\ \text{CO}_2^-\text{[NH}_2\text{(Ph)}_2\text{]}^+ \end{array}$	$\begin{array}{c} \text{R}^S \\ \text{CO}_2^-\text{[NH}_2\text{(Bn)}_2\text{]}^+ \\ \text{CO}_2^-\text{[NH}_2\text{(c-Hex)}_2\text{]}^+ \\ \text{CO}_2^-\text{[NH}_2\text{(Me)}_2\text{]}^+ \\ \text{CO}_2^-\text{[NH}_2\text{(Et)}_2\text{]}^+ \\ \text{CO}_2^-\text{[NHEt}(i\text{-Pr)}_2\text{]}^+ \end{array}$
45			

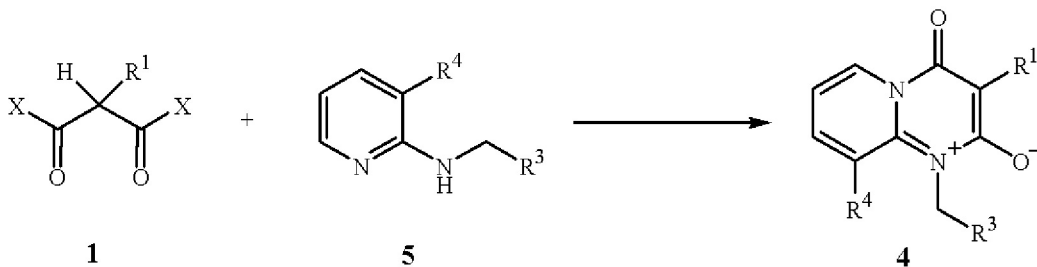
Таблица М-126 построена таким же образом, что и таблица М-125 за исключением того, что фраза в строке заголовка (т.е. “R² представляет собой CF₃; X представляет

с собой Cl; и галогенирующим реагентом является $(\text{COCl})_2$ ”) заменена строкой заголовка таблицы М-126, показанной ниже. Например, строкой заголовка в таблице М-126 является “ R^2 представляет собой Н; Х представляет собой Cl; и галогенирующим реагентом является $(\text{COCl})_2$ ”. Таблицы М-127-М-174 построены подобным образом.

Таблица	R^2 представляет собой	Х представляет собой	галогенирующим реагентом является
М-126	Н	Cl	$(\text{COCl})_2$
М-127	Cl	Cl	$(\text{COCl})_2$
М-128	Br	Cl	$(\text{COCl})_2$
М-129	I	Cl	$(\text{COCl})_2$
М-130	2-хлор-4-(трифторметил)фенил	Cl	$(\text{COCl})_2$
М-131	2-фтор-5-(трифторметил)фенил	Cl	$(\text{COCl})_2$
М-132	2-хлор-4-цианофенил	Cl	$(\text{COCl})_2$
М-133	2-фтор-4-цианофенил	Cl	$(\text{COCl})_2$
М-134	3-хлор-5-трифторметил-2-пиридил	Cl	$(\text{COCl})_2$
М-135	CF_3	Cl	SOCl_2
М-136	Н	Cl	SOCl_2
М-137	Cl	Cl	SOCl_2
М-138	Br	Cl	SOCl_2
М-139	I	Cl	SOCl_2
М-140	2-хлор-4-(трифторметил)фенил	Cl	SOCl_2
М-141	2-фтор-5-(трифторметил)фенил	Cl	SOCl_2
М-142	2-хлор-4-цианофенил	Cl	SOCl_2
М-143	2-фтор-4-цианофенил	Cl	SOCl_2
М-144	3-хлор-5-трифторметил-2-пиридил	Cl	SOCl_2
М-145	CF_3	Br	SOBr_2
М-146	Н	Br	SOBr_2
М-147	Cl	Br	SOBr_2
М-148	Br	Br	SOBr_2
М-149	I	Br	SOBr_2
М-150	2-хлор-4-(трифторметил)фенил	Br	SOBr_2
М-151	2-фтор-5-(трифторметил)фенил	Br	SOBr_2
М-152	2-хлор-4-цианофенил	Br	SOBr_2
М-153	2-фтор-4-цианофенил	Br	SOBr_2
М-154	3-хлор-5-трифторметил-2-пиридил	Br	SOBr_2
М-155	CF_3	Cl	фосген
М-156	Н	Cl	фосген
М-157	Cl	Cl	фосген
М-158	Br	Cl	фосген
М-159	I	Cl	фосген
М-160	2-хлор-4-(трифторметил)фенил	Cl	фосген
М-161	2-фтор-5-(трифторметил)фенил	Cl	фосген
М-162	2-хлор-4-цианофенил	Cl	фосген
М-163	2-фтор-4-цианофенил	Cl	фосген
М-164	3-хлор-5-трифторметил-2-пиридил	Cl	фосген
М-165	CF_3	Cl	трифосген
М-166	Н	Cl	трифосген

M-167	Cl	Cl	трифосген
M-168	Br	Cl	трифосген
M-169	I	Cl	трифосген
M-170	2-хлор-4-(трифторметил)фенил	Cl	трифосген
M-171	2-фтор-5-(трифторметил)фенил	Cl	трифосген
M-172	2-хлор-4-цианофенил	Cl	трифосген
M-173	2-фтор-4-цианофенил	Cl	трифосген
M-174	3-хлор-5-трифторметил-2-пиридил	Cl	трифосген

ТАБЛИЦА С-1



X представляет собой Cl; R^3 представляет собой 2-хлор-5-пиридирил; R^4 представляет собой H

	$(R^2)_m$	$(R^2)_m$	$(R^2)_m$	$(R^2)_m$
	2-F	3-OCF ₃	3-Y21	4- <i>i</i> -Pr
	2-Cl	3-OCHF ₂	3-Y22	4-OMe
5	2-Br	3-OCH ₂ F	3-Y23	4-OEt
	2-I	3-OCH ₂ CF ₃	3-Y24	4- <i>t</i> -Bu
	2-Me	3-SCF ₃	3-Y25	4-CF ₃
	2-Et	3-SCHF ₂	3-Y26	4-CH ₂ F
10	2- <i>n</i> -Pr	3-SCH ₂ F	3-Y27	4-CHF ₂
	2-CN	3-CN	3-Y28	4-O- <i>n</i> -Pr
	2-OMe	3-Y1	3-Y29	4-Ph
	2-OEt	3-Y2	3-Y30	4-O- <i>i</i> -Pr
15	3-F	3-Y3	3-Y31	4-SF ₅
	3-Cl	3-Y4	3-Y32	4-OCF ₃
	3-Br	3-Y5	3-Y33	4-OCHF ₂
	3-I	3-Y6	3-Y34	4-OCH ₂ F
	3-Me	3-Y7	3-Y35	4-OCH ₂ CF ₃
20	3-Et	3-Y8	3-Y36	4-SCF ₃
	3- <i>n</i> -Pr	3-Y9	3-Y37	4-SCHF ₂
	3- <i>i</i> -Pr	3-Y10	3-Y38	4-SCH ₂ F
	3-OMe	3-Y11	3-Y39	4-CN
25	3-OEt	3-Y12	3-Y40	2,3- di -F
	3- <i>t</i> -Bu	3-Y13	3-Y41	2-F-3-Cl
	3-CF ₃	3-Y14	4-F	2-F-3-Br
	3-CH ₂ F	3-Y15	4-Cl	2-F-3-I
	3-CHF ₂	3-Y16	4-Br	2-F-3-Me
30	3-O- <i>n</i> -Pr	3-Y17	4-I	2-F-3-Et
	3-Ph	3-Y18	4-Me	2-F-3- <i>n</i> -Pr
	3-O- <i>i</i> -Pr	3-Y19	4-Et	2-F-3- <i>i</i> -Pr
	3-SF ₅	3-Y20	4- <i>n</i> -Pr	2-F-3-OMe

35

40

45

	$(R^2)_m$	$(R^2)_m$	$(R^2)_m$	$(R^2)_m$
5	2-F-3-OEt	2-F-3-Y21	2-F-4-O- <i>i</i> -Pr	2-F-5-Y2
	2-F-3- <i>t</i> -Bu	2-F-3-Y22	2-F-4-SF ₅	2-F-5-Y3
	2-F-3-CF ₃	2-F-3-Y23	2-F-4-OCF ₃	2-F-5-Y4
	2-F-3-CH ₂ F	2-F-3-Y24	2-F-4-OCHF ₂	2-F-5-Y5
	2-F-3-CHF ₂	2-F-3-Y25	2-F-4-OCH ₂ F	2-F-5-Y6
10	2-F-3-O- <i>n</i> -Pr	2-F-3-Y26	2-F-4-OCH ₂ CF ₃	2-F-5-Y7
	2-F-3-Ph	2-F-3-Y27	2-F-4-SCF ₃	2-F-5-Y8
	2-F-3-O- <i>i</i> -Pr	2-F-3-Y28	2-F-4-SCHF ₂	2-F-5-Y9
	2-F-3-SF ₅	2-F-3-Y29	2-F-4-SCH ₂ F	2-F-5-Y10
	2-F-3-OCF ₃	2-F-3-Y30	2-F-4-CN	2-F-5-Y11
15	2-F-3-OCHF ₂	2-F-3-Y31	2,5- <i>ди</i> -F	2-F-5-Y12
	2-F-3-OCH ₂ F	2-F-3-Y32	2-F-5-Cl	2-F-5-Y13
	2-F-3-OCH ₂ CF ₃	2-F-3-Y33	2-F-5-Br	2-F-5-Y14
	2-F-3-SCF ₃	2-F-3-Y34	2-F-5-I	2-F-5-Y15
	2-F-3-SCHF ₂	2-F-3-Y35	2-F-5-Me	2-F-5-Y16
20	2-F-3-SCH ₂ F	2-F-3-Y36	2-F-5-Et	2-F-5-Y17
	2-F-3-CN	2-F-3-Y37	2-F-5- <i>n</i> -Pr	2-F-5-Y18
	2-F-3-Y1	2-F-3-Y38	2-F-5- <i>i</i> -Pr	2-F-5-Y19
	2-F-3-Y2	2-F-3-Y39	2-F-5-OMe	2-F-5-Y20
	2-F-3-Y3	2-F-3-Y40	2-F-5-OEt	2-F-5-Y21
25	2-F-3-Y4	2-F-3-Y41	2-F-5- <i>t</i> -Bu	2-F-5-Y22
	2-F-3-Y5	2,4- <i>ди</i> -F	2-F-5-CF ₃	2-F-5-Y23
	2-F-3-Y6	2-F-4-Cl	2-F-5-CH ₂ F	2-F-5-Y24
	2-F-3-Y7	2-F-4-Br	2-F-5-CHF ₂	2-F-5-Y25
	2-F-3-Y8	2-F-4-I	2-F-5-O- <i>n</i> -Pr	2-F-5-Y26
30	2-F-3-Y9	2-F-4-Me	2-F-5-Ph	2-F-5-Y27
	2-F-3-Y10	2-F-4-Et	2-F-5-O- <i>i</i> -Pr	2-F-5-Y28
	2-F-3-Y11	2-F-4- <i>n</i> -Pr	2-F-5-SF ₅	2-F-5-Y29
	2-F-3-Y12	2-F-4- <i>i</i> -Pr	2-F-5-OCF ₃	2-F-5-Y30
	2-F-3-Y13	2-F-4-OMe	2-F-5-OCHF ₂	2-F-5-Y31
35	2-F-3-Y14	2-F-4-OEt	2-F-5-OCH ₂ F	2-F-5-Y32
	2-F-3-Y15	2-F-4- <i>t</i> -Bu	2-F-5-OCH ₂ CF ₃	2-F-5-Y33
	2-F-3-Y16	2-F-4-CF ₃	2-F-5-SCF ₃	2-F-5-Y34
	2-F-3-Y17	2-F-4-CH ₂ F	2-F-5-SCHF ₂	2-F-5-Y35
	2-F-3-Y18	2-F-4-CHF ₂	2-F-5-SCH ₂ F	2-F-5-Y36
40	2-F-3-Y19	2-F-4-O- <i>n</i> -Pr	2-F-5-CN	2-F-5-Y37
	2-F-3-Y20	2-F-4-Ph	2-F-5-Y1	2-F-5-Y38
45				

	$(R^2)_m$	$(R^2)_m$	$(R^2)_m$	$(R^2)_m$
5	2-F-5-Y39	2-MeO-3-SCH ₂ F	2-MeO-3-Y36	2-MeO-5-Et
	2-F-5-Y40	2-MeO-3-CN	2-MeO-3-Y37	2-MeO-5- <i>n</i> -Pr
	2-F-5-Y41	2-MeO-3-Y1	2-MeO-3-Y38	2-MeO-5- <i>i</i> -Pr
	2,6- <i>ди</i> -F	2-MeO-3-Y2	2-MeO-3-Y39	2,5- <i>ди</i> -OMe
	2-F-6-Cl	2-MeO-3-Y3	2-MeO-3-Y40	2-MeO-5-OEt
10	2-F-6-Br	2-MeO-3-Y4	2-MeO-3-Y41	2-MeO-5- <i>t</i> -Bu
	2-F-6-I	2-MeO-3-Y5	2-MeO-4-F	2-MeO-5-CF ₃
	2-F-6-Me	2-MeO-3-Y6	2-MeO-4-Cl	2-MeO-5-CH ₂ F
	2-F-6-Et	2-MeO-3-Y7	2-MeO-4-Br	2-MeO-5-CHF ₂
	2-F-6- <i>n</i> -Pr	2-MeO-3-Y8	2-MeO-4-I	2-MeO-5-O- <i>n</i> -Pr
15	2-F-6-CN	2-MeO-3-Y9	2-MeO-4-Me	2-MeO-5-Ph
	2-F-6-OMe	2-MeO-3-Y10	2-MeO-4-Et	2-MeO-5-O- <i>i</i> -Pr
	2-F-6-OEt	2-MeO-3-Y11	2-MeO-4- <i>n</i> -Pr	2-MeO-5-SF ₅
	2-MeO-3-F	2-MeO-3-Y12	2-MeO-4- <i>i</i> -Pr	2-MeO-5-OCF ₃
	2-MeO-3-Cl	2-MeO-3-Y13	2,4- <i>ди</i> -OMe	2-MeO-5-OCHF ₂
20	2-MeO-3-Br	2-MeO-3-Y14	2-MeO-4-OEt	2-MeO-5-OCH ₂ F
	2-MeO-3-I	2-MeO-3-Y15	2-MeO-4- <i>t</i> -Bu	2-MeO-5-OCH ₂ CF ₃
	2-MeO-3-Me	2-MeO-3-Y16	2-MeO-4-CF ₃	2-MeO-5-SCF ₃
	2-MeO-3-Et	2-MeO-3-Y17	2-MeO-4-CH ₂ F	2-MeO-5-SCHF ₂
	2-MeO-3- <i>n</i> -Pr	2-MeO-3-Y18	2-MeO-4-CHF ₂	2-MeO-5-SCH ₂ F
25	2-MeO-3- <i>i</i> -Pr	2-MeO-3-Y19	2-MeO-4-O- <i>n</i> -Pr	2-MeO-5-CN
	2,3- <i>ди</i> -OMe	2-MeO-3-Y20	2-MeO-4-Ph	2-MeO-5-Y1
	2-MeO-3-OEt	2-MeO-3-Y21	2-MeO-4-O- <i>i</i> -Pr	2-MeO-5-Y2
	2-MeO-3- <i>t</i> -Bu	2-MeO-3-Y22	2-MeO-4-SF ₅	2-MeO-5-Y3
	2-MeO-3-CF ₃	2-MeO-3-Y23	2-MeO-4-OCF ₃	2-MeO-5-Y4
30	2-MeO-3-CH ₂ F	2-MeO-3-Y24	2-MeO-4-OCHF ₂	2-MeO-5-Y5
	2-MeO-3-CHF ₂	2-MeO-3-Y25	2-MeO-4-OCH ₂ F	2-MeO-5-Y6
	2-MeO-3-O- <i>n</i> -Pr	2-MeO-3-Y26	2-MeO-4-OCH ₂ CF ₃	2-MeO-5-Y7
	2-MeO-3-Ph	2-MeO-3-Y27	2-MeO-4-SCF ₃	2-MeO-5-Y8
	2-MeO-3-O- <i>i</i> -Pr	2-MeO-3-Y28	2-MeO-4-SCHF ₂	2-MeO-5-Y9
35	2-MeO-3-SF ₅	2-MeO-3-Y29	2-MeO-4-SCH ₂ F	2-MeO-5-Y10
	2-MeO-3-OCF ₃	2-MeO-3-Y30	2-MeO-4-CN	2-MeO-5-Y11
	2-MeO-3-OCHF ₂	2-MeO-3-Y31	2-MeO-5-F	2-MeO-5-Y12
	2-MeO-3-OCH ₂ F	2-MeO-3-Y32	2-MeO-5-Cl	2-MeO-5-Y13
	2-MeO-3-OCH ₂ CF ₃	2-MeO-3-Y33	2-MeO-5-Br	2-MeO-5-Y14
40	2-MeO-3-SCF ₃	2-MeO-3-Y34	2-MeO-5-I	2-MeO-5-Y15
	2-MeO-3-SCHF ₂	2-MeO-3-Y35	2-MeO-5-Me	2-MeO-5-Y16
45				

	$(R^2)_m$	$(R^2)_m$	$(R^2)_m$	$(R^2)_m$
5	2-MeO-5-Y17	3-Br-5-Cl	3-Y14-5-Cl	3-OEt-5-CF ₃
	2-MeO-5-Y18	3- <i>i</i> -5-Cl	3-Y15-5-Cl	3- <i>t</i> -Bu-5-CF ₃
	2-MeO-5-Y19	3-Me-5-Cl	3-Y16-5-Cl	3,5- <i>ди</i> -CF ₃
	2-MeO-5-Y20	3-Et-5-Cl	3-Y17-5-Cl	3-CH ₂ F-5-CF ₃
	2-MeO-5-Y21	3- <i>n</i> -Pr-5-Cl	3-Y18-5-Cl	3-CHF ₂ -5-CF ₃
10	2-MeO-5-Y22	3- <i>i</i> -Pr-5-Cl	3-Y19-5-Cl	3-O- <i>n</i> -Pr-5-CF ₃
	2-MeO-5-Y23	3-OMe-5-Cl	3-Y20-5-Cl	3-Ph-5-CF ₃
	2-MeO-5-Y24	3-OEt-5-Cl	3-Y21-5-Cl	3-O- <i>i</i> -Pr-5-CF ₃
	2-MeO-5-Y25	3- <i>t</i> -Bu-5-Cl	3-Y22-5-Cl	3-SF ₅ -5-CF ₃
	2-MeO-5-Y26	3-CF ₃ -5-Cl	3-Y23-5-Cl	3-OCF ₃ -5-CF ₃
15	2-MeO-5-Y27	3-CH ₂ F-5-Cl	3-Y24-5-Cl	3-OCHF ₂ -5-CF ₃
	2-MeO-5-Y28	3-CHF ₂ -5-Cl	3-Y25-5-Cl	3-OCH ₂ F-5-CF ₃
	2-MeO-5-Y29	3-O- <i>n</i> -Pr-5-Cl	3-Y26-5-Cl	3-OCH ₂ CF ₃ -5-CF ₃
	2-MeO-5-Y30	3-Ph-5-Cl	3-Y27-5-Cl	3-SCF ₃ -5-CF ₃
	2-MeO-5-Y31	3-O- <i>i</i> -Pr-5-Cl	3-Y28-5-Cl	3-SCHF ₂ -5-CF ₃
20	2-MeO-5-Y32	3-SF ₅ -5-Cl	3-Y29-5-Cl	3-SCH ₂ F-5-CF ₃
	2-MeO-5-Y33	3-OCF ₃ -5-Cl	3-Y30-5-Cl	3-CN-5-CF ₃
	2-MeO-5-Y34	3-OCHF ₂ -5-Cl	3-Y31-5-Cl	3-F-5-OCF ₃
	2-MeO-5-Y35	3-OCH ₂ F-5-Cl	3-Y32-5-Cl	3-Cl-5-OCF ₃
	2-MeO-5-Y36	3-OCH ₂ CF ₃ -5-Cl	3-Y33-5-Cl	3-Br-5-OCF ₃
25	2-MeO-5-Y37	3-SCF ₃ -5-Cl	3-Y34-5-Cl	3- <i>i</i> -5-OCF ₃
	2-MeO-5-Y38	3-SCHF ₂ -5-Cl	3-Y35-5-Cl	3-Me-5-OCF ₃
	2-MeO-5-Y39	3-SCH ₂ F-5-Cl	3-Y36-5-Cl	3-Et-5-OCF ₃
	2-MeO-5-Y40	3-CN-5-Cl	3-Y37-5-Cl	3- <i>n</i> -Pr-5-OCF ₃
	2-MeO-5-Y41	3-Y1-5-Cl	3-Y38-5-Cl	3- <i>i</i> -Pr-5-OCF ₃
30	2-MeO-6-F	3-Y2-5-Cl	3-Y39-5-Cl	3-OMe-5-OCF ₃
	2-MeO-6-Cl	3-Y3-5-Cl	3-Y40-5-Cl	3-OEt-5-OCF ₃
	2-MeO-6-Br	3-Y4-5-Cl	3-Y41-5-Cl	3- <i>t</i> -Bu-5-OCF ₃
	2-MeO-6-I	3-Y5-5-Cl	3-F-5-CF ₃	3-CF ₃ -5-OCF ₃
	2-MeO-6-Me	3-Y6-5-Cl	3-Cl-5-CF ₃	3-CH ₂ F-5-OCF ₃
35	2-MeO-6-Et	3-Y7-5-Cl	3-Br-5-CF ₃	3-CHF ₂ -5-OCF ₃
	2-MeO-6- <i>n</i> -Pr	3-Y8-5-Cl	3- <i>i</i> -5-CF ₃	3-O- <i>n</i> -Pr-5-OCF ₃
	2-MeO-6-CN	3-Y9-5-Cl	3-Me-5-CF ₃	3-Ph-5-OCF ₃
	2,6- <i>ди</i> -OMe	3-Y10-5-Cl	3-Et-5-CF ₃	3-O- <i>i</i> -Pr-5-OCF ₃
	2-MeO-6-OEt	3-Y11-5-Cl	3- <i>n</i> -Pr-5-CF ₃	3-SF ₅ -5-OCF ₃
40	3-F-5-Cl	3-Y12-5-Cl	3- <i>i</i> -Pr-5-CF ₃	3,5- <i>ди</i> -OCF ₃
	3,5- <i>ди</i> -Cl	3-Y13-5-Cl	3-OMe-5-CF ₃	3-OCHF ₂ -5-OCF ₃

	$(R^2)_m$	$(R^2)_m$	$(R^2)_m$	$(R^2)_m$
5	3-OCH ₂ F-5-OCF ₃	3-SCF ₃ -5-F	3-CN-5-OMe	2,3-ди-Ф-5-Cl
	3-OCH ₂ CF ₃ -5-OCF ₃	3-SCHF ₂ -5-F	2,3,6-три-Ф	2,3-ди-Ф-5-Br
	3-SCF ₃ -5-OCF ₃	3-SCH ₂ F-5-F	2,6-ди-Ф-3-Cl	2,3-ди-Ф-5-I
	3-SCHF ₂ -5-OCF ₃	3-CN-5-F	2,6-ди-Ф-3-Br	2,3-ди-Ф-5-Me
	3-SCH ₂ F-5-OCF ₃	3-F-5-OMe	2,6-ди-Ф-3-I	2,3-ди-Ф-5-Et
10	3-CN-5-OCF ₃	3-Cl-5-OMe	2,6-ди-Ф-3-Me	2,3-ди-Ф-5- <i>n</i> -Pr
	3,5-ди-Ф	3-Br-5-OMe	2,6-ди-Ф-3-Et	2,3-ди-Ф-5- <i>i</i> -Pr
	3-Cl-5-F	3- <i>i</i> -5-OMe	2,6-ди-Ф-3- <i>n</i> -Pr	2,3-ди-Ф-5-OMe
	3-Br-5-F	3-Me-5-OMe	2,6-ди-Ф-3- <i>i</i> -Pr	2,3-ди-Ф-5-OEt
15	3- <i>i</i> -5-F	3-Et-5-OMe	2,6-ди-Ф-3-OMe	2,3-ди-Ф-5- <i>t</i> -Bu
	3-Me-5-F	3- <i>n</i> -Pr-5-OMe	2,6-ди-Ф-3-OEt	2,3-ди-Ф-5-CF ₃
	3-Et-5-F	3- <i>i</i> -Pr-5-OMe	2,6-ди-Ф-3- <i>t</i> -Bu	2,3-ди-Ф-5-CH ₂ F
	3- <i>n</i> -Pr-5-F	3,5-ди-OMe	2,6-ди-Ф-3-CF ₃	2,3-ди-Ф-5-CHF ₂
	3- <i>i</i> -Pr-5-F	3-OEt-5-OMe	2,6-ди-Ф-3-CH ₂ F	2,3-ди-Ф-5-O- <i>n</i> -Pr
20	3-OMe-5-F	3- <i>t</i> -Bu-5-OMe	2,6-ди-Ф-3-CHF ₂	2,3-ди-Ф-5-Ph
	3-OEt-5-F	3-CF ₃ -5-OMe	2,6-ди-Ф-3-O- <i>n</i> -Pr	2,3-ди-Ф-5-O- <i>i</i> -Pr
	3- <i>t</i> -Bu-5-F	3-CH ₂ F-5-OMe	2,6-ди-Ф-3-Ph	2,3-ди-Ф-5-SF ₅
	3-CF ₃ -5-F	3-CHF ₂ -5-OMe	2,6-ди-Ф-3-O- <i>i</i> -Pr	2,3-ди-Ф-5-OCF ₃
25	3-CH ₂ F-5-F	3-O- <i>n</i> -Pr-5-OMe	2,6-ди-Ф-3-SF ₅	2,3-ди-Ф-5-OCHF ₂
	3-CHF ₂ -5-F	3-Ph-5-OMe	2,6-ди-Ф-3-OCF ₃	2,3-ди-Ф-5-OCH ₂ F
	3-O- <i>n</i> -Pr-5-F	3-O- <i>i</i> -Pr-5-OMe	2,6-ди-Ф-3-OCHF ₂	2,3-ди-Ф-5-OCH ₂ CF ₃
	3-Ph-5-F	3-SF ₅ -5-OMe	2,6-ди-Ф-3-OCH ₂ F	2,3-ди-Ф-5-SCF ₃
30	3-O- <i>i</i> -Pr-5-F	3-OCF ₃ -5-OMe	2,6-ди-Ф-3-OCH ₂ CF ₃	2,3-ди-Ф-5-SCHF ₂
	3-SF ₅ -5-F	3-OCH ₂ F-5-OMe	2,6-ди-Ф-3-SCF ₃	2,3-ди-Ф-5-SCH ₂ F
	3-OCF ₃ -5-F	3-OCH ₂ CF ₃ -5-OMe	2,6-ди-Ф-3-SCHF ₂	2,3-ди-Ф-5-CN
	3-OCHF ₂ -5-F	3-SCF ₃ -5-OMe	2,6-ди-Ф-3-SCH ₂ F	
	3-OCH ₂ F-5-F	3-SCHF ₂ -5-OMe	2,6-ди-Ф-3-CN	
35	3-OCH ₂ CF ₃ -5-F	3-SCH ₂ F-5-OMe	2,3,5-три-Ф	

Таблица С-2 построена таким же образом, что и таблица С-1 за исключением того, что фраза в строке заголовка (т.е. “Х представляет собой Cl; R³ представляет собой 2-хлор-5-пиридирил; R⁴ представляет собой Н”) заменяется фразой, приведенной для таблицы С-2 ниже. Например, строкой заголовка в таблице С-2 является “Х представляет собой Cl; R³ представляет собой 5-пиримидинил; R⁴ представляет собой Н”. Таблицы С-3-С-14 построены подобным образом.

Таблица	Строка заголовка
С-2	Х представляет собой Cl; R ³ представляет собой 5-пиримидинил; R ⁴ представляет собой Н
С-3	Х представляет собой Cl; R ³ представляет собой 2-Ме-5-пиримидинил; R ⁴ представляет собой Н
С-4	Х представляет собой Cl; R ³ представляет собой 5-тиазолил; R ⁴ представляет собой Н
С-5	Х представляет собой Cl; R ³ представляет собой 2-Ме-5-тиазолил; R ⁴ представляет собой Н

C-6	X представляет собой Cl; R ³ представляет собой 2-Cl-5-тиазолил; R ⁴ представляет собой H
C-7	X представляет собой Cl; R ³ представляет собой 2-Cl-5-тиазолил; R ⁴ представляет собой Me
C-8	X представляет собой Br; R ³ представляет собой 2-хлор-5-пиридинил; R ⁴ представляет собой H
C-9	X представляет собой Br; R ³ представляет собой 5-пиримидинил; R ⁴ представляет собой H
C-10	X представляет собой Br; R ³ представляет собой 2-Ме-5-пиримидинил; R ⁴ представляет собой H
C-11	X представляет собой Br; R ³ представляет собой 5-тиазолил; R ⁴ представляет собой H
C-12	X представляет собой Br; R ³ представляет собой 2-Ме-5-тиазолил; R ⁴ представляет собой H
C-13	X представляет собой Br; R ³ представляет собой 2-Cl-5-тиазолил; R ⁴ представляет собой H

C-14	X представляет собой Br; R ³ представляет собой 2-Cl-5-тиазолил; R ⁴ представляет собой Me
------	--

ТАБЛИЦА C-15

X представляет собой Cl; R ³ представляет собой 2-хлор-5-пиридинил; R ⁴ представляет собой H	
R ²	R ²
CF ₃	2-хлор-4-(трифторметил)фенил
H	2-фтор-5-(трифторметил)фенил
Cl	2-хлор-4-цианофенил
Br	2-фтор-4-цианофенил
I	3-хлор-5-трифторметил-2-пиридил

Таблица C-16 построена таким же образом, что и таблица C-15 за исключением того, что фраза в строке заголовка (т.е. “X представляет собой Cl; R³ представляет собой 2-хлор-5-пиридинил; R⁴ представляет собой H”) заменяется фразой, приведенной для таблицы C-16 ниже. Например, строкой заголовка в таблице C-16 является “X представляет собой Cl; R³ представляет собой 5-пиримидинил; R⁴ представляет собой H”. Таблицы C-17-C-28 построены подобным образом.

Таблица	Строка заголовка
C-16	X представляет собой Cl; R ³ представляет собой 5-пиримидинил; R ⁴ представляет собой H
C-17	X представляет собой Cl; R ³ представляет собой 2-Ме-5-пиримидинил; R ⁴ представляет собой H
C-18	X представляет собой Cl; R ³ представляет собой 5-тиазолил; R ⁴ представляет собой H
C-19	X представляет собой Cl; R ³ представляет собой 2-Ме-5-тиазолил; R ⁴ представляет собой H
C-20	X представляет собой Cl; R ³ представляет собой 2-Cl-5-тиазолил; R ⁴ представляет собой H
C-21	X представляет собой Cl; R ³ представляет собой 2-Cl-5-тиазолил; R ⁴ представляет собой Me
C-22	X представляет собой Br; R ³ представляет собой 2-хлор-5-пиридинил; R ⁴ представляет собой H
C-23	X представляет собой Br; R ³ представляет собой 5-пиримидинил; R ⁴ представляет собой H
C-24	X представляет собой Br; R ³ представляет собой 2-Ме-5-пиримидинил; R ⁴ представляет собой H
C-25	X представляет собой Br; R ³ представляет собой 5-тиазолил; R ⁴ представляет собой H
C-26	X представляет собой Br; R ³ представляет собой 2-Ме-5-тиазолил; R ⁴ представляет собой H

C-27	X представляет собой Br; R ³ представляет собой 2-Cl-5-тиазолил; R ⁴ представляет собой H
C-28	X представляет собой Br; R ³ представляет собой 2-Cl-5-тиазолил; R ⁴ представляет собой Me

ТАБЛИЦА C-29

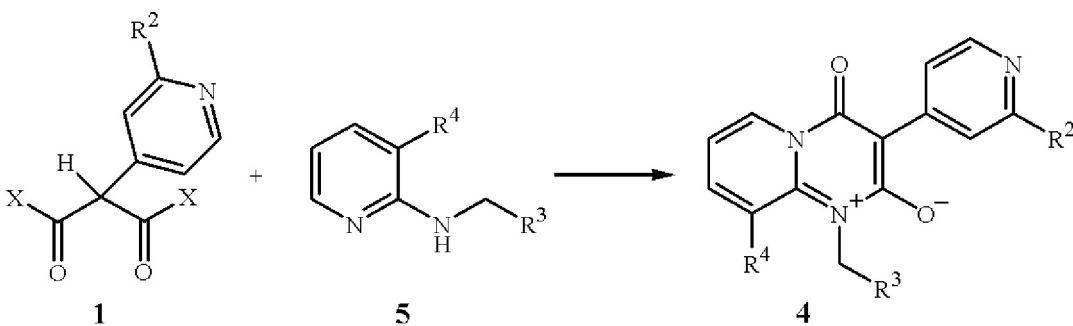
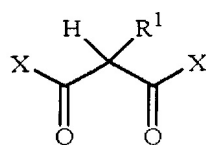
	
X представляет собой Cl; R ³ представляет собой 2-хлор-5-пиридилил; R ⁴ представляет собой H	
R ²	R ²
CF ₃	2-хлор-4-(трифторметил)фенил
H	2-фтор-5-(трифторметил)фенил
Cl	2-хлор-4-цианофенил
Br	2-фтор-4-цианофенил
I	3-хлор-5-трифторметил-2-пиридил

Таблица C-30 построена таким же образом, что и таблица C-29 за исключением того, что фраза в строке заголовка (т.е. “X представляет собой Cl; R³ представляет собой 2-хлор-5-пиридилил; R⁴ представляет собой H”) заменяется фразой, приведенной для таблицы C-30 ниже. Например, строкой заголовка в таблице C-30 является “X представляет собой Cl; R³ представляет собой 5-пиримидинил; R⁴ представляет собой H”. Таблицы C-31-C-42 построены подобным образом.

Таблица	Строка заголовка
C-30	X представляет собой Cl; R ³ представляет собой 5-пиримидинил; R ⁴ представляет собой H
C-31	X представляет собой Cl; R ³ представляет собой 2-Ме-5-пиримидинил; R ⁴ представляет собой H
C-32	X представляет собой Cl; R ³ представляет собой 5-тиазолил; R ⁴ представляет собой H
C-33	X представляет собой Cl; R ³ представляет собой 2-Ме-5-тиазолил; R ⁴ представляет собой H
C-34	X представляет собой Cl; R ³ представляет собой 2-Cl-5-тиазолил; R ⁴ представляет собой H
C-35	X представляет собой Cl; R ³ представляет собой 2-Cl-5-тиазолил; R ⁴ представляет собой Me
C-36	X представляет собой Br; R ³ представляет собой 2-хлор-5-пиридилил; R ⁴ представляет собой H
C-37	X представляет собой Br; R ³ представляет собой 5-пиримидинил; R ⁴ представляет собой H
C-38	X представляет собой Br; R ³ представляет собой 2-Ме-5-пиримидинил; R ⁴ представляет собой H
C-39	X представляет собой Br; R ³ представляет собой 5-тиазолил; R ⁴ представляет собой H
C-40	X представляет собой Br; R ³ представляет собой 2-Ме-5-тиазолил; R ⁴ представляет собой H
C-41	X представляет собой Br; R ³ представляет собой 2-Cl-5-тиазолил; R ⁴ представляет собой H
C-42	X представляет собой Br; R ³ представляет собой 2-Cl-5-тиазолил; R ⁴ представляет собой Me

(57) Формула изобретения

1. Способ получения соединения формулы 1



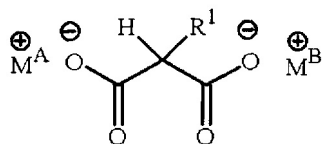
1

где

R^1 представляет собой фенил, замещенный 1 или 2 заместителями, независимо выбранными из Cl или CF_3 ; и

X представляет собой Cl или Br,

включающий приведение в контакт соединения формулы 2



2

где

R^1 представляет собой фенил, замещенный 1 или 2 заместителями, независимо выбранными из Cl или CF_3 ; и

каждый M^A и M^B независимо представляет собой Na, K, NH_4 , $NH(CH_2CH_3)_3$ или $NH(CH_2CH_2CH_2CH_3)_3$,

с галогенирующим средством.

2. Способ по п. 1, где

галогенирующим средством является оксалилхлорид, тионилхлорид, фосген, трифосген, цианурхлорид, хлорокись фосфора, трихлорид фосфора, пентахлорид фосфора, дифосген, сульфурхлорид, тионилбромид, трифенилфосфиндибромид или трибромид фосфора;

приведение в контакт выполняют в органическом растворителе; и

X представляет собой Cl или Br.

3. Способ по п. 2, где

галогенирующим средством является оксалилхлорид, тионилхлорид, фосген, трифосген или цианурхлорид;

X представляет собой Cl; и

органическим растворителем является толуол, дихлорметан, циклогексан, бензол, 1,2-дихлорэтан, этилацетат или бутилацетат.