

(19)



**Евразийское
патентное
ведомство**

(11) **034787**(13) **B1**(12) **ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОМУ ПАТЕНТУ**

(45) Дата публикации и выдачи патента

2020.03.20

(21) Номер заявки

201890098

(22) Дата подачи заявки

2012.08.30

(51) Int.Cl. *C07D 215/56* (2006.01) *C07D 498/04* (2006.01)
C07D 401/04 (2006.01) *C07D 498/06* (2006.01)
C07D 401/10 (2006.01) *C07D 519/00* (2006.01)
C07D 401/14 (2006.01) *A61K 31/444* (2006.01)
C07D 405/04 (2006.01) *A61K 31/4709* (2006.01)
C07D 409/04 (2006.01) *A61K 31/4725* (2006.01)
C07D 409/14 (2006.01) *A61K 31/497* (2006.01)
C07D 413/04 (2006.01) *A61K 31/506* (2006.01)
C07D 413/12 (2006.01) *A61K 31/5377* (2006.01)
C07D 413/14 (2006.01) *A61K 31/538* (2006.01)
C07D 417/04 (2006.01) *A61K 31/5383* (2006.01)
C07D 471/04 (2006.01) *A61P 31/04* (2006.01)
C07D 487/04 (2006.01)

(54) **ПРОИЗВОДНОЕ ХИНОЛОНА**(31) **PCT/CN2011/001477;****PCT/CN2012/001044**(32) **2011.08.31; 2012.08.06**(33) **CN**(43) **2018.05.31**(62) **201490530; 2012.08.30**

(71)(73) Заявитель и патентовладелец:

**ОЦУКА ФАРМАСЬЮТИКАЛ КО.,
ЛТД. (JP)**

(72) Изобретатель:

**Абудусайми Мамути, Е Фанго, Сунь
Цзянцинь (CN), Миямото Хисаси (JP),
Чэн Джей-Фэй (CN), Ока Даисукэ (JP)**

(74) Представитель:

Медведев В.Н. (RU)

(56) Benoit Ledoussal et al.: Discovery, Structure-Activity Relationships and Unique Properties of Non-Fluorinated Quinolones (NFQs), Current Medicinal Chemistry - Anti-Infective Agents, 2003, vol. 2, pp. 13-25, с. 17, фиг. 8, соединения 4, 6, 8, реферат
 EP-A1-0775702

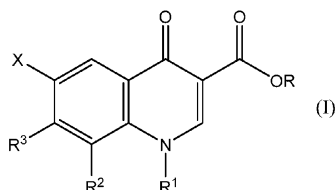
US-A-5308843

Mark P. Wentland et al. Relationship of structure of bridged (2,6-dimethyl-4-pyridinyl)quinolones to mammalian topoisomerase II inhibition, Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, 1993, vol. 3, No. 8, pp. 1711-1716, таблица 1, соединения 1, 2, 12-14, 16-22, 24-26

Salah A. Al-Trawneh et al. Synthesis and biological evaluation of tetracyclic fluoroquinolones as antibacterial and anticancer agents, Bioorganic & Medicinal Chemistry, 2010, vol. 18, pp. 5873-5884, реферат, схема 1, соединения 11a-11e

US-A-4623650

(57) Изобретение относится к соединению, представленному формулой (I)



где значения радикалов X, R, R¹, R², R³ определены в формуле изобретения, или его соли. Соединение по настоящему изобретению обладает превосходной противомикробной активностью и может быть использовано для предупреждения или лечения бактериальной инфекции.

B1**034787****034787 B1**

Область техники

Настоящее изобретение относится к производному хинолона и его фармацевтическому применению.

Предпосылки изобретения

Инфекция *Clostridium difficile* связана с применением антибиотиков, которые нарушают нормальную микробную флору кишечника, давая возможность заселиться самим *Clostridium difficile* и вызывать заболевание. В настоящее время для лечения рекомендуются только ванкомицин или метронидазол, и многие пациенты страдают рецидивами инфекции (Expert Opin. Ther. Patents (2010) 20(10), pp. 1389-1399).

В EP 2177214 A1 описано применение озеноксацина против *Clostridium difficile*.

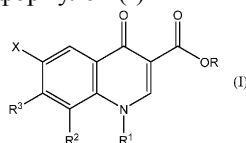
Некоторые соединения хинолона, используемые в качестве антибактериальных средств, описаны в JP1-319463 A, WO 99/51588, WO 99/03465, JP3-66301 B и WO 99/07682.

Сущность изобретения

Задачей настоящего изобретения является обеспечение нового производного хинолона, которое обладает превосходной противомикробной активностью, в частности превосходной противомикробной активностью в отношении *Clostridium difficile*. Другой задачей настоящего изобретения является обеспечение фармацевтической композиции, содержащей указанное производное хинолона, которая может быть использована при предотвращении или лечении различных инфекционных заболеваний, включая диарею, связанную с антибиотиками, (AAD), такую как диарею, связанную с *Clostridium difficile*, (CDAD). Следующей задачей настоящего изобретения является обеспечение способа предотвращения или лечения бактериальной инфекции, включая AAD, такой как CDAD, включающего введение указанного соединения хинолона человеку или животному.

Настоящее изобретение относится к производному хинолона, фармацевтической композиции, содержащей указанное производное, применению указанного производного и способу предотвращения или лечения бактериальной инфекции, как описано в пп. 1-27, ниже.

Пункт 1. Соединение, представленное формулой (I)



где

X представляет собой атом фтора;

R представляет собой атом водорода или C₁₋₆-алкил;

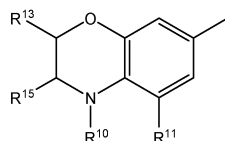
R¹ представляет собой циклопропил, необязательно замещенный 1-3 атомами галогена;

R² представляет собой C₁₋₆-алкил; C₁₋₆-алкокси или атом хлора;

R³ представляет собой

(1) 5-пиримидинил, замещенный 1 или двумя заместителями, выбранными из группы, состоящей из amino, C₁₋₆-алкиламино, ди(C₁₋₆-алкил)амино и карбокси, или

(2) группу формулы



где

R¹⁰ представляет собой

(a) атом водорода или

(b) C₁₋₆-алкил и каждый R¹¹, R¹³ и R¹⁵ независимо представляет собой

(a) атом водорода,

(b) атом галогена,

(c) циано,

(d) нитро,

(e) amino,

(f) C₁₋₆-алкиламино,

(g) ди (C₁₋₆-алкил)амино,

(h) C₁₋₆-алкил, необязательно замещенный гидроксильной или

(i) C₂₋₆-алкенил,

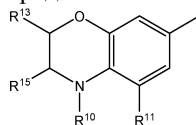
или его соль.

Пункт 2. Соединение по п.1, где R³ представляет собой 5-пиримидинил, замещенный 1 или 2 заместителями, выбранными из группы, состоящей из amino, C₁₋₆-алкиламино, ди (C₁₋₆-алкил)амино и карбокси,

или его соль.

Пункт 3. Соединение по п.1 или 2, где R^3 представляет собой 5-пиримидинил, замещенный 1 или 2 заместителями, выбранными из группы, состоящей из amino, C_{1-6} алкиламино и ди(C_{1-6} алкил)амино, или его соль.

Пункт 3. Соединение по п.1 или 2, где R^3 представляет собой группу формул



где R^{10} , R^{11} , R^{13} и R^{15} такие, как определено в п.1, или его соль.

Пункт 4. Соединение по пп.1-3, где каждый R^{10} , R^{11} , R^{13} и R^{15} представляет собой атом водорода, или его соль.

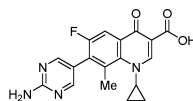
Пункт 5. Соединение по пп.1-4, где R представляет собой атом водорода, или его соль.

Пункт 6. Соединение по пп.1-5, где R^1 представляет собой циклопропил или 2-фторциклопропил, или его соль.

Пункт 7. Соединение по пп.1-6, где R^1 представляет собой циклопропил или 2-фторциклопропил, или его соль.

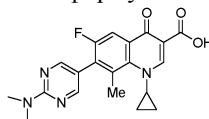
Пункт 8. Соединение по пп.1-7, где R^2 представляет собой метил, метокси или атом хлора, или его соль.

Пункт 9. Соединение по п.1, представленное формулой



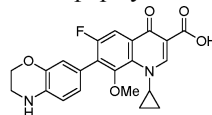
или его соль.

Пункт 10. Соединение по п.1, представленное формулой



или его соль.

Пункт 11. Соединение по п.1, представленное формулой



или его соль.

Пункт 12. Фармацевтическая композиция, содержащая соединение по пп.1-11 или его соль и фармацевтически приемлемый носитель.

Пункт 13. Противомикробное средство, содержащее соединение по пп.1-11 или его соль.

Пункт 14. Применение соединения по пп.1-11 или его соли в качестве лекарственного средства для предупреждения или лечения бактериальной инфекции.

Пункт 15. Применение соединения по пп.1-11 или его соли в качестве противомикробного средства.

Пункт 16. Применение соединения по пп.1-11 или его соли при предотвращении или лечении бактериальной инфекции.

Пункт 17. Применение соединения по пп.1-11 или его соли при получении лекарственного средства для предотвращения или лечения бактериальной инфекции.

Пункт 18. Способ предотвращения или лечения бактериальной инфекции, включающий введение эффективного количества соединения по пп.1-11 или его соли человеку или животному.

Соединение формулы (I) или его соль (здесь и далее иногда сокращенно указываемое как соединение (I)) обладает превосходной антибактериальной активностью в отношении различных грамположительных и грамотрицательных бактерий и может быть использовано при предотвращении или лечении различных инфекционных заболеваний, вызванных различными бактериями, у человека, других животных и рыб, а также может быть использовано в качестве внешнего антимикробного или дезинфицирующего средства для медицинских инструментов или тому подобное.

Краткое описание фигур

На фиг. 1 представлен график, показывающий результат введения животному соединения 2-18 по экспериментальному примеру 2.

На фиг. 2 представлен график, показывающий результат введения животному ванкомицина по экспериментальному примеру 2.

Подробное описание изобретения

Конкретными примерами групп в формуле (I) являются следующие.

Примеры "атома галогена" включают атом фтора, атом хлора, атом брома и атом йода.

Примеры "алкила" и "алкильной" группы в "алкиламино", "диалкиламино", "алкилкарбониле", "циклоалкилалкилсульфониле", "циклоалкилалкиле", "аминоалкиле" и "алкилсульфониле" включают прямой или разветвленный C_{1-6} алкил, такой как метил, этил, пропил, изопропил, бутил, изобутил, втор-бутил, трет-бутил, пентил, 1-этилпропил, изопентил, неопентил, трет-пентил, гексил, 1,2,2-триметилпропил, 3, 3-диметилбутил, 2-этилбутил, изогексил, 3-метилпентил и т.д.

Примеры "алкенила" включают прямой или разветвленный C_{2-6} алкенил, такой как винил, 1-пропенил, 2-пропенил, 1-бутенил, 2-бутенил, 3-бутенил, 1-метил-2-пропенил, 2-пентенил, 2-гексенил и т.д.

Примеры "алкокси" и "алкоксигруппы" в "галогеналкокси", "алкоксикарбониле" и "алкоксикарбониламино" включают прямой или разветвленный C_{1-6} алкокси, такой как метокси, этокси, пропокси, изо-пропокси, бутокси, изобутокси, втор-бутокси, трет-бутокси, пентилокси, изопентилокси, неопентилокси, трет-пентилокси, гексилкокси, изогексилкокси, 3-метилпентилокси и т.д.

Примеры "галогеналкокси" включают прямой или разветвленный C_{1-6} алкокси, замещенный 1 до 3 атомами галогена. Примеры включают фторметокси, дифторметокси, трифторметокси, хлорметокси, дихлорметокси, трихлорметокси, бромметокси, дибромметокси, дихлорфторметокси, 2,2,2-трифторэтокси, 2-хлорэтокси, 3,3,3-трифторпропокси, 2-хлорпропокси, 3-хлорпропокси, 3-бромпропокси, 4,4,4-трифторбутокси, 2-хлорбутокси, 4-хлорбутокси, 4-бромбутокси, 5,5,5-трифторпентилокси, 5-хлорпентилокси, 6,6,6-трифторгексилкокси, 6-хлоргексилкокси и т.д. Предпочтительные примеры включают дифторметокси.

Примеры "арила" и "арильной" группы в "арилсульфониле" включают C_{6-14} (предпочтительно, C_{6-10}) арил, такой как фенил, нафтил (например, 1-нафтил, 2-нафтил) и т.д. Предпочтительные примеры включают фенил.

Примеры "алкиламино" включают C_{1-6} алкиламино, такой как метиламино, этиламино, пропиламино, изопропиламино, бутиламино, изобутиламино, втор-бутиламино, трет-бутиламино, пентиламино, изопентиламино, неопентиламино, трет-пентиламино, гексиламино и т.д.

Примеры "диалкиламино" включают ди(C_{1-6} алкил)амино, такой как диметиламино, диэтиламино, дипропиламино, диизопропиламино, дибутиламино, диизобутиламино, ди(втор-бутил)амино, ди(трет-бутил)амино, дипентиламино, ди(трет-пентил)амино, дигексиламино, этилметиламино и т.д.

Примеры "аминоалкила" включают амино C_{1-6} алкил, такой как аминометил, 2-аминоэтил, 3-аминопропил, 4-аминобутил, 5-аминопентил, 6-аминогексил и т.д.

Примеры "циклоалкила" и "циклоалкильной" группы в "циклоалкилокси", "циклоалкилкарбониле", "циклоалкилалкиле" и "циклоалкилалкилсульфониле" включают C_{3-8} циклоалкил, такой как циклопропил, циклобутил, циклопентил, циклогексил, циклогептил, циклооктил, норборнанил (например, 2-норборнанил) и т.д.

Примеры "циклоалкилалкила" включают C_{3-8} циклоалкил C_{1-6} алкил, такой как циклопропилметил, циклобутилметил, циклопентилметил, циклогексилметил, циклогептилметил, циклооктилметил, норборнанилметил (например, норборнан-2-илметил) и т.д.

Примеры "циклической аминогруппы" включают 4-7-членную (предпочтительно, 5- или 6-членную) циклическую аминогруппу, содержащую один атом азота и необязательно дополнительно один гетероатом, выбранный из атома азота, атома кислорода и атома серы. Примеры включают 1-азетидинил, 1-пирролидинил, 1-имидазолидинил, 1-пиразолидинил, пиперидино, 1-пиперазинил, морфолино, тиоморфолино, 1-азепанил, 1,4-оксазепан-4-ил и т.д. Предпочтительные примеры включают 1-пирролидинил, пиперидино, 1-пиперазинил, морфолино, тиоморфолино и т.д.

Примеры "алкоксикарбонила" включают C_{1-6} алкоксикарбонил, где алкоксигруппа представляет собой C_{1-6} алкокси. Примеры включают метоксикарбонил, этоксикарбонил, пропоксикарбонил, изопропоксикарбонил, бутоксикарбонил, изобутоксикарбонил, втор-бутоксикарбонил, трет-бутоксикарбонил, пентилоксикарбонил, гексилкоксикарбонил и т.д.

Примеры "циклоалкилокси" включают C_{3-8} циклоалкилокси, такой как циклопропилокси, циклобутилокси, циклопентилокси, циклогексилкокси, циклогептилокси, циклооктилокси и т.д.

Примеры "циклопропила, необязательно замещенного 1-3 атомами галогена", включают циклопропил, необязательно замещенный 1 атомом фтора, такой как циклопропил, 2-фторциклопропил и т.д.

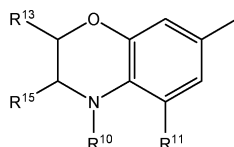
X представляет собой атом фтора.

R представляет собой атом водорода или алкил, предпочтительно атом водорода.

R^1 представляет собой (1) циклопропил, необязательно замещенный 1-3 атомами галогена.

R^2 представляет собой C_{1-6} алкил; C_{1-6} алкокси или атом хлора.

Предпочтительно R^3 представляет собой (1) 5-пиримидинил, замещенный 1 или двумя заместителями, выбранными из группы, состоящей из amino, C_{1-6} алкиламино, ди (C_{1-6} алкил) amino и карбокси, или (2) группу формулы



где

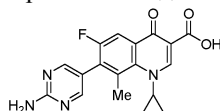
R¹⁰ представляет собой

(a) атом водорода или
(b) C₁₋₆алкил и
каждый R¹¹, R¹³ и R¹⁵ независимо представляет собой

(a) атом водорода,
(b) атом галогена,
(c) циано,
(d) нитро,
(e) амино,
(f) C₁₋₆алкиламино,
(g) ди (C₁₋₆алкил)амино,
(h) C₁₋₆алкил, необязательно замещенный гидроксильной или
(i) C₂₋₆алкенил,

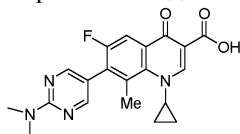
Более предпочтительно R³ представляет собой 5-пиримидинил, замещенный 1 или 2 заместителями, выбранными из группы, состоящей из амино, C₁₋₆алкиламино, ди (C₁₋₆алкил)амино и карбокси.

В одном из вариантов осуществления изобретения соединение представлено формулой



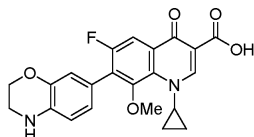
или его солью.

В одном из вариантов осуществления изобретения соединение представлено формулой



или его солью.

В одном из вариантов осуществления изобретения соединение представлено формулой

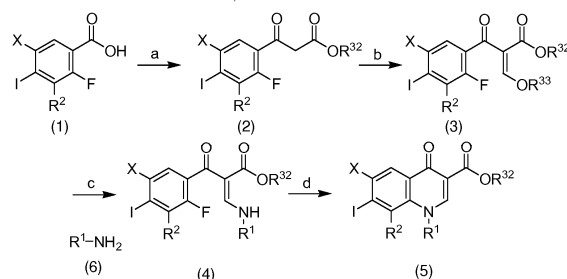


или его солью.

Примеры солей соединений формулы (I) включают фармацевтически приемлемые соли. Подходящие фармацевтически приемлемые соли соединения формулы (I) представляют собой общеизвестные нетоксичные соли и включают, например, соль с основанием или кислотно-аддитивную соль, такие как соль с неорганическим основанием, например, соль щелочного металла (например, соль натрия, соль калия и т.д.), соль щелочно-земельного металла (например, соль кальция, соль магния и т.д.), соль аммония; соль с органическим основанием, например, соль органического амина (например, соль триметил-амина, соль триэтиламина, соль пиридина, соль пиколина, соль этаноламина, соль триэтанол-амина, соль дициклогексиламина, соль N,N'-дибензилэтилендиамин и т.д.); кислотно-аддитивную соль с неорганической кислотой (например, гидрохлорид, гидробромид, сульфат, гидросульфат, фосфат и т.д.); кислотно-аддитивную соль с органической карбоновой или сульфоновой кислотой (например, формиат, ацетат, трифторацетат, малеат, тартрат, цитрат, фумарат, метансульфонат, бензолсульфонат, толуолсульфонат и т.д.) и соль с основной или кислотной аминокислотой (например, аргинин, аспарагиновая кислота, глутаминовая кислота и т.д.).

Соединение (I) может быть получено, например, способом в соответствии со следующими реакционными схемами.

Реакционная схема I



где X, R¹ и R² являются такими, как определено выше, R³² представляет собой алкил и R³³ представляет собой алкил.

Стадия а.

Соединение (1) может быть преобразовано в галогенангидрид кислоты путем взаимодействия соединения (1) с галогенирующим агентом в присутствии или отсутствии растворителя. Растворитель включает ароматические углеводороды, такие как бензол, толуол и ксилол; галогенированные углеводороды, такие как дихлорметан, хлороформ и тетрахлорид углерода; простые эфиры, такие как диоксан, тетрагидрофуран и диэтиловый эфир; N,N-диметилформамид (ДМФА); диметилсульфоксид (ДМСО) и тому подобное.

Галогенирующим агентом может быть любое из общеизвестных галогенирующих агентов, которые могут преобразовывать гидроксил, имеющийся в карбоксигруппе, в атом галогена, и включает, например, тионилхлорид, оксихлорид фосфора, оксибромид фосфора, пентахлорид фосфора, пентабромид фосфора и тому подобное. Количество соединения (1) и галогенирующего агента никак конкретно не ограничивается, но в случае использования растворителя галогенирующий агент обычно используется в большом избытке, и в случае использования растворителя, галогенирующий агент обычно используют в количестве, по меньшей мере, 1 моль, предпочтительно, 2-4 моль на 1 моль соединения (1). Температура реакции и время проведения реакции конкретно не ограничиваются, однако реакцию обычно проводят при температуре от комнатной температуры до приблизительно 100°C в течение от около 30 мин до около 6 ч.

Полученный галогенангидрид кислоты подвергают взаимодействию с магниевой солью моноалкилового эфира малоновой кислоты, с получением соединения (2). Магневая соль моноалкилового эфира малоновой кислоты может быть получена *in situ* из калиевой соли моноалкилового эфира малоновой кислоты, такого как калийэтилмалонат, в присутствии хлорида магния и основания, такого как триэтиламин. Реакция может быть проведена в подходящем растворителе. Растворитель, используемый в реакции, может представлять собой любой из общеизвестных растворителей, если он не оказывает нежелательного влияния на реакцию, и включает, например, сложные эфиры, такие как этилацетат; простые эфиры, такие как диэтиловый эфир, диоксан, тетрагидрофуран, моноглим и диглим; спирты, такие как метанол, этанол и изопропанол; ароматические углеводороды, такие как бензол, толуол и ксилол; алифатические углеводороды, такие как n-гексан, гептан, циклогексан и лигроин; амины, такие как пиридин и N,N-диметиланилин; галогенированные углеводороды, такие как хлороформ, дихлорметан и тетрахлорид углерода; апротонные полярные растворители, такие как ДМФА, ДМСО и гексаметилфосфорная триамид (НМПА); и смесь указанных растворителей. Реакцию обычно проводят при температуре от около 0 до около 150°C, предпочтительно от около 0 до около 120°C, в течение от около 0,5 до около 20 ч. Калиевую соль моноалкилового эфира малоновой кислоты обычно используют в количестве по меньшей мере 1 моль, предпочтительно 1-2 моль на 1 моль соединения (1). Хлорид магния и основание обычно используют в количестве по меньшей мере 1 моль, предпочтительно 1-2 моль на 1 моль соединения (1).

Стадия b.

Соединение (3) может быть получено путем взаимодействия соединения (2) с триалкилортоформиатом, таким как триметилортоформиат и триэтилортоформиат, в уксусном ангидриде. Реакцию обычно проводят при температуре от около 0 до около 200°C, предпочтительно от около 0 до около 150°C, в течение от около 0,5 до около 20 ч. Триалкилортоформиат обычно используют в количестве по меньшей мере 1 моль, предпочтительно 1-10 моль на 1 моль соединения (2).

Стадия с.

Соединение (4) может быть получено взаимодействием соединения (3) с соединением (6).

Взаимодействие между соединением (3) и соединением (6) может быть проведено в подходящем растворителе. Растворитель, используемый в реакции, может представлять собой любой общеизвестный растворитель, если он не оказывает нежелательного влияния на реакцию, и включает, например, спирты, такие как метанол, этанол и пропанол; простые эфиры, такие как диэтиловый эфир, диоксан, тетрагидрофуран, моноглим и диглим; ароматические углеводороды, такие как бензол, толуол и ксилол; алифатические углеводороды, такие как n-гексан, гептан, циклогексан и лигроин; галогенированные углеводороды, такие как хлороформ, метилхлорид и тетрахлорид углерода; апротонные полярные растворители, такие как ДМФА, ДМСО и НМПА; и тому подобное. Реакцию обычно проводят при температуре от около

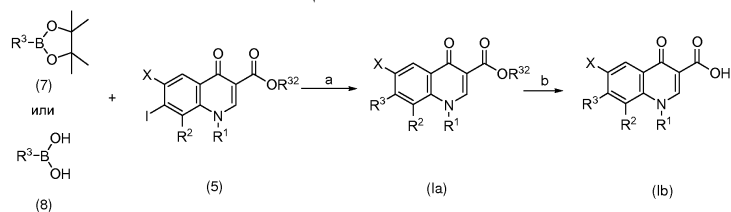
0 до около 150°C, предпочтительно, от комнатной температуры до около 100°C, в течение от около 0,1 до около 15 ч. Соединение (6) обычно используют в количестве по меньшей мере 1 моль, предпочтительно 1-2 моль на 1 моль соединения (3).

Стадия d.

Соединение (5) может быть получено путем циклизации соединения (4).

Циклизация соединения (4) может быть проведена в подходящем растворителе в присутствии основания. Растворитель, используемый в реакции, может представлять собой любой общеизвестный растворитель, если он не оказывает нежелательного влияния на реакцию, и включает, например, простые эфиры, такие как диэтиловый эфир, диоксан, тетрагидрофуран, моноглим и диглим; алифатические углеводороды, такие как н-гексан, гептан и лигроин; галогенированные углеводороды, такие как хлороформ, метилхлорид и тетрагидрид углерода; апротонные полярные растворители, такие как ДМФА, ДМСО и НМРА; и тому подобное. Основание, используемое в реакции, включает неорганические основания, такие как металлический натрий, металлический калий, гидрид натрия, амид натрия, гидроксид натрия, гидроксид калия, карбонат натрия и карбонат калия, алкоголяты металлов, такие как метилат натрия и этилат натрия, органические основания, такие как 1,8-диазацикло[5.4.0]ундец-7-ен (DBU), гидроксид N-бензилтриметиламмония и гидроксид тетрабутиламмония, и тому подобное. Реакцию обычно проводят при температуре от около 0 до около 200°C, предпочтительно от комнатной температуры до около 150°C, в течение от около 0,5 до около 15 ч. Основание обычно используют в количестве по меньшей мере 1 моль, предпочтительно 1-2 моль на 1 моль соединения (4).

Реакционная схема II



где X, R¹, R², R³ и R³² являются такими, как определено выше.

Стадия a.

Соединение (1a) может быть получено взаимодействием соединения (5) и соединения (7) или соединения (8) в инертном растворителе или без использования какого-либо растворителя, в присутствии или отсутствии основания, в присутствии палладиевого катализатора.

Примеры инертных растворителей включают воду; простые эфиры, такие как диоксан, тетрагидрофуран, диэтиловый эфир, 1,2-диметоксиэтан, диметилэтиленгликоль и диметилэтиленгликоль; ароматические углеводороды, такие как бензол, толуол и ксилол; спирты, такие как метанол, этанол и изопропанол; кетоны, такие как ацетон и метилэтилкетон; и апротонные полярные растворители, такие как ДМФА, ДМСО, НМРА и ацетонитрил. Указанные инертные растворители могут быть использованы отдельно или в комбинации двух или более.

Палладиевый катализатор, используемый в реакции, конкретно не ограничивается, но включает, например, четырехвалентные палладиевые катализаторы, такие как тетрагидрат гексахлорпалладата(IV) натрия и гексахлорпалладат(IV) калия; двухвалентные палладиевые катализаторы, такие как хлорид палладия(II), бромид палладия(II), ацетат палладия(II), ацетилацетонат палладия(II), дихлорбис(бензонитрил)палладий(II), дихлорбис(ацетонитрил)палладия(II), дихлорбис(трифенилфосфин)палладий(II), дихлортетрамин палладий(II), дихлор(циклоокта-1,5-диен)палладий(II), трифторацетат палладия(II) и комплекс с дихлорметаном 1,1'-бис(дифенилфосфино)ферроцендихлорпалладия(II) (Pd(dppf)Cl₂-CH₂Cl₂); нольвалентные палладиевые катализаторы, такие как трис(добензилиденацетон)дипалладий(0), комплекс с хлороформом трис(добензилиденацетон)дипалладия(0) и тетраakis(трифенилфосфин)палладия(0) и т.д. Указанные палладиевые катализаторы используют отдельно или в комбинации двух или более.

В реакции количество палладиевого катализатора конкретно не ограничивается, но составляет обычно интервал от 0,000001 до 20 моль в пересчете на палладий относительно 1 моль соединения (5). Количество палладиевого катализатора, предпочтительно, составляет интервал от 0,0001 до 5 моль в пересчете на палладий относительно 1 моль соединения (5).

Данную реакцию удобно проводить в присутствии подходящего лиганда. Примеры лигандов палладиевого катализатора включают, например, 2,2'-бис(дифенилфосфино)-1,1'-бинафтил (BINAP), три-о-толилфосфин, бис(дифенилфосфино)ферроцен, трифенилфосфин, три-трет-бутилфосфин и 4,5-бис(дифенилфосфино)-9,9-диметилксантен (Xantphos). Указанные лиганды используют отдельно или в комбинации двух или более.

Соотношение палладиевого катализатора и лиганда конкретно не ограничивается. Количество лиганда составляет от около 0,1 до около 100 моль на 1 моль палладиевого катализатора и предпочтительно от около 0,5 до около 15 моль на 1 моль палладиевого катализатора.

В качестве оснований могут быть использованы различные известные неорганические и органические

ские основания.

Неорганические основания включают, например, гидроксиды щелочных металлов, такие как гидроксид натрия, гидроксид калия, гидроксид цезия и гидроксид лития; карбонаты щелочных металлов, такие как карбонат натрия, карбонат калия, карбонат цезия и карбонат лития; гидрокарбонаты щелочных металлов, такие как гидрокарбонат лития, гидрокарбонат натрия и гидрокарбонат калия; щелочные металлы, такие как натрий и калий; фосфаты, такие как фосфат натрия и фосфат калия; амиды, такие как амид натрия; и гидриды щелочных металлов, такие как гидрид натрия и гидрид калия.

Органические основания включают, например, низшие алкоксиды щелочных металлов, такие как метоксид натрия, этоксид натрия, трет-бутоксид натрия, метоксид калия, этоксид калия и трет-бутоксид калия, и амины, такие как триэтиламин, трипропиламин, пиридин, хинолин, пиперидин, имидазол, N-этилдиизопропиламин, диметиламинопиридин, триметиламин, диметиланилин, N-метилморфолин, 1,5-диазабцикло[4.3.0]нон-5-ен (DBN), 1,8-диазабцикло[5.4.0]ундец-7-ен (DBU), 1,4-диазабцикло[2.2.2]октан (DABCO) и т.д.

Такие основания могут быть использованы отдельно или в комбинации двух или более. Более предпочтительные основания, используемые в реакции, включают карбонаты щелочных металлов, такие как карбонат натрия, карбонат калия, карбонат цезия и карбонат лития.

Основание обычно используют в количестве от 0,5 до 10 моль на 1 моль соединения (5) и предпочтительно от 0,5 до 6 моль на 1 моль соединения (5).

Соединение (7) или соединение (8) обычно используют в количестве по меньшей мере от 1 на 1 моль соединения (5) и предпочтительно от около 1 до около 5 моль на 1 моль соединения (5).

Реакция может быть осуществлена при нормальном давлении в атмосфере инертного газа, включая азот, аргон и т.д., или при повышенном давлении.

Реакцию осуществляют обычно при температуре от комнатной до около 200°C и предпочтительно от комнатной температуры до около 150°C, и она обычно завершается в течение от около 1 до около 30 ч. Реакция также может быть осуществлена при нагревании от около 100 до около 200°C в течение от около 5 мин до около 1 ч с использованием микроволнового реактора.

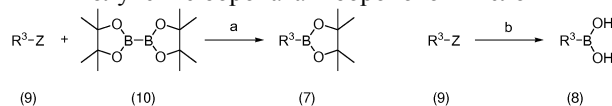
Стадия b.

Соединение (Ib) может быть получено гидролизом соединения (Ia).

Гидролиз соединения (Ia) может быть проведен в условиях, общеизвестных для гидролиза, например, в присутствии основания, такого как гидроксид натрия, гидроксид калия, гидроксид бария или карбонат калия; минеральной кислоты, такой как серная кислота, хлористоводородная кислота или азотная кислота; или органической кислоты, такой как уксусная кислота или ароматическая сульфоновая кислота, в растворителе, включая воду, спирты, такие как метанол, этанол и изопропанол; кетоны, такие как ацетон и метилэтилкетон; простые эфиры, такие как диоксан и диэтиловый эфир этиленгликоля; уксусная кислота; или их смеси. Реакцию обычно проводят при температуре от комнатной до около 200°C, предпочтительно от комнатной температуры до около 150°C, в течение от около 0,1 до около 30 ч.

Реакционная схема III

Получение бороната и бороновой кислоты



где R^3 является таким, как определено выше, и Z представляет собой атом брома или атом йода.

Стадия a.

Соединение (7) может быть получено взаимодействием соединения (9) с бис(пинаколато)дибороном (10) в инертном растворителе в присутствии палладиевого катализатора и основания.

Примеры инертных растворителей и палладиевого катализатора являются такими, как описано для стадии a в реакционной схеме II.

Основание, используемое в реакции, включает ацетат калия, триэтиламин, N-метилморфолин, карбонат натрия, карбонат калия, карбонат цезия, карбонат лития, фосфат калия и гидрокарбонат натрия.

В реакции количество палладиевого катализатора конкретно не ограничивается, но обычно составляет интервал от 0,000001 до 20 моль в пересчете на палладий относительно 1 моль соединения (9). Количество палладиевого катализатора предпочтительно составляет интервал от 0,0001 до 5 моль в пересчете на палладий относительно 1 моль соединения (9).

Основание обычно используют в количестве от 0,5 до 10 моль на 1 моль соединения (9) и предпочтительно от 0,5 до 6 моль на 1 моль соединения (9).

Бис(пинаколато)диборон (10) обычно используют в количестве по меньшей мере от 1 моль на 1 моль соединения (9) и предпочтительно от около 1 до около 5 моль на 1 моль соединения (9).

Реакция может быть осуществлена при нормальном давлении в атмосфере инертного газа, включая азот, аргон и т.д., или при повышенном давлении.

Реакцию обычно проводят при температуре от комнатной до около 200°C и предпочтительно от комнатной температуры до около 150°C и она обычно завершается в течение от около 1 до около 30 ч.

Стадия b.

Соединение (8) может быть получено взаимодействием соединения (9) с триалкилборатом, таким как триметилборат, триэтилборат, три(изопропил)борат и три(н-бутил)борат в инертном растворителе в присутствии н-бутиллития или диизопропиламида лития.

Примеры инертных растворителей являются такими, как описано на стадии a в реакционной схеме II.

Триалкилборат обычно используют в количестве по меньшей мере от 1 моль на 1 моль соединения (9) и предпочтительно от около 1 до около 5 моль на 1 моль соединения (9).

н-Бутиллитий или диизопропиламид лития обычно используют в количестве по меньшей мере от 1 моль на 1 моль соединения (9) и предпочтительно от около 1 до около 5 моль на 1 моль соединения (9).

Реакцию обычно проводят при температуре от около -70 до около 0°C в течение от около 0,1 до около 15 ч.

Соединение (I) по настоящему изобретению может быть легко преобразовано в его соль обработкой фармацевтически приемлемой кислотой или основанием. Кислота включает неорганические кислоты, такие как хлористоводородная кислота, серная кислота, фосфорная кислота и бромистоводородная кислота, и органические кислоты, такие как щавелевая кислота, малеиновая кислота, фумаровая кислота, яблочная кислота, винная кислота, лимонная кислота, бензойная кислота, молочная кислота, метансульфоновая кислота и пропионовая кислота. Основание включает гидроксид натрия, гидроксид калия, гидроксид кальция, карбонат натрия, гидрокарбонат калия и тому подобное.

Полученное таким образом соединение может быть легко выделено и очищено общеизвестными методами, такими как, например, экстракция растворителями, метод разбавления, перекристаллизация, колоночная хроматография и препаративная тонкослойная хроматография.

Соединение (I) проявляет превосходную противомикробную активность в отношении микоплазмы, *Pseudomonas aeruginosa*, анаэробных бактерий, резистентных клеток против различных антибактериальных препаратов, клинически изолированных бактерий и грамотрицательных и грамположительных бактерий, таких как

Clostridium difficile, *Enterococcus faecalis* и *Staphylococcus pyogenes*, и поэтому может быть использовано в качестве противомикробного средства для лечения заболеваний, вызванных указанными микроорганизмами. Соединение (I) проявляет также низкую токсичность и меньше побочных эффектов, и характеризуется хорошей абсорбционной способностью и устойчивой активностью.

Поскольку соединение (I) демонстрирует превосходную противомикробную активность в отношении *Clostridium difficile*, оно может быть использовано при предотвращении или лечении кишечных инфекций, включая диарею, связанную с антибиотиками, (AAD), такую как диарею, связанную с *Clostridium difficile*, (CDAD).

Соединения по настоящему изобретению обычно используют в виде обычного фармацевтического препарата. Фармацевтический препарат может быть получен в смеси с общеизвестными фармацевтически приемлемыми разбавителями или носителями, такими как наполнители, придающие объем агенты, связующие агенты, увлажняющие агенты, дезинтегранты, поверхностно-активные вещества и пластифицирующие агенты. Фармацевтический препарат включает различные препаративные формы, подходящие для лечения заболеваний, например, таблетки, пилюли, порошки, растворы, суспензии, эмульсии, гранулы, капсулы, суппозитории, инъекции, такие как растворы и суспензии, и тому подобное. При получении таблеток могут быть использованы любые общеизвестные носители, например, эксципиенты, такие как лактоза, белый сахар, хлорид натрия, глюкоза, мочевины, крахмалы, карбонат кальция, каолин, кристаллическая целлюлоза и силикат, связующие агенты, такие как вода, этанол, пропанол, простой сироп, раствор глюкозы, раствор крахмала, раствор желатина, карбоксиметилцеллюлоза, шеллак, метилцеллюлоза, фосфат калия и поливинилпирролидон, дезинтегранты, такие как сухой крахмал, альгинат натрия, порошок агара, ламинариевый порошок, гидрокарбонат натрия, карбонат кальция, сложные эфиры полиоксипропилена и жирной кислоты, лаурилсульфат натрия, моноглицерид стеариновой кислоты, крахмалы и лактоза, ингибиторы распада, такие как белый сахар, стеарин, масло какао и гидрированные масла, промоторы абсорбции, такие как соли четвертичного аммония и лаурилсульфат натрия, увлажняющие агенты, такие как глицерин и крахмалы, адсорбенты, такие как крахмалы, лактоза, каолин, бентонит и коллоидные силикаты, лубриканты, такие как очищенный тальк, стеараты, порошок борной кислоты и полиэтиленгликоль, и тому подобное. Таблетки, кроме того, могут быть покрыты общеизвестными агентами для покрытия, например, могут быть в виде таблетки, покрытой сахаром, таблетки, покрытой желатином, таблетки с энтеросолюбильным покрытием, таблетки, покрытой пленкой, или двух- или многослойной таблетки. При получении пилюль могут быть использованы общеизвестные носители, включая эксципиенты, такие как глюкоза, лактоза, крахмалы, масло какао, гидрированные растительные масла, каолин и тальк, связующие агенты, такие как порошок аравийской камеди, порошок трагаканта, желатин и этанол, дезинтегранты, такие как ламинария и агар, и тому подобное. При получении суппозиториев

могут быть использованы общеизвестные носители, такие как, например, полиэтиленгликоль, масло какао, высшие спирты, сложные эфиры высших спиртов, желатин и полусинтетические глицериды. При получении инъекций, растворов, эмульсий или суспензий соединений их стерилизуют и, предпочтительно, придают им изотоничность по отношению к жидкости организма. Указанные растворы, эмульсии и суспензии получают путем смешивания активного соединения с общеизвестным разбавителем, таким как вода, водный раствор молочной кислоты, этиловый спирт, пропиленгликоль, этоксилированный изостеариловый спирт, полиоксилированный изостеариловый спирт или сложные эфиры полиоксиэтиленсорбитана и жирной кислоты. Препараты также могут содержать хлорид натрия, глюкозу или глицерин в количестве, достаточном для придания им изотоничности по отношению к жидкости организма. Препараты также могут содержать общеизвестные солюбилизаторы, буферизирующие агенты, анестезирующие агенты и, кроме того, окрашивающие агенты, консерванты, отдушки, ароматизаторы, подслащивающие агенты и другие лекарственные средства.

Препараты в виде пасты, крема или геля могут быть получены путем использования разбавителя, такого как белое вазелиновое масло, парафин, глицерин, производные целлюлозы, полиэтиленгликоль, силикон, бентонит или тому подобное. Когда соединение активного ингредиента в инъекции образует осадок, в инъекционный раствор может быть добавлена кислота, такая как, например, метансульфоновая кислота, пропионовая кислота, хлористоводородная кислота, янтарная кислота или молочная кислота, как это требуется для поддержания инъекции в виде стабильного раствора.

В препаратах соединение (I) может содержаться в любом количестве, и обычно содержится в количестве 1-70 мас.% относительно всей массы препарата.

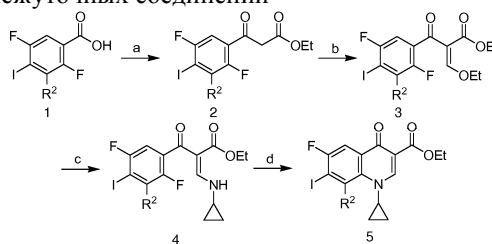
Фармацевтические препараты по настоящему изобретению могут быть введены различными способами. Подходящий путь введения может быть выбран в соответствии с видом препарата, возраста и пола пациентов, серьезности заболеваний и тому подобное. Например, таблетки, пилюли, растворы, суспензии, эмульсии, гранулы и капсулы вводятся пероральным путем. В случае инъекции, ее вводят внутривенно в отдельном виде или вместе со вспомогательной жидкостью, такой как глюкоза или раствор амина. Инъекции также могут быть введены внутримышечным, внутрикожным, подкожным или внутривенным путем. Суппозитории вводятся интравенальным путем.

Дозировка фармацевтических препаратов по настоящему изобретению может изменяться в зависимости от способа введения, возраста и пола пациентов, серьезности заболеваний и тому подобное, обычно составляет интервал от около 0,1 до около 100 мг, более предпочтительно, от около 0,1 до около 50 мг, соединения (I) на 1 кг массы тела пациента в день. Препарат обычно вводят разделенным на дозы от 2 до 4 раз в день.

Настоящее изобретение проиллюстрировано следующими примерами, экспериментальными примерами и препаративными примерами. Следует учесть, что настоящее изобретение не ограничивается указанными примерами, экспериментальными примерами или препаративными примерами и могут быть проделаны различные изменения и модификации без нарушения объема и сущности настоящего изобретения.

Примеры

Общая схема I. Синтез промежуточных соединений



Реагенты и условия реакции:

- $\text{KO}_2\text{CCH}_2\text{CO}_2\text{Et}$, MgCl_2 , Et_3N , 80°C ;
- $\text{HC}(\text{EtO})_3$, 150°C ;
- циклопропиламин;
- K_2CO_3 , ДМСО, 100°C .

Для получения желаемых конечных продуктов в качестве ключевой реакции использовали реакцию сочетание по Сузуки. Для сочетания соответствующие йод-промежуточные соединения могут быть получены хорошо известными способами, которые широко используются для синтеза хинолонов (общая схема I).

Пример 1. Синтез промежуточного соединения 5a ($\text{R}^2=\text{Me}$)

1.1.

Соединение 2: Смесь соединения 1 (2 г, 6,71 ммоль) и тионилхлорида (9,8 мл) кипятили с обратным холодильником в течение 3 ч и затем концентрировали, с получением хлорангидрида кислоты. К остатку добавляли сухой EtOAc (10 мл) и затем смесь концентрировали.

Смесь этилмалоната калия (1,6 г, 9,40 ммоль) и MgCl_2 (1,91 г, 20,13 ммоль) в сухом EtOAc переме-

шивали в течение 30 мин при температуре ниже 50°C. В смесь добавляли Et₃N (2,83 мл, 20,13 ммоль) при температуре ниже 50°C. Затем смесь кипятили с обратным холодильником в течение 1 ч. В смесь добавляли по каплям раствор хлорангидрида кислоты в сухом EtOAc (10 мл) при температуре 50-70°C, и затем смесь кипятили с обратным холодильником в течение 1,5 ч. В реакционную смесь при охлаждении льдом добавляли воду (30 мл) и 5н HCl (30 мл).

Раствор в EtOAc промывали водой, сушили и концентрировали, с получением соединения 2 в виде желтого масла, которое использовали на следующей стадии без дополнительной очистки.

1.2. Соединение 3: Смесь соединения 2 (11 г, 29,88 ммоль), триэтилортоформиата (7,47 мл, 44,82 ммоль) и уксусного ангидрида (6,77 мл, 71,72 ммоль) нагревали при температуре 150°C в течение 1 ч и затем концентрировали, с получением соединения 3, которое использовали на следующей стадии без дополнительной очистки.

1.3. Соединение 4: К соединению 3 (полученное выше) добавляли EtOH (50 мл) и циклопропиламин (2,48 мл, 35,86 ммоль). Смесь перемешивали в течение 30 мин и концентрировали с получением соединения 4, которое использовали на следующей стадии без дополнительной очистки.

1.4. Промежуточное соединение 5a: Соединение 4 (полученное выше) растворяли в сухом ДМСО (100 мл). К раствору добавляли K₂CO₃ (16,52 г, 119,53 ммоль). Реакционную смесь перемешивали при температуре 100°C в течение 1 ч. Когда данные ТСХ (EtOAc/дипропиловый эфир=1/1) показывали, что реакция завершилась, смесь охлаждали до комнатной температуры, выливали в воду и экстрагировали EtOAc. Органический слой промывали насыщенным раствором соли, сушили и концентрировали, с получением желтого твердого вещества, которое перекристаллизовывали из EtOAc. Промежуточное соединение 5a получали в виде белого твердого вещества с общим выходом 75%.

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,60 (с, 1H), 7,70 (д, J=7,8 Гц, 1H), 4,29-4,14 (м, 3H), 2,96 (с, 3H), 1,28 (т, J=7,1 Гц, 3H), 1,14 (кв, J=7,0 Гц, 2H), 0,87-0,76 (м, 2H).

Следующие соединения синтезировали согласно общей схеме I.

Пример 2:

Промежуточное соединение 5b (R²=OMe):

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,51 (с, 1H), 7,69 (д, J=7,7 Гц, 1H), 4,23 (дд, J=14,0, 6,9 Гц, 2H), 4,03 (с, 1H), 3,80 (с, 3H), 1,28 (т, J=7,0 Гц, 3H), 1,09 (д, J=6,2 Гц, 2H), 0,97 (м, 2H).

Пример 3: Промежуточное соединение 5c (R²=Cl):

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,61 (с, 1H), 7,81 (д, J=7,6 Гц, 1H), 4,23 (м, 3H), 1,28 (т, J=7,1 Гц, 3H), 1,21-1,08 (дд, J=7,1, 2,2 Гц, 2H), 0,99-0,92 (м, 2H).

Пример 4: Промежуточное соединение 5d:

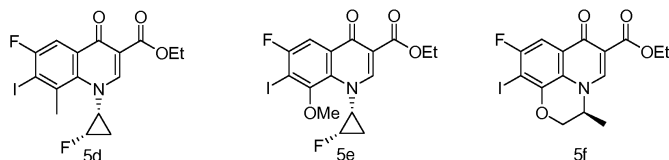
¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ 8,59-8,51 (д, J=3,1 Гц, 1H), 8,03-7,92 (д, J=7,5 Гц, 1H), 4,98-4,73 (ддд, J=62,9, 6,3, 4,9, 3,4 Гц, 1H), 4,44-4,34 (кв, J=7,1 Гц, 2H), 3,91-3,83 (дт, J=8,6, 5,4 Гц, 1H), 2,95-2,88 (с, 3H), 1,59-1,48 (м, 1H), 1,45-1,38 (т, J=7,1 Гц, 3H), 1,35-1,18 (м, 1H).

Пример 5: Промежуточное соединение 5e:

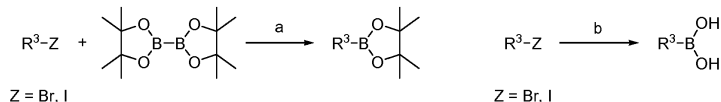
¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ 8,51-8,43 (д, J=2,0 Гц, 1H), 7,94-7,86 (д, J=7,6 Гц, 1H), 4,90-4,65 (ддд, J=62,7, 6,0, 5,1, 3,3 Гц, 1H), 4,37-4,28 (кв, J=7,1 Гц, 2H), 3,80-3,76 (с, 3H), 3,75-3,69 (дт, J=8,7, 5,5 Гц, 1H), 1,61-1,47 (м, 2H), 1,46-1,30 (м, 4H).

Пример 6: Промежуточное соединение 5f:

¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,65 (с, 1H), 7,48 (д, J=8,16 Гц, 1H), 4,79 (кв, J=6,65 Гц, 1H), 4,62 (дд, J=1,82, 11,36 Гц, 1H), 4,44 (дд, J=2,20, 11,36 Гц, 1H), 4,23 (кв.д, J=2,95, 7,09 Гц, 2H), 1,40 (д, J=6,65 Гц, 3H), 1,28 (т, J=7,09 Гц, 3H).



Общая схема II. Получение бороната и бороновой кислоты



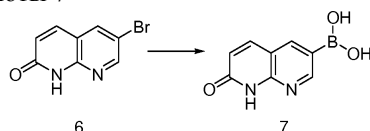
Реагенты и условия реакции:

a. Pd(dppf)Cl₂·CH₂Cl₂ (5% моль), KOAc, диоксан, 80°C;

b. n-BuLi (или LDA), B(OiPr)₃, ТГФ.

На общей схеме II представлено получение требуемых бороновых кислот и боронатов. Они могут быть легко получены общими способами.

Пример 7. Синтез бороновой кислоты 7



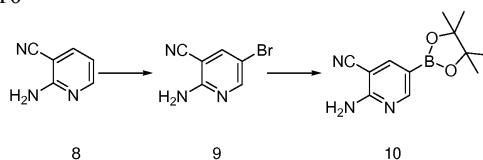
Реагенты и условия реакции:

а. 1) NaH, ТГФ, к.т.; 2) nBuLi, B(OiPr)₃, -70°C до 0°C.

7.1 Бороновая кислота 7:

К раствору соединения 6 (10 г, 44,44 ммоль) в сухом тетрагидрофуране (350 мл) добавляли гидрид натрия (2 г, 66,66 ммоль, 80%-ная дисперсия) при температуре 0°C. После перемешивания смеси при комнатной температуре в течение 30 мин смесь охлаждали ниже -60°C на бане сухой лед/ацетон и в течение 30 мин добавляли н-бутиллитий (70 мл, 112 ммоль, 1,6М в гексане). Смесь оставляли перемешиваться в течение еще 30 мин, затем добавляли по каплям триизопропилборат (40 мл, 177 ммоль). Реакционную смесь перемешивали в течение 10 мин и затем медленно на ледяной бане нагревали до температуры 0°C. В смесь добавляли HCl (5н) для доведения до pH=3-4 и смесь перемешивали в течение 20 мин. В смесь добавляли водн. NaOH доведением до pH=10. После фильтрования органический слой отделяли. Водный слой экстрагировали смесью этилацетат/ТГФ (4/1; 2×120 мл) и EtOAc (100 мл). Водный слой с использованием HCl доводили до pH=5-6. Полученный таким образом остаток собирали фильтрованием и сушили, с получением бороновой кислоты 7 (3,5 г, 41%) в виде белого твердого вещества.

Пример 8. Синтез бороната 10

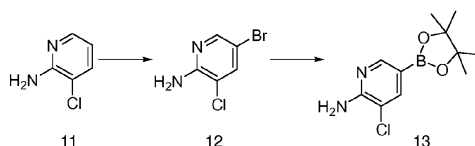


8.1 Соединение 9: 2-Аминоникотинитрил 8 (100 г, 0,839 моль) растворяли в HOAc (800 мл). К раствору добавляли Na₂CO₃ (88,97 г, 0,839 моль). Затем добавляли по каплям Br₂ (46,4 мл, 0,923 моль). Реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 50 мин. В смесь добавляли воду (600 мл).

Смесь охлаждали до температуры около 5°C. Полученный таким образом остаток собирали фильтрованием и сушили с получением соединения 9 (207 г, 96%).

8.2 Боронат 10: В колбу помещали соединение 9 (50 г, 0,224 моль), бис(пинаколато)диборон (85,6 г, 0,337 моль), KOAc (44,1 г, 0,449 моль) и Pd(dppf) Cl₂·CH₂Cl₂ (2,77 г, 3,4 ммоль). Добавляли диоксан (400 мл). Реакционную смесь перемешивали при температуре 100°C в течение 2 ч в атмосфере Ar. Когда данные ЖХ-МС указывали на завершение реакции, смесь охлаждали до комнатной температуры. Смесь фильтровали через диатомит, концентрировали, разбавляли смесью в соотношении 3/1 этилацетата и гексана (1000 мл), фильтровали через силикагель (300-400 меш), концентрировали, кристаллизовали и сушили, с получением бороната 10 (32 г, 66%) в виде белого твердого вещества.

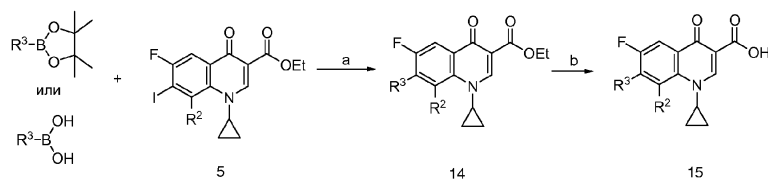
Пример 9. Синтез бороната 13



9.1 Соединение 12: 3-Хлорпиридин-2-амин (100 г, 0,778 моль) растворяли в уксусной кислоте (1200 мл). К раствору добавляли Na₂CO₃ (82,4 г, 0,778 моль). Затем добавляли по каплям Br₂ (39,1 мл, 0,856 ммоль). После добавления реакцию смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 30 мин. В смесь добавляли воду (800 мл). Смесь охлаждали до температуры около 5°C. Полученный твердый продукт собирали фильтрованием и сушили, с получением соединения 12 (147 г, 91%) в виде белого твердого вещества.

9.2 Боронат 13: В колбу помещали соединение 12 (4 г, 17,2 ммоль), бис(пинаколато)диборон (4,79 г, 18,8 ммоль), KOAc (3,37 г, 34,2 ммоль) и Pd(dppf) Cl₂·CH₂Cl₂ (0,210 г, 0,25 ммоль). Добавляли диоксан (80 мл). Смесь перемешивали при температуре 85°C в течение 2 ч в атмосфере Ar. Когда данные ЖХ-МС указывали на завершение реакции, смесь охлаждали до комнатной температуры. Смесь фильтровали через диатомит и концентрировали. Остаток разбавляли этилацетатом и гексаном (3/1, 100 мл), фильтровали через силикагель (300-400 меш), концентрировали и кристаллизовали из н-гексана, с получением бороната 13 (3,4 г, 78%) в виде белого твердого вещества.

Общая схема III

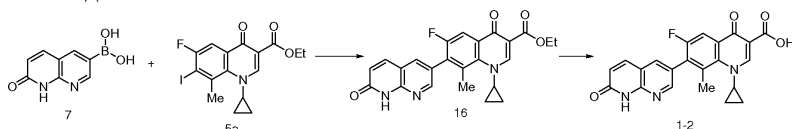


Реагенты и условия реакции:

a. Pd(dppf)Cl₂·CH₂Cl₂ (5% моль), K₂CO₃, диоксан, 80°C;

b. NaOH, EtOH.

Пример 10. Синтез соединений 1-2



10.1 Соединение 16: В колбу помещали промежуточное соединение 5a (30 г, 65 ммоль), бороновую кислоту 7 (17 г, 71,6 ммоль) и K₂CO₃ (27, 195 ммоль). Добавляли диоксан (600 мл) и воду (60 мл). Из раствора с использованием N₂ удаляли кислород в течение 15 мин. В смесь добавляли Pd(dppf)Cl₂·CH₂Cl₂ (2,8 г, 3,24 ммоль). Реакционную смесь перемешивали при температуре 85°C в течение ночи. Когда реакция была завершена, реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры. Осадок отфильтровывали, растворяли в воде, фильтровали, растирали в EtOH, фильтровали и сушили, с получением соединения 16 (16 г, 57%) в виде не совсем белого твердого продукта. Полученное соединение было достаточно чистым для использования.

Органический фильтрат концентрировали. К остатку добавляли воду, дихлорметан и EtOAc. Полученный таким образом остаток собирали фильтрованием и растворяли в HCl (5н). После фильтрования для удаления остатка Pd, фильтрат подщелачивали водн. NaOH (pH=7-8). Осадок собирали фильтрованием и сушили, с получением соединения 16 (3 г, 11%) в виде не совсем белого твердого продукта.

10.2 Соединение 1-2: Соединение 16 (33 г, 76,1 ммоль) суспендировали в EtOH (300 мл). В суспензию добавляли водн. NaOH (4н, 100 мл) и смесь перемешивали при температуре 60°C в течение 2 ч. При пониженном давлении упаривали 200 мл EtOH. К остатку добавляли HCl (5н) для доведения до pH=4. Образовавшийся осадок отфильтровывали, растирали в EtOH, фильтровали и сушили, с получением соединения 1-2 (30 г, 97%) в виде не совсем белого твердого продукта. Т.пл. >300°C.

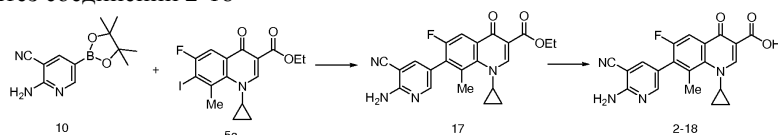
¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,64 (с, 1H), 12,39 (с, 1H), 8,92 (с, 1H), 8,58 (с, 1H), 8,28 (с, 1H), 8,01 (м, 2H), 6,67 (д, J=9,4 Гц, 1H), 4,42 (с, 1H), 2,68 (с, 3H), 1,27 (д, J=6,4 Гц, 2H), 1,12-1,03 (м, 2H).

¹³C ЯМР (101 МГц, ДМСО) δ 176,92, 165,25, 162,85, 158,16, 155,72, 152,71, 150,92, 149,62, 139,29, 138,79, 137,62, 133,70, 133,52, 131,80, 127,47, 127,38, 123,75, 123,42, 113,89, 108,05, 107,81, 107,29, 41,29, 20,64, 20,62, 10,62. ВЭЖХ-МС m/z 406 (M⁺).

Анализ. Вычислено для C₂₂H₁₆FN₃O₄: C, 65,18, H, 3,98, N, 10,37.

Найдено: C, 63,50, H, 4,00, N, 9,91.

Пример 11. Синтез соединений 2-18



11.1 Соединение 17: В колбу помещали боронат 10 (14 г, 56,1 ммоль), промежуточное соединение 5a (20 г, 46,7 ммоль), Cs₂CO₃ (15,22 г, 46,7 ммоль) и Pd(dppf)Cl₂·CH₂Cl₂ (0,98 г, 1,2 ммоль). Добавляли диоксан (500 мл) и воду (5 мл). Смесь перемешивали при температуре 110°C в течение ночи в атмосфере Ar. Смесь охлаждали до комнатной температуры. Смесь фильтровали и твердый продукт промывали диоксаном и этилацетатом. Твердый продукт растворяли в горячем CH₂Cl₂ (1200 мл) и раствор фильтровали через диатомит. Процедуру повторяли два раза. Органические слои объединяли и концентрировали. К остатку добавляли этилацетат (200 мл). Твердый продукт собирали фильтрованием, промывали этилацетатом (60 мл) и сушили, с получением соединения 17 (17,6 г, 90%) в виде белого твердого вещества.

11.2 Соединение 2-18: Соединение 17 (43 г, 0,101 моль) растворяли в ТГФ и EtOH (1/1, 500 мл). К раствору добавляли NaOH (60 мл, 4н). Смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 2 час. Добавляли HCl (63 мл, 4н) для подкисления смеси (pH=3-4). Твердый продукт собирали фильтрованием, промывали EtOH (100 мл) и сушили, с получением соединения 2-18 (35,7 г, 99%) в виде белого твердого вещества. Т.пл. >300°C.

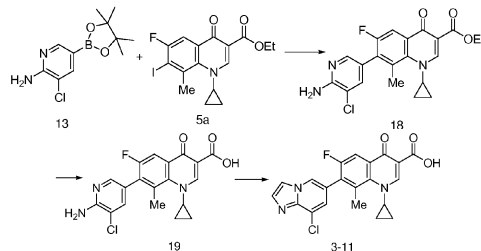
¹H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,65 (с, 1H), 8,89 (с, 1H), 8,32-8,23 (м, 1H), 8,08 (д, J=2,09 Гц, 1H), 7,94 (д, J=8,87 Гц, 1H), 7,28 (с, 2H), 4,40 (тт, J=3,74, 7,17 Гц, 1H), 2,67 (с, 3H), 1,31-1,19 (м, 2H), 1,10-0,99 (м, 2H).

^{13}C ЯМР (101 МГц, ДМСО) δ 176,95, 176,92, 165,32, 159,60, 158,29, 155,86, 154,07, 152,67, 143,59, 139,32, 133,39, 133,22, 131,73, 127,13, 127,05, 116,93, 116,52, 107,96, 107,71, 107,27, 89,15, 41,32, 20,64, 20,62, 10,65. ВЭЖХ-МС m/z 379 (MH^+).

Анализ. Вычислено для $\text{C}_{20}\text{H}_{15}\text{FN}_4\text{O}_3$: С, 63,49, Н, 4,00, N, 14,81.

Найдено: С, 62,04, Н, 4,20, N, 13,97.

Пример 12. Синтез соединений 3-11



12.1 Соединение 18: В колбу помещали боронат 13 (20 г, 7 5,4 ммоль), промежуточное соединение 5a (24,1 г, 58,03 ммоль), Cs_2CO_3 (26,5 г, 81,2 ммоль) и $\text{Pd}(\text{dppf})\text{Cl}_2 \cdot \text{CH}_2\text{Cl}_2$ (1,42 г, 1,7 ммоль). Добавляли диоксан (400 мл) и воду (4 мл). Смесь перемешивали при температуре 100°C в течение ночи в атмосфере Ar . Смесь охлаждали до комнатной температуры. Смесь фильтровали и твердый продукт промывали диоксаном и этилацетатом. Твердый продукт растворяли в горячем CH_2Cl_2 (1200 мл) и раствор фильтровали через диатомит. Процедуру повторяли два раза. Органические слои объединяли и концентрировали. К остатку добавляли этилацетат (200 мл). Твердый продукт собирали фильтрованием, промывали этилацетатом (60 мл) и сушили, с получением соединения 18 (21 г, 85%) в виде белого твердого вещества.

12.2 Соединение 19: Соединение 18 (39 г, 91,91 ммоль) растворяли в ТГФ и EtOH (1/1, 600 мл). В смесь добавляли NaOH (4н, 60 мл). Смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 2 ч. Добавляли HCl (4н, 62 мл) для подкисления раствора ($\text{pH}=3-4$). Твердый продукт собирали фильтрованием, промывали EtOH (100 мл) и сушили, с получением соединения 19 (34 г, 98%) в виде белого твердого вещества.

12.3 Соединение 3-11: К раствору соединения 19 (34 г, 91,9 ммоль) в EtOH (600 мл) добавляли хлорацетальдегид (40% в воде, 80 мл). Смесь кипятили с обратным холодильником в течение 3 ч. Когда данные ЖХ-МС указывали на завершение реакции, смесь охлаждали до температуры 5°C и фильтровали. Твердый продукт сушили, с получением соединения 3-11 (21 г). Маточный раствор подщелачивали ($\text{pH}=7-8$) водн. NaOH . Осадок собирали фильтрованием, промывали EtOH и сушили, с получением соединения 3-11 (11,5 г) в виде белого твердого вещества. Всего получали 32,5 г соединения 3-11 с 93%-ным выходом. Т.пл.: 307-311°C.

^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,53 (с, 1H), 8,98-8,84 (м, 2H), 8,28 (д, $J=1,16$ Гц, 1H), 7,98 (д, $J=8,83$ Гц, 1H), 7,90 (д, $J=0,89$ Гц, 1H), 7,77 (с, 1H), 4,43 (тт, $J=3,70, 7,10$ Гц, 1H), 3,50-3,36 (м, 1H), 2,72 (с, 3H), 1,26 (д, $J=6,80$ Гц, 2H), 1,07 (д, $J=18,24$ Гц, 2H).

^{13}C ЯМР (101 МГц, ДМСО) δ 176,91, 176,88, 165,23, 158,22, 155,77, 152,84, 139,98, 139,17, 139,16, 132,44, 132,15, 131,98, 131,54, 127,86, 127,78, 127,38, 120,72, 118,97, 116,37, 108,15, 107,91, 107,37, 41,38, 20,54, 20,52, 10,72.

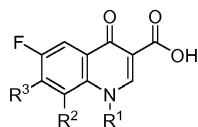
ВЭЖХ-МС: m/z 412 (MH^+).

Анализ. Вычислено для $\text{C}_{21}\text{H}_{15}\text{ClFN}_3\text{O}_3$: С, 61,25, Н, 3,67, N, 10,20.

Найдено: С, 58,59, Н, 3,86, N, 9,76.

Соединения, перечисленные в следующих таблицах, были синтезированы согласно общей схеме III.

Таблица 1











Соед. №	R ³	R ²	R ¹	ЯМР	МС (МН ⁺)	ВЭЖХ
1-1		OMe	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,63 (с, 1H), 12,41 (с, 1H), 8,82 (с, 1H), 8,69 (с, 1H), 8,38 (с, 1H), 8,05 (д, J=9,6 Гц, 1H), 7,99 (д, J=9,1 Гц, 1H), 6,66 (дд, J=9,5, 1,6 Гц, 1H), 4,24 (с, 1H), 3,42 (с, 3H), 1,19 (д, J=7,2 Гц, 4H).	422	98%
1-2		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,64 (с, 1H), 12,39 (с, 1H), 8,92 (с, 1H), 8,58 (с, 1H), 8,28 (с, 1H), 8,01 (м, 2H), 6,67 (д, J=9,4 Гц, 1H), 4,42 (с, 1H), 2,68 (с, 3H), 1,27 (д, J=6,4 Гц, 2H), 1,12-1,03 (м, 2H).	406	98%
1-3		OMe		¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,49 (с, 1H), 12,41 (с, 1H), 8,85 (д, J=1,3 Гц, 1H), 8,67 (с, 1H), 8,36 (с, 1H), 8,05 (д, J=9,6 Гц, 1H), 8,00 (д, J=9,1 Гц, 1H), 6,77-6,54 (м, 1H), 5,24-4,97 (м, 1H), 4,29-4,10 (м, 1H), 3,44 (с, 3H), 1,89-1,59 (м, 2H).	440	98%
1-4		Me		¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,50 (с, 1H), 12,39 (с, 1H), 8,90 (д, J=3,0 Гц, 1H), 8,58 (с, 1H), 8,27 (с, 1H), 8,02 (м, 2H), 6,74-6,61 (м, 1H), 5,17 (дд, J=64,3, 3,1 Гц, 1H), 4,39 (м, 1H), 2,60 (с, 3H), 1,84-1,50 (м, 2H).	424	98%
1-5		Cl	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,22 (с, 1H), 12,42 (с, 1H), 8,94 (с, 1H), 8,61 (д, J=2,0 Гц, 1H), 8,31 (д, J=2,0 Гц, 1H), 8,20 (д, J=8,5 Гц, 1H), 8,03 (д, J=9,6 Гц, 1H), 6,67 (д, J=9,5 Гц, 1H), 4,51-4,34 (м, 1H), 1,29-1,19 (м, 2H), 1,17-1,05 (м, 2H).	426	98%
1-7		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,65 (с, 1H), 11,27 (с, 1H), 8,91 (с, 1H), 8,04 (д, J=9,5 Гц, 1H), 7,98 (д, J=8,8 Гц, 1H), 7,78 (с, 2H), 6,69 (д, J=9,5 Гц, 1H), 4,49-4,30 (м, 1H), 2,65 (с, 3H), 1,25 (д, J=6,7 Гц, 2H), 1,08 (с, 2H).	439	98%
1-8		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,66 (с, 1H), 11,99 (с, 1H), 8,91 (с, 1H), 8,03 (д, J=9,1 Гц, 1H), 7,98 (д, J=8,8 Гц, 1H), 7,60 (с, 1H), 7,57 (д, J=11,5 Гц, 1H), 6,66 (д, J=9,6 Гц, 1H), 4,51-4,29 (м, 1H), 1,25 (д, J=6,3 Гц, 2H), 1,15-0,94 (м, 2H).	423	98%
1-9		OMe	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,64 (с, 1H), 11,30 (с, 1H), 8,82 (с, 1H), 8,15-8,03 (м, 1H), 8,00-7,93 (д, J=9,1 Гц, 1H), 7,93-7,80 (д, J=12,9 Гц, 2H), 6,79-6,51 (д, J=9,4 Гц, 1H), 4,28-4,15 (м, 1H), 3,51-3,38 (с, 3H), 1,31-1,09 (м, 4H).	455	93%
1-10		OMe	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,69-14,59 (с, 1H), 12,08-11,94 (с, 1H), 8,90-8,74 (с, 1H), 8,13-8,01 (д, J=1,8 Гц, 1H), 7,99-7,91 (д, J=9,1 Гц, 1H), 7,77-7,71 (с, 1H), 7,68-7,59 (д, J=11,6 Гц, 1H), 6,71-6,62 (д, J=9,6 Гц, 1H), 4,30-4,17 (дд, J=11,2, 7,5, 4,7 Гц, 1H), 3,47-3,39 (с, 3H), 1,22-1,11 (м, 4H).	439	95%

1-11		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,68 (с, 1H), 9,92 (с, 1H), 8,91 (с, 1H), 8,09 (д, J=9,6 Гц, 1H), 7,99 (д, J=8,8 Гц, 1H), 7,81 (с, 1H), 7,62-7,53 (м, 4H), 7,52-7,47 (м, 1H), 7,46 (с, 1H), 6,65 (д, J=9,5 Гц, 1H), 4,65-4,23 (м, 1H), 2,70 (с, 3H), 1,24 (д, J=7,0 Гц, 2H), 1,07 (с, 2H).	481	98%
1-12		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,68 (с, 1H), 12,23 (с, 1H), 8,92 (с, 1H), 8,10 (д, J=9,5 Гц, 1H), 8,00 (д, J=8,7 Гц, 1H), 7,87 (с, 1H), 7,70 (с, 1H), 6,70 (д, J=9,3 Гц, 1H), 4,43 (с, 1H), 2,64 (с, 3H), 1,23 (с, 2H), 1,07 (д, J=12,5 Гц, 2H).	489	98%
1-13		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,66 (с, 1H), 10,55 (с, 1H), 8,91 (с, 1H), 8,04 (д, J=9,5 Гц, 1H), 7,99 (д, J=8,7 Гц, 1H), 7,84 (с, 1H), 7,74 (с, 1H), 6,68 (д, J=9,4 Гц, 1H), 4,75 (с, 1H), 4,40 (м, 1H), 2,64 (с, 3H), 1,25 (д, J=6,9 Гц, 2H), 1,08 (с, 2H).	429	90%
1-14		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,70 (с, 1H), 11,06 (с, 1H), 8,91 (с, 1H), 8,05-7,87 (м, 2H), 7,31 (с, 1H), 7,16 (с, 1H), 6,60 (д, J=9,5 Гц, 1H), 4,40 (дд, J=7,0, 3,4 Гц, 1H), 3,94 (с, 3H), 2,65 (с, 3H), 1,25 (д, J=7,1 Гц, 2H), 1,08 (с, 2H).	435	90%
1-15		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,65 (с, 1H), 10,97 (с, 1H), 8,92 (с, 1H), 8,28-8,06 (м, 2H), 8,01 (д, J=8,8 Гц, 1H), 7,95 (с, 1H), 6,74 (д, J=8,5 Гц, 1H), 4,49-4,33 (м, 1H), 2,64 (с, 3H), 1,25 (д, J=6,8 Гц, 2H), 1,10 (с, 2H).	473	90%
1-16		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,72 (с, 1H), 11,95 (с, 1H), 8,91 (с, 1H), 7,99 (д, J=7,9 Гц, 2H), 7,76 (с, 1H), 7,54 (д, J=8,4 Гц, 1H), 7,47 (д, J=8,4 Гц, 1H), 6,59 (д, J=9,5 Гц, 1H), 4,40 (с, 1H), 2,63 (с, 3H), 1,25 (д, J=6,1 Гц, 2H), 1,07 (с, 2H).	405	98%
1-17		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,66 (с, 1H), 10,76 (с, 1H), 8,92 (с, 1H), 8,03 (д, J=9,7 Гц, 1H), 7,99 (д, J=8,8 Гц, 1H), 7,93 (с, 1H), 7,83 (с, 1H), 6,68 (д, J=9,4 Гц, 1H), 2,65 (с, 3H), 1,25 (м, 2H), 1,07 (м, 2H).	482; 484	96%
1-18		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,63 (с, 1H), 11,86 (с, 1H), 8,92 (с, 1H), 8,16 (м, 3H), 8,00 (д, J=8,7 Гц, 1H), 6,80 (с, 1H), 4,42 (с, 1H), 2,65 (с, 3H), 1,26 (м, 2H), 1,09 (м, 2H).	430	96%
1-19		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,69 (с, 1H), 11,10 (с, 1H), 8,90 (с, 1H), 7,97 (т, J=9,04 Гц, 2H), 7,58 (с, 1H), 7,39 (с, 1H), 6,59 (д, J=9,48 Гц, 1H), 4,39 (дт, J=3,29, 6,75 Гц, 1H), 3,36 (с, 3H), 2,63 (с, 3H), 1,25 (д, J=6,45 Гц, 2H), 1,06 (с, 2H).	419	96%
1-20		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,64 (с, 1H), 8,93 (с, 1H), 8,21 (с, 1H), 8,18 (с, 1H), 8,15 (д, J=9,7 Гц, 1H), 8,02 (д, J=8,9 Гц, 1H), 6,81 (д, J=9,7 Гц, 1H), 6,24 (с, 2H), 4,41 (м, 2H), 2,65 (с, 4H), 1,25 (м, 2H), 1,10 (м, 2H).	461	90%
1-21		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,75 (с, 1H), 12,18 (с, 1H), 8,91 (с, 1H), 8,14 (с, 1H), 7,96 (д, J=8,8 Гц, 1H), 7,78 (д, J=7,7 Гц, 1H), 7,60 (д, J=7,8 Гц, 1H), 7,41 (д, J=7,9 Гц, 1H), 7,28 (д, J=7,4 Гц, 1H), 4,43 (с, 1H), 2,71 (с, 3H), 1,24 (с, 2H), 1,05 (с, 2H).	405	98%

1-22		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,75 (с, 1H), 8,91 (с, 1H), 8,16 (с, 1H), 7,96 (д, J=8,2 Гц, 1H), 7,90 (с, 1H), 7,85 (д, J=7,3 Гц, 1H), 7,66 (д, J=8,5 Гц, 1H), 7,38 (д, J=6,7 Гц, 1H), 4,42 (с, 1H), 3,74 (с, 3H), 2,69 (с, 3H), 1,23 (с, 2H), 1,05 (с, 2H).	419	95%
1-23		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,72 (с, 1H), 12,04 (с, 1H), 8,93 (с, 1H), 8,04 (д, J=8,2 Гц, 1H), 7,68 (т, J=7,5 Гц, 1H), 7,48 (д, J=8,1 Гц, 1H), 7,35 (д, J=9,7 Гц, 1H), 7,17 (д, J=7,1 Гц, 1H), 6,49 (д, J=9,7 Гц, 1H), 4,39 (с, 1H), 2,50 (с, 3H), 1,16 (м, 4H).	405	96%
1-24		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,82 (с, 1H), 10,88 (с, 1H), 8,95 (с, 1H), 8,20-7,94 (м, 2H), 7,86 (д, J=30,6 Гц, 1H), 7,44 (д, J=7,5 Гц, 1H), 7,36 (с, 1H), 6,57 (с, 1H), 4,41 (с, 1H), 2,67 (с, 3H), 1,47-0,92 (м, 4H).	405	90%
1-25		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,66 (с, 1H), 12,12 (с, 1H), 8,94 (с, 1H), 8,06 (д, J=8,5 Гц, 1H), 7,58 (с, 1H), 7,45 (д, J=7,0 Гц, 1H), 7,13 (с, 1H), 7,02 (д, J=8,0 Гц, 1H), 6,65 (с, 1H), 4,40 (м, 1H), 2,62 (с, 3H), 1,28-1,04 (м, 4H).	405	90%
1-26		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,70 (с, 1H), 11,88 (с, 1H), 8,92 (с, 1H), 8,01 (д, J=8,8 Гц, 2H), 7,86 (д, J=7,8 Гц, 1H), 7,29 (с, 1H), 7,22 (д, J=7,6 Гц, 1H), 6,60 (д, J=9,6 Гц, 1H), 4,40 (с, 1H), 2,62 (с, 3H), 1,24 (д, J=5,6 Гц, 2H), 1,07 (с, 2H).	405	94%
1-27		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,80 (с, 1H), 11,57 (с, 1H), 11,48 (с, 1H), 8,97 (с, 1H), 8,04 (д, J=8,5 Гц, 1H), 7,82 (с, 1H), 7,60 (д, J=8,1 Гц, 1H), 7,49 (д, J=8,2 Гц, 1H), 5,86 (с, 1H), 4,45 (с, 1H), 2,68 (с, 3H), 1,30 (д, J=5,7 Гц, 2H), 1,13 (с, 2H).	421	98%
1-28		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,75 (с, 1H), 10,73 (с, 1H), 8,90 (с, 1H), 7,97 (д, J=8,4 Гц, 1H), 7,89 (с, 1H), 7,43 (с, 1H), 7,28 (д, J=7,6 Гц, 1H), 4,40 (с, 1H), 2,62 (с, 3H), 1,24 (с, 2H), 1,06 (с, 2H).	466	96%
1-29		OMe	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,69 (с, 1H), 11,96 (с, 1H), 8,81 (с, 1H), 8,01 (д, J=9,6 Гц, 1H), 7,95 (д, J=9,1 Гц, 1H), 7,87 (с, 1H), 7,68 (д, J=8,6 Гц, 1H), 7,49 (д, J=8,6 Гц, 1H), 6,57 (дд, J=9,5, 1,7 Гц, 1H), 4,32-4,10 (м, 1H), 3,38 (с, 3H), 1,18 (м, 4H).	421	98%
1-30		Cl	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,41 (с, 1H), 11,96 (с, 1H), 8,91 (с, 1H), 8,20 (д, J=8,8 Гц, 1H), 7,95 (д, J=9,1 Гц, 1H), 7,80 (с, 1H), 7,68 (д, J=8,6 Гц, 1H), 7,49 (д, J=8,6 Гц, 1H), 6,62 (дд, J=9,5, 1,7 Гц, 1H), 4,32-4,10 (м, 1H), 1,30 (м, 2H), 1,18 (м, 2H).	425	96%
1-31		OMe	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,67 (с, 1H), 11,89 (с, 1H), 8,82 (с, 1H), 8,17-7,90 (м, 2H), 7,85 (д, J=8,0 Гц, 1H), 7,48 (с, 1H), 7,35 (д, J=7,9 Гц, 1H), 6,60 (д, J=11,2 Гц, 1H), 4,28-4,14 (м, 1H), 3,41 (с, 4H), 1,18 (м, 4H).	421	90%
1-32		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,69 (с, 1H), 11,78 (с, 1H), 8,91 (с, 1H), 7,98 (д, J=8,77 Гц, 1H), 7,72 (с, 1H), 7,54 (с, 1H), 7,50-7,44 (м, 1H), 6,48 (с, 1H), 2,63 (с, 3H), 2,44 (с, 3H), 1,28-1,21 (м, 2H), 1,12-1,02 (м, 2H).	419	96%

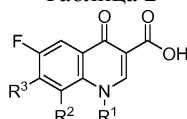
1-33		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,62 (с, 1H), 13,15 (с, 1H), 8,92 (с, 1H), 8,87 (с, 1H), 8,77 (д, J=1,74 Гц, 1H), 8,38 (д, J=1,97 Гц, 1H), 8,02 (д, J=8,86 Гц, 1H), 4,42 (тт, J=3,74, 7,15 Гц, 1H), 2,66 (с, 3H), 1,25 (кв, J=6,85 Гц, 2H), 1,08 (с, 2H).	431	96%
1-34		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 9,11 (с, 1H), 8,92 (с, 1H), 8,31 (д, J=8,86 Гц, 1H), 8,16 (д, J=8,54 Гц, 1H), 8,03 (д, J=8,91 Гц, 1H), 6,51 (с, 1H), 4,44 (тт, J=3,64, 7,02 Гц, 2H), 2,69 (с, 3H), 2,51 (с, 3H), 1,24 (д, J=6,83 Гц, 2H), 1,10 (с, 2H).	420	95%
1-35		OMe	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,75-14,55 (м, 1H), 9,83-9,67 (д, J=3,2 Гц, 1H), 8,89-8,73 (с, 1H), 7,96-7,86 (д, J=9,1 Гц, 1H), 7,58-7,47 (с, 1H), 7,42-7,34 (с, 1H), 4,30-4,14 (тт, J=7,3, 4,5 Гц, 1H), 3,52-3,39 (с, 3H), 3,11-2,95 (т, J=7,5 Гц, 2H), 2,62-2,56 (дд, J=8,5, 6,3 Гц, 2H), 1,21-1,12 (м, 4H).	457	99%
1-36		OMe	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 14,52-14,39 (с, 1H), 8,87-8,82 (с, 1H), 8,01-7,92 (м, 1H), 7,75-7,69 (с, 1H), 7,39-7,34 (т, J=1,7 Гц, 1H), 7,21-7,18 (с, 1H), 6,79-6,69 (дд, J=17,3, 11,0 Гц, 1H), 5,70-5,62 (д, J=17,3 Гц, 1H), 5,54-5,44 (д, J=11,0 Гц, 1H), 4,09-3,99 (д, J=3,7 Гц, 1H), 3,45-3,36 (с, 3H), 3,03-2,95 (дд, J=8,5, 6,5 Гц, 2H), 2,68-2,59 (дд, J=8,7, 6,5 Гц, 2H), 1,26-1,21 (дд, J=5,2, 1,8 Гц, 2H), 1,11-1,03 (дт, J=4,0, 1,9 Гц, 2H).	449	85%
1-37		OMe	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,73-14,60 (с, 1H), 10,38-10,26 (с, 1H), 8,84-8,76 (с, 1H), 7,96-7,88 (д, J=9,1 Гц, 1H), 7,36-7,28 (д, J=11,2 Гц, 1H), 7,25-7,19 (с, 1H), 4,29-4,18 (ддд, J=11,3, 7,3, 4,4 Гц, 1H), 3,47-3,43 (с, 3H), 3,07-2,99 (т, J=7,4 Гц, 2H), 2,60-2,53 (дд, J=8,5, 6,5 Гц, 2H), 1,21-1,08 (д, J=5,3 Гц, 4H).	441	85%
1-38		OMe	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,70 (с, 1H), 9,62 (с, 1H), 8,79 (с, 1H), 7,89 (д, J=9,2 Гц, 1H), 7,20 (д, J=8,5 Гц, 2H), 4,39-4,16 (м, 1H), 3,42 (с, 3H), 3,03-2,88 (м, 2H), 2,54 (м, 5H), 1,16 (м, 4H).	436	99%
1-39		OMe	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 15,13-14,27 (м, 1H), 10,76-10,64 (с, 5H), 8,98-8,88 (с, 1H), 8,19-8,14 (д, J=2,2 Гц, 1H), 8,00-7,94 (д, J=8,7 Гц, 1H), 7,75-7,70 (д, J=2,1 Гц, 1H), 4,49-4,32 (тт, J=7,3, 3,8 Гц, 1H), 3,03-2,95 (м, 2H), 2,69-2,64 (с, 3H), 2,62-2,56 (т, J=7,5 Гц, 2H), 1,28-1,22 (м, 2H), 1,09-1,03 (м, 2H).	408	90%
1-40		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,60 (с, 1H), 12,01 (с, 1H), 8,92 (с, 1H), 8,53 (с, 1H), 8,08-7,98 (м, 2H), 7,72 (с, 1H), 6,85 (д, J=9,75 Гц, 1H), 4,41 (с, 1H), 3,34 (с, 1H), 2,65 (с, 3H), 2,54 (с, 3H), 1,24 (д, J=6,54 Гц, 2H), 1,09 (с, 2H).	406	96%
1-41		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,85-14,51 (с, 1H), 9,00-8,91 (м, 2H), 8,60-8,53 (с, 1H), 8,18-8,09 (т, J=8,4 Гц, 2H), 8,09-8,02 (м, 1H), 7,95-7,84 (с, 1H), 7,79-7,68 (с, 1H), 4,51-4,31 (с, 1H), 2,79-2,61 (с, 3H), 1,36-1,20 (д, J=6,9 Гц, 2H), 1,16-1,04 (с, 2H).	389	100%

1-42		Ме	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 15,01-14,88 (д, J=2,6 Гц, 1H), 8,95-8,82 (д, J=2,5 Гц, 1H), 8,05-7,94 (д, J=6,7 Гц, 1H), 7,89-7,77 (д, J=9,4 Гц, 1H), 7,62-7,40 (м, 3H), 6,33-6,21 (с, 1H), 5,59-5,49 (с, 2H), 4,48-4,35 (с, 1H), 2,86-2,76 (с, 3H), 1,30-1,15 (д, J=7,0 Гц, 2H), 1,00-0,88 (с, 2H).	392	100%
1-43		Ме	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, MeOD) δ 9,05-8,91 (с, 1H), 8,87-8,77 (с, 1H), 8,43-8,36 (с, 1H), 8,14-8,06 (д, J=7,3 Гц, 1H), 8,02-7,88 (д, J=21,7 Гц, 2H), 7,74-7,62 (д, J=8,7 Гц, 1H), 7,59-7,51 (с, 1H), 4,35-4,15 (с, 1H), 2,73-2,53 (м, 3H), 1,05-0,93 (с, 2H), 0,85-0,71 (д, J=8,0 Гц, 2H).	389	97%
1-44		Ме	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,72-14,59 (с, 1H), 9,01-8,91 (с, 1H), 8,88-8,80 (с, 1H), 8,66-8,56 (д, J=8,6 Гц, 1H), 8,25-8,16 (д, J=8,0 Гц, 1H), 8,14-8,09 (с, 1H), 8,08-8,01 (д, J=8,6 Гц, 1H), 7,95-7,89 (д, J=8,7 Гц, 1H), 7,88-7,79 (д, J=7,7 Гц, 1H), 4,51-4,35 (с, 1H), 2,75-2,67 (с, 3H), 1,30-1,19 (д, J=6,8 Гц, 2H), 1,16-1,07 (с, 2H).	405	97,5%
1-45		Ме	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,85-14,58 (с, 1H), 9,00-8,88 (с, 1H), 8,19-8,07 (д, J=8,3 Гц, 1H), 8,07-7,94 (м, 4H), 7,68-7,58 (д, J=6,0 Гц, 2H), 7,57-7,48 (д, J=8,2 Гц, 1H), 4,49-4,33 (с, 1H), 2,72-2,59 (с, 3H), 1,33-1,19 (д, J=7,4 Гц, 2H), 1,16-1,00 (с, 2H).	388	98%
1-46		Ме	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 9,69-9,59 (с, 1H), 9,01-8,92 (д, J=2,5 Гц, 1H), 8,69-8,58 (д, J=2,4 Гц, 1H), 8,47-8,34 (д, J=7,6 Гц, 1H), 8,14-8,04 (д, J=8,1 Гц, 1H), 7,95-7,80 (т, J=8,7 Гц, 2H), 7,57-7,46 (д, J=7,9 Гц, 1H), 4,48-4,34 (с, 1H), 2,52-2,50 (с, 3H), 1,29-1,01 (м, 4H).	389	98%
1-47		Ме	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,96-14,46 (с, 1H), 12,04-11,50 (с, 1H), 8,98-8,89 (с, 1H), 8,34-8,17 (д, J=12,3 Гц, 1H), 8,17-8,01 (м, 2H), 7,97-7,90 (д, J=8,1 Гц, 1H), 4,48-4,36 (дд, J=7,3, 4,1 Гц, 1H), 2,66-2,56 (с, 3H), 1,31-1,17 (д, J=7,1 Гц, 2H), 1,15-1,03 (с, 2H).	422	99%
1-48		Ме	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 9,19-9,11 (с, 1H), 8,98-8,92 (с, 1H), 8,45-8,39 (с, 1H), 8,13-8,00 (дд, J=16,7, 8,4 Гц, 2H), 7,80-7,69 (т, J=7,7 Гц, 1H), 7,66-7,55 (т, J=7,7 Гц, 1H), 7,38-7,29 (д, J=8,3 Гц, 1H), 4,47-4,34 (с, 1H), 2,65-2,54 (с, 3H), 1,28-1,07 (м, 4H).	405	98%
1-49		Ме	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,69-14,45 (с, 1H), 10,31-10,19 (с, 1H), 9,06-8,94 (д, J=3,6 Гц, 2H), 8,73-8,62 (д, J=8,2 Гц, 1H), 8,61-8,43 (м, 2H), 8,32-8,21 (т, J=7,5 Гц, 1H), 8,21-8,11 (м, 2H), 7,83-7,71 (д, J=8,3 Гц, 1H), 4,67-4,52 (с, 3H), 4,50-4,39 (д, J=7,6 Гц, 1H), 2,52-2,50 (м, 3H), 1,32-1,03 (м, 4H).	404	100%
1-50		Ме	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,72-14,45 (с, 1H), 9,88-9,78 (с, 1H), 9,58-9,48 (с, 1H), 9,02-8,92 (с, 1H), 8,70-8,60 (д, J=9,0 Гц, 1H), 8,59-8,51 (д, J=8,2 Гц, 1H), 8,46-8,36 (т, J=7,9 Гц, 1H), 8,24-8,06 (т, J=9,7 Гц, 2H), 4,78-4,67 (с, 2H), 4,53-4,40 (с, 1H), 2,82-2,71 (с, 3H), 1,37-1,18 (д, J=6,4 Гц, 2H), 1,16-1,07 (м, 2H).	404	98%

1-51		Ме	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 9,10-9,01 (д, $J=4,0$ Гц, 1H), 8,98-8,91 (д, $J=2,6$ Гц, 1H), 8,30-8,19 (д, $J=8,4$ Гц, 1H), 8,14-8,07 (с, 1H), 8,05-7,97 (т, $J=7,7$ Гц, 1H), 7,96-7,89 (д, $J=8,4$ Гц, 1H), 7,78-7,68 (д, $J=6,8$ Гц, 1H), 7,65-7,57 (м, 1H), 4,45-4,33 (с, 1H), 2,48-2,40 (д, $J=2,8$ Гц, 3H), 1,28-1,03 (м, 4H).	389	93,6%
1-52		Ме	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,78-14,66 (с, 1H), 9,06-8,97 (с, 1H), 8,96-8,88 (с, 1H), 8,54-8,46 (д, $J=8,1$ Гц, 1H), 8,26-8,14 (д, $J=8,3$ Гц, 1H), 8,14-8,06 (с, 1H), 8,06-7,98 (д, $J=8,6$ Гц, 1H), 7,74-7,58 (д, $J=8,3$ Гц, 2H), 4,51-4,29 (с, 1H), 2,73-2,60 (с, 3H), 1,29-1,18 (д, $J=7,0$ Гц, 2H), 1,15-1,07 (с, 2H).	389	100%
1-53		Ме	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,96-8,88 (д, $J=2,4$ Гц, 1H), 8,85-8,78 (с, 1H), 8,57-8,47 (д, $J=8,2$ Гц, 1H), 8,25-8,13 (д, $J=8,3$ Гц, 1H), 8,03-7,95 (д, $J=8,3$ Гц, 1H), 7,86-7,77 (м, 2H), 7,69-7,54 (д, $J=8,7$ Гц, 1H), 4,44-4,31 (с, 1H), 2,48-2,42 (с, 3H), 1,29-1,16 (д, $J=7,6$ Гц, 2H), 1,15-1,02 (с, 2H).	389	98%
1-54		Ме	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 9,17-9,09 (с, 1H), 9,01-8,91 (д, $J=2,7$ Гц, 1H), 8,26-8,17 (д, $J=8,5$ Гц, 1H), 8,15-8,06 (д, $J=8,5$ Гц, 1H), 7,94-7,84 (с, 1H), 2,48-2,42 (м, 2H), 7,72-7,59 (д, $J=9,2$ Гц, 2H), 7,56-7,45 (д, $J=8,3$ Гц, 1H), 4,45-4,35 (с, 1H), 2,52-2,45 (с, 3H), 1,29-1,03 (дд, $J=16,6, 7,5$ Гц, 4H).	389	98%
1-55		Ме	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 15,08-14,78 (с, 1H), 8,95-8,83 (с, 2H), 8,48-8,37 (д, $J=6,0$ Гц, 1H), 8,33-8,19 (д, $J=8,2$ Гц, 1H), 8,14-8,02 (д, $J=8,5$ Гц, 1H), 7,94-7,76 (м, 2H), 7,68-7,59 (д, $J=7,1$ Гц, 1H), 7,58-7,49 (т, $J=7,2$ Гц, 1H), 4,47-4,34 (с, 1H), 2,73-2,56 (с, 3H), 1,31-0,99 (м, 4H).	405	95%
1-56		Ме	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 9,00-8,91 (с, 1H), 8,85-8,75 (д, $J=6,1$ Гц, 1H), 8,73-8,64 (д, $J=8,6$ Гц, 1H), 8,13-8,05 (д, $J=8,4$ Гц, 1H), 7,97-7,86 (д, $J=8,1$ Гц, 1H), 7,80-7,71 (с, 1H), 7,65-7,58 (д, $J=5,8$ Гц, 1H), 7,57-7,48 (д, $J=8,4$ Гц, 1H), 4,46-4,35 (с, 1H), 2,57-2,52 (с, 3H), 1,28-1,04 (м, 4H).	405	96%
1-57		Ме	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,95-14,35 (м, 1H), 9,01-8,90 (т, $J=2,0$ Гц, 1H), 8,80-8,63 (м, 2H), 8,13-8,06 (м, 1H), 8,04-7,95 (т, $J=7,8$ Гц, 1H), 7,84-7,75 (д, $J=6,5$ Гц, 1H), 7,52-7,41 (ддд, $J=10,0, 5,1, 2,5$ Гц, 1H), 7,38-7,29 (д, $J=8,4$ Гц, 1H), 4,46-4,32 (д, $J=6,9$ Гц, 1H), 2,49-2,44 (с, 3H), 1,29-0,99 (м, 4H).	405	93,3%
1-58		Ме	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,98-8,89 (с, 1H), 8,73-8,64 (д, $J=6,6$ Гц, 1H), 8,58-8,52 (с, 1H), 8,35-8,26 (д, $J=8,2$ Гц, 1H), 8,12-7,99 (т, $J=10,7$ Гц, 2H), 7,83-7,75 (д, $J=8,3$ Гц, 1H), 7,65-7,53 (с, 1H), 4,46-4,36 (с, 1H), 2,65-2,59 (с, 3H), 1,29-1,19 (д, $J=7,8$ Гц, 2H), 1,14-1,07 (с, 2H).	405	96,2%

1-59		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,96-8,87 (с, 1H), 8,75-8,64 (д, $J=7,2$ Гц, 2H), 8,28-8,19 (с, 1H), 8,10-7,99 (д, $J=8,5$ Гц, 2H), 7,90-7,80 (д, $J=9,0$ Гц, 1H), 7,63-7,52 (с, 1H), 4,48-4,34 (с, 1H), 2,65-2,57 (с, 3H), 1,30-1,18 (д, $J=7,1$ Гц, 2H), 1,14-1,02 (с, 2H).	405	99%
1-60		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 9,77-9,61 (с, 1H), 9,00-8,90 (д, $J=3,1$ Гц, 1H), 8,75-8,62 (д, $J=5,8$ Гц, 1H), 8,57-8,42 (д, $J=8,2$ Гц, 1H), 8,31-8,21 (с, 1H), 8,22-8,13 (д, $J=5,3$ Гц, 1H), 8,11-8,01 (д, $J=8,7$ Гц, 1H), 7,94-7,81 (д, $J=8,4$ Гц, 1H), 4,49-4,34 (с, 1H), 2,68-2,59 (с, 3H), 1,34-1,18 (д, $J=7,6$ Гц, 2H), 1,15-1,00 (с, 2H).	389	93,6%
1-61		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 9,19-9,10 (с, 1H), 9,03-8,95 (с, 1H), 8,37-8,27 (д, $J=6,9$ Гц, 1H), 8,18-8,05 (м, 4H), 7,81-7,73 (п, $J=8,4$ Гц, 1H), 4,52-4,42 (т, $J=5,2$ Гц, 1H), 2,74-2,65 (с, 3H), 1,36-1,27 (д, $J=7,1$ Гц, 2H), 1,19-1,10 (с, 2H).	405	100%
1-62		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,82-14,70 (с, 1H), 11,54-11,41 (с, 1H), 9,03-8,93 (с, 1H), 8,44-8,33 (д, $J=8,2$ Гц, 1H), 8,14-8,01 (д, $J=8,0$ Гц, 1H), 7,84-7,75 (с, 1H), 7,58-7,51 (д, $J=7,6$ Гц, 1H), 7,39-7,26 (с, 1H), 6,76-6,64 (д, $J=6,6$ Гц, 1H), 4,52-4,40 (с, 1H), 2,70-2,61 (с, 3H), 1,37-1,22 (д, $J=6,8$ Гц, 2H), 1,19-1,04 (с, 2H).	405	100%
1-63				^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 15,18 (с, 1H), 12,31 (с, 1H), 9,09 (с, 1H), 8,82 (д, $J=2,0$ Гц, 1H), 8,45 (д, $J=1,7$ Гц, 1H), 8,03 (т, $J=9,3$ Гц, 2H), 7,76 (д, $J=8,4$ Гц, 1H), 6,63 (д, $J=9,4$ Гц, 1H), 5,00 (д, $J=6,7$ Гц, 1H), 4,58 (д, $J=10,8$ Гц, 1H), 4,45 (д, $J=10,0$ Гц, 1H), 2,54 (с, 1H), 1,52 (д, $J=6,7$ Гц, 3H).	390	98%
1-64				^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,96 (с, 1H), 12,35 (с, 1H), 9,10 (с, 1H), 8,68 (с, 1H), 8,34 (с, 1H), 8,01 (д, $J=9,53$ Гц, 1H), 7,79 (д, $J=9,70$ Гц, 1H), 6,64 (д, $J=9,45$ Гц, 1H), 5,01 (д, $J=6,68$ Гц, 1H), 4,60-4,54 (м, 1H), 4,46 (д, $J=9,78$ Гц, 1H), 1,49 (д, $J=6,71$ Гц, 3H).	408	96%
1-65				^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 9,27 (с, 1H), 8,95 (с, 1H), 8,87 (д, $J=15,4$ Гц, 1H), 8,41-8,22 (м, 3H), 8,01 (т, $J=7,3$ Гц, 1H), 7,85 (т, $J=7,3$ Гц, 1H), 7,73 (д, $J=8,2$ Гц, 1H), 4,45 (м, 1H), 2,77 (с, 3H), 1,31 (д, $J=6,2$ Гц, 2H), 1,11 (с, 2H).	371	97%

Таблица 2

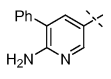
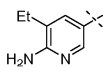
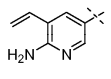
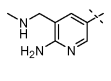
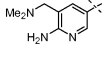
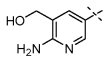
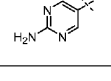
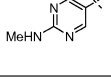
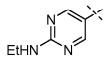
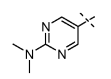
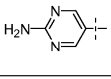
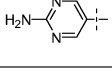



Соед. №	R ³	R ²	R ¹	ЯМР	МС (МН ⁺)	ВЭЖ
2-1		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,28 (с, 1H), 7,98 (с, 1H), 7,80 (с, 1H), 7,33 (д, $J=8,90$ Гц, 1H), 7,16 (д, $J=9,30$ Гц, 1H), 3,66 (д, $J=3,58$ Гц, 1H), 1,96 (с, 3H), 0,58 (д, $J=5,78$ Гц, 2H), 0,37 (д, $J=1,61$ Гц, 2H).	357	94%

2-2		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,93 (с, 1H), 8,48 (д, $J=2,77$ Гц, 1H), 8,13 (с, 1H), 8,01 (д, $J=8,72$ Гц, 1H), 7,61 (с, 1H), 4,50-4,30 (м, 1H), 3,49 (д, $J=5,30$ Гц, 5H), 3,36-3,29 (м, 5H), 2,66 (д, $J=15,95$ Гц, 3H), 1,43 (с, 9H), 1,28-1,21 (м, 2H), 1,08 (с, 2H).	523	98%
2-3		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,92 (с, 1H), 8,79 (д, $J=5,61$ Гц, 2H), 8,01 (д, $J=8,93$ Гц, 1H), 7,50 (д, $J=5,50$ Гц, 2H), 4,40 (с, 1H), 2,61 (с, 3H), 1,24 (д, $J=5,97$ Гц, 2H), 1,07 (с, 2H).	339	98%
2-4		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 9,00 (с, 2H), 8,92 (с, 1H), 8,49 (д, $J=2,73$ Гц, 1H), 8,12 (с, 1H), 7,98 (т, $J=11,57$ Гц, 1H), 7,56 (с, 1H), 4,44-4,34 (м, 1H), 3,64 (с, 5H), 3,26 (с, 4H), 2,62 (с, 3H), 1,23 (д, $J=6,27$ Гц, 2H), 1,07 (с, 2H).	423	95%
2-5		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,93 (с, 1H), 8,71 (т, $J=26,47$ Гц, 1H), 8,04 (д, $J=8,68$ Гц, 2H), 7,61 (д, $J=45,28$ Гц, 1H), 4,44-4,38 (м, 1H), 2,55 (с, 2H), 2,34 (д, $J=9,33$ Гц, 3H), 1,23 (с, 2H), 1,06 (дд, $J=4,45, 8,57$ Гц, 2H).	353	95%
2-6		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,55 (с, 1H), 8,92 (с, 1H), 8,83 (т, $J=8,69$ Гц, 1H), 8,65 (дт, $J=8,70, 17,42$ Гц, 1H), 8,05 (д, $J=8,87$ Гц, 1H), 7,73-7,52 (м, 1H), 4,41 (тт, $J=3,77, 7,16$ Гц, 1H), 2,64 (с, 3H), 1,31-1,16 (м, 2H), 1,10-0,97 (м, 2H).	357	98%
2-7		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,93 (с, 1H), 8,85-8,61 (м, 2H), 8,03 (д, $J=6,60$ Гц, 1H), 7,96 (с, 2H), 7,69 (дд, $J=5,19, 7,64$ Гц, 1H), 4,41 (ддд, $J=3,87, 7,26, 10,97$ Гц, 2H), 2,75-2,72 (м, 5H), 1,33-1,20 (м, 3H), 1,13-1,03 (м, 2H).	339	98%
2-8		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, MeOD) δ 8,79 (с, 1H), 7,92-7,71 (м, 2H), 7,55 (т, $J=17,62$ Гц, 1H), 6,84 (т, $J=36,31$ Гц, 1H), 4,16-4,04 (м, 1H), 3,02 (с, 5H), 1,09-1,01 (м, 2H), 0,81 (кв, $J=7,23$ Гц, 2H).	355	98%
2-9		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, MeOD) δ 8,06 (т, $J=38,62$ Гц, 2H), 7,68 (дд, $J=8,35, 33,76$ Гц, 2H), 7,47 (д, $J=8,87$ Гц, 1H), 7,13-6,77 (м, 2H), 4,33 (с, 1H), 3,97 (д, $J=7,85$ Гц, 3H), 2,20-1,90 (м, 2H), 1,35-1,22 (м, 1H), 1,05 (с, 1H).	369	98%
2-10		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, MeOD) δ 9,06 (с, 1H), 8,33 (с, 1H), 8,01 (д, $J=9,18$ Гц, 1H), 7,67 (т, $J=24,14$ Гц, 2H), 7,17 (с, 1H), 4,37 (с, 1H), 3,94 (с, 3H), 2,66 (с, 3H), 1,32 (д, $J=6,60$ Гц, 2H), 1,07 (с, 2H).	369	98%
2-11		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, MeOD) δ 9,05 (с, 1H), 8,29 (с, 2H), 8,09 (д, $J=7,83$ Гц, 1H), 7,94 (д, $J=23,80$ Гц, 2H), 7,39-7,20 (м, 2H), 7,09 (с, 1H), 4,36 (с, 1H), 2,77 (с, 3H), 1,30 (с, 2H), 1,09 (с, 2H).	466	98%
2-12		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, MeOD) δ 9,02 (с, 1H), 8,40 (д, $J=92,33$ Гц, 2H), 8,16-8,03 (м, 2H), 7,98-7,80 (м, 1H), 7,75-7,50 (м, 2H), 4,34 (с, 1H), 3,82 (д, $J=24,28$ Гц, 4H), 3,45 (с, 4H), 2,70 (д, $J=23,16$ Гц, 3H), 1,27 (дд, $J=11,61, 24,61$ Гц, 3H), 1,09 (с, 2H).	424	98%
2-13		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,68 (с, 1H), 8,91 (с, 1H), 8,69 (с, 1H), 7,97 (д, $J=8,46$ Гц, 1H), 7,79 (с, 1H), 7,63 (с, 1H), 4,40 (с, 1H), 3,82 (д, $J=6,95$ Гц, 2H), 3,21 (с, 2H), 2,63 (д, $J=43,98$ Гц, 3H), 1,22 (д, $J=5,36$ Гц, 2H), 1,05 (с, 2H).	380	97%

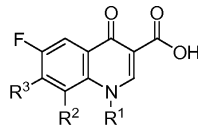
2-14		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,69 (с, 2H), 8,91 (с, 1H), 8,49 (с, 2H), 8,24 (с, 2H), 7,98 (д, $J=8,62$ Гц, 1H), 4,41 (с, 1H), 2,65 (д, $J=31,48$ Гц, 3H), 1,24 (д, $J=6,48$ Гц, 2H), 1,07 (с, 2H).	399	99%
2-15		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,67 (с, 1H), 8,91 (с, 1H), 8,13 (д, $J=25,11$ Гц, 1H), 8,07 (с, 1H), 7,95 (д, $J=8,95, 25,35$ Гц, 2H), 7,06 (д, $J=8,71$ Гц, 1H), 4,41 (с, 1H), 2,65 (д, $J=25,72$ Гц, 3H), 1,22 (д, $J=5,45$ Гц, 2H), 1,05 (с, 2H).	354	99%
2-16		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,91 (с, 1H), 8,74 (с, 1H), 8,54 (т, $J=24,30$ Гц, 2H), 7,99 (д, $J=8,68$ Гц, 1H), 4,41 (с, 1H), 3,10 (д, $J=17,91$ Гц, 3H), 2,70 (с, 3H), 1,25 (д, $J=5,66$ Гц, 2H), 1,07 (с, 2H).	413	99%
2-17		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,63 (с, 1H), 9,79 (с, 2H), 8,92 (с, 1H), 8,61 (с, 1H), 8,01 (д, $J=13,11$ Гц, 2H), 4,67 (д, $J=32,94$ Гц, 4H), 4,40 (с, 1H), 2,62 (с, 3H), 1,23 (с, 3H), 1,07 (с, 2H).	380	97%
2-18		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,65 (с, 1H), 8,89 (с, 1H), 8,27 (с, 1H), 8,07 (т, $J=6,62$ Гц, 1H), 7,94 (д, $J=8,87$ Гц, 1H), 7,28 (с, 2H), 4,40 (т, $J=3,75, 7,16$ Гц, 1H), 3,31 (с, 1H), 2,67 (с, 3H), 1,31-1,19 (м, 2H), 1,10-1,00 (м, 2H).	379	99%
2-19		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 9,28 (с, 1H), 8,93 (с, 1H), 8,70 (с, 1H), 8,36 (с, 1H), 8,03 (д, $J=8,65$ Гц, 1H), 4,41 (с, 2H), 2,65 (с, 3H), 2,44 (с, 3H), 1,25 (д, $J=6,79$ Гц, 2H), 1,10 (с, 2H).	420	97%
2-20		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,91 (с, 1H), 8,19 (д, $J=11,25$ Гц, 3H), 7,99 (д, $J=8,83$ Гц, 1H), 7,62 (с, 1H), 4,41 (с, 2H), 2,69 (с, 3H), 1,25 (д, $J=5,80$ Гц, 2H), 1,05 (с, 2H).	397	99%
2-21		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,72 (с, 1H), 8,89 (с, 1H), 8,11-7,87 (м, 2H), 7,74 (с, 1H), 6,71 (с, 2H), 4,39 (с, 1H), 2,63 (д, $J=29,40$ Гц, 3H), 1,20 (т, $J=25,86$ Гц, 2H), 0,99 (д, $J=41,43$ Гц, 2H).	388	98%
2-22		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,71 (с, 1H), 8,90 (с, 1H), 8,26 (с, 1H), 7,95 (д, $J=8,81$ Гц, 1H), 7,86 (с, 1H), 6,89 (с, 2H), 4,39 (с, 1H), 2,66 (с, 3H), 1,24 (д, $J=5,61$ Гц, 2H), 1,06 (с, 2H).	422	98%
2-23		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,71 (с, 1H), 8,98 (с, 1H), 8,13-8,02 (м, 2H), 7,92 (д, $J=14,79$ Гц, 3H), 4,47 (с, 1H), 2,71 (д, $J=23,60$ Гц, 3H), 2,31 (с, 3H), 1,29 (д, $J=5,54$ Гц, 2H), 1,15 (д, $J=22,69$ Гц, 2H).	368	99%
2-24		OMe	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,67 (с, 1H), 8,79 (с, 1H), 8,11 (с, 1H), 7,90 (с, 1H), 7,82 (с, 1H), 6,73 (с, 2H), 4,22 (с, 1H), 3,46 (с, 3H), 3,31 (с, 2H), 1,16 (с, 4H).	404	98%
2-25		OMe	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,66 (с, 1H), 8,80 (с, 1H), 8,39 (с, 1H), 8,13-7,81 (м, 2H), 6,91 (с, 2H), 4,23 (с, 1H), 3,31 (с, 3H), 1,17 (д, $J=6,99$ Гц, 3H).	438	99%
2-26		OMe	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,74 (д, $J=61,68$ Гц, 1H), 8,76 (д, $J=28,90$ Гц, 1H), 8,39 (с, 1H), 7,97 (с, 1H), 7,92 (д, $J=9,13$ Гц, 1H), 4,23 (с, 1H), 3,46 (с, 3H), 1,17 (д, $J=7,13$ Гц, 4H).	395	98%

2-27		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО), 8,89 (с, 1H), 7,95-7,93 (м, 2H), 7,83 (с, 1H), 7,60-6,57 (д, 1H), 4,39 (с, 1H), 2,63 (д, J=29,40 Гц, 3H), 1,20 (т, J=25,86 Гц, 2H), 0,99 (д, J=41,43 Гц, 2H).	372	98%
2-28		OMe	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 9,95 (с, 1H), 8,94-8,66 (м, 1H), 8,49-8,39 (м, 1H), 8,26 (д, J=1,30 Гц, 1H), 7,91 (дд, J=19,79, 31,75 Гц, 2H), 4,27-4,17 (м, 1H), 3,50-3,42 (м, 3H), 1,17 (дт, J=7,59, 17,65 Гц, 3H).	398	98%
2-29		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 9,95 (с, 1H), 8,92 (д, J=13,25 Гц, 1H), 8,32 (д, J=1,05 Гц, 1H), 8,17 (д, J=1,69 Гц, 1H), 8,00 (т, J=18,18 Гц, 1H), 7,83 (д, J=33,09 Гц, 1H), 4,40 (дт, J=3,59, 10,71 Гц, 1H), 2,68 (д, J=12,78 Гц, 3H), 1,25 (кв, J=6,89 Гц, 2H), 1,14-0,93 (м, 2H).	382	98%
2-30		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,64 (с, 2H), 8,90 (с, 1H), 7,97 (д, J=8,81 Гц, 1H), 7,64 (д, J=1,21 Гц, 1H), 7,34 (с, 1H), 4,40 (тд, J=3,75, 7,19 Гц, 1H), 3,90 (с, 3H), 2,78-2,61 (м, 3H), 1,23 (кв, J=7,19 Гц, 2H), 1,16-0,97 (м, 2H).	384	95%
2-31		Me		¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,64 (с, 2H), 8,90 (с, 1H), 7,97 (д, J=8,81 Гц, 1H), 7,64 (д, J=1,21 Гц, 1H), 7,34 (с, 1H), 4,40 (тд, J=3,75, 7,19 Гц, 1H), 3,90 (с, 3H), 2,78-2,61 (м, 3H), 1,23 (кв, J=7,19 Гц, 2H), 1,16-0,97 (м, 2H).	406	99%
2-32		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,62 (с, 1H), 8,90 (с, 1H), 7,99 (д, J=1,60 Гц, 1H), 7,95 (т, J=10,20 Гц, 1H), 7,70-7,53 (м, 1H), 4,39 (тд, J=3,61, 7,03 Гц, 1H), 2,62 (д, J=19,25 Гц, 3H), 1,84 (ддд, J=5,42, 8,33, 13,56 Гц, 1H), 1,21 (т, J=6,56 Гц, 1H), 1,05 (д, J=8,64 Гц, 1H), 1,03-0,96 (м, 2H), 0,78-0,65 (м, 2H).	394	98%
2-33		Me		¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,88 (д, J=3,01 Гц, 1H), 8,18 (с, 1H), 8,13 (с, 1H), 8,09 (с, 1H), 7,99 (д, J=8,77 Гц, 1H), 7,54 (с, 1H), 5,29-5,01 (м, 1H), 4,50-4,31 (м, 1H), 2,71-2,57 (м, 2H), 1,76 (ддд, J=9,04, 15,14, 17,62 Гц, 1H), 1,53 (д, J=26,94 Гц, 1H).	415	98%
2-34		Cl	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,92 (с, 1H), 8,11 (д, J=8,56 Гц, 1H), 8,02 (д, J=0,96 Гц, 1H), 7,81 (д, J=1,67 Гц, 1H), 4,44-4,39 (м, 2H), 1,32-1,17 (м, 2H), 1,17-1,04 (м, 2H).	408	94%
2-35		OMe	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,80 (с, 1H), 7,99 (с, 1H), 7,92 (д, J=9,3 Гц, 1H), 7,69 (д, J=12,0 Гц, 1H), 4,29-4,14 (м, 1H), 3,47 (с, 3H), 1,24-1,04 (м, 4H).	387	99%
2-36		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,67 (с, 1H), 8,92 (с, 1H), 8,37 (с, 1H), 8,30 (д, J=2,3 Гц, 1H), 8,11-7,88 (м, 3H), 7,51 (с, 1H), 4,55-4,30 (м, 3H), 3,20 (м, 2H), 2,68 (с, 3H), 1,25 (д, J=6,4 Гц, 2H), 1,08 (д, J=7,0 Гц, 2H).	441	98%
2-37		OMe		¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,52 (с, 1H), 8,82 (д, J=1,51 Гц, 1H), 8,38 (с, 1H), 8,11 (с, 1H), 7,94 (д, J=9,20 Гц, 1H), 7,36 (с, 2H), 5,10 (ддд, J=5,42, 8,45, 64,07 Гц, 1H), 4,24-4,12 (м, 1H), 1,86-1,55 (м, 2H).	413	98%
2-38		OMe		¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,55 (с, 1H), 8,82 (д, J=1,46 Гц, 1H), 8,15 (д, J=36,97 Гц, 1H), 7,92 (д, J=9,24 Гц, 1H), 7,80 (с, 1H), 6,75 (с, 2H), 5,10 (ддд, J=5,43, 8,45, 64,08 Гц, 1H), 4,29-4,12 (м, 1H), 1,93-1,53 (м, 2H).	422	98%
2-39		Me		¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,39 (с, 1H), 8,80 (с, 1H), 8,16-8,08 (м, 2H), 7,98-7,86 (м, 2H), 7,69-7,59 (м, 1H), 7,37 (дд, J=5,20, 11,82 Гц, 1H), 7,26 (с, 2H), 1,67 (с, 3H).	451	99%

2-40		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, CDC13) δ 14,60-14,29 (с, 1H), 8,96-8,89 (с, 1H), 8,05-7,96 (м, 2H), 7,48-7,40 (м, 4H), 7,40-7,33 (дт, $J=8,5$, 2,8 Гц, 1H), 7,33-7,29 (с, 1H), 4,88-4,75 (с, 2H), 4,17-3,98 (с, 1H), 2,73-2,62 (с, 3H), 1,28-1,20 (м, 2H), 1,02-0,93 (с, 2H).	430	99%
2-41		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,83-14,68 (с, 1H), 8,99-8,81 (с, 1H), 7,96-7,89 (д, $J=8,9$ Гц, 1H), 7,88-7,81 (с, 1H), 7,36-7,20 (с, 1H), 6,19-6,08 (с, 2H), 4,47-4,31 (с, 1H), 2,75-2,60 (с, 3H), 1,36-1,10 (м, 6H), 1,10-0,94 (т, $J=3,1$ Гц, 2H).	382	93%
2-42		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,83-14,67 (с, 3H), 8,97-8,85 (с, 3H), 8,00-7,85 (м, 6H), 7,72-7,60 (т, $J=1,7$ Гц, 3H), 6,97-6,81 (дд, $J=17,3$, 11,0 Гц, 3H), 6,45-6,27 (с, 6H), 5,85-5,70 (м, 4H), 5,44-5,26 (дд, $J=11,0$, 1,2 Гц, 3H), 4,47-4,33 (с, 1H), 2,76-2,60 (с, 9H), 1,30-1,18 (м, 6H), 1,12-0,98 (м, 5H), 1,32-1,20 (м, 7H).	380	99%
2-43		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,95-8,90 (с, 1H), 8,36-8,31 (м, 1H), 8,13-8,07 (д, $J=2,0$ Гц, 1H), 8,02-7,97 (д, $J=8,8$ Гц, 1H), 4,49-4,36 (м, 3H), 2,90-2,79 (с, 5H), 2,76-2,67 (с, 3H), 1,33-1,20 (кв, $J=6,9$ Гц, 2H), 1,10-0,98 (м, 2H).	397	98%
2-44		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,93-8,91 (с, 1H), 8,24-8,20 (м, 1H), 8,01-7,96 (д, $J=8,8$ Гц, 1H), 7,93-7,87 (т, $J=2,8$ Гц, 1H), 4,49-4,38 (тт, $J=7,2$, 3,9 Гц, 1H), 4,24-4,14 (т, $J=5,5$ Гц, 2H), 2,85-2,77 (с, 6H), 1,29-1,20 (м, 2H), 1,09-0,98 (м, 2H).	411	97%
2-45		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,94-8,89 (с, 1H), 8,15-8,09 (д, $J=2,1$ Гц, 1H), 8,02-7,96 (д, $J=8,9$ Гц, 1H), 7,92-7,88 (с, 1H), 4,46-4,37 (м, 1H), 4,57-4,46 (с, 2H), 2,71-2,65 (с, 3H), 1,25-1,18 (д, $J=6,7$ Гц, 2H), 1,10-0,98 (м, 2H).	384	90%
2-46		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,71 (с, 1H), 8,89 (с, 1H), 8,35 (с, 2H), 7,94 (д, $J=8,67$ Гц, 1H), 7,09 (с, 2H), 4,39 (с, 1H), 2,70 (с, 3H), 1,24 (д, $J=5,31$ Гц, 2H), 1,03 (с, 2H).	354	99%
2-47		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,72 (с, 1H), 8,89 (с, 1H), 8,41 (с, 2H), 7,95 (д, $J=8,41$ Гц, 1H), 7,60 (д, $J=28,12$ Гц, 1H), 4,40 (с, 1H), 2,88 (с, 3H), 2,70 (с, 3H), 1,25 (д, $J=5,56$ Гц, 2H), 1,03 (с, 2H).	369	99%
2-48		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,73 (с, 1H), 8,89 (с, 1H), 8,39 (с, 2H), 7,95 (д, $J=8,73$ Гц, 1H), 7,64 (с, 1H), 4,39 (с, 1H), 2,70 (с, 3H), 2,53 (д, $J=9,32$ Гц, 3H), 1,24 (д, $J=6,11$ Гц, 2H), 1,17 (т, $J=6,98$ Гц, 2H), 1,03 (с, 2H).	383	97%
2-49		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,72 (с, 2H), 8,90 (с, 1H), 8,48 (с, 2H), 7,96 (д, $J=8,59$ Гц, 1H), 4,39 (с, 1H), 3,24 (д, $J=22,01$ Гц, 6H), 2,70 (с, 3H), 1,25 (д, $J=6,03$ Гц, 2H), 1,04 (д, $J=7,73$ Гц, 2H).	383	98%
2-50		Cl	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,92 (с, 1H), 8,35 (с, 2H), 8,13 (д, $J=8,6$ Гц, 1H), 7,15 (с, 2H), 4,41 (м, 3,8 Гц, 1H), 1,37-1,17 (м, 2H), 1,18-1,02 (м, 2H).	375	99%
2-51		Me		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,87 (д, $J=3,2$ Гц, 1H), 8,35 (д, $J=1,0$ Гц, 2H), 7,97 (д, $J=8,9$ Гц, 1H), 7,08 (с, 2H), 5,33-4,97 (м, 2H), 4,37 (м, 1H), 2,65 (с, 3H), 1,89-1,41 (м, 2H).	373	99%

2-52		MeO		¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,54 (с, 1Н), 8,82 (д, J=1,2 Гц, 1Н), 8,44 (с, 2Н), 7,93 (д, J=9,2 Гц, 1Н), 7,10 (с, 2Н), 5,09 (м, 1Н), 4,37-3,96 (м, 1Н), 3,50 (с, 3Н), 1,98-1,52 (м, 2Н).	389	98%
2-53		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,65 (с, 1Н), 8,91 (д, J=4,9 Гц, 1Н), 8,76 (с, 2Н), 8,15-7,85 (м, 1Н), 4,63-4,29 (м, 1Н), 2,50 (с, 3Н), 1,29-1,15 (м, 2Н), 1,06 (д, J=7,0 Гц, 2Н).	384	99%
2-54		MeO	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,86 (с, 1Н), 8,52 (с, 2Н), 8,00 (д, J=9,2 Гц, 1Н), 7,18 (с, 2Н), 4,29 (м, 1Н), 3,55 (с, 3Н), 1,27-1,11 (м, 4Н).	371	99%
2-55		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,67 (с, 1Н), 8,79 (с, 1Н), 8,19 (с, 1Н), 7,90 (д, J=9,3 Гц, 1Н), 7,81 (с, 1Н), 6,91 (т, J=5,6 Гц, 1Н), 4,29-4,11 (м, 1Н), 3,53-3,41 (м, 5Н), 1,26-1,06 (м, 7Н).	432	98%
2-56				¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 9,06 (с, 1Н), 8,38 (с, 1Н), 8,13 (д, J=1,75 Гц, 1Н), 7,72 (д, J=9,80 Гц, 1Н), 7,29 (с, 2Н), 5,06-4,90 (м, 1Н), 4,58 (д, J=10,62 Гц, 1Н), 4,44 (д, J=9,71 Гц, 1Н), 1,48 (д, J=6,75 Гц, 3Н).	381	95%
2-57				¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,95 (с, 1Н), 8,91 (с, 1Н), 8,37-8,33 (д, J=2,5 Гц, 1Н), 8,24-8,19 (д, J=8,3 Гц, 1Н), 8,14-8,10 (д, J=2,5 Гц, 1Н), 7,58-7,51 (д, J=8,3 Гц, 1Н), 7,22 (с, 2Н), 4,42-4,36 (тт, J=7,1, 3,7 Гц, 1Н), 2,71 (с, 3Н), 1,30-1,25 (м, 2Н), 1,05-0,94 (м, 2Н).	361	95%
2-58				¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,95 (с, 1Н), 8,89 (с, 1Н), 8,32 (д, J=3,5 Гц, 1Н), 8,21 (д, J=8,2 Гц, 1Н), 8,06 (с, 1Н), 7,79 (с, 1Н), 7,53 (д, J=8,2 Гц, 1Н), 6,61 (с, 2Н), 4,39 (с, 1Н), 2,72 (с, 3Н), 1,27 (д, J=6,1 Гц, 2Н), 1,03 (с, 2Н).	370	99%
2-59				¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 15,00 (с, 1Н), 9,06 (с, 1Н), 8,17 (с, 1Н), 7,80 (с, 1Н), 7,72 (д, J=9,8 Гц, 1Н), 6,86 (т, J=5,7 Гц, 1Н), 4,98 (д, J=6,7 Гц, 1Н), 4,57 (д, J=10,2 Гц, 1Н), 4,48-4,32 (м, 1Н), 3,55-3,37 (м, 2Н), 1,48 (д, J=6,8 Гц, 2Н), 1,17 (т, J=7,1 Гц, 2Н).	418	98%
2-60				¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,55 (с, 1Н), 8,82 (д, J=1,6 Гц, 1Н), 8,18 (с, 1Н), 7,92 (д, J=9,3 Гц, 1Н), 7,80 (с, 1Н), 6,92 (т, J=5,7 Гц, 1Н), 5,10 (ддд, J=64,1, 8,4, 5,4 Гц, 1Н), 4,32-4,06 (м, 1Н), 3,58-3,37 (м, 5Н), 1,93-1,51 (м, 2Н), 1,19 (т, J=7,1 Гц, 3Н).	450	98%
















Таблица 3



Соед. №	R ³	R ²	R ¹	ЯМР	МС (МН ⁺)	ВЭЖХ
3-1		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,59 (с, 1Н), 9,08 (с, 1Н), 8,94 (с, 1Н), 8,33 (д, J=1,3 Гц, 1Н), 8,16 (д, J=1,7 Гц, 1Н), 8,06 (т, J=8,5 Гц, 2Н), 7,85 (д, J=9,4 Гц, 1Н), 4,49-4,38 (м, 1Н), 2,70 (с, 3Н), 1,25 (д, J=6,6 Гц, 2Н), 1,09 (с, 2Н).	378	98%
3-2		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,63 (с, 1Н), 9,38 (с, 1Н), 8,91 (д, J=25,3 Гц, 1Н), 8,79 (с, 1Н), 8,13 (с, 1Н), 8,06 (д, J=8,8 Гц, 1Н), 8,01 (с, 1Н), 4,44 (с, 1Н), 2,75 (с, 3Н), 1,25 (с, 2Н), 1,09 (с, 2Н).	379	95%

3-3		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,70 (с, 1H), 9,41 (с, 1H), 9,00 (с, 1H), 8,80 (с, 1H), 8,36 (с, 1H), 8,17 (с, 1H), 8,07 (с, 2H), 7,86 (с, 1H), 7,61 (с, 1H), 4,49 (с, 1H), 2,79 (с, 3H), 1,31 (с, 3H), 1,17 (с, 2H).	456	98%
3-4		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,57 (д, $J=5,1$ Гц, 1H), 9,05 (д, $J=6,5$ Гц, 1H), 8,94 (с, 1H), 8,44 (с, 1H), 8,23 (с, 1H), 8,11 (с, 1H), 8,05 (д, $J=8,8$ Гц, 1H), 7,54 (д, $J=6,4$ Гц, 1H), 4,43 (с, 1H), 2,68 (с, 3H), 1,24 (д, $J=5,0$ Гц, 2H), 1,11 (с, 2H).	378	97%
3-5		OMe	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,64 (с, 1H), 9,13 (д, $J=6,3$ Гц, 1H), 8,90 (с, 1H), 8,53 (с, 1H), 8,31 (д, $J=11,7$ Гц, 2H), 8,09 (д, $J=9,1$ Гц, 1H), 7,72 (д, $J=5,8$ Гц, 1H), 4,30 (с, 1H), 3,57 (с, 3H), 1,25 (с, 4H).	394	95%
3-6		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 9,30 (с, 1H), 8,93 (с, 1H), 8,64 (с, 1H), 8,04 (т, $J=9,2$ Гц, 2H), 7,75 (д, $J=9,2$ Гц, 1H), 4,42 (с, 1H), 2,69 (с, 3H), 1,24 (с, 2H), 1,09 (с, 2H).	379	97%
3-7		OMe	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,61 (с, 1H), 9,33 (с, 1H), 8,83 (с, 1H), 8,64 (с, 1H), 8,06 (д, $J=9,2$ Гц, 1H), 8,01 (д, $J=9,1$ Гц, 1H), 7,86 (д, $J=9,3$ Гц, 1H), 4,24 (с, 1H), 3,48 (с, 3H), 1,19 (д, $J=5,2$ Гц, 4H).	395	98%
3-8		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,60 (с, 1H), 9,11 (с, 1H), 8,93 (с, 1H), 8,22 (д, $J=1,2$ Гц, 1H), 8,17 (с, 1H), 8,03 (д, $J=8,9$ Гц, 1H), 7,84 (д, $J=1,1$ Гц, 1H), 4,43 (тт, $J=7,1$, 3,7 Гц, 1H), 2,70 (с, 3H), 1,26 (д, $J=6,8$ Гц, 2H), 1,09 (с, 2H).	379	98%
3-9		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,60 (с, 1H), 9,07 (с, 1H), 8,93 (с, 1H), 8,22 (с, 1H), 8,02 (д, $J=8,9$ Гц, 1H), 7,81 (с, 1H), 7,80 (с, 1H), 4,49-4,37 (м, 1H), 2,70 (д, $J=21,5$ Гц, 3H), 1,27 (т, $J=9,8$ Гц, 2H), 1,14-1,05 (м, 2H).	446	97%
3-10		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,62 (с, 1H), 8,94 (с, 2H), 8,35 (с, 1H), 8,23 (с, 1H), 8,05 (д, $J=8,7$ Гц, 1H), 7,75 (с, 1H), 4,43 (с, 1H), 2,69 (с, 3H), 2,66 (с, 3H), 1,24 (с, 2H), 1,08 (с, 2H).	392	98%
3-11		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,61 (с, 1H), 8,92 (с, 1H), 8,79 (д, $J=1,2$ Гц, 1H), 8,16 (д, $J=1,1$ Гц, 1H), 8,01 (д, $J=8,8$ Гц, 1H), 7,76 (д, $J=1,1$ Гц, 1H), 7,58 (с, 1H), 4,42 (тт, $J=7,2$, 3,8 Гц, 1H), 2,70 (д, $J=20,2$ Гц, 3H), 1,26 (д, $J=6,9$ Гц, 2H), 1,15-1,03 (м, 2H).	412	99%
3-12		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 9,40 (с, 1H), 8,94 (с, 1H), 8,88 (с, 1H), 8,18 (д, $J=9,3$ Гц, 1H), 8,05 (д, $J=8,8$ Гц, 1H), 7,89 (д, $J=9,3$ Гц, 1H), 4,43 (с, 1H), 2,69 (с, 3H), 1,24 (д, $J=6,1$ Гц, 2H), 1,12 (с, 2H).	423	96%
3-13		OMe	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,60 (с, 1H), 8,90 (с, 1H), 8,83 (с, 1H), 8,22 (д, $J=1,0$ Гц, 1H), 7,98 (д, $J=9,2$ Гц, 1H), 7,75 (д, $J=1,0$ Гц, 1H), 7,66 (с, 1H), 4,29-4,18 (м, 1H), 3,51 (д, $J=13,2$ Гц, 3H), 1,25-1,14 (м, 4H).	428	100%
3-14		OMe	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,59 (с, 1H), 9,19 (с, 1H), 8,83 (с, 1H), 8,28 (с, 1H), 8,01 (д, $J=9,2$ Гц, 1H), 7,92 (с, 1H), 7,81 (с, 1H), 4,25 (дт, $J=11,0$, 5,7 Гц, 1H), 3,50 (д, $J=12,8$ Гц, 3H), 1,19 (м, 4H).	462	98%

3-15		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 9,61 (с, 1H), 8,93 (с, 1H), 8,51 (с, 1H), 8,13 (с, 1H), 8,04 (д, J=8,8 Гц, 1H), 7,97 (д, J=9,2 Гц, 1H), 7,62 (д, J=9,2 Гц, 1H), 7,55 (с, 1H), 4,42 (с, 1H), 2,69 (с, 3H), 1,24 (с, 2H), 1,10 (с, 2H).	421	98%
3-16		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,87-13,95 (м, 2H), 9,60 (с, 1H), 8,94 (с, 1H), 8,44 (с, 1H), 8,05 (т, J=9,5 Гц, 2H), 7,71 (д, J=9,4 Гц, 1H), 4,46-4,39 (м, 1H), 2,71 (м, 3H), 2,46 (с, 3H), 1,25 (д, J=6,3 Гц, 2H), 1,11 (с, 2H).	459	98%
3-17		Cl	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,44-13,91 (м, 1H), 9,16 (с, 1H), 8,95 (с, 1H), 8,37 (с, 1H), 8,23 (д, J=8,6 Гц, 1H), 8,08 (с, 1H), 7,81 (с, 1H), 4,43 (м, 1H), 1,23 (м, 2H), 1,16 (с, 2H).	398	98%
3-18		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,62 (с, 1H), 8,92 (с, 1H), 8,68 (с, 1H), 8,19 (д, J=2,9 Гц, 1H), 8,01 (д, J=8,8 Гц, 1H), 7,73 (д, J=1,0 Гц, 1H), 7,32 (д, J=11,7 Гц, 1H), 4,42 (м, 1H), 2,72 (с, 3H), 1,25 (д, 2H), 1,12-1,04 (м, 2H).	396	98%
3-19		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 9,29 (с, 1H), 8,94 (с, 1H), 8,54 (с, 1H), 8,36 (с, 1H), 8,05 (д, J=8,9 Гц, 1H), 8,00 (с, 1H), 4,49-4,38 (м, 1H), 2,74 (с, 3H), 1,25 (д, J=6,9 Гц, 2H), 1,11 (с, 2H).	423	98%
3-20		Cl	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,95 (с, 1H), 8,88 (т, J=4,2 Гц, 1H), 8,22 (т, J=2,4 Гц, 1H), 8,20 (д, J=8,5 Гц, 1H), 7,82 (с, 1H), 7,68 (с, 1H), 4,48-4,36 (м, 1H), 1,26-1,19 (м, 2H), 1,14 (м, 2H).	432	98%
3-21		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,60 (с, 1H), 9,32 (д, J=1,2 Гц, 1H), 8,93 (с, 1H), 8,71 (с, 1H), 8,06 (с, 1H), 8,02 (д, J=8,8 Гц, 1H), 4,43 (тт, J=7,0, 3,6 Гц, 1H), 2,70 (д, J=17,8 Гц, 3H), 1,30-1,20 (м, 2H), 1,15-1,05 (м, 2H).	413	98%
3-22		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,57 (с, 1H), 9,22 (с, 1H), 8,93 (с, 1H), 8,71 (с, 1H), 8,02 (д, J=8,8 Гц, 1H), 7,85 (д, J=10,8 Гц, 1H), 4,47-4,37 (м, 1H), 2,72 (с, 3H), 1,29-1,22 (м, 2H), 1,10 (с, 2H).	397	99%
3-23		OMe	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,57 (с, 1H), 9,26 (с, 1H), 8,84 (с, 1H), 8,72 (с, 1H), 8,01 (д, J=9,1 Гц, 1H), 7,92 (д, J=10,9 Гц, 1H), 4,28-4,18 (м, 1H), 3,51 (с, 3H), 1,20 (д, J=5,5 Гц, 4H).	413	95%
3-24		OMe		¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,47 (с, 1H), 8,89 (т, J=1,3 Гц, 1H), 8,86 (д, J=1,8 Гц, 1H), 8,23 (д, J=1,3 Гц, 1H), 8,00 (д, J=9,1 Гц, 1H), 7,75 (д, J=1,2 Гц, 1H), 7,63 (т, J=1,3 Гц, 1H), 5,31-4,93 (дтд, J=64,0, 5,5, 3,3 Гц, 1H), 4,26-4,12 (дт, J=8,9, 5,4 Гц, 1H), 3,54 (с, 3H), 1,93-1,49 (м, 2H).	446	98%
3-25		Me		¹ H ЯМР (400 МГц, CDCl ₃) δ 14,07 (с, 1H), 8,55 (с, 1H), 8,14 (д, J=8,4 Гц, 1H), 8,00 (д, J=17,0 Гц, 1H), 7,66 (дд, J=11,6, 4,8 Гц, 2H), 7,49 (д, J=4,4 Гц, 1H), 7,13-7,03 (м, 2H), 7,01 (д, J=0,8 Гц, 1H), 5,22 (с, 1H), 1,72 (с, 3H).	484	98%

3-26		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,64 (с, 1H), 9,09 (с, 1H), 8,93 (с, 1H), 8,58 (с, 1H), 8,02 (д, $J=8,8$ Гц, 1H), 7,54 (с, 1H), 4,46-4,36 (м, 1H), 2,70 (с, 3H), 2,64 (с, 3H), 1,25 (д, $J=6,2$ Гц, 2H), 1,09 (с, 2H).	393	98%
3-27		Me		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,48 (с, 1H), 8,90 (д, $J=3,0$ Гц, 1H), 8,78 (с, 1H), 8,16 (с, 1H), 8,03 (д, $J=8,8$ Гц, 1H), 7,75 (с, 1H), 7,57 (с, 1H), 5,16 (д, $J=64,5$ Гц, 1H), 4,44-4,33 (м, 1H), 2,65 (с, 3H), 1,83-1,68 (м, 1H), 1,62 (м, 1H).	430	98%
3-28		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,59 (с, 1H), 9,63 (с, 1H), 8,94 (с, 1H), 8,81 (с, 1H), 8,30 (с, 1H), 8,04 (д, $J=8,9$ Гц, 1H), 4,50-4,37 (м, 1H), 2,73 (с, 3H), 1,24 (т, $J=9,6$ Гц, 2H), 1,12 (с, 2H).	447	98%
3-29		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 9,33 (с, 1H), 8,94 (с, 1H), 8,74 (с, 1H), 8,63 (с, 2H), 8,05 (д, $J=8,8$ Гц, 1H), 7,84 (с, 1H), 4,51 (с, 2H), 4,46-4,36 (м, 1H), 2,71 (с, 3H), 1,26 (д, $J=6,8$ Гц, 2H), 1,09 (с, 2H).	408	95%
3-30		OMe	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,58 (с, 1H), 9,37 (с, 1H), 8,84 (с, 1H), 8,72 (с, 1H), 8,13 (с, 1H), 8,00 (д, $J=9,0$ Гц, 1H), 4,29-4,18 (м, 1H), 3,51 (с, 3H), 1,20 (д, $J=5,4$ Гц, 4H).	429	96%
3-31		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 9,43 (с, 1H), 8,99 (с, 1H), 8,89 (с, 1H), 8,14-8,01 (м, 2H), 7,54 (д, $J=9,8$ Гц, 1H), 4,49 (с, 2H), 2,77 (с, 3H), 1,30 (с, 2H), 1,14 (с, 2H).	379	88%
3-32		OMe	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 9,42 (с, 1H), 8,92 (с, 1H), 8,83 (с, 1H), 8,00 (с, 2H), 7,57 (д, $J=9,3$ Гц, 1H), 4,23 (с, 1H), 3,51 (с, 3H), 1,18 (с, 4H).	395	95%
3-33		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,98 (с, 1H), 8,74 (с, 1H), 8,48 (с, 1H), 8,23 (с, 1H), 8,04 (д, $J=8,9$ Гц, 1H), 4,39 (с, 2H), 2,64 (с, 3H), 1,29 (с, 2H), 1,07 (с, 2H).	379	99%
3-34		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 15,02-14,73 (м, 1H), 9,01 (с, 1H), 8,10 (с, 3H), 7,54 (с, 1H), 4,51 (с, 1H), 1,33 (с, 2H), 1,18 (с, 2H).	379	95%
3-35		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,68 (с, 1H), 14,19 (с, 1H), 8,93 (с, 1H), 8,53 (с, 1H), 8,44 (с, 1H), 8,40 (с, 1H), 8,01 (д, $J=8,5$ Гц, 1H), 4,42 (с, 1H), 2,64 (с, 3H), 1,22 (м, 2H), 1,12 (м, 2H).	423	98%
3-36		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 12,87 (с, 1H), 8,97 (с, 1H), 8,10 (с, 1H), 8,01 (д, $J=8,7$ Гц, 1H), 7,02 (с, 1H), 6,48 (с, 1H), 4,46 (с, 1H), 2,70 (с, 2H), 1,30 (с, 2H), 1,12 (с, 2H).	393	98%
3-37		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,83 (с, 1H), 13,45 (б, 1H), 8,98 (с, 1H), 8,26 (с, 1H), 8,04 (д, $J=8,6$ Гц, 1H), 7,90 (с, 1H), 7,78 (д, $J=8,5$ Гц, 1H), 7,42 (д, $J=8,4$ Гц, 1H), 4,46 (с, 1H), 2,68 (с, 3H), 1,31 (д, $J=5,7$ Гц, 2H), 1,14 (с, 2H).	378	92%
3-38		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,69 (с, 1H), 13,83 (с, 1H), 8,91 (с, 1H), 8,31 (с, 1H), 7,98 (д, $J=8,8$ Гц, 1H), 7,83 (с, 1H), 7,53 (с, 1H), 4,46-4,34 (м, 1H), 2,63 (с, 3H), 1,25 (д, $J=6,9$ Гц, 2H), 1,09 (с, 2H).	412	98%
3-39		OMe	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,74 (с, 1H), 14,27 (с, 1H), 8,90 (с, 1H), 8,62 (д, $J=10,6$ Гц, 3H), 8,07 (д, $J=9,1$ Гц, 1H), 4,31 (с, 1H), 3,44 (с, 3H), 1,26 (с, 4H).	439	95%

3-40		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,77 (с, 1Н), 13,23 (с, 1Н), 8,91 (с, 1Н), 8,49 (с, 1Н), 7,98 (д, $J=8,3$ Гц, 1Н), 7,79 (д, $J=8,0$ Гц, 1Н), 7,67 (с, 1Н), 7,25 (д, $J=7,9$ Гц, 1Н), 4,40 (с, 1Н), 2,61 (с, 2Н), 1,25 (с, 2Н), 1,09 (с, 2Н).	378	98%
3-41		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,72 (с, 1Н), 9,52 (с, 1Н), 8,92 (с, 1Н), 8,30 (с, 1Н), 8,27 (д, $J=8,4$ Гц, 1Н), 8,01 (д, $J=8,8$ Гц, 1Н), 7,58 (д, $J=8,1$ Гц, 1Н), 4,40 (с, 1Н), 2,62 (с, 3Н), 1,25 (д, $J=5,9$ Гц, 2Н), 1,08 (с, 2Н).	395	95%
3-42		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,77 (с, 1Н), 11,96 (с, 1Н), 8,92 (с, 1Н), 8,24 (с, 1Н), 8,06 (с, 1Н), 7,99 (д, $J=8,7$ Гц, 1Н), 7,61 (с, 1Н), 6,57 (с, 1Н), 4,41 (с, 1Н), 2,64 (с, 3Н), 1,26 (д, $J=6,1$ Гц, 2Н), 1,09 (с, 2Н).	378	98%
3-43		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,76-14,48 (с, 1Н), 8,97-8,90 (д, $J=2,7$ Гц, 2Н), 8,63-8,55 (с, 1Н), 8,07-7,97 (т, $J=9,2$ Гц, 2Н), 7,69-7,58 (м, 1Н), 4,48-4,39 (с, 2Н), 2,73-2,65 (с, 3Н), 1,27-1,20 (м, 2Н), 1,14-1,06 (с, 2Н).	403	95%
3-44		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 10,02-9,98 (с, 1Н), 9,48-9,43 (с, 1Н), 8,95-8,90 (с, 1Н), 8,67-8,62 (с, 1Н), 8,12-8,07 (д, $J=9,2$ Гц, 1Н), 8,07-8,01 (д, $J=8,9$ Гц, 1Н), 7,82-7,75 (дд, $J=9,4$, 1,7 Гц, 1Н), 4,48-4,36 (с, 1Н), 2,72-2,67 (с, 3Н), 1,25-1,21 (т, $J=3,8$ Гц, 2Н), 1,14-1,06 (м, 2Н).	406	90%
3-45		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 9,93 (с, 1Н), 8,83 (с, 1Н), 8,40 (с, 1Н), 8,09-8,05 (дд, $J=9,2$, 1,0 Гц, 1Н), 8,05-8,00 (д, $J=8,7$ Гц, 1Н), 7,81-7,72 (дд, $J=9,3$, 1,7 Гц, 1Н), 5,35-5,16 (с, 1Н), 4,53-4,33 (м, 1Н), 2,75-2,64 (с, 3Н), 1,28-1,20 (д, $J=6,2$ Гц, 2Н), 1,15-1,03 (д, $J=3,8$ Гц, 2Н).	402	98%
3-46		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,70-14,56 (с, 1Н), 9,23-9,15 (м, 1Н), 8,99-8,89 (с, 1Н), 8,72-8,65 (с, 1Н), 8,08-7,99 (д, $J=8,8$ Гц, 1Н), 7,84-7,77 (с, 1Н), 7,16-7,04 (м, 1Н), 6,93-6,82 (м, 1Н), 5,82-5,69 (дд, $J=11,2$, 1,6 Гц, 1Н), 4,49-4,36 (т, $J=3,5$ Гц, 1Н), 2,75-2,68 (с, 3Н), 1,33-1,19 (т, $J=6,5$ Гц, 2Н), 1,16-1,03 (с, 2Н).	405	97%
3-47		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,76-14,48 (с, 1Н), 8,96-8,91 (с, 4Н), 8,86-8,79 (с, 4Н), 8,64-8,56 (д, $J=2,3$ Гц, 4Н), 8,06-7,99 (д, $J=8,8$ Гц, 4Н), 7,86-7,79 (д, $J=9,4$ Гц, 4Н), 7,52-7,43 (с, 3Н), 4,48-4,37 (с, 1Н), 2,74-2,67 (с, 12Н), 1,29-1,20 (д, $J=6,8$ Гц, 9Н), 1,11-1,01 (т, $J=3,0$ Гц, 6Н).	422	96%
3-48		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,76-14,48 (с, 1Н), 8,95-8,89 (с, 1Н), 8,84-8,78 (с, 1Н), 8,63-8,58 (с, 1Н), 8,05-8,00 (д, $J=8,8$ Гц, 1Н), 7,90-7,84 (д, $J=9,4$ Гц, 1Н), 7,53-7,45 (д, $J=9,3$ Гц, 1Н), 4,47-4,40 (с, 1Н), 2,73-2,68 (с, 3Н), 1,27-1,21 (д, $J=6,6$ Гц, 2Н), 1,12-1,02 (с, 2Н).	446	90%
3-49		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,93 (с, 1Н), 8,66 (с, 1Н), 8,06-7,99 (д, $J=8,7$ Гц, 1Н), 7,99-7,95 (с, 1Н), 7,94-7,88 (д, $J=9,3$ Гц, 1Н), 7,55-7,47 (дд, $J=9,3$, 1,6 Гц, 1Н), 4,52-4,32 (м, 1Н), 2,77-2,61 (с, 3Н), 1,33-1,17 (д, $J=6,6$ Гц, 2Н), 1,19-1,05 (т, $J=3,3$ Гц, 2Н).	412	98%
3-50		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,93 (с, 1Н), 8,60 (с, 1Н), 8,06-8,00 (д, $J=8,7$ Гц, 1Н), 8,00-7,96 (с, 1Н), 7,92-7,86 (д, $J=9,3$ Гц, 1Н), 7,56-7,48 (д, $J=9,4$ Гц, 1Н), 4,55-4,26 (м, 1Н), 2,81-2,60 (с, 3Н), 1,37-1,21 (п, $J=6,5$ Гц, 2Н), 1,15-1,05 (м, 2Н).	456, 458	97%
3-51		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,71-14,62 (с, 1Н), 8,96-8,88 (с, 1Н), 8,83-8,75 (с, 1Н), 8,25-8,16 (д, $J=7,5$ Гц, 2Н), 8,15-8,07 (с, 1Н), 8,07-7,97 (п, $J=8,8$ Гц, 1Н), 7,77-7,71 (с, 1Н), 7,57-7,42 (м, 4Н), 4,50-4,33 (с, 1Н), 2,82-2,71 (с, 3Н), 1,31-1,22 (д, $J=6,7$ Гц, 2Н), 1,15-1,04 (с, 2Н).	454	99%
3-52		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,71-14,60 (с, 1Н), 8,95-8,88 (с, 1Н), 8,73-8,65 (с, 1Н), 8,10-7,96 (м, 2Н), 7,74-7,68 (с, 1Н), 7,40-7,32 (с, 1Н), 7,11-7,02 (м, 1Н), 6,96-6,83 (м, 1Н), 5,70-5,60 (дд, $J=11,2$, 2,0 Гц, 1Н), 4,47-4,38 (т, $J=3,5$ Гц, 1Н), 2,78-2,69 (с, 3Н), 1,31-1,20 (д, $J=6,9$ Гц, 2Н), 1,14-1,01 (с, 2Н).	405	93%

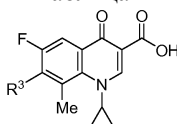
3-53		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,71-14,60 (с, 1H), 8,95-8,88 (с, 1H), 8,73-8,65 (с, 1H), 8,10-7,96 (м, 2H), 7,74-7,68 (с, 1H), 7,40-7,32 (с, 1H), 7,11-7,02 (м, 1H), 6,96-6,83 (м, 1H), 5,70-5,60 (дд, $J=11,2, 2,0$ Гц, 1H), 4,47-4,38 (т, $J=3,5$ Гц, 1H), 2,78-2,69 (с, 3H), 1,31-1,20 (д, $J=6,9$ Гц, 2H), 1,14-1,01 (с, 2H).	403	95%
3-54		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,76-14,39 (с, 1H), 9,20-9,07 (д, $J=7,0$ Гц, 1H), 8,95-8,90 (с, 1H), 8,67-8,60 (с, 1H), 8,08-8,00 (м, 2H), 7,32-7,24 (м, 1H), 4,47-4,36 (с, 1H), 2,75-2,61 (с, 3H), 1,30-1,19 (м, 2H), 1,15-1,03 (кв, $J=3,8, 3,1$ Гц, 2H).	379	98%
3-55		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,76-14,36 (с, 1H), 9,68-9,65 (д, $J=1,5$ Гц, 1H), 8,95-8,92 (с, 1H), 8,84-8,81 (с, 1H), 8,63-8,59 (д, $J=1,5$ Гц, 1H), 8,06-8,01 (д, $J=8,8$ Гц, 1H), 4,46-4,39 (с, 1H), 2,76-2,69 (с, 3H), 1,30-1,20 (м, 2H), 1,14-1,05 (с, 2H).	404	98%
3-56		OMe		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,73-14,06 (с, 1H), 9,21-9,18 (м, 1H), 8,87-8,83 (д, $J=1,86$ Гц, 1H), 8,32-8,27 (д, $J=1,33$ Гц, 1H), 8,20-8,16 (с, 1H), 8,04-7,97 (д, $J=9,06$ Гц, 1H), 7,87-7,80 (д, $J=1,20$ Гц, 1H), 5,31-4,87 (м, 1H), 4,32-4,12 (м, 1H), 3,67-3,47 (с, 3H), 1,95-1,56 (м, 2H).	437	98%
3-57		OMe	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,61 (с, 1H), 8,83 (с, 1H), 8,77 (с, 1H), 8,23 (д, $J=2,1$ Гц, 1H), 7,99 (д, $J=9,2$ Гц, 1H), 7,73 (д, $J=1,0$ Гц, 1H), 7,40 (д, $J=11,8$ Гц, 1H), 4,46-4,08 (м, 1H), 3,51 (д, $J=10,5$ Гц, 3H), 1,19 (д, $J=6,9$ Гц, 4H).	412	90%
3-58		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,83-14,57 (с, 1H), 9,82-9,48 (с, 2H), 9,01-8,84 (д, $J=2,6$ Гц, 1H), 8,05-7,90 (дд, $J=8,5, 2,7$ Гц, 1H), 7,65-7,57 (д, $J=7,5$ Гц, 1H), 7,51-7,46 (с, 1H), 7,45-7,36 (д, $J=7,7$ Гц, 1H), 4,72-4,50 (с, 4H), 4,47-4,28 (д, $J=6,8$ Гц, 1H), 2,64-2,53 (д, $J=2,7$ Гц, 3H), 1,31-1,14 (д, $J=6,1$ Гц, 2H), 1,14-0,96 (с, 2H).	379	95%
3-59		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,95-8,83 (д, $J=2,4$ Гц, 1H), 7,98-7,86 (д, $J=8,8$ Гц, 1H), 7,25-7,15 (с, 1H), 7,14-7,01 (д, $J=7,9$ Гц, 1H), 6,97-6,81 (д, $J=7,9$ Гц, 1H), 3,65-3,50 (м, 2H), 4,45-4,29 (дд, $J=9,2, 4,7, 3,9$ Гц, 1H), 3,16-2,99 (т, $J=8,4$ Гц, 2H), 2,65-2,56 (с, 3H), 1,28-1,16 (д, $J=6,6$ Гц, 3H), 1,12-0,97 (м, 2H).	379	99%
3-60		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 15,01-14,39 (м, 1H), 12,95-12,53 (с, 2H), 9,03-8,82 (т, $J=1,9$ Гц, 1H), 8,73-8,47 (с, 2H), 8,10-7,90 (д, $J=8,4$ Гц, 1H), 7,62-7,44 (м, 1H), 4,51-4,23 (м, 1H), 7,44-7,31 (с, 1H), 7,31-7,11 (д, $J=8,6$ Гц, 1H), 2,65-2,55 (с, 3H), 1,30-1,16 (м, 2H), 1,16-0,96 (с, 2H).	393	90%
3-61		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, MeOD) δ 9,17-9,06 (д, $J=2,8$ Гц, 1H), 8,30-8,15 (м, 1H), 7,94-7,80 (м, 2H), 7,65-7,49 (дд, $J=7,5, 3,3$ Гц, 2H), 4,47-4,32 (д, $J=6,9$ Гц, 1H), 2,96-2,81 (д, $J=2,8$ Гц, 3H), 1,43-1,27 (дд, $J=10,8, 4,5$ Гц, 2H), 1,21-1,05 (с, 2H).	378	100%

3-62		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,63-14,42 (с, 1H), 8,99-8,89 (с, 1H), 8,33-8,25 (д, $J=7,8$ Гц, 1H), 8,25-8,18 (д, $J=8,0$ Гц, 1H), 8,14-8,05 (д, $J=8,7$ Гц, 1H), 7,71-7,56 (дт, $J=22,8, 7,4$ Гц, 2H), 4,51-4,31 (с, 1H), 2,85-2,70 (с, 3H), 1,30-1,20 (д, $J=7,0$ Гц, 2H), 1,13-0,97 (с, 2H).	395	100%
3-63		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 15,01-14,28 (с, 2H), 9,04-8,82 (т, $J=2,3$ Гц, 1H), 8,05-7,98 (д, $J=8,3$ Гц, 1H), 7,98-7,92 (дд, $J=10,5, 2,5$ Гц, 1H), 7,90-7,83 (с, 1H), 7,56-7,47 (д, $J=8,2$ Гц, 1H), 4,46-4,34 (т, $J=6,3$ Гц, 1H), 2,87-2,78 (т, $J=2,1$ Гц, 3H), 2,64-2,55 (с, 3H), 1,29-1,16 (м, 2H), 1,16-1,03 (с, 2H).	392	100%
3-64		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 15,01-14,28 (с, 2H), 9,04-8,82 (т, $J=2,3$ Гц, 1H), 8,05-7,98 (д, $J=8,3$ Гц, 1H), 7,98-7,92 (дд, $J=10,5, 2,5$ Гц, 1H), 7,90-7,83 (с, 1H), 7,56-7,47 (д, $J=8,2$ Гц, 1H), 4,46-4,34 (т, $J=6,3$ Гц, 1H), 2,87-2,78 (т, $J=2,1$ Гц, 3H), 2,64-2,55 (м, 6H), 1,29-1,16 (м, 2H), 1,16-1,03 (с, 2H).	421	100%
3-65		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 15,05-14,35 (м, 1H), 10,46-9,91 (м, 1H), 9,02-8,80 (с, 1H), 8,80-8,47 (д, $J=15,2$ Гц, 1H), 8,12-7,64 (м, 3H), 7,44-7,25 (дд, $J=23,7, 8,0$ Гц, 1H), 4,84-4,63 (д, $J=8,8$ Гц, 2H), 4,49-4,32 (с, 1H), 3,01-2,77 (д, $J=17,9$ Гц, 6H), 1,37-1,13 (д, $J=6,9$ Гц, 2H), 1,17-0,86 (с, 2H).	449	96%
3-66		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,97-14,24 (с, 2H), 9,14-8,97 (м, 2H), 8,98-8,88 (с, 2H), 8,07-7,89 (дд, $J=24,1, 8,9$ Гц, 6H), 7,86-7,79 (с, 1H), 7,52-7,37 (т, $J=9,6$ Гц, 3H), 4,57-4,31 (т, $J=6,8$ Гц, 5H), 2,66-2,55 (с, 7H), 1,60-1,40 (м, 7H), 1,30-1,16 (м, 2H), 1,16-0,98 (с, 2H).	406	97%
3-67		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,97-14,24 (с, 2H), 9,14-8,97 (м, 2H), 8,98-8,88 (с, 2H), 8,07-7,89 (дд, $J=24,1, 8,9$ Гц, 6H), 7,86-7,79 (с, 1H), 7,52-7,37 (т, $J=9,6$ Гц, 3H), 4,57-4,31 (т, $J=6,8$ Гц, 5H), 2,66-2,55 (с, 3H), 1,60-1,40 (м, 7H), 1,30-1,16 (м, 2H), 1,16-0,98 (с, 2H).	392	100%
3-68		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,95-8,91 (с, 1H), 8,65-8,59 (с, 1H), 8,31-8,25 (с, 1H), 8,23-8,17 (с, 1H), 8,05-7,98 (м, 1H), 4,48-4,35 (с, 1H), 2,68-2,61 (с, 3H), 1,30-1,22 (с, 2H), 1,16-1,06 (с, 2H).	423	97%
3-69		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,96-14,48 (м, 1H), 10,94-10,65 (д, $J=25,6$ Гц, 2H), 9,01-8,77 (м, 1H), 8,05-7,81 (д, $J=8,6$ Гц, 1H), 7,18-7,00 (д, $J=7,8$ Гц, 1H), 7,00-6,78 (м, 2H), 4,47-4,25 (тд, $J=6,9, 3,6$ Гц, 1H), 2,67-2,54 (с, 3H), 1,27-1,10 (д, $J=6,3$ Гц, 2H), 1,14-0,88 (с, 2H).	394	94%
3-70		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 15,02-14,18 (с, 1H), 9,00-8,67 (м, 2H), 8,12-7,68 (м, 3H), 7,49-7,25 (дд, $J=16,6, 8,2$ Гц, 1H), 5,04-4,75 (м, 1H), 4,62-4,23 (м, 9H), 3,77-3,55 (м, 2H), 3,57-3,23 (д, $J=7,0$ Гц, 1H), 2,70-2,53 (с, 3H), 1,37-1,15 (т, $J=8,0$ Гц, 2H), 1,15-0,84 (тд, $J=16,0, 7,8$ Гц, 9H).	494	90%


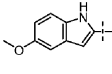
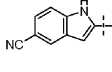
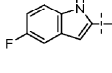




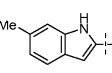
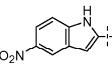
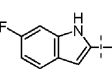

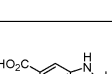
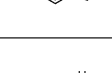
3-71		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,45-14,13 (с, 1H), 11,09-10,85 (с, 1H), 8,73-8,58 (д, $J=2,7$ Гц, 1H), 7,85-7,61 (м, 2H), 7,31-7,15 (м, 1H), 7,07-6,83 (м, 2H), 4,27-4,07 (с, 1H), 3,82-3,71 (д, $J=2,5$ Гц, 3H), 1,27-1,08 (м, 2H), 1,08-0,86 (с, 2H).	408	93%
3-72		OMe	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 15,07-14,72 (с, 1H), 9,21-8,97 (с, 1H), 8,95-8,73 (м, 1H), 8,41-8,14 (м, 1H), 8,12-7,95 (с, 1H), 3,40-3,18 (м, 4H), 7,95-7,79 (д, $J=8,6$ Гц, 1H), 7,79-7,60 (дд, $J=8,5, 3,9$ Гц, 2H), 4,34-4,10 (д, $J=6,3$ Гц, 1H), 1,30-1,02 (с, 4H).	376	95%
3-73		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,85-14,61 (с, 1H), 10,68-10,51 (с, 1H), 9,04-8,78 (м, 1H), 8,01-7,81 (м, 1H), 7,36-7,11 (м, 2H), 7,11-6,87 (дд, $J=7,8, 2,7$ Гц, 1H), 4,47-4,29 (с, 1H), 3,72-3,47 (с, 2H), 1,27-1,08 (м, 2H), 1,08-0,86 (с, 2H).	393	97%
3-74		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,85-14,61 (с, 1H), 10,68-10,51 (с, 1H), 9,04-8,78 (м, 1H), 8,01-7,81 (м, 1H), 7,36-7,11 (м, 2H), 7,11-6,87 (дд, $J=7,8, 2,7$ Гц, 1H), 4,47-4,29 (с, 1H), 3,72-3,47 (с, 2H), 2,66-2,57 (д, $J=2,7$ Гц, 3H), 2,55-2,45 (д, $J=3,4$ Гц, 4H).	424	97%
3-75		OMe	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,80-14,62 (м, 1H), 8,38-8,18 (м, 1H), 8,03-7,83 (м, 1H), 8,96-8,82 (м, 1H), 7,77-7,59 (м, 1H), 7,37-7,22 (м, 1H), 4,48-4,29 (м, 1H), 3,24-3,08 (м, 2H), 3,94-3,70 (м, 2H), 1,32-1,12 (м, 2H), 1,12-0,86 (м, 2H).	394	100%
3-76		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 15,11-14,26 (д, $J=53,0$ Гц, 1H), 10,22-9,45 (м, 1H), 9,01-8,84 (м, 1H), 8,77-8,58 (с, 1H), 8,09-7,92 (д, $J=8,5$ Гц, 1H), 7,88-7,68 (с, 1H), 7,51-7,33 (с, 1H), 4,84-4,58 (с, 2H), 4,53-4,25 (с, 1H), 2,96-2,72 (с, 6H), 2,72-2,56 (с, 3H), 1,34-1,17 (д, $J=6,5$ Гц, 2H), 1,17-0,93 (д, $J=10,1$ Гц, 2H).	435	94%
3-77		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,87-14,59 (с, 1H), 12,20-12,00 (с, 1H), 9,01-8,79 (с, 1H), 8,09-7,83 (д, $J=8,6$ Гц, 1H), 7,74-7,59 (с, 1H), 7,39-7,20 (м, 2H), 4,48-4,31 (с, 1H), 2,72-2,56 (с, 3H), 1,36-1,12 (д, $J=6,9$ Гц, 2H), 1,12-0,79 (с, 2H).	411	98%
3-78		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,85-14,61 (с, 1H), 10,68-10,51 (с, 1H), 9,04-8,78 (м, 1H), 8,01-7,81 (м, 1H), 7,36-7,11 (м, 2H), 7,11-6,87 (дд, $J=7,8, 2,7$ Гц, 1H), 4,47-4,29 (с, 1H), 3,72-3,47 (с, 2H), 1,27-1,08 (м, 2H), 1,08-0,86 (с, 2H).	393	95%
3-79		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,82-14,60 (с, 1H), 11,50-11,28 (с, 1H), 8,99-8,81 (с, 1H), 8,09-7,90 (м, 2H), 7,66-7,53 (д, $J=1,1$ Гц, 1H), 6,91-6,78 (с, 1H), 6,17-5,99 (д, $J=15,7$ Гц, 1H), 5,38-5,23 (д, $J=9,0$ Гц, 1H), 4,48-4,31 (дд, $J=8,4, 4,4$ Гц, 1H), 3,61-3,41 (с, 1H), 2,71-2,56 (с, 3H), 1,32-1,16 (с, 2H), 1,14-0,97 (с, 2H).	421	97%


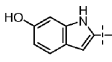
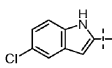
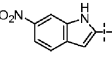


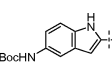
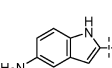
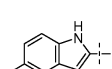
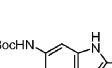

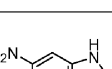
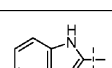
3-80		MeO	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,82-14,60 (с, 1H), 11,50-11,28 (с, 1H), 8,99-8,81 (с, 1H), 8,09-7,90 (м, 2H), 7,66-7,53 (д, J=1,1 Гц, 1H), 6,91-6,78 (с, 1H), 6,17-5,99 (д, J=15,7 Гц, 1H), 5,38-5,23 (д, J=9,0 Гц, 1H), 4,48-4,31 (дд, J=8,4, 4,4 Гц, 1H), 3,61-3,41 (с, 1H), 2,71-2,56 (с, 3H), 1,14-0,97 (с, 4H).	437	90%
3-81		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,85-14,61 (с, 1H), 10,95-10,69 (с, 1H), 9,06-8,79 (с, 2H), 8,05-7,90 (д, J=8,7 Гц, 1H), 7,28-7,09 (с, 1H), 6,85-6,63 (с, 1H), 4,46-4,29 (тт, J=7,4, 4,0 Гц, 1H), 2,72-2,54 (с, 3H), 1,32-1,14 (д, J=5,8 Гц, 2H), 1,14-0,97 (д, J=3,8 Гц, 2H).	394	94%
3-82		OMe	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,89-14,50 (с, 2H), 11,09-10,63 (с, 1H), 9,21-8,97 (с, 1H), 8,97-8,73 (с, 1H), 8,07-7,85 (м, 1H), 3,48-3,31 (м, 5H), 7,42-7,26 (м, 1H), 7,04-6,87 (м, 1H), 4,31-4,13 (р, J=5,6 Гц, 1H), 2,72-2,54 (с, 3H), 1,27-1,01 (д, J=5,6 Гц, 4H).	410	98%
3-83		OMe	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 15,05-14,39 (с, 1H), 13,02-12,32 (с, 1H), 8,97-8,77 (с, 1H), 8,47-8,20 (с, 1H), 7,85-7,39 (м, 2H), 7,33-6,98 (д, J=8,0 Гц, 1H), 4,47-4,23 (с, 1H), 2,74-2,52 (с, 3H), 1,34-1,13 (м, 2H), 1,13-0,71 (с, 2H).	428	100%
3-84		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,75 (д, J=8,7 Гц, 1H), 8,91 (с, 1H), 8,13 (с, 1H), 7,99 (т, J=11,1 Гц, 1H), 7,78 (т, J=13,2 Гц, 1H), 7,72 (с, 1H), 7,33 (д, J=8,5 Гц, 1H), 7,07 (с, 1H), 4,40 (м, 1H), 2,61 (с, 3H), 1,24 (д, J=5,7 Гц, 2H), 1,08 (с, 2H).	378	98%
3-85		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,70 (с, 1H), 8,90 (с, 1H), 8,21 (д, J=8,0 Гц, 1H), 7,98 (д, J=8,1 Гц, 1H), 7,94 (с, 1H), 7,90 (с, 1H), 7,56 (с, 1H), 7,38 (д, J=7,9 Гц, 1H), 4,38 (с, 1H), 2,65 (с, 3H), 1,17 (м, 2H), 1,06 (м, 2H).	394	98%
3-86				¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 15,38-14,22 (с, 1H), 9,14-9,08 (с, 1H), 9,00-8,94 (с, 1H), 8,32-8,24 (с, 1H), 7,93-7,90 (с, 1H), 7,90-7,86 (с, 1H), 7,83-7,76 (д, J=9,72 Гц, 1H), 5,07-4,96 (д, J=6,74 Гц, 1H), 4,65-4,56 (д, J=11,26 Гц, 1H), 4,53-4,43 (д, J=9,86 Гц, 1H), 1,54-1,46 (д, J=6,76 Гц, 3H).	414	99%
3-87				¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,87 (с, 1H), 8,93 (с, 1H), 8,77 (с, 1H), 8,27 (д, J=8,2 Гц, 1H), 8,15 (с, 1H), 7,73 (д, J=0,9 Гц, 1H), 7,63 (м, 2H), 4,46-4,36 (м, 1H), 2,76 (с, 3H), 1,29 (д, J=6,5 Гц, 2H), 1,08 (т, J=7,4 Гц, 2H).	394	99%

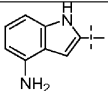
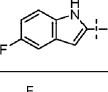
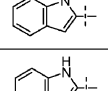
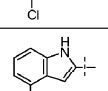
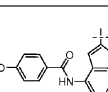
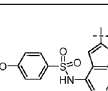
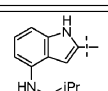
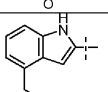
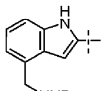
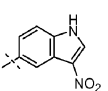
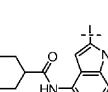
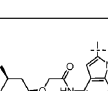
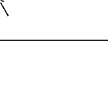
Таблица 4



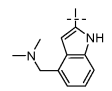
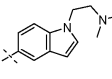
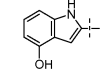
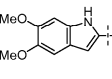
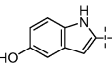
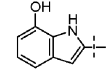
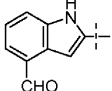
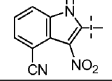
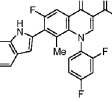
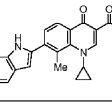
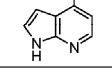
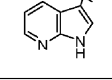
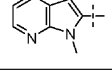
Соед. №	R ³	ЯМР	МС (МН ⁺)	ВЭЖХ
4-1		¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,49 (с, 1H), 11,38 (с, 1H), 8,70 (с, 1H), 7,78 (д, J=9,1 Гц, 1H), 7,42 (д, J=7,9 Гц, 1H), 7,26 (д, J=8,1 Гц, 1H), 7,00-6,92 (м, 1H), 6,86 (т, J=7,5 Гц, 1H), 6,51 (с, 1H), 4,24-4,16 (м, 1H), 2,56 (с, 3H), 1,03 (дд, J=12,0, 4,6 Гц, 2H), 0,86 (д, J=7,4 Гц, 2H).	377	95%
4-2		¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,70 (с, 1H), 11,59 (с, 1H), 8,92 (с, 1H), 8,00 (д, J=9,1 Гц, 1H), 7,64 (д, J=7,5 Гц, 1H), 7,48 (д, J=8,0 Гц, 1H), 7,19 (т, J=7,5 Гц, 1H), 7,08 (т, J=7,3 Гц, 1H), 6,73 (с, 1H), 4,42 (с, 1H), 2,78 (с, 3H), 1,27 (д, J=6,1 Гц, 2H), 1,07 (с, 2H).	377	100%
4-3		¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,66 (с, 1H), 8,93 (с, 1H), 8,05 (д, J=8,6 Гц, 1H), 7,65 (д, J=7,7 Гц, 1H), 7,57 (д, J=8,0 Гц, 1H), 7,30-7,24 (м, 1H), 7,14 (т, J=7,3 Гц, 1H), 6,68 (с, 1H), 4,41 (с, 1H), 3,58 (с, 3H), 2,65 (с, 3H), 1,24 (с, 4H).	391	98%
4-4		¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,82 (с, 1H), 11,36 (с, 1H), 8,90 (с, 1H), 7,95 (д, J=7,8 Гц, 1H), 7,57 (с, 3H), 7,46 (с, 1H), 7,07 (д, J=8,5 Гц, 1H), 6,53 (с, 1H), 4,39 (с, 1H), 2,62 (с, 3H), 1,24 (с, 2H), 1,09 (д, J=18,8 Гц, 2H).	377	87%

4-5		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,71 (с, 1H), 11,55 (с, 1H), 8,92 (с, 1H), 8,00 (д, $J=9,0$ Гц, 1H), 7,30 (д, $J=8,4$ Гц, 1H), 7,09 (т, $J=7,4$ Гц, 1H), 6,87 (д, $J=6,9$ Гц, 1H), 6,75 (с, 1H), 4,42 (с, 1H), 2,79 (с, 3H), 2,09 (с, 3H), 1,28 (д, $J=6,0$ Гц, 2H), 1,07 (с, 2H).	391	90%
4-6		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,71 (с, 1H), 11,43 (с, 1H), 8,91 (с, 1H), 7,99 (д, $J=8,7$ Гц, 1H), 7,37 (д, $J=8,6$ Гц, 1H), 7,13 (с, 1H), 6,84 (д, $J=8,7$ Гц, 1H), 6,63 (с, 1H), 4,41 (с, 1H), 3,78 (с, 4H), 2,77 (с, 3H), 1,26 (д, $J=5,7$ Гц, 2H), 1,07 (с, 2H).	407	92,3%
4-9		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,65 (с, 1H), 12,23 (д, $J=30,1$ Гц, 1H), 8,93 (с, 1H), 8,20 (д, $J=11,8$ Гц, 1H), 7,65 (с, 1H), 7,53 (с, 2H), 6,87 (д, $J=26,1$ Гц, 1H), 4,38 (д, $J=31,7$ Гц, 1H), 2,74 (д, $J=19,6$ Гц, 3H), 1,24 (д, $J=8,9$ Гц, 2H), 1,07 (с, 2H).	402	92,8%
4-10		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,67 (с, 1H), 11,70 (с, 1H), 8,92 (с, 1H), 8,00 (д, $J=8,9$ Гц, 1H), 7,52-7,44 (м, 1H), 7,41 (д, $J=9,8$ Гц, 1H), 7,04 (т, $J=9,3$ Гц, 1H), 6,72 (с, 1H), 4,42 (с, 1H), 2,77 (с, 3H), 1,26 (д, $J=6,4$ Гц, 2H), 1,07 (с, 2H).	395	89,7%
4-11		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,68 (с, 1H), 11,98 (с, 1H), 8,93 (с, 1H), 8,02 (д, $J=9,1$ Гц, 1H), 7,47 (д, $J=7,3$ Гц, 1H), 7,19 (кв, $J=7,8$ Гц, 2H), 6,76 (с, 1H), 4,42 (с, 1H), 2,78 (с, 3H), 1,27 (д, $J=6,2$ Гц, 2H), 1,08 (с, 2H).	411	97%
4-12		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,64 (с, 1H), 12,30 (с, 1H), 8,93 (с, 1H), 8,04 (д, $J=8,3$ Гц, 1H), 7,86 (д, $J=6,8$ Гц, 1H), 7,64 (с, 1H), 7,36 (с, 1H), 6,91 (с, 1H), 4,43 (с, 1H), 2,78 (с, 3H), 1,28 (с, 2H), 1,09 (с, 2H).	402	99%
4-13		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,66 (с, 1H), 11,93 (с, 1H), 8,92 (с, 1H), 8,01 (д, $J=9,1$ Гц, 1H), 7,33 (д, $J=8,3$ Гц, 1H), 7,17 (д, $J=6,5$ Гц, 1H), 6,87 (т, $J=8,9$ Гц, 1H), 6,80 (с, 1H), 4,42 (с, 1H), 2,78 (с, 3H), 1,27 (д, $J=6,4$ Гц, 2H), 1,07 (с, 2H).	395	87%
4-14		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,70 (с, 1H), 11,43 (с, 1H), 8,92 (с, 1H), 8,00 (д, $J=8,8$ Гц, 1H), 7,46 (с, 1H), 6,98 (с, 2H), 6,67 (с, 1H), 4,42 (с, 1H), 2,77 (с, 3H), 1,26 (д, $J=6,3$ Гц, 2H), 1,09 (с, 2H).	391	92,7%
4-15		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 11,07 (с, 1H), 9,02 (с, 1H), 8,04 (с, 1H), 7,55 (с, 2H), 7,29 (с, 1H), 6,96 (с, 1H), 6,67 (с, 1H), 2,85 (с, 3H), 2,47 (с, 3H), 1,34 (с, 2H), 1,09 (с, 2H).	391	99%
4-16		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,64 (с, 1H), 12,41 (с, 1H), 8,93 (с, 1H), 8,69 (с, 1H), 8,07 (д, $J=13,8$ Гц, 2H), 7,67 (с, 1H), 7,05 (с, 1H), 4,42 (с, 1H), 2,78 (с, 3H), 1,26 (с, 2H), 1,08 (с, 2H).	422	100%
4-17		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,70 (с, 1H), 11,70 (с, 1H), 8,92 (с, 1H), 8,00 (д, $J=9,0$ Гц, 1H), 7,65 (с, 1H), 7,24 (д, $J=10,1$ Гц, 1H), 6,96 (т, $J=9,1$ Гц, 1H), 6,76 (с, 1H), 4,42 (с, 1H), 2,77 (с, 3H), 1,26 (д, $J=5,7$ Гц, 2H), 1,07 (с, 2H).	395	88%
4-18		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,68 (с, 1H), 12,08 (с, 1H), 8,92 (с, 1H), 8,01 (д, $J=8,9$ Гц, 1H), 7,47 (д, $J=6,4$ Гц, 1H), 7,04 (д, $J=9,3$ Гц, 2H), 6,79 (с, 1H), 4,42 (с, 1H), 2,76 (с, 3H), 1,26 (д, $J=6,2$ Гц, 2H), 1,08 (с, 2H).	395	89,1%
4-19		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,65 (с, 1H), 12,66 (с, 1H), 11,98 (с, 1H), 8,93 (с, 1H), 8,12 (с, 1H), 8,03 (д, $J=8,8$ Гц, 1H), 7,70 (кв, $J=8,2$ Гц, 2H), 6,83 (с, 1H), 4,43 (с, 1H), 2,78 (с, 3H), 1,27 (д, $J=6,2$ Гц, 2H), 1,08 (с, 2H).	421	100%
4-20		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,68 (с, 1H), 11,78 (с, 1H), 8,92 (с, 1H), 8,01 (д, $J=9,0$ Гц, 1H), 7,66 (д, $J=8,6$ Гц, 1H), 7,51 (с, 1H), 7,10 (д, $J=8,4$ Гц, 1H), 6,77 (с, 1H), 4,42 (с, 1H), 2,77 (с, 3H), 1,26 (д, $J=6,1$ Гц, 2H), 1,07 (с, 2H).	411	90%

4-21		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,49 (с, 1H), 12,71 (с, 1H), 8,92 (с, 1H), 8,15 (с, 1H), 8,04 (д, $J=9,4$ Гц, 2H), 7,43 (с, 1H), 7,29 (с, 1H), 4,42 (с, 1H), 2,79 (с, 3H), 1,27 (с, 2H), 1,08 (с, 2H).	422	97%
4-22		^1H ЯМР (400 МГц, MeOD) δ 8,96 (с, 1H), 7,93 (д, $J=9,1$ Гц, 1H), 7,55 (д, $J=12,6$ Гц, 2H), 7,47 (с, 1H), 7,34 (д, $J=8,1$ Гц, 1H), 6,77 (с, 1H), 6,57 (д, $J=7,9$ Гц, 1H), 6,51 (с, 1H), 4,29 (с, 1H), 2,78 (с, 3H), 1,38-1,24 (м, 2H), 1,20 (с, 2H).	393	90%
4-23		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,68 (с, 1H), 11,82 (с, 1H), 8,92 (с, 1H), 8,01 (д, $J=8,5$ Гц, 1H), 7,70 (с, 1H), 7,50 (д, $J=8,3$ Гц, 1H), 7,19 (д, $J=9,4$ Гц, 1H), 6,73 (с, 1H), 4,42 (с, 1H), 2,76 (с, 3H), 1,26 (д, $J=6,1$ Гц, 2H), 1,07 (с, 2H).	411	90%
4-24		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,63 (с, 1H), 11,61 (с, 1H), 8,95 (д, $J=9,5$ Гц, 1H), 8,41 (с, 1H), 7,99 (с, 1H), 7,67 (д, $J=9,1$ Гц, 1H), 6,52 (с, 1H), 4,43 (с, 1H), 2,78 (с, 3H), 1,25 (с, 2H), 1,08 (с, 2H).	422	90%
4-25		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,82 (с, 1H), 11,31 (с, 1H), 8,91 (с, 1H), 7,97 (д, $J=8,4$ Гц, 1H), 7,71 (д, $J=7,8$ Гц, 1H), 7,48 (с, 1H), 7,41 (с, 1H), 6,99 (д, $J=7,9$ Гц, 1H), 6,53 (с, 1H), 4,40 (с, 1H), 2,63 (с, 3H), 1,24 (с, 2H), 1,08 (с, 2H).	377	100%
4-26		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,70 (с, 1H), 12,37 (с, 1H), 8,93 (с, 1H), 8,19 (т, $J=9,0$ Гц, 2H), 8,01 (д, $J=8,0$ Гц, 1H), 7,34 (с, 1H), 7,00 (с, 1H), 4,43 (с, 1H), 2,75 (с, 3H), 1,24 (с, 2H), 1,11 (с, 2H).	422	99%
4-27		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,73 (с, 1H), 11,45 (с, 1H), 9,17 (с, 1H), 8,92 (с, 1H), 7,99 (д, $J=8,6$ Гц, 1H), 7,77 (с, 1H), 7,35 (д, $J=8,5$ Гц, 1H), 7,24 (с, 1H), 6,64 (с, 1H), 4,42 (с, 1H), 2,77 (с, 2H), 1,46 (д, $J=29,9$ Гц, 9H), 1,25 (с, 2H), 1,06 (с, 2H).	492	100%
4-28		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,67 (с, 1H), 11,94 (с, 1H), 9,97 (с, 2H), 8,93 (с, 1H), 8,02 (д, $J=8,7$ Гц, 1H), 7,65 (с, 1H), 7,60 (д, $J=8,6$ Гц, 1H), 7,19-7,13 (м, 1H), 6,84 (с, 1H), 4,42 (с, 2H), 2,76 (с, 3H), 1,14-1,00 (м, 4H).	392	94%
4-29		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,67 (с, 1H), 11,94 (с, 1H), 9,97 (с, 2H), 8,93 (с, 1H), 8,02 (д, $J=8,7$ Гц, 1H), 7,65 (с, 1H), 7,60 (д, $J=8,6$ Гц, 1H), 7,19-7,13 (м, 1H), 6,84 (с, 1H), 4,42 (с, 2H), 2,76 (с, 3H), 1,14-1,00 (м, 4H).	391	100%
4-30		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,73 (с, 1H), 11,38 (с, 1H), 9,33 (с, 1H), 8,91 (с, 1H), 7,98 (д, $J=9,1$ Гц, 1H), 7,81 (с, 1H), 7,48 (д, $J=8,3$ Гц, 1H), 7,09 (д, $J=8,7$ Гц, 1H), 6,64 (с, 1H), 4,42 (с, 1H), 2,78 (с, 3H), 1,51 (с, 10H), 1,25 (д, $J=8,9$ Гц, 2H), 1,08 (дд, $J=14,0$, 6,3 Гц, 2H).	492	97%
4-31		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,31 (с, 1H), 11,68 (с, 1H), 8,94 (с, 1H), 8,17 (д, $J=8,7$ Гц, 1H), 7,66 (д, $J=7,8$ Гц, 1H), 7,49 (д, $J=8,1$ Гц, 1H), 7,21 (т, $J=7,5$ Гц, 1H), 7,08 (т, $J=7,4$ Гц, 1H), 6,80 (с, 1H), 4,44 (с, 1H), 1,25 (д, $J=6,4$ Гц, 2H), 1,12 (с, 2H).	397	100%
4-32		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,72 (с, 1H), 11,74 (с, 1H), 9,35 (с, 2H), 8,92 (с, 1H), 8,00 (д, $J=9,0$ Гц, 1H), 7,66 (д, $J=8,5$ Гц, 1H), 7,34 (с, 1H), 6,94 (д, $J=8,3$ Гц, 1H), 6,76 (с, 1H), 4,42 (с, 1H), 2,78 (с, 3H), 1,27 (д, $J=5,6$ Гц, 3H), 1,06 (с, 2H).	392	97%
4-33		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,73 (с, 1H), 11,56 (с, 1H), 9,17 (с, 1H), 8,93 (с, 1H), 8,00 (д, $J=7,7$ Гц, 1H), 7,46 (с, 2H), 7,12 (д, $J=20,9$ Гц, 2H), 5,18-4,56 (м, 1H), 4,44 (с, 1H), 2,80 (с, 3H), 1,24 (с, 2H), 1,07 (с, 2H).	492	91%

4-34		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,70 (с, 1H), 11,77 (с, 1H), 8,93 (с, 1H), 8,01 (д, $J=8,4$ Гц, 1H), 7,23-7,03 (м, 2H), 6,88 (с, 1H), 6,76 (д, $J=6,4$ Гц, 1H), 4,43 (м, 1H), 2,77 (с, 3H), 1,24 (д, $J=6,6$ Гц, 2H), 1,12 (с, 2H).	392	99%
4-35		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,28 (с, 1H), 11,79 (с, 1H), 8,94 (с, 1H), 8,17 (д, $J=8,8$ Гц, 1H), 7,56-7,38 (м, 2H), 7,06 (т, $J=8,8$ Гц, 1H), 6,79 (с, 1H), 4,44 (с, 1H), 1,24 (д, $J=6,6$ Гц, 2H), 1,12 (с, 2H).	415	91%
4-36		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,28 (с, 1H), 12,16 (с, 1H), 8,95 (с, 1H), 8,18 (д, $J=8,0$ Гц, 1H), 7,49 (д, $J=4,2$ Гц, 1H), 7,05 (д, $J=8,5$ Гц, 2H), 6,85 (с, 1H), 4,43 (с, 1H), 1,24 (с, 2H), 1,13 (с, 2H).	415	95%
4-37		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,26 (с, 1H), 12,07 (с, 1H), 8,95 (с, 1H), 8,19 (д, $J=8,5$ Гц, 1H), 7,49 (д, $J=7,6$ Гц, 1H), 7,29-7,07 (м, 2H), 6,81 (с, 1H), 4,44 (с, 1H), 1,25 (с, 2H), 1,13 (с, 2H).	431	95%
4-38		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,28 (с, 1H), 12,04 (с, 1H), 8,95 (с, 1H), 8,19 (д, $J=8,7$ Гц, 1H), 7,34 (д, $J=8,0$ Гц, 1H), 7,20 (с, 1H), 6,93-6,81 (м, 2H), 4,44 (с, 1H), 1,24 (с, 2H), 1,13 (с, 2H).	415	87%
4-39		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,71 (с, 1H), 11,66 (с, 1H), 10,06 (с, 1H), 8,92 (с, 1H), 8,02 (с, 3H), 7,46 (с, 1H), 7,31 (с, 1H), 7,19 (с, 1H), 7,06 (с, 1H), 6,90 (с, 1H), 4,42 (с, 1H), 3,85 (с, 3H), 2,79 (с, 3H), 1,26 (с, 2H), 1,07 (с, 2H).	526	95,6%
4-40		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,71 (с, 1H), 11,62 (с, 1H), 10,05 (с, 1H), 8,93 (с, 1H), 7,99 (д, $J=9,2$ Гц, 1H), 7,70 (д, $J=7,5$ Гц, 2H), 7,28-6,87 (м, 6H), 4,42 (с, 1H), 3,75 (с, 3H), 2,68 (с, 3H), 1,25 (д, $J=9,3$ Гц, 2H), 1,05 (д, $J=18,8$ Гц, 2H).	562	96%
4-41		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,73 (с, 1H), 11,66 (с, 1H), 9,62 (с, 1H), 8,93 (с, 1H), 8,02 (д, $J=8,7$ Гц, 1H), 7,72 (с, 1H), 7,21 (с, 1H), 7,12 (с, 1H), 7,04 (с, 1H), 4,44 (с, 1H), 3,05 (с, 1H), 2,82 (д, $J=25,3$ Гц, 3H), 1,12 (д, $J=24,4$ Гц, 10H).	462	87%
4-42		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 11,87 (с, 1H), 9,18 (с, 1H), 8,08-7,63 (м, 2H), 7,48 (с, 2H), 7,20 (с, 2H), 6,95 (с, 2H), 4,54 (с, 1H), 4,24 (с, 2H), 2,81 (с, 3H), 1,29 (с, 2H), 1,06 (с, 2H).	406	97%
4-43		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,78 (с, 1H), 11,70 (с, 1H), 8,98 (с, 1H), 8,06 (д, $J=9,0$ Гц, 1H), 7,49 (с, 1H), 7,43 (д, $J=7,4$ Гц, 1H), 7,20 (с, 1H), 7,00 (д, $J=6,8$ Гц, 1H), 6,91 (с, 1H), 4,49 (с, 3H), 2,84 (с, 3H), 1,46 (с, 9H), 1,30 (с, 2H), 1,13 (с, 2H).	506	98%
4-44		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,76 (с, 1H), 12,92 (с, 1H), 8,92 (с, 1H), 8,79 (с, 1H), 8,07 (с, 1H), 7,99 (д, $J=8,6$ Гц, 1H), 7,77 (д, $J=8,3$ Гц, 1H), 7,37 (д, $J=8,0$ Гц, 1H), 4,40 (с, 1H), 2,62 (с, 3H), 1,25 (д, $J=5,7$ Гц, 2H), 1,10 (с, 2H).	422	100%
4-45		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 11,65 (с, 1H), 9,57 (с, 1H), 8,82 (с, 1H), 7,93 (д, $J=8,3$ Гц, 1H), 7,71 (д, $J=5,5$ Гц, 1H), 7,19 (с, 1H), 7,09 (с, 1H), 7,00 (с, 1H), 4,32 (с, 1H), 2,72 (д, $J=18,9$ Гц, 3H), 1,89-1,77 (м, 5H), 1,65 (с, 1H), 1,45 (д, $J=10,5$ Гц, 2H), 1,35-1,16 (м, 6H), 0,97 (с, 2H).	502	89%
4-46		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,69 (с, 1H), 11,94 (с, 1H), 9,39 (с, 1H), 8,92 (с, 1H), 8,00 (д, $J=7,8$ Гц, 1H), 7,72 (с, 1H), 7,28 (с, 1H), 7,15 (с, 1H), 6,81 (с, 1H), 4,43 (с, 1H), 4,27-4,13 (м, 2H), 2,79 (с, 3H), 2,33 (с, 1H), 2,17 (с, 1H), 1,59 (д, $J=14,2$ Гц, 2H), 1,26 (с, 5H), 1,07 (с, 2H), 0,85 (дд, $J=54,3, 14,6$ Гц, 14H).	588	86,3%

4-47		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,73 (с, 1H), 11,74 (с, 1H), 10,60 (с, 1H), 9,30 (с, 1H), 8,92 (с, 1H), 8,61 (д, $J=7,6$ Гц, 1H), 8,11 (д, $J=7,9$ Гц, 1H), 8,01 (д, $J=8,8$ Гц, 1H), 7,59 (д, $J=6,7$ Гц, 1H), 7,37 (д, $J=7,8$ Гц, 1H), 7,24 (д, $J=8,0$ Гц, 1H), 6,97 (с, 1H), 4,43 (с, 1H), 2,79 (с, 3H), 1,25 (с, 2H), 1,07 (с, 2H).	565	96%
4-48		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,70 (с, 1H), 11,74 (с, 1H), 9,76 (с, 1H), 8,93 (с, 1H), 8,01 (д, $J=8,7$ Гц, 1H), 7,29 (д, $J=6,6$ Гц, 1H), 7,23-7,01 (м, 3H), 4,43 (с, 1H), 3,49 (д, $J=14,6$ Гц, 1H), 3,06 (д, $J=14,8$ Гц, 1H), 2,37 (дд, $J=27,4$, 15,5 Гц, 2H), 2,04 (с, 1H), 1,91 (д, $J=17,7$ Гц, 2H), 1,51 (д, $J=11,3$ Гц, 1H), 1,41 (д, $J=10,3$ Гц, 1H), 1,25 (с, 2H), 1,09 (д, $J=11,8$ Гц, 3H), 0,98 (с, 2H), 0,77 (д, $J=22,2$ Гц, 3H).	606	88%
4-49		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,69 (с, 1H), 11,58 (с, 1H), 10,29 (с, 1H), 8,91 (с, 1H), 8,40 (с, 1H), 8,05 (дд, $J=15,6$, 8,6 Гц, 2H), 7,97 (с, 2H), 7,83 (д, $J=8,2$ Гц, 1H), 7,72-7,56 (м, 2H), 7,18 (д, $J=8,0$ Гц, 1H), 7,04 (т, $J=8,0$ Гц, 1H), 6,98 (д, $J=7,5$ Гц, 1H), 6,81 (с, 1H), 4,35 (с, 1H), 2,54 (с, 3H), 1,23 (с, 2H), 1,04 (с, 2H).	582	100%
4-50		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,72 (с, 1H), 11,68 (с, 1H), 10,26 (с, 1H), 8,92 (с, 1H), 8,00 (с, 1H), 7,74 (с, 1H), 7,29 (с, 1H), 7,19 (с, 1H), 7,03 (с, 1H), 6,93 (с, 2H), 4,43 (с, 1H), 2,79 (с, 3H), 2,31 (с, 6H), 2,10 (с, 3H), 1,24 (с, 2H), 1,07 (с, 2H).	538	90%
4-51		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,73 (с, 1H), 11,62 (с, 1H), 10,08 (с, 1H), 8,93 (с, 1H), 8,00 (д, $J=7,6$ Гц, 1H), 7,76 (д, $J=8,6$ Гц, 2H), 7,18 (д, $J=7,7$ Гц, 2H), 7,02 (д, $J=18,7$ Гц, 2H), 4,44 (с, 1H), 3,63 (с, 3H), 2,76 (с, 3H), 1,24 (с, 2H), 1,08 (с, 2H).	536	99%
4-52		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,72 (с, 1H), 11,68 (с, 1H), 9,29 (с, 1H), 8,93 (с, 1H), 8,81 (с, 1H), 8,31 (с, 1H), 8,03 (д, $J=8,9$ Гц, 1H), 7,15 (с, 2H), 7,02 (дд, $J=24,0$, 8,3 Гц, 2H), 6,94 (с, 1H), 4,44 (с, 1H), 3,91 (с, 3H), 2,80 (с, 3H), 1,25 (д, $J=15,5$ Гц, 2H), 1,08 (с, 2H).	575	96%
4-53		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,71 (с, 1H), 11,72 (с, 1H), 10,04 (с, 1H), 8,94 (с, 1H), 8,02 (д, $J=10,3$ Гц, 1H), 7,71 (д, $J=7,0$ Гц, 1H), 7,24 (с, 1H), 7,15 (д, $J=7,3$ Гц, 1H), 7,04 (с, 1H), 4,44 (с, 1H), 3,98 (с, 2H), 3,76 (с, 2H), 3,43 (с, 2H), 3,07 (д, $J=24,3$ Гц, 4H), 2,78 (с, 3H), 2,69 (д, $J=10,9$ Гц, 1H), 1,26 (с, 2H), 1,08 (с, 2H).	533	99%
4-54		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,71 (с, 1H), 11,72 (с, 1H), 10,03 (с, 1H), 8,94 (с, 1H), 8,02 (д, $J=8,9$ Гц, 1H), 7,70 (с, 1H), 7,24 (с, 1H), 7,14 (с, 1H), 7,03 (с, 1H), 5,33 (с, 1H), 4,43 (с, 1H), 4,03 (с, 2H), 3,03 (с, 4H), 2,78 (с, 3H), 2,00 (д, $J=7,6$ Гц, 2H), 1,24 (с, 9H), 1,08 (с, 2H), 0,85 (с, 2H).	632	96%
4-55		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,71 (с, 1H), 11,72 (с, 1H), 10,04 (с, 1H), 9,57 (с, 1H), 8,94 (с, 1H), 8,02 (д, $J=8,9$ Гц, 1H), 7,71 (д, $J=7,8$ Гц, 1H), 7,26 (д, $J=7,6$ Гц, 1H), 7,15 (д, $J=9,1$ Гц, 1H), 7,03 (д, $J=9,6$ Гц, 1H), 4,44 (с, 1H), 2,99 (с, 1H), 2,82 (с, 3H), 2,78 (с, 2H), 2,54 (с, 2H), 1,26 (с, 2H), 1,08 (с, 2H).	491	91%
4-56		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,71 (с, 1H), 11,87 (с, 1H), 10,45 (с, 1H), 8,93 (с, 1H), 8,02 (д, $J=8,8$ Гц, 1H), 7,47 (д, $J=7,2$ Гц, 1H), 7,23 (с, 1H), 7,07 (д, $J=7,9$ Гц, 1H), 6,68 (с, 1H), 4,42 (с, 1H), 2,78 (с, 3H), 2,68 (с, 3H), 1,26 (с, 2H), 1,08 (с, 2H).	490	96%

4-57		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,78 (с, 1Н), 11,75 (с, 1Н), 9,64 (с, 1Н), 8,92 (с, 1Н), 7,99 (д, $J=8,7$ Гц, 1Н), 7,83 (с, 1Н), 7,70 (с, 1Н), 7,63 (д, $J=7,8$ Гц, 1Н), 7,18 (д, $J=8,6$ Гц, 1Н), 4,48 (с, 2Н), 4,40 (с, 1Н), 2,72 (д, $J=27,2$ Гц, 7Н), 2,62 (с, 3Н), 1,25 (с, 2Н), 1,08 (с, 2Н).	M-(Me) ₂ N 389	100%
4-58		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,79 (с, 1Н), 9,84 (с, 1Н), 8,92 (с, 1Н), 7,97 (д, $J=8,2$ Гц, 1Н), 7,77 (д, $J=8,7$ Гц, 1Н), 7,62 (с, 1Н), 7,56 (с, 1Н), 7,20 (д, $J=8,0$ Гц, 1Н), 6,63 (с, 1Н), 4,64 (с, 2Н), 4,39 (с, 1Н), 3,57 (с, 2Н), 2,88 (с, 6Н), 2,65 (д, $J=22,8$ Гц, 3Н), 1,24 (с, 2Н), 1,08 (с, 2Н).	448	100%
4-59		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,76 (с, 1Н), 11,62 (с, 1Н), 9,68 (с, 1Н), 8,92 (с, 1Н), 7,99 (с, 1Н), 6,95 (с, 2Н), 6,77 (с, 1Н), 6,46 (с, 1Н), 4,43 (с, 1Н), 2,80 (с, 3Н), 1,27 (с, 2Н), 1,07 (с, 4Н).	393	99%
4-60		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,77 (с, 1Н), 11,29 (с, 1Н), 8,91 (с, 1Н), 7,97 (д, $J=9,0$ Гц, 1Н), 7,13 (с, 1Н), 6,97 (с, 1Н), 6,61 (с, 1Н), 4,42 (с, 1Н), 3,80 (д, $J=13,7$ Гц, 7Н), 2,78 (с, 3Н), 1,26 (с, 2Н), 1,06 (с, 2Н).	437	99%
4-61		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,74 (с, 1Н), 11,29 (с, 1Н), 8,91 (с, 1Н), 8,81 (с, 1Н), 7,98 (д, $J=9,1$ Гц, 1Н), 7,27 (д, $J=8,8$ Гц, 1Н), 6,93 (с, 1Н), 6,71 (д, $J=8,4$ Гц, 1Н), 6,53 (с, 1Н), 4,41 (с, 2Н), 2,77 (с, 3Н), 1,25 (с, 2Н), 1,06 (с, 2Н).	393	98%
4-62		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,75 (с, 1Н), 11,50 (с, 1Н), 9,79 (с, 1Н), 8,91 (с, 1Н), 7,97 (д, $J=8,7$ Гц, 1Н), 7,07 (д, $J=6,7$ Гц, 1Н), 6,86 (с, 1Н), 6,60 (с, 2Н), 4,41 (с, 1Н), 2,76 (с, 3Н), 1,23 (с, 2Н), 1,08 (с, 2Н).	393	100%
4-63		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 12,18 (с, 1Н), 10,24 (с, 1Н), 8,93 (с, 1Н), 8,04 (д, $J=8,8$ Гц, 1Н), 7,87 (д, $J=8,8$ Гц, 2Н), 7,78 (д, $J=7,0$ Гц, 1Н), 7,46 (д, $J=7,3$ Гц, 2Н), 7,35 (с, 1Н), 4,43 (с, 1Н), 2,77 (с, 3Н), 1,27 (с, 2Н), 1,09 (с, 2Н).	405	85%
4-64		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,55 (с, 1Н), 13,88 (с, 1Н), 8,94 (с, 1Н), 8,10 (д, $J=8,4$ Гц, 1Н), 8,01 (дд, $J=14,5$, 7,6 Гц, 2Н), 7,62 (с, 1Н), 4,44 (с, 1Н), 2,71 (с, 3Н), 1,24 (с, 2Н), 1,08 (с, 2Н).	447	89%
4-65		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,44 (с, 1Н), 11,53 (с, 1Н), 8,84 (с, 1Н), 8,16 (д, $J=9,1$ Гц, 1Н), 7,95 (д, $J=7,2$ Гц, 1Н), 7,69 (д, $J=9,7$ Гц, 1Н), 7,58 (т, $J=10,6$ Гц, 1Н), 7,42 (д, $J=7,4$ Гц, 2Н), 7,16 (т, $J=7,5$ Гц, 1Н), 7,04 (т, $J=7,4$ Гц, 1Н), 6,62 (с, 1Н), 5,77 (с, 1Н), 1,77 (д, $J=17,9$ Гц, 3Н).	449	94,06%
4-66		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,79 (с, 1Н), 11,42 (с, 1Н), 8,70 (с, 1Н), 8,04 (д, $J=8,2$ Гц, 1Н), 7,57 (д, $J=8,2$ Гц, 1Н), 7,42 (д, $J=8,0$ Гц, 1Н), 7,25 (с, 1Н), 6,96 (д, $J=8,1$ Гц, 1Н), 6,86 (д, $J=7,7$ Гц, 1Н), 6,61 (с, 1Н), 4,23 (с, 1Н), 2,70 (с, 3Н), 1,06 (с, 2Н), 0,81 (с, 2Н).	359	91,2%
4-67		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 11,76 (с, 1Н), 8,71 (с, 1Н), 8,16 (д, $J=4,8$ Гц, 1Н), 7,81 (д, $J=8,8$ Гц, 1Н), 7,36 (с, 1Н), 5,94 (дд, $J=3,4$, 1,8 Гц, 1Н), 5,10 (с, 1Н), 4,22-4,08 (м, 1Н), 2,33 (с, 3Н), 1,09-0,88 (м, 4Н).	378	97%
4-68		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 12,33 (с, 1Н), 8,92 (с, 1Н), 8,35 (д, $J=4,4$ Гц, 1Н), 7,99 (д, $J=8,8$ Гц, 1Н), 7,87 (с, 1Н), 7,77 (д, $J=7,8$ Гц, 1Н), 7,21 (дд, $J=7,7$, 4,0 Гц, 1Н), 4,47-4,34 (м, 2Н), 2,69 (с, 3Н), 1,28 (д, $J=6,6$ Гц, 2Н), 1,10 (с, 2Н).	378	98%
4-69		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,94 (с, 1Н), 8,39 (т, $J=3,1$ Гц, 1Н), 8,08 (т, $J=9,0$ Гц, 2Н), 7,22 (дд, $J=8,1$, 4,1 Гц, 1Н), 6,74 (д, $J=2,9$ Гц, 1Н), 4,48-4,36 (м, 1Н), 2,67 (с, 3Н), 1,26 (д, $J=7,0$ Гц, 4Н), 1,09 (с, 4Н).	392	98%

4-70		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,94 (с, 1H), 8,39 (т, $J=3,1$ Гц, 1H), 8,07 (т, $J=9,0$ Гц, 1H), 7,21 (дт, $J=7,7, 3,7$ Гц, 1H), 6,74 (д, $J=2,9$ Гц, 1H), 4,50-4,32 (м, 1H), 2,67 (с, 3H), 1,33-1,19 (д, $J=7,0$ Гц, 2H), 1,09 (с, 2H).	392	96%
4-71		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,73 (с, 1H), 11,96 (с, 1H), 8,92 (с, 1H), 8,24 (с, 1H), 8,06 (с, 1H), 8,00 (д, $J=8,7$ Гц, 1H), 7,61 (т, $J=2,8$ Гц, 1H), 6,57 (с, 1H), 4,59-4,15 (дм, 1H), 2,64 (с, 3H), 1,26 (д, $J=6,8$ Гц, 2H), 1,09 (м, 2H).	378	98%
4-72		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,67 (с, 1H), 13,15 (с, 1H), 8,93 (с, 1H), 8,27 (д, $J=6,1$ Гц, 1H), 8,01 (д, $J=8,8$ Гц, 1H), 7,78 (д, $J=7,9$ Гц, 1H), 7,19 (т, $J=7,1$ Гц, 1H), 6,88 (с, 1H), 4,49-4,33 (м, 1H), 2,77 (с, 3H), 1,39-1,21 (д, $J=7,0$ Гц, 2H), 1,15-1,01 (м, 2H).	394	98%
4-73		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,63 (с, 1H), 12,94 (с, 1H), 8,93 (с, 1H), 8,72 (с, 1H), 8,65 (с, 1H), 8,04 (д, $J=8,7$ Гц, 1H), 6,93 (с, 1H), 4,53-4,29 (м, 1H), 2,77 (с, 3H), 1,32-1,19 (м, 3H), 1,17-0,95 (м, 2H).	403	92%
4-74		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,65 (с, 1H), 13,00 (с, 1H), 8,94 (с, 1H), 8,53 (с, 7H), 8,04 (д, $J=8$ Гц, 1H), 7,69 (д, $J=4,4, 2,4$ Гц, 1H), 7,01 (с, 6H), 4,58-4,31 (м, 1H), 2,78 (с, 3H), 1,27 (д, $J=6,6$ Гц, 15H), 1,18-1,01 (м, 16H).	403	92%
4-75		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,57 (с, 1H), 13,95 (с, 1H), 8,94 (с, 1H), 8,58 (с, 2H), 8,09 (д, $J=8,7$ Гц, 1H), 7,60-7,51 (м, 1H), 4,53-4,33 (м, 1H), 2,73 (с, 3H), 1,35-1,17 (м, 2H), 1,15-1,01 (м, 2H).	423	86%
4-76		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 13,25 (с, 1H), 8,99 (с, 1H), 8,36 (д, $J=5,9$ Гц, 1H), 8,07 (д, $J=8,7$ Гц, 1H), 7,95 (с, 1H), 7,52 (д, $J=8,0$ Гц, 1H), 7,28 (т, $J=6,8$ Гц, 1H), 4,54-4,44 (м, 1H), 2,76 (с, 3H), 1,34 (д, $J=6,8$ Гц, 2H), 1,26-1,06 (м, 2H).	394	98%
4-77		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 12,56 (с, 1H), 8,93 (с, 1H), 8,38 (т, $J=3,6$ Гц, 1H), 8,20 (д, $J=7,4$ Гц, 1H), 8,02 (д, $J=9,1$ Гц, 1H), 7,26 (дд, $J=8,0, 4,1$ Гц, 1H), 6,83 (с, 1H), 4,57-4,33 (м, 1H), 2,78 (с, 3H), 1,35-1,19 (д, $J=6,9$ Гц, 2H), 1,15-1,01 (с, 2H).	378	98%
4-78		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,65 (с, 1H), 12,47 (с, 1H), 11,98 (с, 1H), 8,91 (с, 1H), 7,95 (м, 2H), 6,76 (с, 1H), 4,51-4,36 (м, 1H), 2,78 (с, 3H), 1,26 (д, $J=6,9$ Гц, 2H), 1,17-1,01 (м, 2H).	395	95%
4-79		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,57 (с, 1H), 13,19 (д, $J=8,5$ Гц, 1H), 9,29 (д, $J=2,9$ Гц, 1H), 9,02 (д, $J=2,4$ Гц, 1H), 8,94 (с, 1H), 8,05 (д, $J=8,8$ Гц, 1H), 7,06 (с, 1H), 4,49-4,35 (м, 1H), 2,77 (с, 3H), 1,26 (д, $J=7,2$ Гц, 2H), 1,13-0,99 (с, 2H).	379	98%
4-80		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 15,167 (с, 1H), 14,59 (с, 1H), 13,80 (с, 1H), 9,32 (с, 1H), 8,96 (д, $J=2,3$ Гц, 1H), 8,40 (д, $J=6,1$ Гц, 1H), 8,25 (д, $J=6,0$ Гц, 1H), 8,10 (д, $J=8,4$ Гц, 1H), 7,27 (с, 1H), 4,51-4,39 (м, 1H), 2,76 (м, 3H), 1,29-1,17 (д, $J=7,0$ Гц, 2H), 1,17-0,97 (м, 2H).	378	85%
4-81		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,56 (с, 1H), 13,05 (с, 1H), 8,95 (с, 1H), 8,68 (с, 1H), 8,08 (д, $J=9,1$ Гц, 1H), 7,62 (с, 1H), 7,12 (с, 1H), 4,51-4,36 (м, 1H), 2,76 (с, 3H), 1,33-1,19 (д, $J=7,1$ Гц, 2H), 1,13-1,05 (с, 2H).	378	85%
4-82		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,88 (с, 1H), 14,57 (с, 1H), 13,46 (с, 1H), 9,41 (с, 1H), 8,96 (с, 1H), 8,52 (д, $J=6,5$ Гц, 1H), 8,21-7,93 (м, 2H), 7,38 (с, 1H), 4,53-4,29 (м, 1H), 2,77 (с, 3H), 1,35-1,17 (д, $J=6,7$ Гц, 2H), 1,19-1,03 (с, 2H).	378	98%
4-83			421	90%

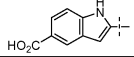
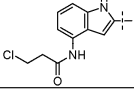
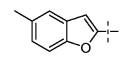
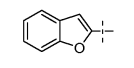
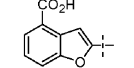
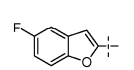
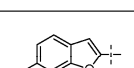
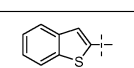
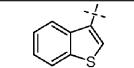
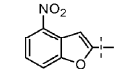
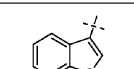
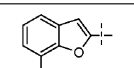
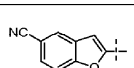
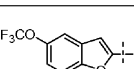
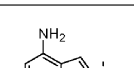
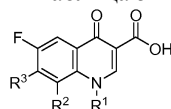
4-84			421	98%
4-85			482	93%
4-86		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,60 (с, 1H), 10,06 (с, 1H), 8,81 (с, 1H), 7,88 (д, $J=8,5$ Гц, 1H), 7,21 (с, 1H), 7,05 (д, $J=8,1$ Гц, 1H), 6,80 (д, $J=8,1$ Гц, 1H), 4,36 (м, 1H), 3,08 (с, 2H), 1,06 (м, 4H).	392	95%
4-87		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,57 (с, 1H), 8,91 (с, 1H), 8,03 (д, $J=9,3$ Гц, 1H), 7,80 (д, $J=7,7$ Гц, 1H), 7,73 (д, $J=8,3$ Гц, 1H), 7,56-7,22 (м, 3H), 4,57-4,32 (м, 1H), 2,84 (с, 3H), 1,27 (м, 2H), 1,06 (м, 2H).	378	98%
4-88		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,50 (с, 1H), 13,22 (с, 1H), 8,84 (с, 1H), 8,10-7,80 (м, 2H), 7,74-7,58 (с, 1H), 7,49 (с, 1H), 4,38 (м, 1H), 2,78 (с, 3H), 1,30-1,12 (м, 2H), 1,00 (м, 2H).	422	98%
4-89		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,56 (с, 1H), 8,93 (с, 1H), 8,02 (д, $J=9,2$ Гц, 1H), 7,76 (дд, $J=8,8$, 3,5 Гц, 1H), 7,61 (д, $J=8,6$ Гц, 1H), 7,41 (с, 1H), 7,28 (т, $J=9,3$ Гц, 1H), 4,43 (м, 1H), 2,82 (с, 3H), 1,26 (д, $J=6,4$ Гц, 3H), 1,05 (с, 2H).	396	98%
4-90		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,88 (с, 1H), 7,95 (д, $J=8,9$ Гц, 1H), 7,76 (с, 1H), 7,61 (д, $J=8,9$ Гц, 1H), 7,36 (с, 1H), 7,20 (т, $J=9,0$ Гц, 1H), 4,35 (м, 1H), 2,76 (с, 3H), 1,30-1,09 (м, 3H), 0,96 (с, 2H).	396	98%
4-91		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,57 (с, 1H), 8,86 (с, 1H), 7,96 (м, 3H), 7,59 (с, 1H), 7,41 (д, $J=5,1$ Гц, 2H), 4,35 (м, 1H), 2,72 (с, 3H), 1,17 (м, 2H), 1,00 (м, 2H).	394	96%
4-92		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,65 (с, 1H), 8,86 (с, 1H), 8,08 (д, $J=7,6$ Гц, 1H), 7,97 (м, 2H), 7,36 (м, 3H), 4,32 (м, 1H), 2,57 (с, 3H), 1,03 (м, 4H).	394	98%
4-93		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,51 (с, 1H), 8,92 (с, 1H), 8,32 (д, $J=8,1$ Гц, 1H), 8,28 (д, $J=8,0$ Гц, 1H), 8,05 (т, $J=13,1$ Гц, 1H), 7,90 (с, 1H), 7,70 (т, $J=8,2$ Гц, 1H), 4,45 (м, 1H), 2,86 (с, 3H), 1,26 (т, $J=11,6$ Гц, 2H), 1,10 (д, $J=21,6$ Гц, 2H).	423	98%
4-94		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,46 (с, 1H), 8,69 (с, 1H), 8,14 (с, 1H), 7,75 (д, $J=9,2$ Гц, 1H), 7,52 (дд, $J=8,8$, 3,5 Гц, 1H), 7,20-7,11 (м, 3H), 4,43 (с, 1H), 2,64 (с, 3H), 1,26 (д, $J=6,4$ Гц, 3H), 1,05 (с, 2H).	378	98%
4-95		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,55 (с, 1H), 8,94 (с, 1H), 8,05 (д, $J=9,3$ Гц, 1H), 7,64 (д, $J=2,9$ Гц, 1H), 7,54 (с, 1H), 7,36 (д, $J=6,6$ Гц, 2H), 4,44 (м, 1H), 2,85 (с, 3H), 1,34-1,19 (м, 2H), 1,06 (с, 2H).	396	96%
4-96		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,91 (с, 1H), 8,38 (с, 1H), 8,04 (д, $J=9,2$ Гц, 1H), 7,96 (д, $J=8,4$ Гц, 1H), 7,88 (д, $J=8,5$ Гц, 1H), 7,55 (с, 1H), 4,44 (м, 1H), 2,83 (с, 3H), 1,35-1,18 (м, 2H), 1,06 (м, 2H).	403	98%
4-97		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,56 (с, 1H), 8,94 (с, 1H), 8,04 (д, $J=9,1$ Гц, 1H), 7,95-7,77 (м, 2H), 7,53-7,33 (м, 2H), 4,45 (м, 1H), 2,83 (с, 3H), 1,27 (д, $J=6,3$ Гц, 2H), 1,05 (с, 2H).	462	98%
4-98		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,61 (с, 1H), 8,86 (с, 1H), 7,95 (д, $J=9,0$ Гц, 1H), 7,43 (с, 1H), 7,03 (т, $J=8,1$ Гц, 1H), 6,77 (д, $J=7,4$ Гц, 1H), 6,39 (д, $J=7,1$ Гц, 1H), 4,38 (м, 1H), 2,77 (с, 3H), 1,19 (м, 2H), 0,98 (м, 1H).	393	96%

Таблица 5



Соед. №	R ³	R ²	R ¹	ЯМР	МС (МН ⁺)	ВЭЖХ
5-1		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,72 (с, 1H), 10,91 (с, 1H), 8,89 (с, 1H), 7,94 (д, J=8,60 Гц, 1H), 7,13-6,90 (м, 3H), 4,67 (с, 2H), 4,38 (с, 1H), 2,62 (с, 3H), 1,23 (д, J=5,80 Гц, 2H), 1,04 (с, 2H).	409	97%
5-2		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,71 (с, 1H), 10,78 (с, 1H), 8,90 (с, 1H), 7,95 (д, J=8,72 Гц, 1H), 7,41 (с, 1H), 7,22 (д, J=8,03 Гц, 1H), 7,13 (д, J=8,17 Гц, 1H), 4,38 (с, 1H), 3,57 (с, 2H), 2,62 (с, 3H), 1,24 (д, J=6,14 Гц, 2H), 1,05 (с, 2H).	425	98%
5-3		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,70 (с, 1H), 10,64 (с, 1H), 8,98 (с, 1H), 8,05 (д, J=8,72 Гц, 1H), 7,90 (с, 1H), 7,62 (с, 1H), 4,92 (с, 2H), 4,46 (с, 1H), 2,71 (с, 3H), 1,30 (с, 3H), 1,15 (с, 2H).	454	97%
5-4		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,66 (с, 1H), 11,39 (с, 1H), 8,90 (с, 1H), 7,96 (д, J=8,72 Гц, 1H), 7,57 (с, 1H), 7,43 (с, 1H), 4,75 (с, 2H), 4,39 (с, 1H), 2,62 (с, 3H), 1,23 (д, J=5,26 Гц, 2H), 1,06 (с, 2H).	434	98%
5-5		OMe	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,72 (с, 1H), 10,94 (с, 1H), 8,80 (с, 1H), 7,90 (с, 1H), 7,11 (д, J=26,18 Гц, 2H), 4,67 (с, 2H), 1,15 (с, 4H).	425	98%
5-6		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,75 (с, 1H), 10,87 (с, 1H), 8,90 (с, 1H), 7,96 (д, J=8,58 Гц, 1H), 7,14 (д, J=8,35 Гц, 1H), 6,97 (д, J=8,15 Гц, 1H), 6,89 (с, 1H), 4,69 (с, 2H), 4,39 (с, 1H), 2,62 (с, 3H), 1,23 (с, 2H), 1,04 (с, 2H).	409	98%
5-9		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,74 (с, 1H), 10,28 (с, 1H), 8,90 (с, 1H), 7,94 (д, J=8,20 Гц, 1H), 7,23 (с, 1H), 7,17 (с, 1H), 7,03 (с, 1H), 4,38 (с, 2H), 2,97 (с, 2H), 2,63 (с, 2H), 1,23 (с, 2H), 1,04 (с, 2H).	407	85%
5-10		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,71 (с, 1H), 11,47 (с, 1H), 11,39 (с, 1H), 8,91 (с, 1H), 7,98 (д, J=8,50 Гц, 1H), 7,89 (с, 1H), 7,70 (д, J=8,10 Гц, 1H), 7,35 (д, J=8,11 Гц, 1H), 4,40 (с, 1H), 3,49 (д, J=87,04 Гц, 2H), 2,62 (с, 3H), 1,23 (с, 2H), 1,08 (с, 3H).	422	98%
5-11		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,67 (с, 1H), 11,96 (с, 1H), 11,63 (с, 1H), 8,92 (с, 1H), 8,69 (с, 1H), 8,34 (с, 1H), 8,00 (д, J=8,65 Гц, 1H), 4,41 (с, 1H), 2,61 (д, J=29,62 Гц, 3H), 1,24 (д, J=5,11 Гц, 2H), 1,09 (с, 2H).	423	99%
5-12		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,73 (с, 1H), 12,44-11,74 (м, 2H), 8,91 (с, 1H), 7,98 (д, J=8,01 Гц, 1H), 7,53-7,03 (м, 3H), 4,39 (с, 1H), 2,61 (с, 3H), 1,20 (д, J=26,27 Гц, 3H), 1,05 (с, 2H).	422	96%
5-13		Me	Циклопропил	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,83 (с, 1H), 8,88 (с, 1H), 7,90 (с, 2H), 6,70 (с, 3H), 4,27 (д, J=77,51 Гц, 4H), 2,60 (д, J=25,07 Гц, 3H), 1,23 (с, 2H), 1,02 (с, 2H).	395	98%

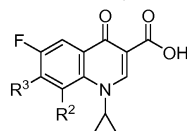
5-14		OMe	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,78 (с, 1H), 8,76 (с, 1H), 7,83 (д, $J=9,18$ Гц, 1H), 6,92-6,81 (м, 2H), 6,70 (д, $J=7,26$ Гц, 1H), 6,19 (д, $J=22,26$ Гц, 1H), 4,16 (с, 4H), 3,39 (с, 3H), 2,50 (с, 7H).	411	96%
5-15		8-N	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,55 (с, 1H), 8,61 (с, 1H), 8,19 (д, $J=11,38$ Гц, 1H), 7,55 (д, $J=8,31$ Гц, 1H), 7,47 (с, 1H), 6,68 (с, 1H), 6,54 (д, $J=8,26$ Гц, 1H), 4,00 (с, 2H), 3,73 (с, 1H), 1,15-0,91 (м, 5H).	382	94%
5-16		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,90 (с, 1H), 8,94 (с, 1H), 7,94 (д, $J=9,06$ Гц, 1H), 6,95 (д, $J=8,81$ Гц, 2H), 6,63 (д, $J=7,73$ Гц, 1H), 6,14 (с, 1H), 4,43 (с, 1H), 3,31 (с, 2H), 2,79 (с, 2H), 2,70 (с, 3H), 1,90 (с, 2H), 1,30 (с, 2H), 1,08 (с, 2H).	393	94%
5-17		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,71 (с, 1H), 8,89 (с, 1H), 8,60 (с, 1H), 7,94 (д, $J=8,81$ Гц, 1H), 7,67 (с, 1H), 7,10 (с, 1H), 4,38 (с, 1H), 4,27 (с, 2H), 3,63 (с, 2H), 2,66 (с, 3H), 1,24 (д, $J=5,67$ Гц, 2H), 1,07 (с, 2H).	440	97%
5-18		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 10,19 (с, 1H), 8,89 (с, 1H), 7,91 (д, $J=8,74$ Гц, 1H), 6,33 (с, 1H), 6,24 (с, 1H), 4,57 (с, 2H), 4,38 (с, 2H), 2,64 (с, 3H), 1,23 (д, $J=5,42$ Гц, 3H), 1,03 (с, 2H).	424	97%
5-19		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,88 (с, 1H), 7,91 (с, 1H), 6,29 (с, 1H), 6,18 (с, 1H), 4,37 (с, 2H), 4,18 (с, 3H), 3,10 (с, 2H), 2,65 (д, $J=16,81$ Гц, 6H), 1,23 (с, 3H), 1,03 (с, 2H).	424	97%
5-20		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,97 (с, 1H), 8,01 (д, $J=9,26$ Гц, 1H), 7,85-7,65 (м, 2H), 7,64-7,40 (м, 1H), 7,36 (с, 1H), 4,46 (с, 1H), 4,32 (с, 3H), 3,63 (с, 3H), 2,74 (с, 3H), 1,30 (д, $J=5,75$ Гц, 2H), 1,11 (с, 2H).	396	98%
5-21		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,72 (с, 1H), 8,85 (д, $J=23,76$ Гц, 1H), 7,87 (т, $J=19,93$ Гц, 1H), 7,17 (с, 1H), 6,99 (д, $J=9,29$ Гц, 2H), 4,37 (с, 1H), 4,20 (с, 2H), 3,59 (с, 1H), 3,44 (с, 2H), 2,63 (с, 3H), 1,24 (с, 2H), 1,07 (д, $J=23,80$ Гц, 2H).	420	95%
5-22		OMe	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,67 (с, 1H), 8,76 (с, 1H), 7,87 (д, $J=9,24$ Гц, 1H), 7,26 (д, $J=10,63$ Гц, 1H), 7,11 (с, 1H), 7,04 (с, 1H), 4,20 (с, 3H), 2,00 (дд, $J=7,56, 15,22$ Гц, 1H), 1,21 (д, $J=14,05$ Гц, 4H).	436	98%
5-24		OMe	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,77 (с, 1H), 7,87 (д, $J=9,25$ Гц, 1H), 7,75 (с, 1H), 7,20 (с, 1H), 7,14 (с, 1H), 4,17 (с, 3H), 3,47 (с, 3H), 1,32-1,05 (м, 8H).	412	96%
5-25		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,82 (с, 1H), 10,92 (с, 1H), 10,86 (с, 1H), 8,96 (с, 1H), 7,98 (т, $J=12,31$ Гц, 1H), 7,15 (д, $J=7,60$ Гц, 1H), 7,00 (д, $J=8,89$ Гц, 2H), 4,44 (с, 1H), 2,67 (с, 3H), 1,28 (с, 2H), 1,12 (с, 2H).	394	98%
5-26		OMe	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,63 (с, 1H), 10,94 (с, 1H), 10,87 (с, 1H), 8,86 (с, 1H), 7,97 (д, $J=8,82$ Гц, 1H), 7,17 (д, $J=7,41$ Гц, 3H), 4,29 (с, 1H), 1,23 (с, 4H).	410	98%

5-27		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,95 (с, 1H), 7,96 (д, $J=8,75$ Гц, 1H), 6,96 (д, $J=10,17$ Гц, 1H), 6,92 (д, $J=8,04$ Гц, 1H), 6,72 (д, $J=7,83$ Гц, 1H), 4,44 (с, 1H), 3,63 (с, 2H), 3,09 (с, 2H), 2,70 (с, 3H), 1,30 (д, $J=5,29$ Гц, 2H), 1,10 (с, 2H).	411	98%
5-28		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,74 (с, 1H), 8,89 (с, 1H), 7,94 (д, $J=8,48$ Гц, 1H), 7,53 (с, 1H), 7,44 (с, 1H), 7,33 (д, $J=8,57$ Гц, 1H), 6,94 (д, $J=8,45$ Гц, 1H), 4,39 (с, 1H), 3,80 (с, 2H), 3,48 (с, 2H), 2,64 (с, 3H), 1,23 (с, 2H), 1,06 (с, 2H).	443	98%
5-29		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,67 (с, 1H), 10,84 (с, 1H), 8,83 (с, 1H), 7,86 (д, $J=8,65$ Гц, 1H), 6,52 (с, 2H), 4,38 (с, 2H), 4,31 (с, 1H), 3,89 (с, 2H), 2,54 (с, 3H), 1,16 (с, 2H), 1,00 (с, 2H).	436	98%
5-30		OMe	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,71 (с, 1H), 10,91 (с, 1H), 8,79 (с, 1H), 7,88 (д, $J=9,15$ Гц, 1H), 6,75 (д, $J=14,51$ Гц, 2H), 4,45 (т, $J=4,51$ Гц, 2H), 4,27-4,16 (м, 1H), 3,96 (т, $J=4,53$ Гц, 2H), 1,17 (д, $J=7,20$ Гц, 4H).	452	99%
5-31		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,94 (с, 1H), 7,95 (д, $J=8,62$ Гц, 1H), 6,79 (дд, $J=7,23, 14,68$ Гц, 3H), 4,43 (с, 1H), 4,23 (д, $J=10,57$ Гц, 1H), 4,06 (д, $J=10,42$ Гц, 1H), 3,60-3,41 (м, 3H), 2,70 (с, 3H), 1,30 (д, $J=5,98$ Гц, 2H), 1,09 (с, 2H).	425	99%
5-32		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,95 (с, 1H), 7,98 (д, $J=8,04$ Гц, 1H), 7,09 (с, 1H), 6,96 (с, 2H), 4,44 (с, 1H), 4,15 (с, 2H), 3,29 (с, 3H), 2,69 (с, 3H), 2,02 (с, 2H), 1,30 (с, 2H), 1,10 (с, 2H).	409	99%
5-33		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,76 (с, 1H), 7,77 (д, $J=8,81$ Гц, 1H), 6,59 (с, 3H), 4,25 (с, 1H), 4,04 (с, 2H), 3,27 (д, $J=11,94$ Гц, 1H), 2,96-2,79 (м, 1H), 2,52 (с, 3H), 1,18 (т, $J=8,54$ Гц, 3H), 1,12 (д, $J=5,48$ Гц, 2H), 0,91 (с, 2H).	409	98%
5-34		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,71 (с, 1H), 7,72 (д, $J=8,62$ Гц, 1H), 6,54 (с, 3H), 4,20 (с, 2H), 4,03 (д, $J=10,38$ Гц, 2H), 3,52 (т, $J=8,97$ Гц, 1H), 3,31 (с, 1H), 2,46 (с, 3H), 1,07 (д, $J=5,70$ Гц, 2H), 0,96 (д, $J=4,88$ Гц, 3H), 0,86 (с, 2H).	409	98%
5-35		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 10,57 (с, 1H), 8,89 (с, 1H), 7,93 (д, $J=8,73$ Гц, 1H), 7,48 (д, $J=52,24$ Гц, 1H), 6,96 (д, $J=7,83$ Гц, 1H), 6,80 (с, 1H), 6,74 (д, $J=7,83$ Гц, 1H), 4,38 (с, 1H), 3,76 (д, $J=12,76$ Гц, 1H), 2,63 (с, 3H), 2,07 (с, 1H), 1,85 (с, 1H), 1,66 (с, 1H), 1,58-1,37 (м, 3H), 1,23 (д, $J=6,52$ Гц, 2H), 1,06 (с, 2H).	462	98%
5-36		Cl	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 10,92 (с, 1H), 10,70 (с, 1H), 8,92 (с, 1H), 8,09 (д, $J=8,43$ Гц, 1H), 7,82 (с, 1H), 7,04 (д, $J=22,18$ Гц, 1H), 6,64 (д, $J=10,90$ Гц, 2H), 4,52-4,28 (м, 3H), 4,01-3,82 (м, 2H), 1,20 (т, $J=10,03$ Гц, 2H), 1,12 (д, $J=3,28$ Гц, 2H).	456	97%
5-37		8-Me		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,85 (д, $J=3,12$ Гц, 1H), 7,90 (д, $J=8,88$ Гц, 1H), 6,71 (д, $J=5,48$ Гц, 3H), 5,23 (д, $J=3,10$ Гц, 1H), 5,07 (д, $J=2,78$ Гц, 1H), 4,42-4,27 (м, 1H), 4,22-4,12 (м, 2H), 2,55 (с, 3H), 1,74 (ддд, $J=8,97, 14,93, 17,91$ Гц, 1H), 1,62-1,45 (м, 1H).	413	98%

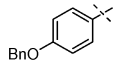
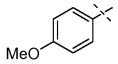
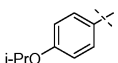
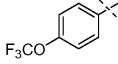
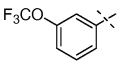
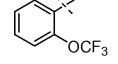
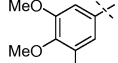
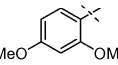
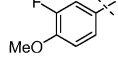
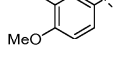
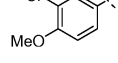
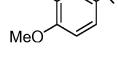
5-38		8-Me		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,44 (д, $J=137,56$ Гц, 2H), 10,82 (д, $J=68,59$ Гц, 1H), 8,85 (т, $J=9,38$ Гц, 1H), 7,93 (т, $J=10,51$ Гц, 1H), 6,56 (т, $J=40,40$ Гц, 2H), 4,44 (д, $J=4,54$ Гц, 3H), 4,39-4,29 (м, 1H), 4,04-3,90 (м, 3H), 2,54 (с, 3H), 1,64 (м, 2H).	454	98%
5-39		Cl	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,92 (с, 1H), 8,10 (д, $J=8,56$ Гц, 1H), 7,69 (с, 1H), 7,18 (с, 1H), 4,41 (с, 2H), 4,23-4,19 (м, 3H), 3,51 (с, 2H), 1,22 (д, $J=6,34$ Гц, 2H), 1,11 (с, 2H).	416	98%
5-40		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,67 (с, 1H), 8,91 (с, 1H), 7,97 (д, $J=8,68$ Гц, 1H), 7,35 (с, 1H), 6,99 (с, 1H), 4,68 (д, $J=4,53$ Гц, 2H), 4,58 (д, $J=4,64$ Гц, 2H), 4,40 (дд, $J=3,32$, 6,77 Гц, 1H), 2,61 (с, 3H), 1,24 (д, $J=6,14$ Гц, 2H), 1,10 (с, 2H).	434	98%
5-41		8-OMe		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,59 (с, 1H), 10,91 (с, 1H), 8,82 (с, 1H), 7,89 (д, $J=9,04$ Гц, 1H), 6,74 (д, $J=14,28$ Гц, 2H), 5,08 (д, $J=64,31$ Гц, 1H), 4,45 (с, 2H), 4,19 (с, 1H), 3,96 (с, 2H), 1,80 (д, $J=26,47$ Гц, 1H), 1,65 (дд, $J=7,14$, 16,55 Гц, 1H).	470	98%
5-42		8-OMe		^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,80 (с, 1H), 7,86 (д, $J=9,34$ Гц, 1H), 6,87 (д, $J=8,16$ Гц, 1H), 6,84 (с, 1H), 6,70 (д, $J=8,14$ Гц, 1H), 5,18-4,96 (м, 1H), 4,17 (с, 3H), 3,36 (с, 2H), 1,84-1,58 (м, 2H).	429	98%
5-43		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,75-14,70 (с, 1H), 8,80-8,76 (с, 1H), 7,89-7,83 (д, $J=9,4$ Гц, 1H), 6,92-6,86 (д, $J=11,4$ Гц, 1H), 6,77-6,73 (с, 1H), 6,16-6,10 (с, 1H), 4,27-4,15 (с, 3H), 3,47-3,41 (с, 3H), 3,40-3,34 (кв, $J=3,6$ Гц, 2H), 1,20-1,09 (дд, $J=14,4$, 5,5 Гц, 4H).	429	90%
5-44		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,77-14,65 (с, 1H), 8,80-8,76 (с, 1H), 7,89-7,83 (д, $J=9,3$ Гц, 1H), 7,09-7,03 (т, $J=1,6$ Гц, 1H), 6,90-6,84 (т, $J=1,6$ Гц, 1H), 6,19-6,10 (с, 1H), 4,26-4,15 (м, 3H), 3,48-3,39 (с, 5H), 1,20-1,09 (ддд, $J=10,6$, 5,5, 3,0 Гц, 4H).	445	100%
5-45		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,80-8,74 (с, 1H), 7,88-7,80 (д, $J=9,3$ Гц, 1H), 6,81-6,71 (дд, $J=17,1$, 2,1 Гц, 2H), 4,28-4,18 (тт, $J=7,2$, 4,3 Гц, 1H), 4,18-4,12 (т, $J=4,2$ Гц, 2H), 3,44-3,35 (м, 5H), 2,16-2,10 (с, 3H), 1,20-1,08 (м, 4H).	425	100%
5-46		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,79-8,75 (с, 1H), 7,87-7,81 (д, $J=9,3$ Гц, 1H), 6,55-6,49 (с, 1H), 6,43-6,39 (с, 1H), 4,27-4,18 (с, 1H), 4,16-4,10 (т, $J=4,3$ Гц, 2H), 3,33-3,5 (с, 2H), 2,57-2,52 (с, 3H), 1,20-1,09 (м, 4H).	426	96%
5-47		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,83-14,56 (с, 1H), 8,81-8,77 (с, 1H), 8,66-8,59 (м, 1H), 7,95-7,89 (д, $J=9,3$ Гц, 1H), 7,89-7,84 (т, $J=1,7$ Гц, 1H), 7,24-7,19 (с, 1H), 4,30-4,18 (м, 3H), 3,67-3,60 (кв, $J=3,8$ Гц, 2H), 3,52-3,44 (с, 3H), 1,20-1,12 (тд, $J=6,5$, 5,8, 2,7 Гц, 4H).	456	100%
5-48		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 15,22-14,17 (м, 1H), 8,97-8,90 (с, 1H), 8,84-8,80 (с, 1H), 7,97-7,90 (д, $J=9,0$ Гц, 1H), 7,51-7,47 (с, 1H), 7,07-7,02 (с, 1H), 4,69-4,57 (с, 4H), 4,28-4,18 (р, $J=5,7$ Гц, 1H), 3,42-3,35 (с, 3H), 1,21-1,12 (д, $J=5,6$ Гц, 4H).	436	100%

5-49		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,70-14,66 (с, 1H), 8,84-8,80 (с, 1H), 7,97-7,92 (д, $J=9,0$ Гц, 1H), 7,78-7,74 (с, 1H), 7,08-7,04 (с, 1H), 5,00-4,94 (т, $J=4,9$ Гц, 2H), 4,82-4,74 (т, $J=4,8$ Гц, 2H), 4,27-4,18 (р, $J=5,7$ Гц, 1H), 3,43-3,38 (с, 3H), 1,21-1,13 (д, $J=5,6$ Гц, 4H).	437	85%
5-50		OMe	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,72 (с, 1H), 8,94 (с, 1H), 7,87 (д, $J=9,4$ Гц, 1H), 6,89 (д, $J=11,4$ Гц, 1H), 6,75 (с, 1H), 6,13 (с, 1H), 4,21 (м, 3H), 3,40 (с, 3H), 1,31-0,94 (м, 4H).	429	90%
5-51		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,72 (с, 1H), 8,88 (с, 1H), 7,91 (д, $J=8,8$ Гц, 1H), 6,91 (с, 1H), 6,72 (с, 1H), 6,07 (с, 1H), 4,48-4,30 (м, 1H), 4,20 (м, 2H), 3,43 (м, 2H), 2,70-2,56 (м, 3H), 1,24 (д, $J=4,0$ Гц, 2H), 1,04 (с, 2H).	429	98%
5-52		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,5 (ушир., 1H), 8,91 (с, 1H), 8,86 (с, 1H), 7,97 (д, $J=8,8$ Гц, 1H), 7,34 (с, 1H), 6,90 (с, 1H), 4,63 (с, 4H), 4,39 (м, 1H), 2,61 (с, 3H), 1,24 (д, $J=4,6$ Гц, 2H), 1,09 (с, 2H).	420	98%
5-53		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,73 (с, 1H), 8,88 (с, 1H), 7,90 (д, $J=8,8$ Гц, 1H), 7,22 (с, 1H), 6,76 (с, 1H), 4,44-4,28 (м, 1H), 4,15 (м, 2H), 3,43 (м, 2H), 2,65 (с, 3H), 1,24 (с, 2H), 1,04 (с, 2H).	521	97%
5-54		Me	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,73 (с, 1H), 8,89 (с, 1H), 7,91 (д, $J=7,8$ Гц, 1H), 6,75 (д, $J=11,3$ Гц, 1H), 6,59 (с, 1H), 4,37 (м, 1H), 4,22 (с, 2H), 3,39 (с, 2H), 2,65 (с, 3H), 1,22 (м, 2H), 1,00 (м, 2H).	413	97%
5-55		Cl	Циклопропил	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,90 (с, 1H), 8,05 (д, $J=8,6$ Гц, 1H), 6,91-6,49 (м, 3H), 4,46-4,36 (м, 1H), 4,16 (м, 2H), 3,49 (м, 2H), 2,67 (с, 3H), 1,19 (т, $J=15,1$ Гц, 2H), 1,09 (с, 2H).	415	98%
5-56				^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,77 (с, 1H), 8,15 (д, $J=7,00$ Гц, 1H), 7,24-7,02 (м, 2H), 6,78 (д, $J=8,23$ Гц, 1H), 4,28-4,13 (м, 2H), 4,05-3,86 (м, 1H), 3,49-3,34 (м, 2H), 2,90 (д, $J=2,66$ Гц, 3H), 1,44-1,32 (м, 2H), 1,28-1,17 (м, 2H).	395	98%
5-57				^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 15,13 (с, 1H), 8,84 (с, 1H), 8,16 (д, $J=8,2$ Гц, 1H), 7,71 (с, 1H), 7,20-7,06 (м, 2H), 6,73 (т, $J=16,6$ Гц, 1H), 4,30 (м, 1H), 4,22-4,17 (м, 2H), 3,68 (с, 2H), 3,44 (с, 3H), 1,43-0,95 (м, 4H).	393	98%

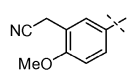
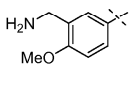
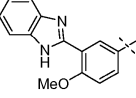
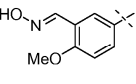
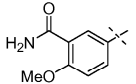
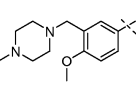
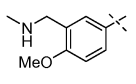
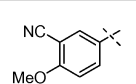
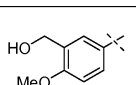
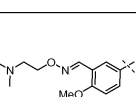
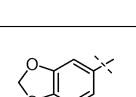
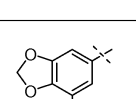
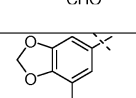
Таблица 6



Соед. №	R ³	R ²	ЯМР	МС (МН ⁺)	ВЭЖХ
6-1		Me	^1H ЯМР (400 МГц, MeOD) δ 7,92 (с, 1H), 7,35 (м, 2H), 6,96 (с, 1H), 6,80 (м, 2H), 4,30-4,19 (м, 1H), 3,75 (с, 3H), 2,59 (с, 3H), 0,96 (м, 2H), 0,79 (м, 2H).	368	98%
6-2		Me	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,75 (с, 1H), 8,89 (с, 1H), 7,92 (д, $J=8,6$ Гц, 1H), 7,50 (т, $J=7,7$ Гц, 1H), 7,24 (дд, $J=15,3$, 7,9 Гц, 2H), 7,14 (д, $J=7,4$ Гц, 1H), 4,38 (м, 1H), 3,76 (с, 3H), 2,55 (с, 3H), 1,41-1,15 (м, 2H), 1,12-0,96 (м, 2H).	482	90%

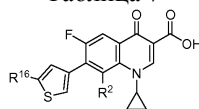
6-3		Me	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,80 (с, 1H), 8,95 (с, 1H), 8,00 (д, $J=8,8$ Гц, 1H), 7,57 (д, $J=7,2$ Гц, 2H), 7,49 (т, $J=7,3$ Гц, 2H), 7,45-7,36 (м, 3H), 7,26 (д, $J=8,6$ Гц, 2H), 5,25 (с, 2H), 4,54-4,32 (м, 1H), 2,67 (с, 3H), 1,30 (д, $J=6,2$ Гц, 2H), 1,11 (с, 2H).	444	99%
6-4		Me	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,76 (с, 1H), 8,90 (с, 1H), 7,94 (д, $J=8,5$ Гц, 1H), 7,35 (д, $J=8,0$ Гц, 2H), 7,12 (д, $J=8,2$ Гц, 2H), 4,38 (с, 1H), 3,84 (с, 3H), 2,61 (с, 3H), 1,23 (д, $J=6,2$ Гц, 2H), 1,05 (с, 2H).	368	96%
6-5		Me	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,63 (с, 1H), 8,88 (с, 1H), 7,92 (д, $J=8,9$ Гц, 1H), 7,31 (д, $J=8,4$ Гц, 2H), 7,08 (д, $J=8,7$ Гц, 2H), 4,71 (дт, $J=12,0, 6,0$ Гц, 1H), 4,38 (м, 1H), 2,58 (д, $J=26,0$ Гц, 3H), 1,32 (д, $J=6,0$ Гц, 6H), 1,23 (кв, $J=6,9$ Гц, 2H), 1,02 (с, 2H).	396	99%
6-6		Me	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,68 (с, 1H), 8,91 (с, 1H), 7,98 (д, $J=8,8$ Гц, 1H), 7,58 (с, 4H), 4,52-4,24 (м, 1H), 2,60 (с, 3H), 1,23 (кв, $J=7,0$ Гц, 2H), 1,15-1,01 (м, 2H).	422	99%
6-7		Me	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,66 (с, 1H), 8,91 (с, 1H), 7,99 (д, $J=8,8$ Гц, 1H), 7,72 (т, $J=7,9$ Гц, 1H), 7,54 (д, $J=8,3$ Гц, 1H), 7,52-7,44 (м, 2H), 4,52-4,20 (м, 1H), 2,60 (с, 3H), 1,23 (д, $J=6,8$ Гц, 2H), 1,08 (с, 2H).	422	99%
6-8		Me	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,48 (с, 1H), 8,76 (с, 1H), 7,86 (д, $J=8,7$ Гц, 1H), 7,60-7,52 (м, 1H), 7,45 (дд, $J=10,9, 9,8, 4,6$ Гц, 3H), 4,25 (дт, $J=10,7, 3,6$ Гц, 1H), 2,43 (с, 3H), 1,06 (дкв., $J=9,4, 7,1$ Гц, 2H), 0,99-0,71 (м, 3H).	422	99%
6-9		Me	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,64 (с, 1H), 8,83 (с, 1H), 7,87 (д, $J=8,7$ Гц, 1H), 6,61 (с, 2H), 4,33 (м, 1H), 3,74 (с, 6H), 3,68 (с, 3H), 2,57 (с, 3H), 1,18 (д, $J=6,4$ Гц, 2H), 1,01 (с, 2H).	428	95%
6-10		Me	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,80 (с, 1H), 8,88 (с, 1H), 7,90 (д, $J=8,6$ Гц, 1H), 7,17 (д, $J=8,3$ Гц, 1H), 6,76 (д, $J=2,2$ Гц, 1H), 6,70 (дд, $J=8,4, 2,3$ Гц, 1H), 4,47-4,28 (м, 1H), 3,85 (с, 3H), 3,75 (с, 3H), 2,55 (с, 3H), 1,21 (дд, $J=6,7, 4,5$ Гц, 2H), 1,02 (дд, $J=10,3, 4,5$ Гц, 2H).	398	96%
6-11		Me	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,70 (с, 1H), 8,80 (с, 1H), 7,86 (д, $J=8,1$ Гц, 1H), 7,32 (м, 2H), 7,16 (д, $J=7,2$ Гц, 1H), 4,25 (с, 1H), 3,92 (с, 3H), 2,57 (с, 3H), 1,41-1,10 (м, 2H), 0,89 (м, 2H).	386	96%
6-12		Me	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,74 (с, 1H), 8,90 (с, 1H), 7,93 (д, $J=8,8$ Гц, 1H), 7,13 (д, $J=8,3$ Гц, 1H), 6,97 (с, 1H), 6,93 (дд, $J=8,2, 1,7$ Гц, 1H), 4,39 (тт, $J=7,1, 3,8$ Гц, 1H), 3,84 (с, 3H), 3,79 (с, 3H), 2,63 (с, 3H), 1,24 (д, $J=6,8$ Гц, 2H), 1,07 (с, 2H).	398	99%
6-13		Me	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,70 (с, 1H), 8,90 (с, 1H), 7,94 (д, $J=8,7$ Гц, 1H), 7,54 (с, 1H), 7,35 (дд, $J=18,3, 8,3$ Гц, 2H), 4,39 (м, 1H), 3,95 (с, 3H), 2,62 (с, 3H), 1,23 (д, $J=5,8$ Гц, 2H), 1,06 (с, 2H).	402	99%
6-14		Me	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,69 (с, 1H), 8,91 (с, 1H), 7,97 (д, $J=8,6$ Гц, 1H), 7,72 (д, $J=8,6$ Гц, 1H), 7,67 (с, 1H), 7,47 (д, $J=8,6$ Гц, 1H), 4,40 (м, 1H), 3,99 (с, 3H), 2,61 (с, 3H), 1,24 (д, $J=5,6$ Гц, 2H), 1,08 (с, 2H).	436	99%

6-15		Me	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,76 (с, 1H), 8,89 (с, 1H), 7,93 (д, J=8,5 Гц, 1H), 7,20 (д, J=12,7 Гц, 2H), 7,11 (д, J=8,0 Гц, 1H), 4,38 (м, 1H), 3,87 (с, 3H), 2,64 (с, 3H), 2,23 (с, 3H), 1,23 (м, 2H), 1,07 (м, 2H).	382	99%
6-16		Me	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,78 (с, 1H), 8,88 (с, 1H), 7,91 (д, J=8,6 Гц, 1H), 6,95 (д, J=7,4 Гц, 1H), 6,62 (с, 1H), 6,52 (д, J=6,8 Гц, 1H), 4,94 (с, 2H), 4,39 (с, 1H), 3,84 (с, 3H), 2,63 (с, 3H), 1,23 (с, 2H), 1,03 (с, 2H).	383	95%
6-17		Me	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,66 (с, 1H), 10,16 (с, 1H), 8,91 (с, 1H), 7,96 (д, J=8,9 Гц, 2H), 7,26 (дд, J=28,6, 8,1 Гц, 2H), 4,39 (м, 1H), 4,24 (м, 2H), 3,86 (м, 4H), 3,33 (м, 4H), 2,63 (с, 3H), 1,22 (д, J=6,1 Гц, 2H), 1,05 (с, 2H).	510	90%
6-18		Me	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,73 (с, 1H), 9,12 (с, 1H), 8,90 (с, 1H), 7,95 (д, J=9,0 Гц, 1H), 7,29 (с, 1H), 7,26 (с, 2H), 4,39 (м, 1H), 3,92 (с, 3H), 3,01 (с, 3H), 2,62 (с, 3H), 1,35-1,15 (м, 2H), 1,06 (м, 2H).	461	98%
6-19		Me	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,76 (с, 1H), 8,89 (с, 1H), 8,14 (д, J=14,8 Гц, 2H), 7,94 (д, J=8,9 Гц, 1H), 7,14 (д, J=8,3 Гц, 1H), 6,90 (д, J=7,9 Гц, 1H), 6,28 (с, 2H), 4,39 (с, 1H), 3,93 (с, 3H), 2,65 (с, 3H), 1,19 (м, 2H), 1,04 (м, 2H).	426	98%
6-20		Me	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,73 (с, 1H), 8,91 (с, 1H), 7,97 (д, J=8,7 Гц, 1H), 7,56 (д, J=6,9 Гц, 2H), 7,31 (д, J=8,5 Гц, 1H), 4,39 (м, 1H), 3,91 (с, 3H), 2,62 (с, 3H), 1,52 (с, 9H), 1,24 (м, 2H), 1,07 (м, 2H).	468	98%
6-21		Me	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,80 (с, 1H), 12,93 (с, 1H), 8,97 (с, 1H), 8,02 (д, J=8,8 Гц, 1H), 7,70 (с, 1H), 7,62 (д, J=8,8 Гц, 1H), 7,38 (д, J=0,8 Гц, 1H), 4,39 (м, 1H), 3,67 (с, 3H), 2,62 (с, 3H), 1,52 (с, 9H), 1,30 (м, 2H), 1,13 (м, 2H).	412	98%
6-22		Me	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,72 (с, 1H), 8,92 (с, 1H), 8,52 (с, 1H), 7,97 (д, J=8,3 Гц, 1H), 7,81 (с, 3H), 7,57 (д, J=7,9 Гц, 1H), 7,36 (д, J=8,4 Гц, 1H), 4,39 (с, 1H), 3,96 (д, J=24,7 Гц, 3H), 3,54 (с, 2H), 2,99 (с, 2H), 2,69-2,54 (м, 3H), 1,23 (д, J=5,3 Гц, 2H), 1,07 (с, 2H).	454	95%
6-24		Me	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,72 (с, 1H), 9,40 (с, 1H), 8,92 (с, 1H), 8,60 (с, 1H), 7,99 (с, 1H), 7,81 (с, 1H), 7,57 (с, 1H), 7,38 (с, 1H), 4,40 (с, 1H), 4,00 (с, 3H), 3,66 (с, 2H), 3,28 (с, 2H), 2,85 (с, 6H), 2,61 (с, 3H), 1,24 (с, 2H), 1,07 (с, 2H).	482	99%
6-25		Me	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,73 (с, 1H), 8,91 (с, 1H), 8,37 (с, 1H), 7,96 (д, J=8,3 Гц, 1H), 7,75 (с, 1H), 7,53 (д, J=8,2 Гц, 1H), 7,33 (д, J=8,4 Гц, 1H), 6,95 (с, 1H), 4,40 (с, 1H), 3,98 (с, 3H), 3,33 (д, J=5,1 Гц, 2H), 3,13 (д, J=5,4 Гц, 2H), 2,61 (с, 3H), 1,36 (с, 9H), 1,24 (д, J=4,4 Гц, 2H), 1,07 (с, 2H).	554	95%
6-26		Me	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,72 (с, 1H), 10,43 (с, 1H), 8,91 (с, 1H), 7,97 (д, J=8,7 Гц, 1H), 7,74 (д, J=8,8 Гц, 1H), 7,70 (с, 1H), 7,45 (д, J=8,6 Гц, 1H), 4,39 (м, 1H), 4,02 (с, 3H), 2,61 (с, 3H), 1,23 (м, 2H), 1,07 (м, 2H).	396	98%
6-27		Me	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,65 (с, 1H), 8,91 (с, 1H), 8,47 (с, 1H), 7,97 (д, J=8,7 Гц, 1H), 7,71 (с, 1H), 7,66 (с, 1H), 7,44 (д, J=8,7 Гц, 1H), 7,38 (д, J=8,6 Гц, 1H), 4,40 (м, 1H), 4,05 (с, 3H), 2,65 (с, 3H), 1,25 (д, J=6,7 Гц, 2H), 1,08 (с, 2H).	435	90%

6-28		Me	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,71 (с, 1H), 8,90 (с, 1H), 7,96 (д, $J=8,4$ Гц, 1H), 7,40 (д, $J=11,8$ Гц, 2H), 7,26 (д, $J=8,0$ Гц, 1H), 4,39 (с, 1H), 3,94 (с, 5H), 2,62 (с, 3H), 1,23 (с, 2H), 1,06 (с, 2H).	407	95%
6-29		Me	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,68 (с, 1H), 10,43 (с, 1H), 8,91 (с, 1H), 7,97 (д, $J=8,8$ Гц, 1H), 7,86-7,62 (м, 2H), 7,44 (д, $J=8,5$ Гц, 1H), 4,39 (с, 1H), 4,02 (с, 2H), 2,64 (с, 3H), 1,23 (с, 2H), 1,07 (с, 2H).	396	95%
6-30		Me	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,66 (с, 2H), 8,93 (с, 1H), 8,33 (с, 1H), 8,02 (д, $J=8,6$ Гц, 1H), 7,80 (с, 2H), 7,71 (д, $J=8,5$ Гц, 1H), 7,56 (д, $J=8,4$ Гц, 1H), 7,46 (с, 2H), 4,42 (с, 1H), 4,17 (с, 3H), 2,66 (с, 3H), 1,35-1,15 (м, 2H), 1,09 (с, 2H).	484	85%
6-31		Me	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,74 (с, 1H), 11,37 (с, 1H), 8,90 (с, 1H), 8,35 (с, 1H), 7,96 (д, $J=8,1$ Гц, 1H), 7,64 (с, 1H), 7,43 (д, $J=8,1$ Гц, 1H), 7,27 (д, $J=8,5$ Гц, 1H), 4,39 (с, 1H), 3,92 (с, 3H), 2,63 (с, 3H), 1,23 (д, $J=5,2$ Гц, 2H), 1,06 (с, 2H).	411	95%
6-32		Me	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,75 (с, 1H), 8,91 (с, 1H), 7,97 (д, $J=8,7$ Гц, 1H), 7,78 (с, 2H), 7,70 (с, 1H), 7,54 (д, $J=8,2$ Гц, 1H), 7,33 (д, $J=8,4$ Гц, 1H), 4,40 (с, 1H), 3,98 (с, 3H), 2,61 (с, 3H), 1,23 (с, 2H), 1,07 (с, 2H).	411	94%
6-33		Me	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,73 (с, 1H), 8,92 (с, 1H), 7,96 (д, $J=8,6$ Гц, 1H), 7,37 (с, 2H), 7,23 (д, $J=7,3$ Гц, 1H), 4,39 (м, 1H), 3,89 (с, 3H), 3,74 (м, 4H), 3,07 (с, 4H), 2,76 (с, 3H), 2,62 (с, 3H), 1,24 (с, 2H), 1,06 (с, 2H).	480	96%
6-34		Me	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,73 (с, 1H), 8,92 (с, 1H), 8,87 (с, 1H), 7,97 (д, $J=8,1$ Гц, 1H), 7,48 (с, 2H), 7,29 (д, $J=8,7$ Гц, 1H), 4,40 (м, 1H), 4,18 (с, 2H), 3,94 (с, 3H), 2,63 (с, 3H), 2,55 (с, 3H), 1,24 (с, 2H), 1,05 (с, 2H).	411	86%
6-35		Me	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,69 (с, 1H), 8,91 (с, 1H), 7,97 (д, $J=8,6$ Гц, 1H), 7,91 (с, 1H), 7,75 (д, $J=8,1$ Гц, 1H), 7,44 (д, $J=8,1$ Гц, 1H), 4,39 (с, 1H), 4,02 (с, 3H), 2,61 (с, 3H), 1,23 (с, 2H), 1,07 (с, 2H).	393	95%
6-36		Me	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,78 (с, 1H), 8,90 (с, 1H), 7,95 (д, $J=8,7$ Гц, 1H), 7,37 (с, 1H), 7,26 (д, $J=8,0$ Гц, 1H), 7,13 (д, $J=8,3$ Гц, 1H), 5,18 (с, 1H), 4,57 (с, 2H), 4,39 (с, 1H), 3,87 (с, 3H), 2,62 (с, 3H), 1,23 (с, 2H), 1,05 (с, 2H).	398	95%
6-37		Me	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,71 (с, 1H), 9,63 (с, 1H), 8,92 (с, 1H), 8,51 (с, 1H), 7,98 (д, $J=8,5$ Гц, 1H), 7,67 (с, 1H), 7,52 (д, $J=8,3$ Гц, 1H), 7,32 (д, $J=8,5$ Гц, 1H), 4,43 (м, 3H), 3,94 (с, 3H), 3,43 (с, 2H), 2,80 (д, $J=24,7$ Гц, 6H), 2,62 (с, 3H), 1,23 (с, 2H), 1,07 (с, 2H).	482	95%
6-38		Me	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,74 (с, 1H), 8,90 (с, 1H), 7,93 (д, $J=9,2$ Гц, 1H), 7,10 (д, $J=8,0$ Гц, 1H), 7,02 (с, 1H), 6,86 (д, $J=8,0$ Гц, 1H), 6,13 (с, 2H), 4,38 (м, 1H), 2,62 (с, 3H), 1,23 (м, 2H), 1,05 (м, 2H).	382	98%
6-39		Me	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,67 (с, 1H), 10,11 (с, 1H), 8,91 (с, 1H), 7,97 (д, $J=8,7$ Гц, 1H), 7,33 (д, $J=1,6$ Гц, 1H), 7,29 (д, $J=1,6$ Гц, 1H), 6,45-6,21 (с, 2H), 4,41-4,30 (м, 1H), 2,74-2,56 (с, 3H), 1,33-1,17 (д, $J=6,6$ Гц, 2H), 1,12-0,96 (т, $J=3,1$ Гц, 2H).	410	98%
6-40		Me	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,69 (с, 1H), 11,53 (с, 1H), 8,90 (с, 1H), 8,16 (с, 1H), 7,95 (д, $J=8,7$ Гц, 1H), 7,08 (д, $J=1,7$ Гц, 1H), 7,02 (д, $J=1,7$ Гц, 1H), 6,21 (с, 2H), 4,48-4,16 (м, 1H), 2,64 (с, 3H), 1,35-1,21 (д, $J=6,8$ Гц, 2H), 1,12-1,01 (м, 2H).	425	98%

6-41		Me	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,64 (с, 1H), 8,90 (с, 1H), 7,96 (д, $J=8,8$ Гц, 1H), 7,36 (д, $J=1,6$ Гц, 1H), 7,4 (д, $J=1,6$ Гц, 1H), 6,36 (с, 2H), 4,52-4,26 (м, 1H), 2,63 (с, 3H), 1,35-1,15 (д, $J=6,6$ Гц, 2H), 1,10-0,99 (м, 2H).	407	98%
6-42		Me	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,68 (с, 1H), 8,89 (с, 1H), 7,94 (д, $J=8,7$ Гц, 1H), 7,06 (д, $J=1,5$ Гц, 1H), 6,95 (д, $J=1,5$ Гц, 1H), 6,22 (с, 2H), 4,57-4,46 (с, 1H), 4,42-4,30 (м, 1H), 2,63 (с, 3H), 1,33-1,15 (д, $J=6,2$ Гц, 2H), 1,12-0,90 (м, 1H).	406	95%
6-43		OMe	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,70 (с, 1H), 8,80 (с, 1H), 7,90 (д, $J=9,1$ Гц, 1H), 7,06 (с, 1H), 7,01 (с, 1H), 6,13 (с, 2H), 5,31 (т, $J=5,6$ Гц, 1H), 4,54 (д, $J=5,6$ Гц, 2H), 4,34-4,12 (м, 1H), 3,44 (с, 3H), 1,33-0,99 (м, 4H).	428	97%
6-44		Me	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,69 (с, 1H), 8,89 (с, 1H), 7,93 (д, $J=8,7$ Гц, 1H), 6,97 (с, 1H), 6,93 (с, 1H), 6,73 (дд, $J=17,7, 11,3$ Гц, 1H), 6,20 (с, 2H), 6,00 (д, $J=17,6$ Гц, 1H), 5,49 (д, $J=11,5$ Гц, 1H), 4,53-4,25 (м, 1H), 2,75-2,57 (с, 3H), 1,32-1,17 (д, $J=6,7$ Гц, 2H), 1,11-0,89 (с, 2H).	408	95%
6-45		OMe	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,66 (с, 1H), 8,80 (с, 1H), 7,90 (д, $J=9,1$ Гц, 1H), 7,17 (с, 1H), 7,09 (с, 1H), 6,23 (с, 2H), 4,49 (с, 1H), 4,34-4,14 (м, 1H), 3,47-3,42 (с, 3H), 1,31-0,96 (м, 4H).	422	98%
6-46		OMe	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,62 (с, 1H), 8,81 (с, 1H), 7,93 (д, $J=9,1$ Гц, 1H), 7,45 (с, 1H), 7,44 (с, 1H), 6,36 (с, 2H), 4,39-4,04 (м, 1H), 3,46 (с, 3H), 1,26-1,06 (м, 4H).	423	98%
6-47		OMe	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,65 (с, 1H), 8,80 (с, 1H), 7,92 (д, $J=9,1$ Гц, 1H), 7,30 (с, 1H), 7,19 (с, 1H), 7,17 (т, $J=5,6$ Гц, 1H), 6,27 (с, 2H), 4,33-4,17 (м, 1H), 3,45 (с, 3H), 1,29-0,97 (м, 4H).	448	92%
6-48		OMe	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,67 (с, 1H), 8,80 (с, 1H), 7,93 (д, $J=9,1$ Гц, 1H), 7,77 (с, 1H), 7,42 (т, $J=1,4$ Гц, 1H), 7,28 (т, $J=1,3$ Гц, 1H), 7,25 (с, 1H), 6,27 (с, 2H), 4,33-4,13 (м, 1H), 3,44 (с, 3H), 1,37-0,87 (м, 4H).	441	98%
6-49		OMe	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,66 (с, 1H), 10,12 (д, $J=1,2$ Гц, 1H), 8,81 (с, 1H), 7,93 (д, $J=9,5$ Гц, 1H), 7,44 (с, 1H), 7,42 (с, 1H), 6,35 (с, 2H), 4,33-4,17 (м, 1H), 3,46 (с, 3H), 1,32-0,97 (м, 4H).	426	98%
6-50		OMe	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,68 (с, 1H), 8,80 (с, 1H), 7,89 (д, $J=9,1$ Гц, 1H), 6,83-6,80 (т, $J=1,3$ Гц, 1H), 6,80-6,76 (т, $J=1,2$ Гц, 1H), 6,11 (с, 2H), 4,34-4,12 (м, 1H), 3,86 (с, 3H), 3,31 (с, 3H), 1,26-1,02 (м, 4H).	428	98%
6-51		OMe	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,70-14,61 (с, 1H), 8,84-8,78 (с, 1H), 7,96-7,88 (д, $J=9,0$ Гц, 1H), 7,14 (с, 1H), 7,13 (с, 1H), 6,33-6,22 (с, 2H), 4,26-4,18 (м, 1H), 3,47 (с, 3H), 1,20-1,11 (м, 4H).	432	95%
6-52		OMe	^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,67 (с, 1H), 8,80 (с, 1H), 7,92 (д, $J=9,1$ Гц, 1H), 7,77 (с, 1H), 7,42 (с, 1H), 7,28 (с, 1H), 7,25 (с, 1H), 6,27 (с, 2H), 4,22 (м, 1H), 3,44 (с, 3H), 1,17 (м, 4H).	441	85%
6-53			^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,49 (с, 1H), 8,83 (с, 1H), 7,94 (д, $J=8,0$ Гц, 1H), 7,42 (с, 1H), 6,36 (с, 2H), 5,10 (м, 1H), 4,18 (м, 1H), 3,47 (с, 3H), 1,82-1,63 (м, 4H).	441	98%
6-54			^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,50 (с, 1H), 11,55 (с, 1H), 8,83 (с, 1H), 8,16 (с, 1H), 7,92 (д, $J=8,0$ Гц, 1H), 7,27 (с, 1H), 7,10 (с, 1H), 6,22 (с, 1H), 5,10 (м, 1H), 4,18 (м, 1H), 3,47 (с, 3H), 1,82-1,63 (м, 4H).	459	95%
6-55			^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,47 (с, 1H), 8,82 (с, 1H), 8,10 (д, $J=8,7$ Гц, 1H), 8,00-7,87 (м, 1H), 7,66 (т, $J=9,4$ Гц, 1H), 7,37 (т, $J=8,3$ Гц, 1H), 7,21 (д, $J=8,0$ Гц, 2H), 7,06 (д, $J=8,1$ Гц, 2H), 3,81 (с, 3H).	440	99%
6-56			^1H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 15,44-15,10 (с, 1H), 9,12-8,99 (т, $J=1,7$ Гц, 1H), 8,03-7,92 (дт, $J=8,4, 1,8$ Гц, 1H), 7,67-7,56 (дд, $J=8,6, 2,5$ Гц, 3H), 7,16-6,98 (м, 2H), 5,03-4,89 (д, $J=7,3$ Гц, 1H), 4,60-4,47 (д, $J=11,4$ Гц, 1H), 4,44-4,33 (д, $J=11,5$ Гц, 1H), 3,86-3,75 (т, $J=1,7$ Гц, 3H), 1,53-1,42 (д, $J=6,3$ Гц, 3H).	352	99%

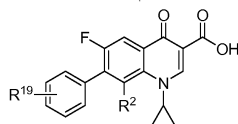
Таблица 7



Соед. №	R ¹⁶	R ²	ЯМР	МС (МН ⁺)	ВЭЖХ
7-1	H	Me	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,74 (с, 1H), 8,90 (с, 1H), 7,95 (д, J=9,3 Гц, 1H), 7,80 (с, 2H), 7,27 (с, 1H), 4,39 (с, 1H), 2,68 (с, 3H), 1,23 (с, 3H), 1,03 (с, 2H).	344	100%
7-2		Me	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,69 (с, 1H), 9,37 (с, 2H), 8,91 (с, 1H), 7,96 (д, J=8,9 Гц, 1H), 7,87 (с, 1H), 7,51 (с, 1H), 4,43 (с, 3H), 3,00 (д, J=6,2 Гц, 2H), 2,71 (с, 3H), 1,24 (д, J=6,4 Гц, 5H), 1,03 (с, 2H).	401	95%
7-3		Me	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,70 (с, 1H), 13,87 (с, 1H), 8,91 (с, 1H), 7,98 (д, J=8,1 Гц, 2H), 7,60 (с, 1H), 4,41 (с, 1H), 2,70 (с, 3H), 1,23 (с, 2H), 1,06 (с, 2H).	412	100%
7-4	CH ₂ CN	Me	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,75 (с, 1H), 8,90 (с, 1H), 7,95 (д, J=8,8 Гц, 1H), 7,76 (с, 1H), 7,22 (с, 1H), 5,76 (с, 2H), 4,40 (м, 1H), 2,69 (с, 3H), 1,23 (м, 2H), 1,04 (с, 2H).	383	97%
7-5	CHO	Me	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,67 (с, 1H), 10,03 (с, 1H), 8,92 (с, 1H), 8,39 (с, 1H), 8,23 (с, 1H), 7,99 (д, J=9,1 Гц, 1H), 4,42 (с, 1H), 2,71 (с, 3H), 1,24 (д, J=6,4 Гц, 2H), 1,05 (с, 2H).	372	98%
7-6		Me	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,70 (с, 1H), 11,34 (д, J=16,3 Гц, 1H), 8,90 (с, 1H), 8,40 (с, 1H), 7,96 (д, J=8,6 Гц, 1H), 7,78 (с, 1H), 7,42 (д, J=14,9 Гц, 1H), 4,40 (с, 1H), 2,71 (с, 3H), 1,24 (д, J=5,8 Гц, 2H), 1,04 (с, 2H).	387	96%
7-7		Me	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 13,57-13,17 (м, 1H), 11,49 (с, 1H), 9,30 (с, 1H), 8,77 (с, 1H), 8,09 (с, 1H), 7,90 (д, J=9,3 Гц, 1H), 7,83 (с, 1H), 4,33 (с, 1H), 2,66 (с, 3H), 1,22 (д, J=7,5 Гц, 2H), 0,97 (с, 2H).	403	100%
7-8	CONH ₂	Me	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,70 (с, 1H), 8,91 (с, 1H), 8,12 (с, 1H), 7,98 (м, 2H), 7,89 (с, 1H), 7,57 (с, 1H), 4,41 (с, 1H), 2,71 (с, 3H), 1,25 (д, J=5,7 Гц, 2H), 1,03 (с, 2H).	387	100%
7-9	CO ₂ H	Me	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,69 (с, 1H), 13,34 (с, 1H), 8,91 (с, 1H), 8,12 (с, 1H), 7,96 (д, J=8,7 Гц, 1H), 7,86 (с, 1H), 4,40 (с, 1H), 2,69 (с, 3H), 1,24 (д, J=6,2 Гц, 2H), 1,05 (с, 2H).	388	100%
7-10		Me	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,68 (с, 1H), 12,49 (с, 1H), 8,87 (с, 1H), 7,96 (д, J=11,9 Гц, 2H), 7,81 (д, J=15,8 Гц, 1H), 7,69 (с, 1H), 6,30 (д, J=15,7 Гц, 1H), 4,40 (с, 1H), 2,71 (с, 3H), 1,24 (д, J=6,4 Гц, 2H), 1,04 (с, 2H).	414	95%
7-11		Me	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,69 (с, 1H), 8,92 (с, 1H), 8,13 (с, 1H), 8,00 (д, J=8,7 Гц, 1H), 7,91 (с, 1H), 4,42 (с, 1H), 2,74 (с, 3H), 1,24 (с, 2H), 1,06 (с, 2H).	412	100%
7-12		Me	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,75 (с, 1H), 11,75 (с, 1H), 8,90 (с, 1H), 7,97 (с, 1H), 7,58 (с, 1H), 7,46 (с, 1H), 7,26 (с, 1H), 7,13 (с, 1H), 7,00 (с, 2H), 4,41 (с, 1H), 4,17 (д, J=6,9 Гц, 2H), 2,75 (с, 3H), 1,99 (с, 2H), 1,23 (с, 3H), 1,04 (с, 2H), 0,85 (с, 2H).	481	100%
7-13		Me	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,70 (с, 1H), 8,91 (с, 1H), 8,49 (с, 1H), 7,97 (д, J=8,7 Гц, 1H), 7,91 (с, 1H), 7,64 (с, 2H), 4,41 (с, 1H), 2,73 (с, 3H), 1,25 (д, J=6,5 Гц, 2H), 1,05 (с, 2H).	411	95%
7-14		Me	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,90-14,46 (м, 1H), 8,93 (с, 1H), 8,05 (с, 1H), 8,02 (д, J=8,4 Гц, 2H), 7,63 (с, 2H), 7,28 (с, 2H), 4,44 (с, 1H), 2,78 (с, 3H), 1,27 (д, J=6,4 Гц, 2H), 1,07 (с, 2H).	460	100%
7-15		Me	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,92 (с, 1H), 8,07 (д, J=6,7 Гц, 2H), 7,99 (д, J=8,8 Гц, 1H), 7,91 (с, 1H), 7,79 (с, 1H), 7,54 (с, 3H), 4,42 (с, 1H), 2,76 (с, 3H), 1,26 (д, J=6,0 Гц, 3H), 1,07 (м, 2H).	487	95%
7-16		Me	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,68 (с, 1H), 13,75 (с, 1H), 8,90 (с, 1H), 7,96 (д, J=8,9 Гц, 1H), 7,77 (с, 1H), 7,61 (с, 1H), 4,47-4,32 (м, 1H), 2,73 (с, 3H), 2,41 (с, 3H), 1,25 (д, J=6,3 Гц, 2H), 1,07 (с, 2H).	425	98%
7-17	CN	OMe	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 14,63 (с, 1H), 8,80 (с, 1H), 8,42 (с, 1H), 7,28 (с, 1H), 7,96 (д, J=9,2 Гц, 1H), 4,47-4,32 (м, 1H), 3,47 (с, 3H), 1,23-1,15 (м, 4H).	385	98%
7-18		OMe	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,57 (с, 1H), 7,72 (с, 2H), 7,58 (с, 1H), 7,43 (д, J=9,7 Гц, 1H), 4,13 (м, 1H), 3,27 (с, 3H), 2,20 (с, 3H), 1,05-0,81 (м, 4H).	441	98%
7-19		Cl	¹ H ЯМР (400 МГц, ДМСО) δ 8,93 (с, 1H), 8,13 (д, J=8,0 Гц, 1H), 7,86 (с, 1H), 7,67 (с, 1H), 4,13 (м, 1H), 2,40 (с, 3H), 1,24-1,12 (м, 4H).	445	85%

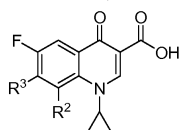
034787

Таблица 8-1



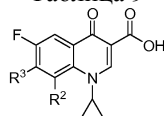
Соединение №	R ¹⁹	R ²	МС (МН ⁺)
8-1	H	Me	352, 36
8-2	3-NH ₂	Me	337, 34
8-3	4-F	Me	355, 33
8-4	4-CO ₂ H	Me	381, 35
8-5	2-NH ₂	Me	352, 36
8-6	3-Me	Me	351, 37
8-7	4-Me	Me	351, 37
8-8	2, 3-Диметил	Me	365, 4
8-9	2-Cl	Me	371, 79
8-10	4-Cl	Me	371, 79
8-11	3-CO ₂ H	Me	381, 35
8-12	3-CF ₃	Me	405, 34
8-13	3, 4-Дихлор	Me	406, 23
8-14	3-F	Me	355, 33
8-15	4-tBu	Me	393, 45
8-16	4-MeO	Циклопропил	393, 41
8-17	4-Ph	Me	413, 44
8-18	4-NO ₂	Me	382, 34
8-19	3, 4-Дихлор	MeO	404, 24
8-20	4-MeO	Me	365, 38
8-21	3, 4-Диметил	Me	365, 4
8-22	4-CF ₃	Me	405, 34
8-24	3-CONH ₂	Me	380, 37
8-25	4-NH ₂	Me	352, 36
8-26	4-OH	Me	353, 34
8-27	4-OMe	F	353, 34
8-28	4-OMe	NO ₂	398, 34
8-29	4-OMe	Cl	387, 79
8-30	4-OMe	NH ₂	368, 36
8-31	4-OMe	Br	432, 24
8-32	4-OMe	H	353, 34
8-33	4-OMe	CN	378, 35
8-34	4-OMe	CH ₂ F	385, 36
8-35	4-OMe	MeO	383, 37
8-36	4-OMe	CH ₂ Br	446, 27
8-37	4-OMe	CH ₂ OH	383, 37
8-38	4-OMe	CHF ₂	403, 35
8-39	4-Амино-3-гидрокси	Me	368, 36
8-40	4-OMe	CHO	381, 35
8-41	4-OMe	C≡CH	377, 37
8-42	4-OMe	Et	381, 4
8-43	4-OMe	CH=CH ₂	379, 38
8-44	3, 4-Диамино	Me	367, 37
8-45	4-Амино-3-нитро	Me	397, 36
8-46	4-Метиламино-3-нитро	Me	411, 38
8-47	3-Диметиламино	Me	380, 41
8-48	2, 4-Динитро-3-диметиламино	Me	470, 41
8-49	4-Нитро-3-диметиламино	Me	425, 41
8-50	2-Нитро-3-диметиламино	Me	425, 41
8-51	4-Диметиламино-3-нитро	Me	425, 41
8-52	4-Этиламино-3-нитро	Me	425, 41
8-53	4-Диметиламино	Me	380, 41
8-54	3-Формил-4-нитро	Me	410, 35
8-55	4-Амино-3-нитро	Me	413, 36
8-56	3-Фтор-4-нитро	Me	400, 33

Таблица 8-2



Соединение №	R ³	R ²	МС (МН ⁺)
8-57		Me	451, 45
8-58		Me	465, 47
8-59		Me	480, 49
8-60		Me	495, 48
8-61		Me	508, 54
8-62		Me	452, 44
8-63		Me	466, 46
8-64		Me	467, 45
8-65		Me	411, 38
8-66		Me	415, 35
8-67		Me	425, 41
8-68		Me	429, 37
8-69		Me	426, 35
8-70		Me	454, 45
8-71		Me	449, 39
8-72		Me	454, 45
8-73		Me	463, 42
8-74		Me	447, 46
8-75		Me	406, 45
8-76		Me	421, 46
8-77		Me	418, 42

Таблица 9



Соединение №	R ³	R ²	МС (МН ⁺)
9-1		Me	407, 19
9-2		Me	404, 39
9-3		Me	394, 35
9-4		Me	397, 4
9-5		Me	392, 38
9-6		Me	326, 32
9-7		Me	326, 32
9-8		Me	394, 4
9-9		Me	380, 41
9-10		Me	395, 43
9-11		Me	355, 36
9-12		Me	393, 37
9-13		Me	327, 31
9-14		Me	406, 2
9-15		Me	409, 43
9-16		Me	372, 3
9-17		Me	328, 34
9-18		Me	397, 44
9-19		Me	354, 33
9-20		Me	354, 33
9-21		Me	422, 33
9-22		Me	342, 36
9-24		Me	411, 47

Экспериментальный пример 1. Антибактериальная активность *in vitro*

Все соединения растворяли в диметилсульфоксиде (ДМСО, Merck, чистота >99,9%) до достижения конечной желаемой концентрации 1 мг/мл.

МИС (минимальные ингибирующие концентрации) определяли методом микроразведений с использованием 96-луночных планшетов для микроразведения. Антимикробные свойства исследовали с ис-

пользованием следующих интервалов MIC: от 0,008 до 8 мкг/мл. Планшеты заполняли по 100 мкл усиленной клостридиальной среды (Oxoid; Unipath Ltd., Basingstoke, United Kingdom) на лунку, содержащей конечные концентрации антибиотика. Планшеты оттаивали и предварительно инкубировали в течение 3 часов в анаэробной камере (Thermal, USA), атмосфера которой содержала 80% N₂, 15% CO₂ и 5% H₂. Бактериальную посевную культуру готовили путем поддержания роста в течение 48 ч в усиленной клостридиальной среде. Окончательная посевная культура составляла приблизительно 1,0×10⁵⁻⁶ CFU/лунка. Планшеты инкубировали в течение 48 ч при температуре 37°C в анаэробной камере. MIC определяли как наименьшую концентрацию антибиотика, которая ингибирует видимый рост. В качестве позитивного контроля использовали ципрофлоксацин, ванкомицин и метронидазол. Результаты показаны в табл. 10.

Таблица 10. MIC соединений по примерам в отношении *C. difficile* (мкг/мл)

Соед. №	<i>C. difficile</i> ATCC43255	<i>C. difficile</i> ATCC70057	<i>C. difficile</i> ATCC70092	<i>C. difficile</i> IQCC23903
2-18	0,016-0,063	0,016-0,063	≤0,008-0,063	0,032-0,063
2-46	0,032-0,125	0,032-0,25	0,063-0,25	0,125-0,25
5-14	0,125-0,25	0,125-0,5	0,125-0,25	0,125-0,5
2-49	0,063-0,25	0,063-0,25	0,063-0,5	0,063-0,25
3-11	≤0,008-0,032	0,016-0,032	≤0,008-0,032	≤0,008-0,063
2-31	≤0,008-0,032	0,016-0,032	0,016-0,032	0,016-0,063
1-2	0,032-0,125	0,032-0,125	0,032-0,125	0,063-0,25
3-21	0,016-0,032	0,016-0,063	0,016-0,063	0,032-0,063
2-38	0,016-0,032	0,016-0,032	0,032-0,063	0,016-0,032
3-30	0,032-0,063	0,063-0,125	0,063-0,125	0,063-0,25

Экспериментальный пример 2. Антибактериальная эффективность in vivo

Эффективность in vivo оценивали на модели лечения кишечной инфекции у хомяков. Самцов золотых сирийских хомяков получали от фирмы Charles River Laboratories (Kingston, NY, USA) возраста около 6 недель с массой тела в интервале от 80 до 100 г в начале исследования. Животных содержали отдельно в фильтруемых поликарбонатных клетках в стиле коробок для обуви, снабженных бутылками с питьевой водой, и из пищевого контейнера неограниченно был доступен корм Harlan Teklab Global Diet 2016. Хомяков предварительно обрабатывали клиндамицином (1 мг/кг, р. о.) и ванкомицином (50 мг/кг, р.о.), в виде смеси с аравийской камедью, в день 0. В день 7 каждому хомяку вводили через желудочный зонд 0,5 мл суспензии *C. difficile* ATCC 43255 (105 CFU/тело, р.о.). С целью приготовления указанного инокула *C. difficile* выращивали на агаре GAM (Japan) в течение 5 дней при температуре 37°C и бактерии собирали центрифугированием, промывали два раза аравийской камедью, вновь суспендировали в аравийской камеди и точную плотность бактерий определяли с использованием разведения чашечным методом подсчета. Пероральное дозирование соединений, измельченных и смешанных с аравийской камедью, начинали на следующий день (день 8). Лечение проводили один раз в день в течение 5 дней подряд в указанных дозах (10, 2 и 0,4 мг/кг) при пяти хомяках в группе. Контролями были неинфицированная группа и зараженная, но необработанная группа, и в качестве положительного контроля использовали ванкомицин. Хомяки находились под ежедневным наблюдением с регистрацией клинических признаков (продолжительность, время начала, время восстановления или смерти), и животных в летаргическом, отчетливо умирающем состоянии подвергали эвтаназии. Вскрытие проводили на животных, которые были либо найдены мертвыми, либо были умерщвлены в конце исследования (37 дней). Результаты показаны на фиг. 1 и 2.

Препаративный пример 1.

Инъекционный препарат готовили из следующих компонентов.

<u>Компоненты</u>	<u>Количество</u>
Соединение 1-2	200 мг
Глюкоза	250 мг
<u>Дистиллированная вода для инъекций</u>	<u>q.s.</u>
Всего	5 мл

Соединение 1-2 и глюкозу растворяли в дистиллированной воде для инъекций и раствор помещали в 5-мл ампулу, которую продували газообразным азотом и затем подвергали стерилизации при температуре 121°C в течение 15 мин с получением инъекционного препарата.

Препаративный пример 2.

Покрываемые пленкой таблетки готовили из следующих компонентов.

<u>Компоненты</u>	<u>Количество</u>
Соединение 2-18	100 г
Avicel (зарегистрированная торговая марка)	40 г
Кукурузный крахмал	30 г
Стеарат магния	2 г
ТС-5 (зарегистрированная торговая марка)	10 г
Полиэтиленгликоль 6000	3 г
Касторовое масло	40 г
Этанол	40 г

Соединение 2-18, Avicel (зарегистрированная торговая марка микрокристаллической целлюлозы, производства фирмы Asahi Kasei Corporation, Japan), кукурузный крахмал и стеарат магния смешивали и пластифицировали и смесь таблетировали с использованием обычной дробилки (R 10 мм) для покрытия сахаром (производства фирмы Kikusui Seisakusho Ltd., Japan). Полученные таким образом таблетки покрывали агентом для покрытия, состоящим из ТС-5 (зарегистрированная торговая марка гидроксипропилметилцеллюлозы производства фирмы Shin-Etsu Chemical Co., Ltd., Japan), полиэтиленгликоля 6000, касторового масла и этанола, с получением покрытых пленкой таблеток.

Препаративный пример 3.

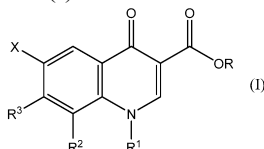
Мазь готовили из следующих компонентов.

<u>Компоненты</u>	<u>Количество</u>
Соединение 3-11	2 г
Очищенный ланолин	5 г
Отбеленный пчелиный воск	5 г
<u>Белое вазелиновое масло</u>	<u>88 г</u>
Всего	100 г

Отбеленный пчелиный воск разжижали путем нагревания и к нему добавляли соединение 3-11, очищенный ланолин и белое вазелиновое масло и смесь нагревали до жидкого состояния. Смесь перемешивали до загустения с получением мази.

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Соединение, представленное формулой (I)



где

X представляет собой атом фтора;

R представляет собой атом водорода или C₁₋₆алкил;

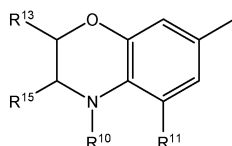
R¹ представляет собой циклопропил, необязательно замещенный 1-3 атомами галогена;

R² представляет собой C₁₋₆алкил; C₁₋₆алкокси или атом хлора;

R³ представляет собой

(1) 5-пиримидинил, замещенный 1 или двумя заместителями, выбранными из группы, состоящей из amino, C₁₋₆алкиламино, ди(C₁₋₆алкил)амино и карбокси, или

(2) группу формулы



где

R¹⁰ представляет собой

(a) атом водорода или

(b) C₁₋₆алкил и

каждый R¹¹, R¹³ и R¹⁵ независимо представляет собой

(a) атом водорода,

(b) атом галогена,

(c) циано,

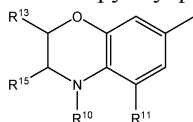
(d) нитро,

- (e) amino,
 (f) C₁₋₆алкиламино,
 (g) ди(C₁₋₆алкил)амино,
 (h) C₁₋₆алкил, необязательно замещенный гидроксильной или
 (i) C₂₋₆алкенил,
 или его соль.

2. Соединение по п.1, где R³ представляет собой 5-пиримидинил, замещенный 1 или 2 заместителями, выбранными из группы, состоящей из amino, C₁₋₆алкиламино, ди(C₁₋₆алкил)амино и карбокси, или его соль.

3. Соединение по п.1, где R³ представляет собой 5-пиримидинил, замещенный 1 или 2 заместителями, выбранными из группы, состоящей из amino, C₁₋₆алкиламино и ди(C₁₋₆алкил)амино, или его соль.

4. Соединение по п.1, где R³ представляет собой группу формулы



где R¹⁰, R¹¹, R¹³ и R¹⁵ такие, как определено в п.1, или его соль.

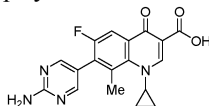
5. Соединение по п.4, где каждый R¹⁰, R¹¹, R¹³ и R¹⁵ представляет собой атом водорода, или его соль.

6. Соединение по любому из пп.1-5, где R представляет собой атом водорода, или его соль.

7. Соединение по любому из пп.1-6, где R¹ представляет собой циклопропил или 2-фторциклопропил, или его соль.

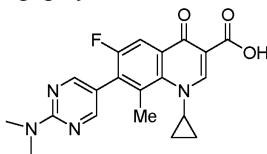
8. Соединение по любому из пп.1-7, где R² представляет собой метил, метокси или атом хлора, или его соль.

9. Соединение по п.1, представленное формулой



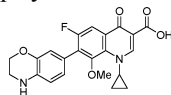
или его соль.

10. Соединение по п.1, представленное формулой



или его соль.

11. Соединение по п.1, представленное формулой



или его соль.

12. Фармацевтическая композиция для предотвращения или лечения бактериальной инфекции, содержащая соединение по любому из пп.1-11 или его соль и фармацевтически приемлемый носитель.

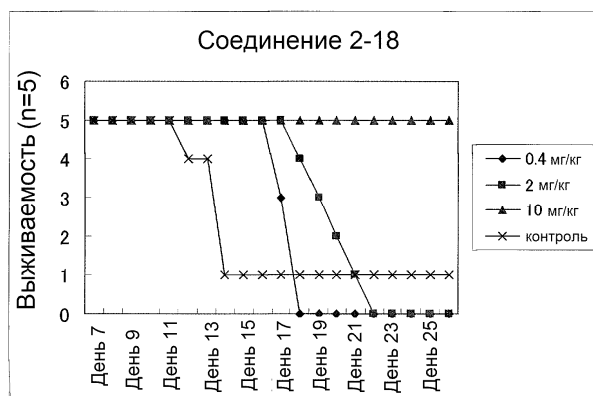
13. Противомикробное средство, содержащее соединение по любому из пп.1-11 или его соль.

14. Применение соединения по любому из пп.1-11 или его соли в качестве противомикробного средства.

15. Применение соединения по любому из пп.1-11 или его соли для предотвращения или лечения бактериальной инфекции.

16. Применение соединения по любому из пп.1-11 или его соли для получения лекарственного средства для предотвращения или лечения бактериальной инфекции.

17. Способ предотвращения или лечения бактериальной инфекции, включающий введение эффективного количества соединения по любому из пп.1-11 или его соли человеку или животному.



Фиг. 1



Фиг. 2

